

*Кучкаров А. А., Ботиров К. З. Хамидов Ф. Ш., Кучкаров А. А.,*

*Абдурахманов А. А., Муминов М. М.*

*Андижанский Государственный медицинский институт*

## **В ЛЕЧЕНИИ КРАПИВНИЦЫ**

**Аннотация:** В данной статье обсуждается эффективность аллернова в лечении крапивницы

**Ключевые слова:** лекарственные препараты, крапивница, эффективность аллернова

*Kuchkarov A. A., Botirov K. Z. Khamidov F. Sh., Kuchkarov A. A.,*

*Abdurakhmanov A. A., Muminov M. M.*

*Andijan State Medical Institute*

## **IN THE TREATMENT OF URTICARIA**

**Abstract:** This article discusses the effectiveness of Allernov in the treatment of urticaria.

**Key words:** drugs, urticaria, Allernov effectiveness

В настоящее время часто встречаются аллергические заболевания, распространение которых напрямую связано с ростом вредных производств, постоянным увеличением количества автомобилей, загрязнением окружающей среды. Несмотря на широкий спектр и различные лекарственные формы противоаллергических препаратов, ученые продолжают поиск и разработку средств нового поколения. Перед учеными поставлена задача – создание лекарств, идеально сочетающих в себе антигистаминную, противоаллергическую, противовоспалительную активность, при этом свободных от недостатков своих предшественников.

Первые лекарственные препараты, обладающие антигистаминной активностью, были синтезированы еще в 1936 г. (Bovet D., Staub A.). Но уже в 60-х годах XX в. была доказана гетерогенность рецепторов гистамина в организме ( $H_1$ ,  $H_2$  и  $H_3$ ), подтипы которых различаются по

строению, локализации и физиологическим эффектам, возникающим при их активации и блокаде. Это открытие ознаменовало начало периода активного синтеза и клинических исследований антигистаминных препаратов, которые сегодня насчитывают уже 3 поколения.

К первому поколению относятся так называемые седативные антигистаминные средства. Для этих препаратов характерна обратимая связь с  $H_1$ -рецептором и наличие побочных седативного и  $M$ -холинергического эффектов. К побочным явлениям антигистаминных препаратов I поколения относится слабость, сонливость, головокружение, тошнота, снижение концентрации внимания. Их следует применять несколько раз в сутки и менять каждые 10 дней.

Препараты второго поколения более стойко связываются с рецепторами, что и определяет длительность их действия – до 34 часов. Им свойственны быстрое начало действия и большая безопасность. При этом, как было установлено большинство средств второго поколения в организме проходит ряд превращений прежде, чем образуется активно действующий метаболит. К препаратам второго поколения относится Цетиризин, который в меньшей степени подвергается метаболизму. На протяжении многих лет было известно, что он является смесью двух изомеров, только один из которых преимущественно связывается с рецептором. В 2001 году удалось применить технологию, позволяющую выделить изомер левоцетиризин. Безусловным преимуществом обладают новые антигистаминные средства третьего поколения, полученные на основе фармакологически активных метаболитов. В последние годы на фармацевтическом рынке Узбекистана присутствует левовращающий оптический изомер цетиризина, селективный обратный агонист  $H_1$ -рецепторов – Аллернова. Избирательность левоцетиризина в отношении  $H_1$ -гистаминовых рецепторов в два раза выше по сравнению с цетиризином, а также в 600 раз выше, чем к другим receptorам и ионным

каналам, близким по структуре, в связи с чем его антихолинэргическое и антисеротониновое действие сводится к минимуму. Фармакодинамика и фармакокинетика Аллернова достаточно хорошо изучены. Аллернова быстро всасывается в кишечнике, достигая максимальной концентрации в плазме через 0,5–1 час после приема. Биодоступность препарата близка к 100% – это значит, что препарат почти полностью попадает в системный кровоток (около 100% относительно исходной дозы препарата). Из кишечника левоцетиризин транспортируется в печень, а оттуда поступает в кровоток. Аллернова – это конечный метаболит, он не проходит печеночный метаболизм, чтобы стать активным. Аллернова не взаимодействует с цитохромом печени Р450, поэтому у него нет конкурентного лекарственного взаимодействия. Это дает возможность сочетать его с антибиотиками, противогрибковыми и другими препаратами и применять у пациентов с патологией печени. Аллернова можно сочетать с другими препаратами, он лишен кардиотоксического действия.

Эффективность левоцетиризина доказана многими клиническими исследованиями. Так, в Бельгии в исследовании с участием 1290 пациентов с сезонным аллергическим ринитом, не поддающимся стандартной терапии, было показано, что применение Аллернова в количестве 5 мг один раз в сутки в течение 4 недель эффективнее использовавшихся прежде средств.

В исследовании, которое проводилось в 5 странах Европы и включало 551 пациента с аллергическим ринитом с сенсибилизацией к пыльце трав и домашней пыли, было установлено, что Аллернова обладает высокой клинической эффективностью, улучшает качество жизни и снижает стоимость длительного лечения аллергического ринита. Исследование клинической эффективности Аллернова в дозе 5 мг в сутки при лечении хронической крапивницы через 4 недели терапии показало снижение проявлений симптомов зуда, количества и размеров высыпаний.

Уже получен положительный опыт применения левоцетиризина при лечении атопического дерматита, хронической экземы, псориаза.

Исследования, проведенные на животных, не выявили прямого или опосредованного вредного эффекта на беременность, развитие эмбриона или плода, роды или постнатальное развитие. Контролируемых клинических исследований по безопасности применения препарата у беременных женщин не проводилось, поэтому препарат не следует назначать при беременности.

Аллернова – препарат последнего, 3 поколения антигистаминных средств, обладающий мощным и длительным антиаллергическим действием. Левоцетиризину помогает не только на ранней, но и на поздней фазе аллергической реакции, оказывая как антигистаминное, так и противоздунное действие. Он имеет хороший профиль безопасности, не взаимодействует с пищей и лекарственными препаратами. Аллернова предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэксудативное, противоздунное действие; практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинергического действия. Применяется против широкого спектра аллергических реакций и используется для симптоматического лечения круглогодичного (персистирующего) и сезонного аллергического ринита и конъюнктивита (зуд, чиханье, ринорея, слезотечение, гиперемия конъюнктивы), сенной лихорадки (поллиноз), крапивницы, в т.ч. хронической идиопатической крапивницы; при отеке Квинке, аллергическом дерматозе, сопровождающемся зудом и высыпаниями.

Аллернова – препарат, который начинает действовать уже через 12 минут после приема внутрь, причем независимо от приема пищи и времени суток. Для устранения всех симптомов аллергии достаточно 1 таблетки соответствующей дозировки в сутки, как на ранней, так и на поздней стадии аллергической реакции. Препарат может быть показан для

длительного применения (в среднем от 1 до 6 недель, существует также клинический опыт применения препарата до 18 месяцев).

Выпускается препарат в таблетках, покрытых пленочной оболочкой Аллернова (левоцетиризина дигидрохлорид 5 мг соответствует 4,21 мг левоцетиризина) «Advance Pharmaceutical Business».

Нами было проведено лечение 65 больных крапивницей, рекомендуемая доза Аллернова для взрослых и детей старше 6 лет составляла 5 мг в сутки, длительность приема зависела от симптомов заболевания и распространенности патологического процесса. В среднем курс лечения составил от 1 до 4 недель. Пяти больным при хронической форме крапивницы (круглогодичный ринит, хроническая идиопатическая крапивница) курс был увеличен до 5 месяцев (существует клинический опыт применения препарата до 18 месяцев при длительно текущих и тяжелых формах крапивницы). Из побочных эффектов в некоторых случаях (у 5 пациентов) отмечалась повышенная утомляемость и сонливость: таким пациентам мы рекомендовали применять препарат в вечернее время суток. У 4 пациентов отмечались жалобы на сухость во рту и тошноту, однако после первой недели приема левоцетиризина диспептические явления снижались. У всех больных наблюдался хороший терапевтический эффект (отмечался полный регресс высыпаний, исчезновение клинических симптомов крапивницы, таких как зуд) и увеличение периода ремиссии. Также в нашем исследовании принимали участие 10 пациентов с выраженными клиническими симптомами аллергического дерматита (зуд, высыпания) и 3 пациент с тяжело протекающим аллергическим конъюнктивитом. Они отмечали значительный противозудный эффект уже после первого дня приема препарата.

Проведенное исследование позволяет сделать вывод, что Аллернова – современный эффективный антигистаминный препарат последнего поколения обладает высоким профилем безопасности, быстро действует.

Аллернова является достойным представителем антигистаминных средств последнего поколения.

### Литература

1. Гущин И.С. Разнообразие противоаллергического действия цетиризина // РАЖ. 2006. № 4. С. 33–44.
2. Астафьева Н.Г., Гамова И.В., Удовиченко Е.И., Перфилова И. А. Левоцетиризин: современные аспекты применения при аллергических заболеваниях с точки зрения доказательной медицины, Клиническая фармакология, № 5, 2010
3. Трусова О.В., Коростовцев Д.С. Левоцетиризин (Ксизал). Характеристика препарата и опыт клинического применения. Аллергология, № 2, 2006
4. Сулима В.В., Сулейманов С.Ш., Васильева М.М., Абросимова Н.В., Молчанова О.В. Фармакоэкономические аспекты применения антигистаминных препаратов в лечении аллергических заболеваний. Аллергология, №3 2005
5. Taxa T.B., Новые возможности в терапии крапивницы, РМЖ №12,2010
6. K. Kontou–Fili Clinical advantages of dual activity in urticaria Allergy 2000: 55: 28–33.
7. Fineman S.M. Urticaria and Angioedema. Manual of Allergy and Immunology, 1988, p.214–24.
8. Breneman D, Bronsky EA, Bruce S et al. Cetirizine and astemizole therapy for chronic idiopathic urticaria: a double-blind, placebocontrolled comparative trial. J Am Acad Dermatol 1995; 33:192–

9. Abramovits W., Gupta A. Xyzal (levocetirizine dihydrochloride) // Skinmed. 2008, Mar–Apr; 7 (2). P. 84–85.
10. Chen C. Physicochemical, pharmacological and pharmacokinetic properties of the zwitterionic antihistamines cetirizine and levocetirizine // Curr Med Chem. 2008. 15 (21). P. 2173–2191.
11. Klimek L. Levocetirizine: from scientific evidence to a potent modern–day treatment of today’s allergic patients // Drugs Today (Barc). 2009. Mar. 45 (3). P. 213–225.
12. Strolin M. et al. Absorption, distribution, metabolism and excretion of levocetirizine, the R enantiomer of cetirizine, in healthy volunteers // Eur J Clin Pharmacol. 2001. 57. P. 571–582.
13. De Esch et al. Trends Pharmacol // Sci. 2005. 26. 462.
14. Gillard M., Christophe B., Wels B. et al. H1 antagonists: receptor affinity versus selectivity // Inflamm Res. 2003, Apr. 52. Suppl 1: S49–50.
15. Leurs R., Church M. K., Taglialatela M. H<sub>1</sub>–antihistamines: inverse agonism, anti–inflammatory actions and cardiac effects // Clin Exp Allergy. 2002. 32. P. 489–498.