Medikamente Inositolnicotinat III—8.3

Inositolnicotinat

Synonyma:

myo-Inosithexanicotinat (IUP), Inosit-hexanicotinsäureester, Inositol hexanicotinat (WHO), Inositol-hexanicotinsäureester, Inositoli nicotinas (NFN), Inositol nicotinate (BAN), Inositol niacinate (USAN)

Chemische Formel:

Verwendung:

Indikation: Hämorrhoidalleiden, vor allem bei Schmerzen, Blutungen, Brennen und Jucken. Ferner als unterstützende Maßnahme bei Sklerosierungstherapie. Periphere Durchblutungsstörungen der Extremitäten mit organischer oder funktioneller Ursache, wie z. B. Gefäßobliterationen infolge von Arteriosklerose oder Diabetes mit nachfolgender Ulzeration oder Gangrän, intermittierendes Hinken, »restless legs«, obliterierende Thrombangiitis (Buerger'sche Krankheit), Gefäßspasmen (abgestorbene Finger), Angioneurosen (z. B. Raynaud'sche Krankheit), Parästhesien, nächtliche Wadenkrämpfe.

Kontraindikation: Dekompensierte Herzinsuffizienz, frischer Myokardinfarkt, massive akute Blutungen.

Vorkommen:

Dosierung: 2 x täglich 1 Kautablette mit Flüssigkeit einnehmen, falls erforderlich, kann die Dosis unbedenklich erhöht werden.

Hämovannad Kautabletten 1 Tab. 600 mg (Bastian-Werk); Hexanicit-forte Tabletten (Astra Chemicals); Hexanicit-Tabletten (Astra Chemicals)

Wirkungscharakter:

Inositolnicotinat wird nach oraler Aufnahme zu etwa 70% resorbiert, ca. 30% werden mit den Fäces wieder ausgeschieden. Die Resorption erfolgt überwiegend als ungespaltener Ester, die Aufspaltung in Inositol und Nicotinsäure **im** Darm ist gering (J. G. Lennart Harthon und J. G. Lindquist). Im Blut wird der Ester relativ langsam gespalten; bis zu 24 Stunden nach peroraler Aufnahme ist noch unverändertes Inositolnicotinat nachweisbar (H. Sommer). Die Substanz hat infolgedessen eine spezifische protrahierte Freisetzung von Nicotinsäure. Da eines der beiden Spaltprodukte, das Inositol, als physiologischer Bestandteil im menschlichen Körper vorkommt und sogar dem Vitamin-B-Komplex zugeordnet wird, ist dessen Toxizität wohl zu vernachlässigen. Die akute Toxizität hängt also von dem Blutspiegel an freier Nicotinsäure ab. Beim gesunden Menschen kommt Nicotinsäure ebenfalls als physiologischer Bestandteil des Blutes vor, wobei Werte zwischen etwa 0,3 bis 0,8 mg% gefunden werden. Durch die Gabe von etwa 400 mg Inositolnicotinat wird dieser Blutspiegel um etwa 0,17 mg% erhöht (J. G. L. Harthon, K. J. E. Sigroth und R. A.

Sjöbom, H. Brandt und H. Fromm). Da die Aufspaltung des Esters eine beträchtliche Zeit erfordert, werden hohe Blutspiegel an freier Nicotinsäure kaum erreicht. Zur akuten Toxizität wurden Untersuchungen durchgeführt (L. Donatelli, P. Spigliati, M. Zabban, R. Selleri in »Minerva Medica«, 42, Heft Nr. 31 vom 6.6.1951). Dabei konnte eine minimale LD₁₀ nicht festgestellt werden. Die Versuche gliederten sich wie folgt: Bis zu 1 g/kg KG Inositolnicotinat wurde, in Wasser gelöst, per Magensonde an folgenden Tierarten verabreicht: Hase, Meerschweinchen, Maus, Hund. Die Beobachtungszeit betrug 1 Woche. Alle Tiere überlebten diese Dosierung; es zeigten sich während des ganzen Beobachtungszeitraums keine Auffälligkeiten. 150 mg/kg KG und 350 mg/kg KG Inositolnicotinat wurden an Hase und Hund i.v. verabfolgt. Auch hier überlebten alle Tiere, es traten keine allgemein auffälligen Symptome auf. Bei diesen Tierversuchen wurden Blutspiegel an Inositolnicotinat nicht bestimmt.

Symptome:

Entsprechen denen einer Überdosierung von freier Nicotinsäure: Erweiterung der peripheren Gefäße, Flush, Schocksymptomatik, Auswirkungen auf das ZNS.

Nachweis:

Ein Schnelltest auf Inositolnicotinat ist nicht verfügbar, die Substanz wird in der Regel dünnschichtchromatographisch identifiziert. Ferner besteht die Möglichkeit der spektralfotometrischen Bestimmung.

Therapie:

Als Einleitung einer Therapie ist Kohlegabe bzw. Magenspülung angezeigt. Weiterhin muß eventuell ein auftretender Schock behandelt werden durch Infusion von Plasmaexpandern und eventuell Prednisolon; gegen die Erregungszustände des ZNS kann man Promethazin verabreichen.

Literatur zu Vergiftungsfällen mit Inositolnicotinat liegt nicht vor. Uns sind bisher auch keinerlei Überdosierungen mit toxischen Wirkungen bekannt geworden.