



Frage des Monats Juni 2021

Wird Lorazepam bei Anwendung der Schmelztabletten über die Mundschleimhaut resorbiert?

Lorazepam gehört zu der Gruppe der Benzodiazepine. Es handelt sich um einen Tranquilizer von mittellanger Wirkdauer. Bei den verfügbaren Schmelztabletten (z.B. Expidet®) handelt es sich um eine gefriergetrocknete Darreichungsform (Lyophilisat), die bei Kontakt mit Speichel im Mund sofort zerfällt und so der Wirkstoff in Lösung geht. Diese Wirkstofflösung wird dann mit dem Speichel geschluckt und im Gastrointestinaltrakt resorbiert (z.B. Loperamid-Schmelztabletten). Im Unterschied dazu verbleiben Sublingual- und Buccaltabletten tatsächlich in der Mundhöhle, und der enthaltene Wirkstoff wird dort resorbiert (z.B. Fentanyl-Sublingualtabletten).

Ursprünglich wurden Schmelztabletten vor allem im Bereich psychiatrischer Arzneimittel entwickelt um zu vermeiden, dass PatientInnen Tabletten in der Wangentasche „aufbewahren“ und dann wieder ausspucken. Die heutzutage verfügbaren Schmelztabletten dienen oftmals der erleichterten Einnahme. Sie unterscheiden sich hinsichtlich der Pharmakokinetik nicht von einer gepressten Tablette zum Schlucken im Ganzen. Letztere wird im Ganzen geschluckt, zerfällt dann im Magen, wo der Wirkstoff in Lösung geht und im Dünndarm resorbiert werden kann. Voraussetzung für die Resorption eines Arzneistoffes aus dem Gastrointestinaltrakt ist, dass dieser gelöst (und nicht nur suspendiert!) vorliegt. Wo und wie schnell die Resorption stattfindet, hängt dann von weiteren Arzneistoffeigenschaften ab. Da der Wirkstoff bei Schmelztabletten direkt gelöst vorliegt, kann von einer schnelleren Resorption ausgegangen werden – die jeweilige klinische Relevanz davon ist jedoch sicherlich von Arzneistoff und Indikation abhängig.

Laut dem Hersteller unterscheiden sich Lorazepam Tabletten und Schmelztabletten nicht in ihrem pharmakokinetischen Profil. Es wird von einer Resorption im Gastrointestinaltrakt und nicht speziell in der Mundhöhle ausgegangen.

Spezielle Untersuchungen zur Pharmakokinetik von Lorazepam bei sublingualer und oraler Einnahme konnten eine etwas, jedoch nicht signifikant schnellere Resorption bei der Schmelztablette demonstrieren. Diese wurde auf den schneller gelösten Wirkstoff zurückgeführt [Caillé 1983]. In einer weiteren Studie konnte nur eine geringe Aufnahme von Lorazepam bei ausschließlich sublingualer oder bukkaler Anwendung festgestellt werden [Wilson 1987].

Fazit

Alle vorliegenden Daten weisen darauf hin, dass nur eine vernachlässigbare Resorption von Lorazepam über die Mundschleimhaut stattfindet. Wir gehen aber davon aus, dass das schnelle Zerfallen der Schmerztabletten in der Mundhöhle einen nicht unerheblichen psychologischen Beitrag zu einem schnell empfundenen Wirkeintritt leisten kann.

Literatur

Caille G et al. Pharmacokinetics of two lorazepam formulations, oral and sublingual, after multiple doses. *Biopharmaceutics and Drug Disposition*. 1983 Jan-Mar;4(1):31-42.

Wilson C et al. The behaviour of a fast-dissolving dosage form (Expidet) followed by γ -scintigraphy. *Int J Pharm*. 1987;40, 119-123.

Direktorin der Klinik: Prof. Dr. med. Claudia Bausewein PhD MSc
Leitung Kompetenzzentrum Palliativpharmazie: Dr. rer. hum. biol. Constanze Rémi MSc

Vorstand: Ärztlicher Direktor: Prof. Dr. med. Markus Lerch (Vorsitz), Kaufmännischer Direktor: Markus Zendler,
Pflegedirektor: Marcus Huppertz, Vertreter der Medizinischen Fakultät: Prof. Dr. med. dent. Reinhard Hickel (Dekan),
Institutionskennzeichen: 260 914 050, Umsatzsteuer-Identifikationsnummer gemäß §27a Umsatzsteuergesetz: DE813536017

Das Klinikum der Universität München ist eine Anstalt des Öffentlichen Rechts