

Едем

Відчуй життя без алергії!



Антигістамінний засіб для усунення симптомів алергії³

- ✓ Ефективний контроль симптомів алергічного риніту протягом 24 годин¹
- ✓ Чинить виражену деконгестивну дію²
- ✓ Володіє додатковими протизапальними властивостями³

¹ «Роль комплексного застосування назальної іригаційної та антигістамінної терапії в лікуванні алергічного риніту у дітей» Крючко Т.О., Ткаченко О.Я., Щербак В.В., Климко Д.О., Олійніченко М.О., Клиштя В.В. Полтавський державний медичний університет, кафедра педіатрії №2, м. Полтава, Україна. ² Decongestant efficacy of desloratadine in patients with seasonal allergic rhinitis, Bacher L. 2001. ³ Інструкція для медичного застосування препарату Едем сироп, Едем таблетки. Реклама лікарських засобів. Інформаційний матеріал для розміщення у спеціалізованих виданнях, призначених для медичних установ та лікарів, а також для розповсюдження на семінарах, конференціях, симпозиумах з медичної тематики. РП. № UA/7746/01/01, від «12» вересня 2018 р. (наказ МОЗ України від «12» вересня 2018 р. № 1664.). РП. № UA/8360/01/01, від «19» березня 2018 р. (наказ МОЗ України від «25» листопада 2022 р. № 2131.). Виробник: АТ «Фармак», 04080, м. Київ, вул. Кирилівська, 63. тел.: +38 (044) 496-87-87/e-mail: info@farmak.ua / веб-сайт: www.farmak.ua / УКР/ПРОМО/04/2023/ЕДЕ/ДМ/002

Дезлоратадин: у фокусі — алергічне запалення

Сучасний погляд на алергічні захворювання як на системну патологію потребує застосування ефективних та безпечних засобів для лікування та профілактики, що дозволяють впливати на основні механізми розвитку алергічного запалення – т. зв. алергічний каскад. Останнім часом з'являється все більше даних, що таким засобом є дезлоратадин – антигістамінний препарат II покоління, який, крім блокади H_1 -гістамінових рецепторів, має потужну протиалергічну та протизапальну дію.

Гістамін як медіатор запалення

Як відомо, гістамін є ключовим медіатором розвитку алергічних реакцій і захворювань, а також потужною вазоактивною речовиною; міститься в більшості тканин організму, як-от гранули опасистих клітин, базофілів, еозинофілів тощо. Під час взаємодії з гістаміновими рецепторами він контролює низку клітинних процесів, пов'язаних із розвитком алергічних реакцій та імунної відповіді. Спричинене гістаміном порушення проникності капілярів із виходом рідини із плазми крові до тканин клінічно проявляється сльозотечею та ринореєю, при цьому вираженість цих процесів залежить від характеру впливу гістаміну (місцевий або системний), локалізації його дії (наприклад, дихальні шляхи чи шкіра), концентрації алергену та рівня попередньої сенсibilізації до нього.

Клінічні симптоми вивільнення гістаміну варіюють від зумовлених ним пухирів і висипу до потенційно летальних анафілактичних реакцій. Численні симптоми алергічної реакції є наслідком впливу гістаміну на кровеносні судини, що спричиняє підвищення їхньої проникності, вазодилатацію та збільшення кровотоку.

Основні механізми дії гістаміну залежать як від типів клітин, котрі він активує, так і від типів гістамінових рецепторів. Наразі відомо про 4 типи гістамінових рецепторів: H_1 -рецептори, активація яких викликає міграцію клітин до ділянки запалення, ноцицепцію, вазодилатацію та бронхоконстрикцію; H_2 -рецептори, що беруть участь у регуляції секреції шлункової кислоти, утворенні слизу в дихальних шляхах і проникності судин; H_3 -рецептори, котрі відіграють важливу роль у розвитку запальних захворювань нервової системи, та H_4 -рецептори, які сьогодні розглядаються в контексті розвитку запальних та алергічних реакцій.

У відповідь на контакт з алергеном на клітинній мембрані мастоцитів і базофілів синтезується специфічний IgE, який прикріплюється на внутрішній поверхні кровеносних судин майбутніх органів-мішеней. У разі подальшого контакту та зв'язування алергену з IgE на поверхні сенсibilізованих базофілів чи опасистих клітин відбувається їхня дегрануляція з вивільненням медіаторів запалення, зокрема гістаміну.

Антигістамінні препарати

Антагоністи рецепторів гістаміну H_1 , також відомі як АГП, використовуються для лікування алергії уже протягом тривалого часу. Вважається, що вони діють шляхом пригнічення запальних реакцій, спричинених вивільненням гістаміну. На відміну від АГП I покоління (ципропептадин, дексхлорфенірамін, фенірамін, прометазин, алімемазин), які демонструють низьку специфічність і високу частоту побічних ефектів та одним із яких є центральна седативна дія, для більшості АГП II покоління (цетиризин, дезлоратадин, фексофенадин, лоратадин) ці побічні прояви не є характерними.

АГП зв'язуються з рецепторами гістаміну на поверхні клітин. Варто зауважити, що ці рецептори демонструють незалежне від агоніста передання сигналів, яке працює навіть тоді, коли гістамін не взаємодіє з поверхнею

клітини, при цьому існує баланс між активною та неактивною структурами рецептора: активна форма стабілізується наявністю гістаміну, тоді як АГП стабілізують неактивну форму рецептора й діють як зворотні антагоністи.

Дезлоратадин

Дезлоратадин – активний метаболіт лоратадину, пероральний АГП II покоління, висока ефективність та зів'язані із плацебо профілі безпеки і переносимості якого були доведені в рандомізованих контрольованих дослідженнях.

З-поміж АГП II покоління дезлоратадин має найвищий ступінь спорідненості з H_1 -рецепторами. Дезлоратадин характеризується швидкістю дії, тривалим періодом напіввиведення (близько 27 год) і відсутністю взаємодій з іншими лікарськими засобами та їжею. Метаболізм дезлоратадину представлено на рисунку.

У Європі дезлоратадин застосовують для лікування сезонного та цілорічного алергічного риніту й кропив'янки в дорослих і дітей віком >1 рік. Окрім того, препарат схвалено в США для лікування цілорічного алергічного риніту та хронічної ідіопатичної кропив'янки в дорослих і дітей віком від 6 міс, а також для лікування сезонного алергічного риніту в дорослих і дітей віком від 2 років.

Антигістамінні й протизапальні властивості дезлоратадину

Дезлоратадин є потужним неседативним антагоністом H_1 -рецепторів з антиалергічними та протизапальними властивостями. В дослідженнях in vitro показано, що дезлоратадин інгібує хімічні медіатори, які беруть участь в алергічних реакціях на ранній і пізній стадіях. Було встановлено, що дезлоратадин значно покращує носове дихання в пацієнтів з алергічним ринітом. Доведена здатність дезлоратадину запобігати виділенню цитокінів, хемокінів і молекул клітинної адгезії, зв'язаних із пізньою фазою алергічної відповіді, що обумовлює його деконгестантні властивості.

Окрім H_1 -антигістамінної дії, дезлоратадин (як і деякі інші АГП) пригнічує вивільнення низки прозапальних медіаторів та має антигістамінні, протизапальні, протиалергічні властивості.

Дезлоратадин ефективніше взаємодіє з H_1 -рецепторами порівняно із цетиризином, ебастином, фексофенадином і лоратадином. Препарат інгібує підвищення внутрішньоклітинної концентрації іонів кальцію забезпеченням мембраностабілізуючого ефекту. Дезлоратадин діє як зворотний агоніст H_1 -гістамінового рецептора. Зокрема, через 6 год після застосування лише 37% препарату залишається зв'язаним, що сприяє більшій тривалості терапевтичного ефекту. Порівняно з відповідною дозою цетиризину, фексофенадину, лоратадину чи піриламину дезлоратадин ефективно знижує конституційне (незалежне від агоніста) передання сигналів H_1 -рецептором людини шляхом пригнічення активації ядерного фактора транскрипції NF-каппа-B (NF-kB). Окрім того, дезлоратадин виявився ефективнішим за свої аналоги щодо пригнічення утворення NF-kB після активації рецептора гістаміном.

Клінічні переваги дезлоратадину

• Дезлоратадин ефективно контролює як назальні симптоми алергічного риніту, включаючи закладеність носа, що не пригнічується іншими сучасними H_1 -антагоністами, так і неназальні (свербіж і почервоніння очей, сльозотеча, свербіж піднебіння, пирхота в горлі, кашель та ін.).

• Дезлоратадин має виражений деконгестантний ефект – зменшує закладеність носа, що мінімізує вплив алергенів на нижні дихальні шляхи і поліпшує дію інтраназальних препаратів.

• Дезлоратадин ефективний також у разі поєднання бронхіальної астми з алергічним ринітом. У таких пацієнтів препарат позитивно впливає не тільки на симптоми риніту, а й на клінічний перебіг астми – покращує показники функції зовнішнього дихання та зменшує потребу в інгаляційних засобах.

• Дезлоратадин є високоефективним у лікуванні гострої та хронічної кропив'янки. Вже після першої дози суттєво зменшується симптоматика, покращується нічний сон та підвищується якість життя пацієнтів.

• Дезлоратадин не проникає через гематоенцефалічний бар'єр, не чинить седативної дії і не пригнічує психомоторні функції, не потенціює дії алкоголю.

• Дезлоратадин дуже добре переноситься, частота небажаних проявів за його застосування порівнянна або навіть нижча за таку плацебо.

ВИСНОВКИ

Завдяки зв'язуванню з H_1 - та H_4 -гістаміновими рецепторами гістамін відіграє ключову роль у патогенезі алергічного запалення. Хоча в більшості досліджень щодо лікування різноманітних алергічних захворювань вивчаються блокатори H_1 -гістамінових рецепторів, вони не завжди демонструють достатню клінічну ефективність. Натомість сьогодні надходять нові дані щодо здатності дезлоратадину впливати на різні елементи запалення через механізми, відмінні від інгібування H_1 -гістамінових рецепторів, і в такий спосіб переривати алергічний каскад. Ці властивості разом із клінічно доведеними ефективністю і безпекою дозволяють вважати дезлоратадин АГП першого вибору для лікування алергічного риніту й кропив'янки у дорослих і дітей.

За матеріалами: Nisha et al. Desloratadine: An Insight On Acute Inflammation / Journal of Pharmaceutical Negative Results, Vol. 14, Regular Issue 02, 2023.

ДОВІДКА «ЗУ»

На фармацевтичному ринку України дезлоратадин представлений вітчизняним препаратом Едем від АТ «Фармак». Едем зареєстровано в двох лікарських формах: таблетки по 5 мг і сироп (0,5 мг в 1 мл). Препарат показаний для усунення симптомів, пов'язаних з алергічним ринітом, як-от чхання, виділення з носа, свербіж, набряк і закладеність носа, свербіж та почервоніння очей, сльозотеча, свербіж піднебіння й кашель, а також для усунення симптомів, пов'язаних із кропив'янкою, як-от свербіж, висипи.

Варто відзначити, що Едем у вигляді сиропу не містить ароматизаторів, які можуть зумовлювати чи посилювати алергію, і може призначатися дітям із 6-місячного віку, а частота прийому 1 р/день дозволяє досягти хорошого комплаєнсу. Рекомендовані дози в дитячому віці становлять 2 мл; 1-5 років – 2,5 мл; 6-11 років – 5 мл. У пацієнтів віком понад 12 років раціональним є прийом як 10 мл сиропу (еквівалентно 5 мг дезлоратадину), так і препарату в таблетованій формі, що містить 5 мг дезлоратадину, 1 р/добу. Важливою перевагою препарату Едем є його доступна вартість, що для багатьох українців має особливе значення в нинішніх умовах.

Підготувала Ольга Гуйванюк

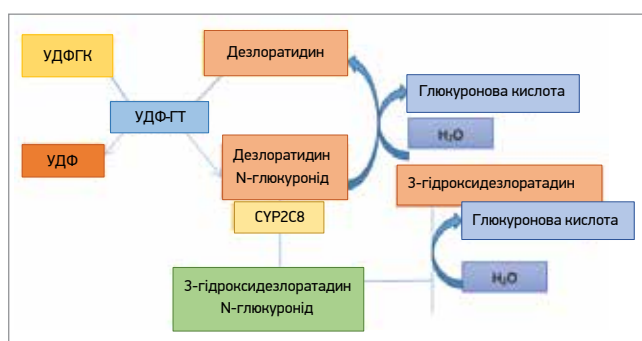


Рис. Метаболізм дезлоратадину

Примітки: УДФГК – уридиндифосфоглюкуронова кислота; УДФ – уридиндифосфат; УДФ-ГТ – уридиндифосфатглюкуронілтрансфераза; СУР2С8 – цитохром 2С8.