

Антигистаминные средства

И.М.Вешкурцева

Основные медиаторы аллергии

- Гистамин (тучные клетки, базофилы)
- Лейкотриены (LTC₄, LTD₄, LTE₄)
- Простагландины
- Эйкозаноиды
- Брадикинин
- ФАТ (фактор активации тромбоцитов)

Лекарства – «провокаторы» крапивницы

- НПВС
- Иодсодержащие рентгеноконтрастные
- Плазмозаменители (декстраны)
- Местные анестетики
- Ингибиторы АПФ
- Опиаты (кодеин, морфин)

Гистаминорецепторы

<u>Тип</u>	<u>Эффекты</u>
H-1	Сокращение гладкой мускулатуры, > проницаемости сосудов, > цГМФ
H-2	> секреции HCl, > слизи в бронхах
H-3	Торможение в ЦНС

Механизм действия и основные эффекты

- Кокурентная блокада гистаминовых R
- Влияние на обмен гистамина в ЦНС, сердечной мышце и др. тканях
- А/гистаминный: устранение зуда, чихания, ринореи, НО не устраняют заложенность носа !

Н₁ блокаторы 1 поколения

- Дифенгидрамин (димедрол)
- Прометазин (пипольфен, дипразин)
- Клемастин (тавегил)
- Супрастин
- Диазолин (мебгидролин),
- Фенкарол

Н₁ блокаторы 1 поколения

Преимущества

- 1. Инъекционные формы**
- 2. Невысокая стоимость**
- 3. Дополнительно –противоотечное, седативное, местноанестезирующее, противокашлевое действие, противорвотный, противоукачивающий эффекты**

H₁ блокаторы 1 поколения

Недостатки

- **Х/литический эффект – сухость во рту, атония кишечника и моч.пузыря, нечеткость зрения, сгущение мокроты**
- **Седативный эффект – сонливость, спутанность сознания, нарушение координации**
- **Кратковременное действие**
- **Тахифилаксия (чередовать)**

Индивидуальность а/гистаминных средств – 1 поколение

Дифенгидрамин (димедрол):

- Выраженный противоотечный эффект
- П/кашлевое, п/рвотное действие
- Спазмолитик
- Местный анестетик (онемение полости рта)
- Седация, апатия, головокружение, утомляемость, непредсказуемость реакции

- 7-12 мес. – 0,3-0,5 мл 1% р-ра
- 1- 3 года – 0,5- 1 мл
- 4-6 лет
- 1-1.5 мл
- 7-14 лет - 1,5-3 мл каждые 6-8 часов

Прометазин (пипольфен, дипразин)

- **Высокая седативная активность (нейролептик)**
- **Адьювантный эффект**
- **Гипотермическое действие**
- **Противорвотное действие**
- **Синдром Меньера, профилактика укачивания**
- **Адренолитик – резкое ↓↓ АД**
- **«Кошмарные» сны, возбуждение**

Индивидуальность а/гистаминных средств – 1 поколение

- Клемастин (тавегил) – мощность, быстрота эффекта, длительный T1/2, гиперчувствительность! СД – 25 мг/кг на 2 приема в/м
- Супрастин – выраженная седация,
- Диазолин (мебгидролин), Фенкарол – << мощность, эффект – до 48 ч; << седация, << м/холинолитический эффект

Современные показания к а/гистаминным препаратам -1 поколения

- Купирование острых АР (крапивница, отек Квинке),
- Лечение зудящих дерматозов (седация),
- Премидикация,
- Вестибулярные расстройства,
- Бессоница
- Симптоматическая терапия ОРВИ – устраняют зуд в носу, чихание (но нет доказательной базы)

Эффективность А/гистаминных средств при ОРВИ

- Рандомизированные плацебо контролируемые исследования**
- Антигистаминные средства не купируют симптоматику и не влияют на сроки выздоровления при ОРВИ**
- Их необходимо исключить из числа рекламируемых для лечения простуды**

H₁ блокаторы 2 и 3 поколения

- **Высокое сродство к H-1 рецепторам – меньше дозы;**
- **Отсутствие блокады других рецепторов**
- **Продолжительный эффект – до 24 ч**
- **Быстрый эффект – ч/з 20-40 мин**
- **Отсутствие тахифилаксии**
- **Хуже проходят через ГЭБ**
- **Пища не влияет на абсорбцию**
- **При алл.рините – уровень доказательности A**

Антигистаминные препараты 2 поколения

- Лоратадин (кларитин) – 36 ч, умеренное бронхорасширяющее действие, слабое седативное, м.б. аритмогенное действие; с 2-х л.
- Цетиризин (зиртек) – 24 ч, м.б. седация и возбуждение, с 1-го года;
- Эбастин – 48 ч, с 6 лет
- Акривастин (семпрекс) – 8-12 ч, с 12 лет

Антигистаминные препараты 3 поколения

- **Активные метаболиты – нет седативного, х/литического, аритмогенного эффектов**
- Фексофенадин (телфаст) – до 24 ч, с 6 лет
- Дезлоратадин (эриус) - >>> эффект, противовоспалительное действие, деконгестант, с 1 года (сироп). При А. рините – уровень доказательности - А
- Левоцетиризин (ксизал) – с 6 лет

Показания к а/гистаминным препаратам 2 и 3 поколений

- Круглогодичный аллергический ринит
- Сезонный аллергический ринит
- Зудящие дерматозы
- Аллергический конъюнктивит
- БА с другими проявлениями АР

Сосудосуживающие средства, зарегистрированные в России

- Фенилэфрин
Адрианол,
Ринза, Колдрекс,
Терафлю,
- Фенилпропаноламин
Колдакт Риниколд
- Псевдоэфедрин
Нурофен стопколд,
Антифлу Клариназе,

Потенциальные ПЭ деконгестантов-симпатомиметиков

- Тахикардия
- Гипертензия
- Возбуждение
- Кардиотоксичность
- Снижение аппетита

Препараты железа

1. Двухвалентные:

- Сорбифер-дурулес - 100 мг Fe + аск.к-та
- Ферроплекс* - 10 мг Fe + аск.к-та
- Актиферрин* - 113,8 мг Fe + серин
- Ферроградумент - 34,8 мг/мл Fe + серин
- Ферроградумент - 105 мг Fe + градумент
- Тотема* - 5 мг/мл Fe + Mn, Mg
- Фенюльс* - 45 мг Fe + аск.к-та, вит. B,
НИК.К-та

Препараты железа

2. Трехвалентное железо:

- Феррум Лек* - г/о п/мальтозный комплекс
5 мг/мл; 100 мг/таб
- Мальтофер - г/о п/мальтозный комплекс
10 мг/мл
- Ферлатум – протеин сукциниллат 40 мг/мл

ПЭ пероральных форм препаратов Fe

- Гипертермия
- Головная боль
- Гиперемия кожи
- Диспепсия
- Запор
- Передозировка – боль в животе, некроз слизистой ЖКТ, коллапс