

# Tapentadol

Ein Opioid mit **dualem Wirkmechanismus** ist Tapentadol, das bei starken chronischen Schmerzen angezeigt ist. Es hemmt die Schmerzweiterleitung und die Noradrenalin-Wiederaufnahme aus dem synaptischen Spalt.

**D**as zweigleisige Wirkprinzip ähnelt dem von Tramadol. Tapentadol wirkt einerseits als Agonist und bindet stärker als Tramadol an  $\mu$ -Opioid-Rezeptoren im zentralen Nervensystem. Deshalb wird die Substanz auch als WHO-Stufe 3 Analgetikum bewertet. Es hat nicht nur analgetische Effekte, weil es die prä- und postsynaptische Schmerzweiterleitung im ZNS blockt, es hemmt zusätzlich auch die Wiederaufnahme von Noradrenalin aus dem synaptischen Spalt. Diese Wirkung auf die absteigenden Nervenbahnen aus dem ZNS in die Peripherie erzielt eine Unterdrückung der Ausbreitung von Schmerzimpulsen. Anders als bei Tramadol treten hier jedoch keine serotonergen Begleitwirkungen auf.

Als Indikation wird die Behandlung von starken chronischen Schmerzen angegeben. Auch zur Therapie von neuropathischen Schmerzen liegen positive Studien vor. Als Agonist an  $\mu$ -Opioid-Rezeptoren stellen sich nach Einnahme von Tapentadol schmerzlindernde, antitussive und sedierende Effekte ein. Auch dieses Opioid reduziert die Darmmotilität und führt zur Obstipation, außerdem sind atemdepressive Wirkungen typisch.

**Schnelle Resorption** Tapentadol ist als retardierte und Filmtablette verfügbar. Unretardierte Arzneimittel erzielen eine rasche Wirkung und werden zur Linderung akuter Zustände oder zur ergänzenden Therapie von Schmerzspitzen verwendet. Tapentadol wird nach oraler Ein-

nahme schnell und vollständig resorbiert. Die mittlere absolute Bioverfügbarkeit nach einer Einzeldosis liegt aufgrund des starken First-Pass-Effektes nur bei etwa 32 Prozent. Maximale Serumkonzentrationen werden etwa nach einer Stunde nach oraler Einnahme von Tapentadol beobachtet.

**Metabolisierung** Die Pharmakokinetik verläuft über den therapeutischen Dosierungsbereich hinweg proportional zur Dosis. Die Metabolisierung erfolgt überwiegend über Glucuronidierung und Sulfatierung. Hauptmetabolit ist das pharmakologisch inaktive Tapentadol-O-Glucuronid. Auch wenn an der Metabolisierung die CYP-Enzyme CYP 2C9, CYP 2C19 und CYP 2D6 beteiligt sind, spielen Interaktionen mit diesen Enzymsystemen keine Rolle, da die Abbauprodukte wirkungslos sind. Tapentadol und seine Metabolite werden zu 99 Prozent über die Nieren eliminiert. Bei Patienten mit einer leicht eingeschränkten Leberinsuffizienz ist keine Dosisanpassung nötig. Bei schwerer Leber- und/oder Niereninsuffizienz sollte der Einsatz von Tapentadol vermieden werden, da die Datenlage laut Fachinformation dazu nicht ausreichend ist.

Üblicherweise liegt die Dosierungsempfehlung zu Therapiebeginn für Erwachsene bei 50 Milligramm Tapentadol. Der Wirkstoff kann dann alle zwölf Stunden in dieser Dosierung eingenommen werden. Höhere Startdosen können je nach Schmerzintensität und vorausgegangener Therapie des Patienten notwendig

sein. Hier entscheidet der Arzt individuell. Wenn die Indikation nicht mehr besteht, sollte das Arzneimittel schrittweise ausgeschlichen werden, um Absetzphänomene zu vermeiden.

**Typisch Opioid** Häufigste Nebenwirkungen sind gastrointestinale Beschwerden wie Übelkeit, Erbrechen und Obstipation. Insbesondere zu Beginn der Behandlung treten diese Symptome auf. Weitere mögliche Beschwerden unter der Therapie sind Juckreiz, vermehrtes Schwitzen und Miktionsstörungen.

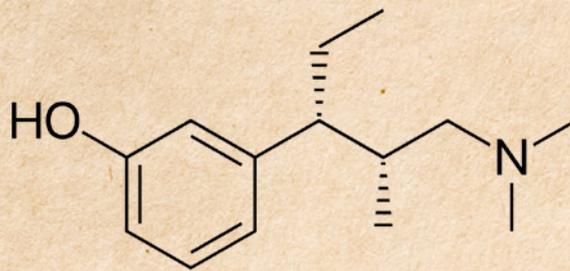
Wie bei anderen Opioid-Analgetika sind die üblichen pharmakodynamischen Wechselwirkungen mit zentral wirkenden Arzneistoffen, wie Benzodiazepinen, Psychopharmaka, Antihistaminika, Antidepressiva und Alkohol, zu erwarten. Es kommt zur gegenseitigen Wirkverstärkung. Bei Erstverordnung sollten die Patienten darauf hingewiesen werden, dass ihre Reaktionsfähigkeit eingeschränkt wird, zum Beispiel im Straßenverkehr oder beim Bedienen von Maschinen.

In Schwangerschaft und Stillzeit ist Tapentadol nur mit Vorsicht einzusetzen. Die Daten zur Anwendung von Tapentadol innerhalb der Schwangerschaft sind begrenzt. Tierexperimentelle Studien haben keine teratogene Wirkung aufgezeigt, doch wurden eine verzögerte Entwicklung und Embryotoxizität bei Dosierungen oberhalb des therapeutischen Bereichs beobachtet. ■

Dr. Katja Renner,  
Apothekerin

# Wanted

## Tapentadol



### Wirkung

durch agonistische Wirkung an Opioid-Rezeptoren und Wiederaufnahmehemmung von Noradrenalin Blockade der Schmerzweiterleitung

### Hauptindikationen

Analgetikum bei starken akuten und chronischen Schmerzen, die nur mit Opioidanalgetika angemessen behandelt werden können

### Einnahme

oral als Retardtablette oder Filmtablette

### Nebenwirkungen

Schwindel, Benommenheit, gastrointestinale Beschwerden (Übelkeit, Obstipation und Erbrechen), Atemdepression, vermehrtes Schwitzen, Müdigkeit und Kopfschmerzen, Miktionsstörungen, Urticaria, Juckreiz, Miosis, Konzentrationsstörungen

### Kontraindikationen

Schwangerschaft und Stillzeit, Drogenmissbrauch, Abhängigkeitserkrankung, Asthma und ausgeprägte Atemdepression, bestehender oder Verdacht auf paralytischen Ileus, Vorsicht bei Epilepsie

### Wechselwirkungen

zentralwirkende Wirkstoffe wie Benzodiazepine, Sedativa, Antidepressiva, Alkohol, Anticholinergika, Antihistaminika, mit starken Enzyminduktoren theoretisch möglich, MAO-Hemmer

