

Antihistaminika der ersten Generation

Sie wirken antiallergisch, antiemetisch und sedierend, sind also wahre Alleskönner. Auch als **Schlafmittel** sind sie ohne Rezept in der Apotheke erhältlich, ganz risikolos sind sie jedoch nicht.

Diphenhydramin und Doxylamin sind klassische Wirkstoffe aus der Gruppe der H_1 -Antihistaminika der ersten Generation. Sie wirken am H_1 -Rezeptor und heben dort die Wirkung von Histamin auf. H_1 -Rezeptoren finden sich in Geweben der Peripherie aber auch im zentralen Nervensystem. Histaminerge Effekte in der Peripherie äußern sich als allergische Reaktion des Körpers, zum Beispiel in Form der Obstruktion der Atemwegsmuskulatur, vermehrte Durchlässigkeit der kleinen Blutgefäße und Juckreiz. Im Gehirn führt der Botenstoff Histamin zur Steigerung des Wachzustands und zur Erhöhung des Brechreizes. Antihistaminika der ersten Generation haben lipophile Eigenschaften und dadurch im Gegensatz zu den neueren Wirkstoffen zentrale Effekte. Sie wirken daher auch antiemetisch und sedierend. Ihre Haupteinsatzgebiete sind die Indikationen Übelkeit, Erbrechen und Schlafstörungen. Sie verbessern das Einschlafen durch die schlafanstoßende Wirkung. Allerdings verschieben sie die Schlafphasen und greifen in das physiologische Schlafprofil ein. Die Einnahme sollte etwa 30 Minuten vor dem Schlafengehen stattfinden. Die übliche Dosis beträgt 50 Milligramm Diphenhydramin und 25 bis 50 Milligramm Doxyla-

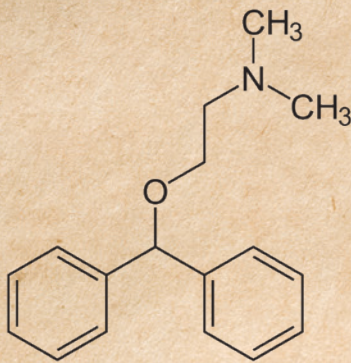
min. Da die Reaktionsfähigkeit durch die Antihistaminika deutlich verringert sein kann, ist darauf hinzuweisen, dass die Schlafdauer bis zum Aufstehen mindestens acht Stunden betragen sollte. Problematisch ist jedoch der Gewöhnungseffekt nach wenigen Tagen regelmäßiger Anwendung. So gibt es eine Anwendungsbeschränkung, die Substanzen nicht länger als 14 Tage dauerhaft einzunehmen. Geeignet sind sie für die kurzfristige Einnahme, zum Beispiel wenn eine Einschlafhilfe nach dem Schichtdienst oder auf Reisen gewünscht ist. Doxylamin und Diphenhydramin haben weiterhin auch ein hohes Bindungsvermögen an Muscarinrezeptoren. Damit verbunden sind anticholinerge Nebenwirkungen, wie Mundtrockenheit, Obstipation, Unruhe, Tachykardie, Harnentleerungsstörungen und Kognitionseinschränkungen. Dies bereitet besonders alten Menschen mit Polymedikation und Multimorbidität Probleme. Aus diesem Grund werden sie auf der Priscus-Liste für potenziell inadäquate Arzneistoffe im Alter geführt. Apotheker und PTA sollten die Wechselwirkungen mit anderen Medikamenten der Dauermedikation abchecken. So kann sich bei Kombination von anticholinergen Urologika, Neuroleptika oder trizyklischen Antidepressiva mit dem

Antihistaminikum zum Schlafen die anticholinerge Last massiv erhöhen und zu gesundheitlichen Komplikationen führen. In so einem Fall sollte eher ein pflanzliches Sedativum als Schlafmittel empfohlen werden. Die H_1 -Antihistaminika erhöhen außerdem das Sturzrisiko, die QT-Zeit und bergen die Gefahr für ein Delir. Bei einer Erhöhung der QT-Zeit sind De- und Repolarisation des Aktionspotenzials am Herzen verlängert, was zu einer Bradykardie führt. Die zentralen Effekte verstärken sich, wenn zusätzlich Alkohol, Hypnotika oder zentraldämpfende Psychopharmaka kombiniert werden. In der Schwangerschaft sind die alten H_1 -Antihistaminika eine Therapieoption, wenn kurzfristig eine schlafanstoßende Wirkung benötigt wird. Der Erfahrungsumfang für den Einsatz in der Schwangerschaft ist relativ groß, auch weil sie gegen Schwangerschaftsübelkeit eingesetzt werden können. Für Kinder ist Doxylamin zur Therapie von Schlafproblemen verschreibungspflichtig. Diphenhydramin zur Behandlung von Übelkeit und Erbrechen bei Kindern ist allerdings weiterhin ohne Rezept erhältlich. Für Kinder unter drei Jahren gilt allerdings eine strenge Indikationsstellung, denn Überdosierungen können lebensbedrohlich sein. Weitere Kontraindikationen für die Anwendung von H_1 -Antihistaminika sind manifeste Herzerkrankungen, Engwinkelglaukom, und Leberfunktionsstörungen. ■

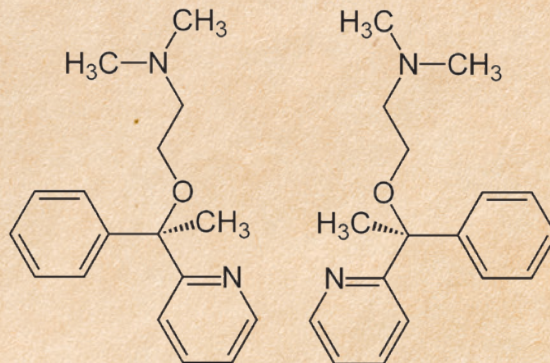
*Dr. Katja Renner,
Apothekerin*

Wanted

Antihistaminika



Diphenhydramin



Doxylamin

Wirkung

Blockade von Histaminrezeptoren, antiallergisch, antiemetisch, sedierend

Hauptindikationen

Zur kurzfristigen Behandlung von Einschlaf- oder Durchschlafstörungen

Einnahme/Anwendung

Oral, wenn Sedierung gewünscht 25 bis 50 Milligramm 30 bis 60 Minuten vor dem Schlafengehen

Nebenwirkungen

Anticholinerge Nebenwirkungen (z. B. Mundtrockenheit, Tachykardie, Miktionsstörungen, Obstipation), Gewichtszunahme, Schwindel, Hypotonie, Verlängerung QT-Zeit, erhöhte Sturzgefahr, paradoxe Erregung möglich

Kontraindikationen

Akutes Asthma, Epilepsie, Vorsicht bei Patienten mit fokalen Hirnschäden, Delirien, Harnverhalt, Pylorusstenose und unbehandeltes Engwinkelglaukom

Wechselwirkungen

Mit Anticholinergika Verstärkung der Nebenwirkungen, Alkohol und zentraldämpfende Wirkstoffe verstärken die Wirkung, additive QT-Zeit-Verlängerung mit Substanzen, die ebenfalls QT-Zeit-verlängernd wirken