

Comparative bioavailability of two vitamin B1 preparations: benfotiamine and thiamine mononitrate

Schreeb KH, Freudenthaler S, Vormfelde SV, Gundert-Remy U, Gleiter CH

Eur J Clin Pharmacol 1997; 52: 319-320

Zusammenfassung / Fazit

In einer randomisierten, doppelblinden Studie im crossover-Design wurde an 12 gesunden Erwachsenen die Bioverfügbarkeit von Thiaminmononitrat und Benfotiamin in äquimolaren Mengen geprüft. Die Teilnehmer erhielten im Abstand von 2 Wochen einmalig 70,2 mg Thiaminmononitrat bzw. 100 mg Benfotiamin (beides entspricht 210 µmol Thiamin).

Der Plasmathiamingehalt, gemessen als Fläche unter der Plasmathiamin-Konzentration/Zeit Kurve über die Zeit von 0–10 h, ist nach Benfotiamin 5 mal höher ($p < 0,005$), der max. Plasmathiamingehalt ist 6,7 mal höher ($p < 0,005$) als nach Thiaminmononitrat. Der maximale Plasmathiamingehalt wird mit Benfotiamin signifikant schneller erreicht.

Der Erythrozythenthiamingehalt ist unter Benfotiamin im Vergleich zu Thiaminmononitrat durchschnittlich 6,8fach erhöht.

Nach Gabe von Benfotiamin wird im Urin über 24h eine 10 mal höhere Thiamin-Ausscheidung gemessen als nach Thiaminmononitrat ($p < 0,005$).

Im Vergleich mit Thiaminmononitrat zeigt Benfotiamin eine signifikant höhere Bioverfügbarkeit.

Einleitung / Problemstellung

B1-Vitamine werden in der Therapie neuropathischer Erkrankungen eingesetzt. Die therapeutische Wirksamkeit des eingesetzten Präparates wird auch von dessen Bioverfügbarkeit bestimmt. Bekannt ist, dass fettlösliche Allithiamine wie Benfotiamin besser resorbiert werden als wasserlösliches Thiamin. Es gab jedoch bisher keine Arbeit, die die Bioverfügbarkeit beider Vitamin B1-Präparate exakt vergleicht.

Gegenstand / Ziel der Arbeit

Vergleich der Bioverfügbarkeit von Benfotiamin und Thiaminmononitrat nach Applikation äquimolarer Mengen.

Studiendesign / Methodik

- ◆ Studiendesign: randomisiert, doppelblind, Crossover-Design
- ◆ Patientenzahl: 12 gesunde Personen (6m/6w)
- ◆ Therapie/Intervention: nüchtern einmalige Dosis von 100 mg Benfotiamin oder 70,2 mg Thiaminmononitrat (=210 µmol Thiamin); nach 2 Wochen entsprechend dem Crossover-Design die andere Variante

- ◆ Untersuchungsparameter:
 - Thiamin im Plasma
 - $AUC_{(0-10h)}$: Fläche unter der Plasmathiamin/Zeit-Kurve
 - C_{max} : maximale erreichte Thiaminkonzentration im Plasma
 - t_{max} : Zeit, in der C_{max} erreicht wird
 - Thiamin in den Erythrozyten
 - Thiamin im 24hUrin

Studienergebnisse

- ◆ $AUC_{(0-10h)}$: bei Benfotiamin 5 mal höher als bei Thiaminmononitrat ($p < 0,005$)
- ◆ C_{max} : Bei Benfotiamin 6,7 mal höher als bei Thiaminmononitrat ($p < 0,005$)
- ◆ t_{max} : erreicht mit Benfotiamin nach 35-40 Minuten, mit Thiaminmononitrat nach 70-75 Minuten ($p < 0,005$)
- ◆ Thiamingehalt der Erythrozyten:
 - zum Zeitpunkt t_{max} : nach Benfotiamin 107 ng/ml nach Thiaminmononitrat 32 ng/ml ($p < 0,05$)
 - über die gesamte Zeit (0-10 h): nach Benfotiamin ca. 6,8 mal höher als nach Thiaminmononitrat
- ◆ Thiamin im 24h-Urin: nach Benfotiamin 10 mal höher als nach Thiaminmononitrat ($p < 0,005$)