

Klinische Pharmazie

Erneut: Verbindung von COX-2-Hemmern zu Blutdruckerhöhung

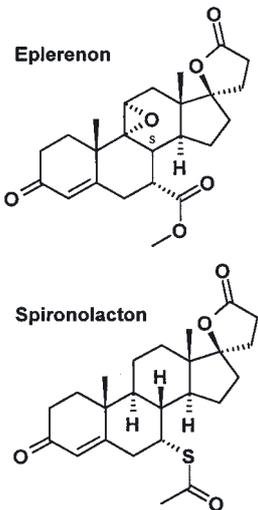
Die Behandlung mit prävalenten COX-2-Hemmern scheint im Vergleich mit Placebo und nicht selektiven NSAIDs den Blutdruck zu erhöhen. Dies lassen Daten einer kürzlich veröffentlichten Meta-Analyse vermuten (Arch Intern Med 2005; 165: 1-7). Grundlage dieser Studie sind Daten aus 19 randomisierten Untersuchungen von 45.451 Patienten, die entweder mit COX-2-Hemmern, nicht selektiven NSAIDs oder Placebo behandelt wurden. Verglichen mit Placebo stiegen sowohl der systolische wie auch der diastolische Blutdruck um 3,85 bzw. 1,06 mm Hg. Im Vergleich mit nicht selektiven NSAIDs ergab die Untersuchung einen Anstieg von 2,83 resp. 1,34 mm Hg. Die Ergebnisse sind statistisch zwar signifikant, die Frage der klinischen Relevanz bleibt allerdings weiterhin unklar. Ch. Franken

Pharmazeutische Chemie

Selektiver Aldosteron-Blocker Eplerenon

Mit Eplerenon (Inspra®) wurde der erste selektive Aldosteron-Antagonist zur Behandlung der Herzinsuffizienz nach kürzlich aufgetretenem Herzinfarkt zugelassen. Die Anwendung erfolgt zusätzlich zu einer Standardtherapie (ACE-Hemmer, AT-II-Antagonisten oder Betablocker). Die verringerte Mortalitäts- und Morbiditätsrate unter Zusatz von Eplerenon konnte in Studien eindeutig belegt werden (Schwinger H.G, *Dtsch. Med. Wschr.* **1999**, 124, 987). Ein ähnlicher Effekt wurde auch für Spironolacton gezeigt (Pitt B. et al., *New. Engl. J. Med.* **1999**, 341, 709). Es wird vermutet, dass die Aldosteron-Antagonisten verhindern, dass den ohnehin an Hypokaliämie leidenden Patienten mit chronischer Herzinsuffizienz noch mehr Kalium entzogen wird. Im Tierexperiment konnte auch gezeigt werden, dass Aldosteron die Proliferation von Bindegewebe am Herz und Gefäßen fördert, was möglicherweise zur Hypertonie beitragen könnte. Mit Eplerenon steht ein selektiver Hemmstoff zur Verfügung, der im Gegensatz zu Spironolacton nicht mehr die unerwünschten antiandrogenen und progestagenen Nebenwirkungen aufweist. Das protektive Potenzial der Aldosteron-Antagonisten scheint so reizvoll, dass der amerikanische Pharmakonzern Searle eine weltweite Überlebensstudie mit Eplerenon angekündigt hat. An EPHEUS (Eplerenone Neurohormonal Efficacy and Survival Study) sollen 6200 Menschen in 600 klinischen Zentren rund um den Globus teilnehmen.

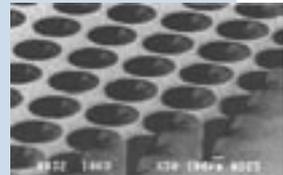
Klaus-Jürgen Schleifer



Pharmazeutische Technologie

Neues Trägermaterial für topische Formulierungen: Nanostrukturiertes Silicium

BioSilicon™ ist eine poröse Form des Silicium, die biokompatibel und durch Entstehung von Kieselsäure bioabbaubar ist. Die Bienenwabenstruktur des Elementes, die den porösen Aufbau von Biomembranen nachahmen soll, wird durch Erzeugen von Nanoporen mittels Ätztechnik mit Säure erhalten. Die physikalisch-chemischen Eigenschaften (z.B. Halbleiterfunktion) des Siliciums (z.B. Halbleiterfunktion) werden dabei nicht verändert. In die Poren können verschiedenste Wirkstoffe mit hoher Beladungskapazität eingelagert und nach Applikation langsam, z.B. unter Nutzung der Halbleitereigenschaften, über einen längeren Zeitraum freigegeben werden. Auch die Verwendung des Materials im Rahmen der Chip-Technologie für eine Prozessor-basierte Wirkstofffreigabe ist möglich. Des weiteren eignen sich BioSilicon™-Formulierungen zur Brachytherapie, d.h. zur Lokalthherapie von soliden Tumoren mittels Implantation von Radiotherapeutika. Radiopharmaka und auch Chemotherapeutika können über eine feine Kanüle direkt in den Tumor injiziert werden. Das Präparat BrachySil™ mit dem P-32-Isotop zur Radiotherapie von inoperablen Lebertumoren befindet sich bereits in Phase IIb der klinischen Prüfung. Auch die transdermale Route soll durch Verwendung von BioSilicon™ in Form von Mikronadelchen in transdermalen Pflastern verfolgt werden. Quelle: Innovations Pharm. Technol. **15**, 64-67 (Herbst 2004) C. Leopold



BioSilicon™: Nanostruktur

Pharmazeutische Biologie

Antidiabetische Effekte verschiedener Zimt-Arten

Die Anzahl der an Diabetes Typ-2 erkrankten Menschen steigt in den letzten Jahren immer weiter an. Diese Stoffwechselstörung wird im Allgemeinen mit oralen Antidiabetika aus der Klasse der Sulfonylharnstoffe behandelt. Gleichzeitig sollten diätetische Maßnahmen ergriffen werden. Die Bereitschaft dazu ist jedoch so unterschiedlich stark ausgeprägt, dass manchmal keine oder nur sehr schwache Effekte erzielt werden.

Vor einiger Zeit wurde berichtet, dass bereits ein Gramm Zimt pro Tag in der Lage sei, den Blutzuckerspiegel um bis zu 20 Prozent zu senken. Pharmakologen der Universität Münster haben jetzt die antidiabetische Wirkung von Zimt in einer *in vitro* und *in vivo* Testreihe im direkten Vergleich mit Glibenclamid an Ratten überprüft. Verwendet wurden die Extrakte von *Cinnamomum ceylanicum*, dem Ceylon-Zimt und *Cinnamomum cassia*, dem Chinesischen Zimt, wodurch gleichzeitig mögliche Wirkunterschiede zwischen beiden Arten erkennbar werden sollten.

Nach Gabe unterschiedlicher Konzentration der Zimtextrakte fand man einen deutlichen Anstieg der Insulin-Konzentration im Plasma. Dieser Effekt war für den *C. cassia* Extrakt etwas stärker ausgeprägt als für *C. ceylanicum*. Obwohl die gefundene Insulinfreisetzung nicht ganz so stark war wie bei einer hohen Dosis von Glibenclamid, schlagen die Autoren vor das antidiabetische Potential insbesondere des chinesischen Zimts zu nutzen.