

[Akceptuje](#)

W ramach naszej witryny stosujemy pliki cookies w celu świadczenia państwu usług na najwyższym poziomie, w tym w sposób dostosowany do indywidualnych potrzeb. Korzystanie z witryny bez zmiany ustawień dotyczących cookies oznacza, że będą one zamieszczone w Państwa urządzeniu końcowym. Możecie Państwo dokonać w każdym czasie zmiany ustawień dotyczących cookies. Więcej szczegółów w naszej [Polityce Prywatności](#)

[Portal](#) [Informacje](#) [Katalog firm](#) [Praca](#) [Szkolenia](#) [Wydarzenia](#) [Porównania międzylaboratoryjne](#)
[Kontakt](#)



[Laboratoria](#)
[.net](#)
[Innowacje](#)
[Nauka](#)
[Technologie](#)

[Logowanie](#) [Rejestracja](#) [pl](#)

Newsletter

zapisz się



[Strona główna](#) > [Start](#)

Bezpieczeństwo leków antyhistaminowych

Leczenie alergii jest zdominowane przez leki antyhistaminowe. Współczesne leki antyhistaminowe skutecznie zwalczają objawy alergicznego nieżytu nosa, spojówek oka, idopatycznej pokrzywki. Nowoczesny antyhistaminik powoduje usunięcie wodnistego kataru, uporczywych napadów kichania, a więc objawów dominujących w alergicznych nieżytach nosa; przeciwdziała świądowi, łzawieniu oczu, itp. W astmie leki przeciwhistaminowe stosowane są czasem w leczeniu wspomagającym. Jak działają te leki na organizm? - zadają sobie to pytanie chorzy na alergię i astmę? Czy nie mają niepożądanych działań ubocznych?



Jaką rolę pełni histamina w chorobach alergicznych?

Histamina inicjuje rozwój zapalenia alergicznego. Mediator ten działa prozapalnie, jak też wpływa m.in. na wydzielanie innych ważnych mediatorów reakcji alergicznej - cytokin. Cytokiny to białka i peptydy wydzielane głównie przez komórki układu odpornościowego. Kontrolują one przebieg procesów zapalnych (oraz działanie i dojrzewanie komórek układu odpornościowego). Należą do nich m.in. interleukiny, interferony i czynniki wzrostowe komórek szpiku kostnego. Histamina poprzez nadmierne uwalnienie cytokin współdecyduje o rozwoju zapalnej reakcji alergicznej.

Jak działają leki antyhistaminowe?

Leki antyhistaminowe działają poprzez blokowanie receptorów komórkowych dla histaminy - głównie tzw. receptorów H1. Receptory komórkowe są to specjalne białka związane albo z błoną, albo z wnętrzem komórki i wrażliwe chemicznie na działanie jakiejś substancji czynnej fizjologicznie - białkowego mediatora, hormonu. Receptory histaminowe są chemicznym "zamkiem" wielu komórek, który otwiera histamina. Wiążąc się ze swym receptorem otwiera dostęp jonom wapnia, co skutkuje eskalacją dotkliwych objawów chorobowych. Okazało się jednak, że struktura chemiczna receptorów komórkowych, w tym histaminowych jest bardzo wrażliwa na wpływ substancji zewnętrznych. Jeśli wcześniej ulegnie zmianie pod wpływem takiej substancji - straci zdolność wiązania się z właściwą fizjologicznie substancją, jaką jest histamina. Ta cecha receptorów, została wykorzystana przez producentów leków antyhistaminowych.

Efektywność lecznicza antyhistaminików zależy od silnego związania się substancji czynnej leku z receptorem komórkowym.

Jak łatwo zauważyć skuteczność leku przeciwhistaminowego zależy od "wygrania" konkurencji z histaminą o receptor. Zdolność wcześniejszego i odpowiednio silnego związania się z receptorem H-1 umożliwia wygraną tej walki. Jednocześnie zamyka tam dostęp histaminie obficie wydzielanej w reakcji na alergen. Tym samym blokada lekowa skutecznie chroni przed wejściem wapnia do wnętrza komórek wielu narządów i związanymi z tym objawami chorób alergicznych.

Jeszcze kilka lat temu leki te stosowano niezbyt chętnie - chociaż już były skuteczne.

Przyczyną były objawy niepożądane - senność, uczucie zmęczenia, tycie i nietolerancja alkoholu. Już wówczas były znacznie bezpieczniejsze od kortykosterydów - gdyż, nawet przy długotrwałym stosowaniu nie powodowały poważnych następstw. W laboratoriach firm farmaceutycznych stale pracuje się jednak nad poprawą bezpieczeństwa tej grupy leków i osiągnięciem lepszych efektów leczniczych. Efektem tych prac są leki tzw. II generacji.

Dlaczego współczesna medycyna przywiązuje dużą wagę do doskonalenie leków przeciwhistaminowych?

Odpowiedź wynika z fizjologii reakcji alergicznej. Histamina jest substancją najobficiej wydzielaną przez komórki tuczne. Co prawda, wraz z nią uwalniane są również inne mediatory zapalenia: prostaglandyny D₂, leukotrieny C₄ i D₄ i czynnik aktywujący płytki krwi - to jednak histamina jest wydzielana w kilkaset razy większej ilości, niż te pozostałe substancje.

W przypadku histaminy zarówno duża jej ilość, jak i jej własności fizykochemiczne wywołują silne i dotkliwe reakcje fizjologiczne. Obfity "wyrzut" histaminy z komórek tucznych wzbudza tzw. wczesną reakcję alergiczną. Składa się na nią uwolnienie tlenu azotu przez komórki śródbłonna, co powoduje rozszerzenie drobnych naczyń krwionośnych i zwiększa ich przepuszczalność. Wskutek tego komórki krwi przenikają do przestrzeni pozanaczyniowej i powodują obrzęk i stan zapalny błon śluzowych nosa, nosogardzieli, oskrzeli, niekiedy błony śluzowej jelit, lub - w przypadku alergii skórnej - zaczerwienienie, obrzęk i stan zapalny skóry gładkiej ciała. Długotrwałe wydzielanie histaminy przez komórki tuczne wywołuje szereg dotkliwych i niebezpiecznych dla zdrowia objawów chorobowych.

Histamina i alergia

Jakie warunki powinien spełniać skuteczny i bezpieczny lek antyhistaminowy?

Idealny lek antyhistaminowy powinien charakteryzować się szybkim początkiem aktywności leczniczej i 24 godzinnym czasem działania. Oznacza to, że powinien możliwie szybko osiągnąć maksymalne stężenie w krwi. Po drugie nie powinien wywołać niekorzystnych objawów ubocznych oraz nie kumulować się w tkankach, nie ulegać rozkładowi w wątrobie i wydalać się możliwie w niezmienionej postaci. Spełniając powyższe warunki powinien skutecznie blokować dokuczliwe objawy alergii.

Jakimi własnościami pod tym względem charakteryzują się obecnie dostępne leki?

Większość leków przeciwhistaminowych, zwanych antagonistami receptorów histaminowych (tzw. receptory H₁) - jest szybko wchłaniana i często osiąga maksymalne stężenie w osoczu krwi już w ciągu 2 godzin. Substancje czynne leków są w znacznym stopniu wiązane przez białka krwi i nie gromadzą się w tkankach. Udokumentowano też, że skuteczność leków przeciwhistaminowych jest wysoka.

Leczenie alergii

Przykładowo, jeden z leków najnowszej generacji - feksofenadyna wchłania się szybko, gdyż w czasie 2,6 godziny osiąga maksymalne stężenie. Wiąże się tylko z białkami krwi i w niezmienionej postaci wydalana z kałem (80%) i z moczem (12%). Tylko 5% leku ulega metabolizmowi, przy czym metabolizm wątrobowy jest minimalny (ok. 0,5-1,5%) a jego wynikiem jest nieaktywny metabolit. Czas półtrwania leku wynosi - 11-15 godzin, co zbliża czas jego działania do wzorca idealnego, gdyż działanie blokujące receptory histaminowe utrzymuje się nawet wówczas, gdy stężenie leku w osoczu jest minimalne.

Czy są jakieś działania niepożądane leków przeciwhistaminowych?

Do niedawna leki antyhistaminowe I generacji powodowały szereg objawów takich, jak: suchość w ustach, bóle głowy, retencja moczu oraz zaburzenia postrzegania i senność. Te ostatnie objawy, zwłaszcza dekoncentracja uwagi uniemożliwiała prowadzenie pojazdów samochodowych, samolotów, itp., co wielu osobom uniemożliwiała, bądź utrudniało pracę zawodową, naukę, czy podróżowanie. Większości działań niepożądanych leków I generacji nie wykazywały leki II generacji.

Pierwszym lekiem, który nie powodował takich objawów był astemizol. Okazało się jednak, że

w połączeniu z innymi lekami może powodować zaburzenia pracy serca, więc jest obecnie w większości krajów wycofywany. Kolejnym lekiem była cetyryzyna; krótko później zsyntetyzowano loratadynę. Oba te leki nazywa się obecnie "lekami antyhistaminowymi drugiej generacji", chociaż przy stosowaniu cetyryzyny nadal nie zaleca się prowadzenia samochodu (to samo dotyczy dużych dawek loratadyny). Leki te, dzięki wygodnemu dawkowaniu - raz dziennie - stały się bardzo popularne. Są wygodną alternatywą dla hormonów w alergicznym nieżycie nosa, spojówek oka i w przypadkach pokrzywki; w astmie stosowane są czasem jako leczenie wspomagające.

Oto, co mówi jeden ze znanych lekarzy badający bezpieczeństwo stosowania leków przeciwhistaminowe pod kątem takich objawów niepożądanych, jak zaburzenia sprawności postrzegania i senność:

- Poddaliśmy 15 zdrowych ochotników w podeszłym wieku ocenie wpływu kilku leków przeciwhistaminowych. Ci, którzy otrzymali lek drugiej generacji (loratadynę lub cetyryzynę) odczuwali wyraźnie mniejszy wpływ tych leków, niż otrzymujący leki pierwszej generacji." Leki przeciwhistaminowe przeszły bowiem znaczną przemianę od leków pierwszej generacji do leków drugiej generacji, takich jak feksofenadyna, czy loratadyna, które są lepiej tolerowane i równie skuteczne w leczeniu alergicznego nieżyty nosa, czy pokrzywki idopatycznej. Warto podkreślić, że leki najnowszej generacji - np. wspomniana feksofenadyna, jak też ebastyna nie wykazują wpływu na układ nerwowy.

Bezpieczne dla serca i układu krążenia

Zastrzeżenia co do bezpieczeństwa leków antyhistaminowych wobec serca i układu krążenia pojawiły się w końcu lat 80-tych. Początkowo dotyczyły migotania komór serca po przedawkowaniu astemizolu. Dokładne badania przyczyn tych zaburzeń, jakie pojawiły się również pod wpływem innego leku przeciwhistaminowego terfenadyny - ujawniły, że ich przyczyną jest hamowanie funkcji tzw. kanałów przewodzących jony potasowe do serca - co utrudniało dopływ tego biopierwiastka, niezbędnego dla poprawnej kurczliwości włókien mięśniowych serca. Powstająca wskutek tego tachyarytmia - zagrażała życiu pacjenta. Wspomniane leki zostały wycofane, jak też w niektórych krajach nie zarejestrowano innego leku - ebastyny, który również hamował transport potasu do mięśnia sercowego. Pod wpływem powyższych negatywnych doświadczeń - badanie nowych leków, pod kątem ich wpływu na drożność kanałów potasowych - stało się standardem. Przykładowo - antyhistaminik najnowszej generacji - feksofenadyna został dokładnie przebadany pod tym względem w wielu badaniach przedklinicznych i klinicznych. Dopiero po dokładnym upewnieniu się, co do braku działań niepożądanych i został dopuszczony do powszechnej praktyki medycznej.

Leki antyhistaminowe nie są toksyczne

Lek zanim znajdzie się w sprzedaży przechodzi wielostronne i precyzyjne badania przedkliniczne i kliniczne testujące jego wpływ na organizm. W przypadku leków antyhistaminowych badania takie dokonuje się najpierw na zwierzętach, z zastosowaniem bardzo wysokich dawek (po to m.in. aby ustalić minimalnie skuteczną dawkę dla ludzi), a następnie dopiero bada się wpływ leczniczy na ludzi (najpierw wyłącznie wpływ na ochotników). W tych ostatnich badaniach ocenia się wpływ leku na wątrobę, nerki oraz inne ważne narządy i funkcje organizmu. Np. w czasie wszechstronnych badań jednego z leków (feksofenadyny) nie stwierdzano żadnych istotnych działań ubocznych leku. W badaniach na zwierzętach nie stwierdzono np. żadnego negatywnego wpływu na płodność, liczebność miotów, czy obumieranie płodów. Pomimo to, ze względów na daleko posunięta ostrożność leków z tej grupy, tak jak i wielu innych bezpiecznych dla zwierząt nie zaleca się kobietom w ciąży, jak też matkom karmiącym. Jednak o bezpieczeństwie tej grupy leków dla chorych świadczyć może zastosowanie jednego z leków (cetyryzyny) w profilaktyce astmy u niemowląt wysokiego ryzyka, tj. uczulonych na roztocze kurzu domowego i pyłki traw. Pomimo wysokich dawek

leku odsetek małych pacjentów, którzy przerwali kurację był niski, a objawy niepożądane rzadkie.

Brak interakcji i objawów ubocznych

Zaletą leków antyhistaminowych nowej generacji jest - w odróżnieniu od starej - brak wyraźnego antagonizmu z pokarmami, alkoholem (w umiarkowanych dawkach) i lekami stosowanymi w leczeniu chorób alergicznych. Bardzo rzadkie i nieistotne dla zdrowia są interakcje z innymi lekami. Przeciwnie, w przypadku łącznej kuracji z glikokorykosteroidami stwierdza się synergizm, pozwalający zmniejszyć dawkę tych ostatnich. (A jak wiemy glikokorykosteroidy nie zawsze są obojętne dla zdrowia.)

Dzięki postępowi w przemyśle farmaceutycznym leczenie objawów chorób alergicznych - bo samych chorób nie umiemy leczyć inaczej, niż przez odczulanie - stało się dziś skuteczne i bezpieczne. Same leki jednak nie wystarczą. Chorzy na alergię powinni przestrzegać zdrowego trybu życia: nie palić tytoniu, unikać alkoholu (wino i piwo może być silnym alergenem), walczyć z nadwagą (szczególnie ważne dla chorych z astmą), zażywać dużo ruchu, unikać nadmiernego nasłonecznienia. Powinni też, jeśli znają swój alergen, eliminować w miarę możliwości ze swojego otoczenia; istnieją specjalne odkurzacze dla chorych na astmę, dostępne są kalendarzyki z okresami pylenia poszczególnych gatunków roślin itp. Ale uwaga - bezpieczne leki nie oznaczają, że sama choroba nie naraża nas na niebezpieczeństwo nieoczekiwanej reakcji uczuleniowej. Toteż jeśli czasami kusi nas, by poeksperymentować z niezwykle skutecznym lekiem, który lekarz przepisał znajomemu, albo z preparatami ziołowymi. **NIGDY TEGO NIE RÓBMY BEZ POROZUMIENIA Z NASZYM LEKARZEM!** Chorzy na alergię mogą gwałtownie reagować na niektóre leki, przede wszystkim na preparaty ziołowe, ale także na zwykłą aspirynę i środki przeciwbólowe.

*Oprac. mgr Edward Ozga Michalski
Konsultacja Prof. dr hab. med. Andrzej Danysz
Źródło: www.mp.pl*

<http://laboratoria.net/home/15402.html>

Informacje dnia: [Nietypowy czerwony cydr wyprodukowano na SGGW Polskie nietoperze nie boją się blasku Księżycy NASA: Odyseusz pomyślnie wylądował na Księżycu Dłuższy palec serdeczny to... lepsze wykorzystanie tlenu Ograniczenie stosowania antybiotyków przynosi korzyści](#) [Dzięgiel chiński może wzmacniać kości Nietypowy czerwony cydr wyprodukowano na SGGW Polskie nietoperze nie boją się blasku Księżycy NASA: Odyseusz pomyślnie wylądował na Księżycu Dłuższy palec serdeczny to... lepsze wykorzystanie tlenu Ograniczenie stosowania antybiotyków przynosi korzyści](#) [Dzięgiel chiński może wzmacniać kości](#)

Partnerzy