

Acid neutralization and bile acid binding capacity of hydrotalcite compared with other antacids: An *in vitro* study

Miederer SE, Wirtz M, Fladung B, Chin J Dig Dis 4: 140–146, 2003

Säureneutralisations- und Gallensäurebindungskapazität von Hydrotalcit im Vergleich zu anderen Antazida: eine *In-vitro*-Studie

Hintergrund und Ziele

Antazida werden weltweit zur Selbstmedikation von Beschwerden wie Sodbrennen, saurem Aufstoßen und säurebedingten Magenbeschwerden eingesetzt. Bei der Bewertung eines Antazidums spielt neben seiner Säureneutralisationskapazität vor allem auch seine Fähigkeit zur Bindung von aggressiven Gallensäuren eine entscheidende Rolle, denn bei einer Refluxerkrankung können Gallensäuren aus dem Dünndarm in den Magen oder sogar bis in die Speiseröhre gelangen und hier als endogene Noxen die Schleimhäute reizen. Eine besondere Bedeutung kommt dabei den lipophilen Gallensäuren (z.B. Taurodesoxycholsäure) zu, da sie ein sehr hohes zytotoxisches und schleimhautschädigendes Potenzial aufweisen.

In dieser *In-vitro*-Studie wurde die Säureneutralisations- und Gallensäurebindungskapazität von Hydrotalcit und anderen Antazida untersucht.

Methodik

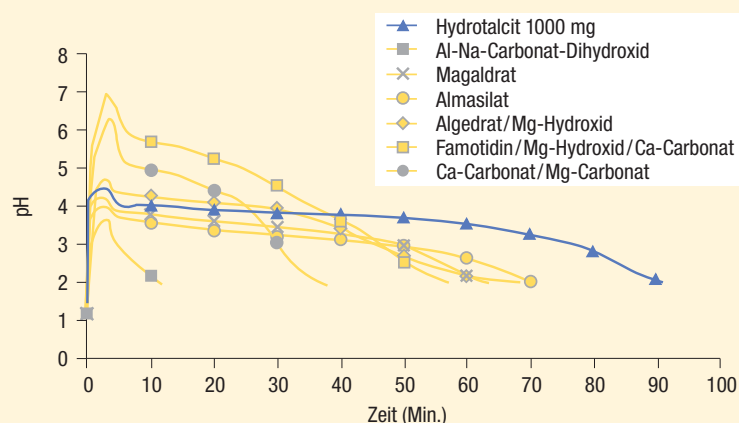
Zur Bestimmung der Säureneutralisationskapazität wurden drei verschiedene *In-vitro*-Testsysteme eingesetzt. Beim sog. „Preliminary Antacid Test“ (PAT) und dem „Acid Neutralization Capacity (ANC)-Test“ handelt es sich jeweils um ein statisches Testsystem. Der sog. Rossett-Rice-Test stellt dagegen ein dynamisches *In-vitro*-Testverfahren dar, bei dem die im Magenlumen vorherrschenden physiologischen Bedingungen simuliert werden. Dabei wird das zu untersuchende Antazidum zunächst einer definierten Säuremenge ausgesetzt; anschließend erfolgt ein kontinuierlicher Säurezufluss. Da unter *In-vivo*-Bedingungen ebenfalls kontinuierlich Säure in das Magenlumen sezerniert wird, spiegelt der Rossett-Rice-Test die physiologischen Gegebenheiten am besten wider.

Zur Ermittlung der Gallensäurebindungskapazität wurde ein statisches Analysemodell eingesetzt. Die hierbei verwendeten Gallensäurekonzentrationen entsprachen der Konzentration des Refluxats unter *In-vivo*-Bedingungen.

Ergebnisse

In allen drei Tests, in denen die Antazida unter dem Aspekt der Säureneutralisation untersucht wurden, zeigte sich, dass Hydrotalcit über ein sehr gutes Säureneutralisationsvermögen verfügt. Im PAT, bei dem die pH-Werte nach Säureexposition gemessen wurden, ergab sich für Hydrotalcit (500 mg) ein pH-Wert von 4,31. Hydrotalcit konnte somit den pH-Wert in den therapeutisch optimalen Bereich zwischen pH 3 und 5 anheben. Auch im ANC-Test wies Hydrotalcit (500 mg) mit ca. 17 mEq/g Zubereitung eine sehr gute Säureneutralisationskapazität auf. Im dynamischen Rossett-Rice-Test fiel auf, dass alle getesteten Antazida ihre säureneutralisierende Wirkung innerhalb der ersten Minute entfalteten, d.h. den pH-Wert über 3 anhoben. Hinsichtlich der Dauer der Säureneutralisation verhielten sich die Präparate jedoch sehr unterschiedlich.

pH-Wert-Profile im Rossett-Rice-Test



Hydrotalcit (1000 mg) wies von allen getesteten Antazida die längste Wirkdauer auf: Es konnte über einen Zeitraum von 76,9 Minuten den pH-Wert über 3 halten.

Die Untersuchungen zur Gallensäurebindungs-kapazität zeigten, dass Hydrotalcit (500 mg) mit Abstand das höchste Bindungsvermögen in Bezug auf die stark lipophile Taurodesoxycholsäure besitzt. Alle anderen Antazida schnitten deutlich schlechter ab.

Zusammenfassung

Die Studienergebnisse zeigen, dass Hydrotalcit sehr gute Säureneutralisationseigenschaften aufweist. Im Gegensatz zu anderen Antazida ist es in der Lage, durch kontrollierte Säureneutralisation den pH-Wert über einen langen Zeitraum hinweg im therapeutisch optimalen Bereich zwischen pH 3 und 5 zu halten. Darüber hinaus kann es aggressive Gallensäuren effektiv binden und somit die Magenschleimhaut wirkungsvoll vor Läsionen schützen. Hydrotalcit ist daher zur Behandlung von Sodbrennen und säurebedingten Magenbeschwerden sehr gut geeignet.

Bindung von Taurodesoxycholsäure

