

Aerius

desloratadinum

Úvod

Významným pokrokem v antialergické léčbě byl vývoj antihistaminik II. generace, která mají oproti starším léčivům snížené sedativní účinky, rychlejší nástup účinku, působí dlouhodoběji a potlačují alergický zánět. K antihistaminikům II. generace pro systémovou aplikaci užívaným v České republice patří kromě cetirizinu a levocetirizinu i loratadin a nejnověji jeho aktivní metabolit desloratadin (Aerius, Schering-Plough).

Charakteristika

Desloratadin (DL) je dlouhodobě účinkující antagonist histaminových receptorů se selektivním účinkem na periferní H_1 -receptory (z užívaných antihistaminik má nejvyšší afinitu k H_1 -receptorům). Inhibuje i uvolňování prozánětlivých cytokinů z mastocytů a bazofilů (podle jedné studie je inhibice některých prozánětlivých interleukinů srovnatelná s dexametazonem); na epitelu nosní sliznice inhibuje DL expresi adhezivní molekuly antigenů ICAM-1 a HLA-DR. Neprostupuje do centrálního nervového systému, nemá proto centrálně tlumivé účinky. Zvýšení účinnosti DL oproti loratadinu je způsobeno odstraněním nutnosti přeměny loratadinu na aktivní látku; DL má výrazně vyšší afinitu k H_1 -receptoru. Účinek DL nastupuje rychle po vstřebání ze střeva a není závislý na příjmu potravy. U pacientů s alergickou rinitidou vede podávání DL k ústupu příznaků, jako je nosní obstrukce, kýchání, výtok z nosu a svědění nosu, svědění, slzení a zarudnutí očí a svědění na patře, u pacientů s urtikárií vede k ústupu svědění a snížení počtu a rozsahu kopřivkových pupenů. DL působí po celých 24 hodin, podává se proto jedenkrát denně.

Klinické studie

Účinnost a bezpečnost desloratadinu v obou hlavních indikacích byla prokázána v řadě klinických studií.¹ Metaanalýza 13 studií (do kterých bylo zařazeno více než 3 000 pacientů) ukázala, že u pacientů s **alergickou rinitidou** vedlo podávání DL k ústupu nosní kongesce, kýchání, sekrece a svědění, ke zmírnění slzení, svědění a zarudnutí očí a svědění patra i k potlačení známek eozinofilního zánětu.² Účinnost DL byla prokázána i u dětí s alergickou rinitidou.³ Významné výsledky přinesly dvě prospektivní, randomizované, placebem kontrolované studie zve-

řejněné v roce 2008. Studie ACCEPT1 (Aerius Control: Clinical and Epidemiological Profile of Treatment-1) prokázala, že u pacientů s intermitentní alergickou rinitidou je DL významně účinnější než placebo, a to již po prvním dni léčby.⁴ DL zlepšoval i kvalitu života, kvalitu spánku a snižoval omezení denních aktivit způsobené alergickou rinitidou. Podávání DL je výhodné rovněž po farmakoekonomické stránce (např. léčba umožňuje bez obtíží vykonávat zaměstnání, zkracuje délku pracovní neschopnosti apod.). V další studii, nazvané ACCEPT2, byla prokázána účinnost a bezpečnost DL jako léčby pacientů s perzistující alergickou rinitidou.⁵ Alergická rinitida je podle dnešního pojetí součástí komplexního alergického postižení dýchacích cest; DL ve studii, do které byli zařazeni pacienti s alergickou rinitidou a lehčím astmatem, tlumil i projevy astmatu.

V placebem kontrolovaných šestidenních studiích, kterých se zúčastnili pacienti s **chronickou idiopatickou urtikárií**, vedlo podávání DL už na konci prvního dne léčby k ústupu svědění a ke snížení počtu a rozsahu kopřivkových pupenů. Účinek přetrvával 24 hodin. DL také snížil narušení spánku a denních aktivit.⁶

Pokud jde o užití DL u malých dětí, byla ověřena účinnost i bezpečnost formy určené dětem od jednoho roku věku (perorální roztok).⁷ Nesedativní charakter DL pomáhá zabránit při léčbě dětí narušení procesu učení a dalších aktivit.

Indikace

Zmírnění příznaků spojených s alergickou rýmou a s urtikárií.

Kontraindikace, nežádoucí účinky

Kontraindikací je přecitlivělost na složky přípravku. Přípravek je dobře snášen, ve srovnání s placebem byly častěji zaznamenány únava, sucho v ústech a bolesti hlavy.

Dávkování

Aerius je v České republice k dispozici ve formě potahovaných tablet (s obsahem 5 mg DL v 1 tableti), a roztoku pro perorální aplikaci (s obsahem 0,5 mg DL/ml). Dávkování: potahované tablety – děti od 12 let a dospělí 1 tbl denně; roztok pro perorální aplikaci – děti 1–5 let 2,5 ml denně; děti 6–11 let 5 ml denně; děti od 12 let a dospělí 10 ml denně.

Literatura

- Seberová E. Desloratadin – charakteristika a postavení mezi antihistaminiky. *Farmakoterapie* 2008;4:47–53.
- Canonica GW, Tarantini F, Compalati E, Penagos M. Efficacy of desloratadine in the treatment of allergic rhinitis: a meta-analysis of randomized, double-blind, controlled trials. *Allergy* 2007;62:359–366.
- Tassinari P, Suárez NR, Centeno J, et al. Improvement of symptoms in children 6 to 12 years with allergic rhinitis seen with desloratadine therapy with or without concomitant corticosteroids. *J Allergy Clin Immunol* 2007;119(suppl 1):S63.
- Bachert C, et al. Desloratadine significantly reduces nasal congestion and other individual symptom scores in subjects with intermittent allergic rhinitis: the ACCEPT1 study in collaboration with GA²LEN. XXVII. Congress of the European Academy of Allergy and Clinical Immunology (EAACI), abstracts. Barcelona, 2008. Abstract 1760.
- Bachert C, et al. Desloratadine treatment has an early and enduring effect on nasal congestion and other symptoms in subjects with persistent allergic rhinitis: ACCEPT-2 study in collaboration with GA²LEN. American College of Allergy, Asthma and Immunology (ACAAI) annual conference, abstracts. Seattle, 2008. Abstract 356.
- Ortonne JP, Grob J-J, Auquier P, Dreyfus I. Efficacy and safety of desloratadine in adults with chronic idiopathic urticaria. *Am J Clin Dermatol* 2007;8:37–42.
- Prenner B, Ballona R, Bueso A, et al. Safety of desloratadine syrup in children six months to younger than 2 years of age: A randomized, double-blinded, placebo-controlled study. *Pediatr Asthma Allergy Immunol* 2006;19:91–99.

Další literatura u autora.

Poznámka: Statut přípravků: léčivé přípravky, vázané na lékařský předpis. Úhrada z prostředků veřejného zdravotního pojištění: viz Číselník VZP. Profil vypracoval autorský kolektiv pod vedením MUDr. Pavla Kostiuka, CSc., s použitím odborné literatury a SPC dle poslední revize.

