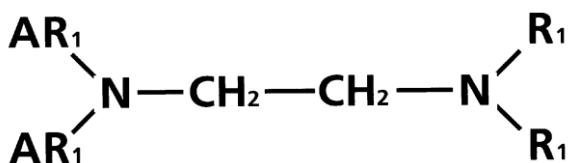
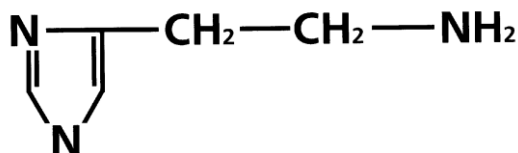


АНТИГИСТАМИННЫЕ ПРЕПАРАТЫ



Первый антигистаминный препарат синтезировал учёный D. Bovet (Бельгия, Швейцария), за что получил Нобелевскую премию (1957).



Гистамин (вверху) и общая формула антигистаминного препарата (внизу)

Механизмы действия антигистаминных препаратов (H1-блокаторов):

- Конкуренция за H1-рецепторы;
- Торможение выделения гистамина, кислородных радикалов, лейкотриенов, фактора активации тромбоцитов;
- Инактивация гистамина;
- Ингибирование синтеза адгезивных молекул воспаления;
- Нарушение процессов активации клеток за счёт иммобилизации ионов кальция.

Таблица

Гистаминовые рецепторы

<i>Тип</i>	<i>Экспрессия на клетках</i>	<i>Эффекты</i>
H1	Миоциты, эндотелий, железистый эпителий, нейтрофилы, эозинофилы, моноциты, макрофаги	Вовлечение в Th2-воспаление; Зуд; Системное расширение сосудов; Спазм гладких мышц (в т.ч., бронхоспазм); Спазмы кишечника; Избыточная продукция слизи; Стимуляция хемотаксиса нейтрофилов и эозинофилов; Повышение цГМФ
H2	Железистый эпителий, нейтрофилы, эозинофилы, тучные клетки, базофилы	Вовлечение в Th1-воспаление; Регуляция секреции HCl секреции; Расслабление гладких мышц; Ингибция адаптивных ответов и продукции цитокинов; Синусовая тахикардия;

		Ослабление хемотаксиса нейтрофилов и эозинофилов; Повышение цАМФ
Н3	Нейроны, тучные клетки, базофилы	Функционирование ГЭБ; Уменьшение экспрессии пресинаптических рецепторов к ацетилхолину, серотонину и норадреналину
Н4	Тучные клетки, базофилы, многие типы лейкоцитов, энтероциты, колоноциты, гепатоциты, спленоциты, тимоциты, эпителий экзокринных желёз	Вовлечение в Th2-воспаление; Регуляция хемотаксиса нейтрофилов и эозинофилов; Активация эозинофилов

Антигистаминные препараты 1-го поколения – это «пролекарства» с неизбирательным действием.

Дифенгидрамин (димедрол®, бенадрил®)

Клемастин (тавегил®)

Прометазин (пипольфен®)

Хлоропирамин (супрастин®)

Ципрогептадин (перитол®)

Квифенадин (фенкарол®)

Мекгидролин (диазолин®)

Препараты этого поколения обладают седативным побочным эффектом. В настоящее время применяются, главным образом, **хлоропирамин (супрастин®)** и **клемастин (тавегил®)** в ампулированных формах с целью оказания помощи при острых аллергических реакциях. В западных странах продолжает широко назначаться дифенгидрамин (бенадрил) форме таблеток и гелей.



Антигистаминные препараты 1-го поколения назначаются курсом не более 10 дней.

Антигистаминные препараты 2-го поколения – это «пролекарства» с избирательным действием.

Азеластин (аллергодил®)

Лоратадин (klarитин® , кларотатид®, кларисенс®)
Астемизол (гисманал®)
Активастин (семпрекс®)
Оксатомид (тинсет®)
Рупатидин (рупафин®)
Эбастин (кестин®)
Диметинден (фенистил®)
Цетиризин (зиртек®, парлазин®, зодак®, цетрин®)

Отдельные препараты 2-го поколения (астемизол) могут оказывать аритмогенное действие, поэтому в настоящее время не рекомендуются к употреблению. Некоторые препараты всё-таки имеют побочный седативный эффект.



Зиртек® (цетиризин)

6 мес-1 год - по 5 кап. x 1 раз в день

1-2 года - по 5 кап. x 2 раза

2-6 лет - по 5 мг (10 кап.) x 1 раз в день или по 5 кап. x 2 раза в день

Ст.6 лет и взрослым - по 1 табл. (10 мг или 20 кап.) x 1 раз в день

Антигистаминные препараты 3-го поколения – это действующие метаболиты, не требующие превращения в организме, без побочных эффектов.

Фексофенадин (телфаст, фексадин)

Дезлоратадин (эриус, лордестин)

Левоцетиризин (ксизал, супрастинекс)

Антигистаминные препараты 2-го и 3-го поколений назначаются курсом до 3-х недель.

Преимущества препаратов 3-го поколения:

- Быстрое наступление терапевтического эффекта
- Длительность эффекта 24 часа
- Снижение потребности в топических кортикостероидах
- Отсутствие тахифилаксии
- Отсутствие побочных эффектов (влияния на ЦНС, сердце, печень)
- Возможность профилактического назначения



Телфаст® (фексофенадин)

6-11 лет - по 30 мг x 2 раза в день

Ст. 12 лет и взрослым - по табл. 120 мг-180 мг x 1 раз в день



Эриус® (дезлоратадин)

1-5 лет - 1,25 мг (2,5 мл) сиропа

6-11 лет – 2,5 мг (5 мл) сиропа

Ст. 12 лет и взрослым - 5 мг x 1 раз



Ксизал® (левоцетиризин)

2-6 лет - по 1,25 мг (= 5 капель) x 2 раза в день; суточная доза - 2,5 мг (10 капель)

6 лет и взрослым - суточная доза составляет 5 мг (= 20 капель)

Таблица

Назначение антигистаминных средств в зависимости от возраста

Возраст	Препарат
С 1 месяца	Хлоропирамин (супрастин), диметинден (фенистил)
С 6 месяцев	Цетиризин (зиртек, парлазин, зодак, цетрин)
С 1 года	Клемастин (тавегил), дезлоратадин (эриус, лордестин)
С 2 лет	Левосетиризин (ксизал, супрастинекс), лоратадин (klarитин, кларотатид, кларисенс)
С 6 лет	Фексофенадин (телфаст, фексадин), эбастин (кестин)

Назначение антигистаминных средств при беременности и лактации

Информация по назначению большинства препаратов при беременности и лактации противоречивая, либо ещё не проведены всеобъемлющие исследования по безопасности. В отечественных рекомендациях не допускается назначения следующих средств: супрастин®, эриус® (лордестин), кестин®, рупафин®. В западных странах отношение к применению почти всех антигистаминных средств при беременности следующая - врач решает, превышает или нет предполагаемая польза потенциальный риск.

Топические антигистаминные препараты:



Фенистил® (диметинден) гель



Опатазол® (олопатадин)

Аллергодил® (азеластин)

Назальные спреи и глазные капли применяются главным образом при сезонном аллергическом риноконъюнктивите по 1-2 капли 2 раза в день, а фенистилгель - при инсектной аллергии - нанесение на место укусу до 3- раз в день..

©В.В.Климов