

Aerius

desloratadinum

ÚVOD

Významným pokrokem v antialergické léčbě byl vývoj antihistaminik 2. generace, která mají oproti starším léčivům snížené sedativní účinky, rychlejší nástup účinku, působí dlouhodoběji a potlačují alergický zánět. K antihistaminikům 2. generace pro systémovou aplikaci užívaným v České republice patří (kromě cetirizinu a levocetirizinu) loratadin a jeho aktivní metabolit desloratadin (Aerius, Schering-Plough).

CHARAKTERISTIKA

Desloratadin (DL) je dlouhodobě působící antagonist histaminových receptorů se selektivním účinkem na periferní H_1 -receptory (z užívaných antihistaminik má nejvyšší afinitu k H_1 -receptorům). DL inhibuje i uvolňování prozánětlivých cytokinů z mastocytů a bazofilů (podle jedné studie je inhibice některých prozánětlivých interleukinů srovnatelná s dexametazonem).¹ Na epitelu nosní sliznice inhibuje DL expresi adhezivní molekuly ICAM-1 a HLA-DR antigenů.² Neprostupuje do centrální nervové soustavy, 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, kýčání, výtok z nosu a svědění nosu, svědění, slzení a zarudnutí očí a svědění na patře, u pacientů s urtikárií k ústupu svědění a snížení počtu a rozsahu kopřivkových pupenů. Působení DL trvá 24 hodin, lék se proto podává jedenkrát denně.

KLINICKÉ STUDIE

Účinnost a bezpečnost desloratadinu byla prokázána v řadě klinických studií.³ 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, kýčání, sekrece a svědění, k ústupu slzení, svědění a zarudnutí očí a svědění patra i k potlačení známek eozinofilního zánětu.⁴ Účinnost DL byla prokázána i u dětí s alergickou rinitidou.⁵ Významné výsledky přinesly dvě prospektivní, randomizované, placebem kontrolované studie, zveřejněné 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.⁶ DL zlepšoval rovněž kvalitu života, kvalitu spánku a snižoval omezení denních aktivit způsobené alergickou rinitidou. Podávání DL je

výhodné i farmakoekonomicky (např. léčba umožňuje bez obtíží vykonávat zaměstnání, zkracuje délku pracovní neschopnosti apod.). V další studii, ACCEPT2, byla prokázána účinnost a bezpečnost DL u pacientů s perzistující alergickou rinitidou.⁷ 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.⁸

V placebem kontrolovaných šestitýdenních studiích, kterých se zúčastnili pacienti s **chronickou idiopatickou urtikárií**, vedlo podávání DL už na konci 1. dne léčby k ústupu svědění a snížení počtu a rozsahu kopřivkových pupenů. Účinek přetrvával 24 hodin. DL snížil narušení spánku a denních aktivit.⁹

Byla prokázána i účinnost a bezpečnost tekuté formy DL, určené dětem od 1 roku.¹⁰ 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: tablety – děti od 12 let, dospělí 1 tbl denně; roztok – 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

1. Bousquet J, Bindslev-Jensen C, Canonica GW, et al. The ARIA/EAAI criteria for antihistamines: an assessment of the efficacy, safety and pharmacology of desloratadine. *Allergy* 2004;59(Suppl 77):4–16.
2. Vignola AM, Crampette L, Moudain M, et al. Inhibitory activity of loratadine and desloratadine on expression of ICAM-1 and HLA-DR by nasal epithelial cells. *Allergy* 1995;50:200–203.
3. Seberová E. Desloratadin – charakteristika a postavení mezi antihistaminiky. *Farmakoterapie* 2008;4:47–53.
4. 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.
5. Tassinari P, Suárez N, 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;199(Suppl 1):S63.
6. 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 GALEN. XXVII. Congress of the European Academy of Allergy and Clinical Immunology (EAACI), abstracts. Barcelona, 2008. Abstract 1760.
7. Bachert C, et al. Desloratadine treatment has an early and enduring effect on nasal congestion and other symptoms in subjects with persistent allergic rhinitis: ACCEPT2 study in collaboration with GALEN. American College of Allergy, Asthma and Immunology (ACAAI) annual conference, abstracts. Seattle, 2008. Abstract 356.
8. Baena-Cagnani C. Desloratadine improved asthma symptoms and decreased beta-2 agonist use in patients with seasonal allergic rhinitis and concomitant asthma. *Allergy* 2001;56(Suppl 68):Abstr 60.
9. Ortonne JP, Grob J-J, Pascal A, Dreyfus I. Efficacy and safety of desloratadine in adults with chronic idiopathic urticaria. *Am J Clin Dermatol* 2007;8:37–42.
10. 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.

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



léčivé přípravky