

Северный государственный медицинский университет
Кафедра клинической фармакологии
Заведующая кафедрой: д.м.н., профессор Воробьева Надежда Александровна
Преподаватель: к.м.н., доцент Белякова Ирина Вячеславовна

Антигистаминные средства

Выполнила студентка
6 курса педиатрического факультета
2 группы Бабицкая Д.А.

- Аллергические заболевания в настоящее время представляют серьезнейшую проблему практического здравоохранения.
- Занимают 3-е место после сердечно-сосудистых и онкологических болезней у человека.
- Этими заболеваниями страдают от 13,9 до 35% населения России.

- Аллергическая реакция представляет собой ответ иммунной системы на антигены (или аллергены), например пыльцу или пыль, которые в других условиях не причиняют человеку какого-либо вреда.
- Аллергические реакции чаще всего возникают со стороны кожи, верхних и нижних дыхательных путей и желудочно-кишечного тракта (ЖКТ).
- Их проявления включают в себя крапивницу и экзему, сезонный аллергический ринит, круглогодичный аллергический ринит, астму и пищевую аллергию.

- В развитии аллергических реакций принимают участие 2 типа рецепторов – H1- и H2-рецепторы.
- Локализация H1 -рецепторов – гладкие мышцы бронхов, артерий, пищеварительной системы и мочевого пузыря, сердце и головной мозг.
- Локализация H2-рецепторов цГМФ – слизистая оболочка желудка, слюнные железы, мускулатура матки, сердце, головной мозг, тучные клетки, базофилы, эозинофилы, лимфоциты и тромбоциты.

- Со стороны кожи типичными клиническими проявлениями действия гистамина являются зуд, гиперемия, отек.
- В воздухоносных путях – отек слизистой носа, гиперсекреция слизи в носу, бронхоспазм, гиперпродукция слизи бронхиальными железами.
- В ЖКТ – боли, усиление продукции пепсина, соляной кислоты в желудке, избыточное образование слизи.
- В сердечно-сосудистой системе – падение артериального давления, нарушение сердечного ритма.

- Существует несколько классификаций АГП, хотя ни одна из них не является общепринятой. Согласно одной из наиболее популярных классификаций АГП подразделяют на препараты I, II и III поколения.

- К I поколению АГП относят:
хлоропирамин, дифенгидрамин,
клемастин, ципрогептадин, прометазин,
фенкарол, мебгидролин, гидроксизин,
диметинден.
- Ко II поколению – лоратадин,
акривастин, левокабастин, азеластин,
эбастин, терфенадин, астемизол.
- К III поколению – цетиризин,
фексофенадин, дезлоратадин.

I поколение

1. Седативное действие.
2. Анксиолитическое действие.
3. Атропиноподобные реакции.
4. Противорвотный и противоишемический эффект.
5. Антисеротониновый эффект.
6. Местноанестезирующее (кокаиноподобное) действие.

I поколение

- Отличаются относительно быстрым наступлением клинического эффекта, но кратковременностью воздействия, из-за чего их приходится назначать довольно часто – до 3–4 раз в сутки.
- Для этих препаратов характерно развитие тахифилаксии – снижения антигистаминной активности при длительном приеме. Поэтому их следует применять короткими курсами (по 5–7 дней) с последующей заменой на другой препарат, если остается необходимость в их применении.
- В настоящее время АГП I поколения применяют преимущественно для купирования острых аллергических реакций в ситуациях, когда преобладают реакции ранней фазы аллергического воспаления.

Противопоказаниями для применения АГП I поколения являются:

работа, требующая психической и двигательной активности, внимания; бронхиальная астма; язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки со стенозирующими явлениями в пилорической и дуоденальной области; аденома предстательной железы, задержка мочеиспускания и некоторые другие. Их нельзя принимать с успокаивающими, снотворными препаратами, ингибиторами моноаминоксидазы, противодиабетическими средствами.

Преимущества

- возможность применения у детей грудного возраста;
- возможность парентерального введения при острых аллергических реакциях, оказании неотложной помощи;
- антихолинергический и седативный эффект, способствующий значительному уменьшению выраженности кожного зуда – причины бессонницы и снижения качества жизни;
- высокая эффективность при холинергической крапивнице;
- возможность использования при премедикации перед диагностическими и хирургическими вмешательствами (для предупреждения высвобождения гистамина неаллергического генеза);
- симптоматическое лечение острых респираторных заболеваний (местное и системное назначение в составе комбинированных препаратов)

II поколение

- Высокая специфичность и высокое сродство к H₁-рецепторам при отсутствии влияния на холиновые и серотониновые рецепторы.
- Быстрое наступление клинического эффекта и достаточная продолжительность антигистаминного эффекта (до 24 ч). Пролонгация может достигаться за счет высокого связывания с белком, кумуляции препарата и его метаболитов в организме и замедленного выведения.
- Минимальный седативный эффект при использовании препаратов в терапевтических дозах, что объясняется слабым прохождением гематоэнцефалического барьера вследствие особенностей структуры этих средств. У некоторых особенно чувствительных лиц может наблюдаться умеренная сонливость, которая редко бывает причиной отмены препарата.
- Отсутствие связи абсорбции с приемом пищи.
- Отсутствие тахифилаксии при длительном применении.
- Являются пролекарствами

- Противопоказания для применения АГП II поколения: индивидуальная непереносимость; беременность; период лактации.

III поколение

- являются активными метаболитами (а не пролекарствами), поэтому быстрее развивается эффект; высокая предсказуемость противоаллергического действия; нет дополнительной нагрузки на печень; безопасность одновременного приема с другими лекарствами, подвергающимися метаболизму через цитохромы Р-450. Не влияют на интервал QT;
- влияют не только на раннюю (гистаминазависимую), но и на позднюю (клеточную) фазу аллергической реакции, чем объясняется способность этих препаратов устранять ринорею, чиханье и заложенность носа при аллергическом рините, а также предотвращать развитие бронхиальной астмы у больных с аллергическим ринитом и дерматитом.

Применения у детей

- Цетиризин в каплях для приема внутрь может использоваться только с 6 мес.
- Инъекционная форма хлоропирамина, разрешенного с 1 мес, применяется только в особых случаях, когда врач расценивает состояние ребенка как угрожающее развитием острых аллергических реакций.
- Единственным дозированным препаратом, применяемым с 1 мес, является диметиндена малеат (Фенистил).

Таким образом, имея столь широкий круг антигистаминных препаратов, врач имеет возможность выбирать лекарственное средство в зависимости от возраста пациента, конкретной клинической ситуации, диагноза. Антигистаминные препараты 1-го, 2-го и 3-го поколения остаются неотъемлемой частью комплексного лечения аллергических заболеваний у взрослых и детей.