

Bilastyna w terapii schorzeń alergicznych

Therapy of joint pain using diclofenac



lek., mgr zdr. publ. Jan W. Pęksa^{1,2}

¹Poradnia Lekarza Rodzinnego „COR VITA” w Krakowie

²Oddział Kliniczny Kardiologii i Elektrokardiologii Interwencyjnej oraz Nadciśnienia Tętniczego, Szpital Uniwersytecki w Krakowie

ORCID: 0000-0001-5474-6439

Nr art. GP.202301.01 © P

■ **Słowa kluczowe:** bilastyna, leki przeciwhistaminowe, alergie, podstawowa opieka zdrowotna.

■ **Streszczenie:** Alergie wynikają z nadmiernej reakcji układu odpornościowego na kontakt z alergenami. Powszechnie spotykane alergeny znajdują się w pyłkach traw i zbóż, roztoczech kurzu domowego, wydzielinach zwierząt domowych, w jądzie owadów, w niektórych składnikach żywności oraz w lekach. W części przypadków objawy alergii mogą być bardzo uciążliwe i znacząco obniżają jakość życia pacjentów. Jedną z opcji terapeutycznych stosowanych w przypadku alergii są leki przeciwhistaminowe. Do tej grupy należy bilastyna, czyli długo działający selektywny antagonistą obwodowych receptorów histaminowych H₁.

■ **Keywords:** bilastine, antihistamines, allergies, primary care.

■ **Abstract:** Allergies result from an overreaction of the immune system to contact with allergens. Common allergens are found in grass and grain pollen, house dust mites, pet secretions, insect venom, certain food ingredients and some medications. In some cases, allergy symptoms can be very bothersome and can significantly reduce patients' quality of life. One of the therapeutic options used for allergies, are antihistamines. This group includes bilastine, a long-acting selective antagonist of peripheral histamine H₁ receptors.

■ Wprowadzenie

Alergie (gr. *allos* – inny, *ergos* – reakcja) **powstają, gdy układ odpornościowy organizmu nadmiernie reaguje na kontakt z alergenami, czyli zewnątrzpochodnymi antygenami.** U większości ludzi kontakt z alergenami nie prowadzi do nadmiernej, patologicznej odpowiedzi. W przypadku osób z alergiami jest inaczej. Najczęściej w wyniku reakcji immunologicznych z udziałem przeciwciał IgE, przyłączonych do receptorów na powierzchni komórek tucznych (mastocytów) i bazofili, następuje uwalnianie mediatorów chemicznych (głównie histaminy). Mediatory oddziałując na okoliczne tkanki, prowadzą do wystąpienia objawów alergii [1-6]. Powszechnie występujące alergeny znajdują się w pyłkach traw i zbóż, roztoczech kurzu domowego, wydzielinach zwierząt domowych, w jądzie

owadów, w niektórych składnikach żywności oraz leków. W wielu przypadkach objawy alergii nie są bardzo nasilone, mają postać łagodnych objawów z dróg oddechowych oraz skóry. W części przypadków objawy alergii mogą być jednak bardzo uciążliwe i znacząco obniżać jakość życia pacjentów, np. utrudniają oddychanie przez nos i powodują przewlekły, męczący kaszel [1-6].

W pracy opisano mechanizm działania, wskazania do stosowania i zasady prowadzenia farmakoterapii schorzeń alergicznych przy użyciu bilastyny, czyli długo działającego selektywnego antagonisty obwodowych receptorów histaminowych H₁.

■ Obraz kliniczny schorzeń alergicznych

Do chorób alergicznych zaliczana jest grupa schorzeń, które obejmują alergiczny nieżyt

nosa, pokrzywkę, obrzęk naczynioruchowy, chorobę posurowiczą oraz stany bezpośredniego zagrożenia życia – anafilaksję i wstrząs anafilaktyczny. Do najczęściej spotykanych alergii należą dwa pierwsze spośród wymienionych schorzeń.

Objawy **alergicznego nieżytu nosa**, który może mieć postać sezonową lub całoroczną, to m.in.:

- wyciek wodnistej lub śluzowej wydzieliny z nosa, co prowadzi do zatkania nosa. Może występować znaczne osłabienie węchu lub jego utrata;
- kichanie, często w postaci napadów;
- świąd nosa, podniebienia oraz często świąd i przekrwienie spojówek;
- kaszel, który może być przewlekły. Powstaje w wyniku spływania nadmiaru wydzieliny po tylnej ścianie gardła;
- objawy ogólnoustrojowe, takie jak niewielkie podwyższenie temperatury ciała, bóle głowy, zaburzenia snu, problemy z koncentracją i uczeniem się.

Pokrzywkę (łac. *urticaria*) charakteryzuje m.in.:

- obecność bąbli pokrzywkowych, czyli różowych lub porcelanowobiałych zmian otoczonych rumieniem; najczęściej są one wypukłe – wystają ponad powierzchnię skóry;
- świąd, pieczenie okolic zajętych przez bąble pokrzywkowe;
- ustępowanie bąbli w czasie < 24 godzin, bez pozostawienia zmian na skórze;
- może jej towarzyszyć obrzęk naczynioruchowy [1-6].

■ Mechanizm działania bilastyny

Najważniejsze z klinicznego punktu widzenia elementy opisujące właściwości bilastyny to:

- jest ona **długo działającym selektywnym antagonistą obwodowych receptorów histaminowych H₁**. Należy do antyhistaminików II generacji. Lek nie wiąże się z receptorami cholinergicznymi – muskarynowymi

i dzięki temu nie powoduje uciążliwych działań niepożądanych;

- **po podaniu doustnym szybko wchłania się z przewodu pokarmowego**. Maksymalne stężenie leku w osoczu krwi (t_{max}) wynosi ok. 1,3 godziny. Dostępność biologiczna wynosi ok. 60%. Pokarm znacząco zmniejsza dostępność biologiczną bilastyny;
- **lek wiąże się z białkami osocza w ok. 90%**; nie ulega istotnym przemianom w ustroju. Czas półtrwania ($t_{1/2}$) bilastyny wynosi ok. 14 godzin. Z tego względu lek jest podawany 1 raz/dobę;
- **prawie 95% dawki jednorazowej ulega wydaleniu w postaci niezmienionej**, w tym ok. 30% jest usuwane z moczem i ok. 70% z kałem [7-10].

■ Wskazania i zasady prowadzenia farmakoterapii bilastyną

Wskazania do zastosowania bilastyny obejmują objawową terapię typowych schorzeń alergicznych:

- alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa oraz spojówek (postaci sezonowej i całorocznej);
- pokrzywki.

Oczywiście w przypadku wymienionych chorób stosuje się również inne postaci farmaceutyczne, jednak doustne antyhistaminiki, do których należy bilastyna, są bardzo dobrą opcją terapeutyczną [7-10].

Zasady prowadzenia farmakoterapii bilastyną są następujące:

- **lek przyjmuje się doustnie, najlepiej 1 godzinę przed posiłkiem lub 2 godziny po posiłku**. Dzięki temu większe jest wchłanianie substancji czynnej;
- **u osób dorosłych i dzieci w wieku > 12 lat zalecane jest przyjmowanie 20 mg leku/dobę**. Nie ma konieczności modyfikacji dawkowania u osób starszych oraz u pacjentów z zaburzeniami czynności nerek albo wątroby;
- **u dzieci w wieku 6–11 lat podaje się 10 mg leku/dobę**. Nie ma badań dotyczących

Clabilla

Bilastinum

ŻYCIE Z ALERGIĄ
UMIŁA



OD 12.
ROKU ŻYCIA

ZAPALENIE BŁONY ŚLIZOWEJ NOSA

 glenmark

ZAPALENIE SPOJÓWEK

POKRZYWKĄ

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO: Clabilla

2. NAZWA POWSZECHNIE STOSOWANA: *Bilastinum*

3. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY: Każda tabletką zawiera 20 mg bilastyny.

4. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA: Tabletką.

5. WSKAZANIA DO STOSOWANIA: Objawowe leczenie alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa i spojówek (sezonowego i całorocznego) oraz pokrzywki. Produkt leczniczy Clabilla jest wskazany do stosowania u dorosłych i młodzieży (w wieku 12 lat i powyżej).

6. DAWKOWANIE I SPOSÓB PODAWANIA:

Dawkowanie

Dorośli i młodzież (w wieku 12 lat i powyżej)

20 mg bilastyny (1 tabletką) raz na dobę w celu złagodzenia objawów alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa i spojówek (sezonowego i całorocznego) oraz pokrzywki. Tabletkę należy przyjmować godzinę przed lub dwie godziny po posiłku lub spożyciu soku owocowego.

Czas trwania leczenia

W przypadku alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa i spojówek czas leczenia powinien być ograniczony do okresu ekspozycji na alergeny. W przypadku sezonowego alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa leczenie można przerwać po ustąpieniu objawów i wznowić po ich ponownym wystąpieniu. W całorocznym alergicznym zapaleniu błony śluzowej nosa leczenie ciągle można zaproponować pacjentom podczas okresów ekspozycji na alergeny. Czas leczenia pokrzywki zależy od rodzaju, czasu trwania i jej przebiegu.

Specjalne grupy pacjentów

Osoby w podeszłym wieku

Nie jest konieczne dostosowanie dawkowania u pacjentów w podeszłym wieku.

Zaburzenia czynności nerek

Badania przeprowadzone u dorosłych, w grupach szczególnego ryzyka (pacjenci z zaburzeniami czynności nerek) wskazują, że nie jest konieczne dostosowanie dawkowania bilastyny u dorosłych.

Zaburzenia czynności wątroby

Brak badań klinicznych u dorosłych pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby. Niemniej jednak, ponieważ bilastyna nie jest metabolizowana i jest wydalana w postaci niezmienionej w moczu i kale, nie uważa się, że zaburzenia czynności wątroby mają wpływ na zwiększenie ogólnoustrojowego narażenia powyżej marginesu bezpieczeństwa u dorosłych pacjentów. Dlatego nie jest konieczne dostosowywanie dawkowania u dorosłych pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby.

Dzieci i młodzież

– Dzieci w wieku od 6 do 11 lat o masie ciała co najmniej 20 kg.

W tej populacji właściwe jest stosowanie bilastyny w postaci tabletek ulegających rozpadowi w jamie ustnej o mocy 10 mg i bilastyny w postaci roztworu doustnego o mocy 2,5 mg/ml.

– Dzieci w wieku poniżej 6 lat i o masie ciała poniżej 20 kg.

Brak zaleceń dotyczących dawkowania. W związku z tym bilastyny nie należy stosować w tej grupie wiekowej.

Nie określono bezpieczeństwa stosowania ani skuteczności bilastyny u dzieci z zaburzeniami czynności nerek i wątroby.

Sposób podawania

Podanie doustne. Tabletkę należy połknąć w całości, popijając wodą. Zaleca się przyjmować dobową dawkę jednorazowo.

7. PRZECIWWSKAZANIA:

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą.

8. SPECJALNE OSTRZEŻENIA I ŚRODKI OSTROŻNOŚCI DOTYCZĄCE STOSOWANIA:

Dzieci i młodzież

Nie ustalono skuteczności i bezpieczeństwa stosowania bilastyny u dzieci w wieku poniżej 2 lat, a u dzieci w wieku od 2 do 5 lat dane kliniczne są ograniczone, dlatego nie należy stosować bilastyny w tych grupach wiekowych. U pacjentów z umiarkowaną lub ciężką niewydolnością nerek podawanie bilastyny jednocześnie z inhibitorami glikoproteiny P (takimi jak np. ketokonazol, erytromycyna, cyklosporyna, rytonawir lub diltiazem) może zwiększać stężenie bilastyny w osoczu, a tym samym zwiększać ryzyko działań niepożądanych bilastyny. Dlatego u pacjentów z umiarkowaną lub ciężką niewydolnością nerek należy unikać podawania bilastyny jednocześnie z inhibitorami glikoproteiny P.

Sód

Ten produkt leczniczy zawiera mniej niż 1 mmol (23 mg) sodu na tabletkę, to znaczy, że lek uznaje się za „wolny od sodu”.

9. DZIAŁANIA NIEPOŻĄDANE:

Ciąża

Brak lub dostępne są nieliczne dane dotyczące stosowania bilastyny u kobiet w ciąży.

Badania przeprowadzane na zwierzętach nie wykazują bezpośredniego ani pośredniego szkodliwego działania w odniesieniu do toksycznego wpływu na rozród, przebieg porodu czy rozwój pourodzeniowy. W celu zachowania środków ostrożności zaleca się unikać stosowania produktu Clabilla podczas ciąży.

Karmienie piersią

Nie badano u ludzi wydzielania bilastyny do mleka. Dostępne dane farmakokinetyczne u zwierząt wykazały wydzielanie bilastyny do mleka. Należy podjąć decyzję, czy kontynuować lub przerwać karmienie piersią lub przerwać leczenie produktem leczniczym Clabilla, biorąc pod uwagę korzyści z karmienia piersią dla dziecka i korzyści dla matki wynikające z leczenia bilastyną.

Płodność

Brak lub dostępne są nieliczne dane kliniczne. Badania na szczurach nie wykazały niekorzystnego wpływu na płodność.

10. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU: Glenmark Pharmaceuticals s.r.o., Hvězdova 1716/2b, 140 78 Praga 4, Republika Czeska.

11. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU: 27288

12. KATEGORIA DOSTĘPNOŚCI: Rp – Lek wydawany na receptę.

13. PODMIOT PROWADZĄCY REKLAMĘ NA ZLECENIE PODMIOTU ODPOWIEDZIALNEGO: Glenmark Pharmaceuticals sp. z o.o., ul. Osmańska 14, 02-823 Warszawa.

bezpieczeństwa i skuteczności stosowania bilastyny u dzieci z zaburzeniami czynności nerek lub wątroby. Z tego względu nie należy jej podawać dzieciom w wieku 6–11 lat z uszkodzeniem tych narządów;

- **czas prowadzenia terapii**

- o w leczeniu postaci pokrzywki zależy od przebiegu schorzenia;
- o w przypadku alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa:
 - w leczeniu postaci sezonowej terapię można przerwać po ustąpieniu objawów i ponownie podawać lek po nawrocie objawów;
 - w leczeniu postaci całorocznej terapię można kontynuować przez cały okres narażenia na alergeny;

- ze względu na brak odpowiednich badań, **zalecane jest unikanie stosowania bilastyny w czasie ciąży**. Decyzja dotycząca stosowania leku w okresie karmienia piersią powinna być podjęta po rozważeniu stosunku korzyści i ryzyka dla dziecka oraz matki;
- w większości przypadków **lek nie wywiera negatywnego wpływu na funkcje psychoruchowe** i nie wpływa na zdolność prowadzenia pojazdów lub obsługi urządzeń mechanicznych. W bardzo rzadkich przypadkach bilastyna może powodować senność [7-10].

lub pacjentów z zaburzeniami czynności nerek i wątroby. Wskazania do stosowania bilastyny obejmują leczenie alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa oraz terapię pokrzywki.

Nadesłano: 12-02-2023

Adres do korespondencji: redakcja@gabinetprywatny.pl

Piśmiennictwo:

1. Świerczyńska-Krępa M, Rogala B, Brożek J, et al. Alergiczny nieżyt nosa. *Medycyna praktyczna. Interna Szczeklika*. <https://www.mp.pl/interna/chapter/B16.II.17.4>. [data dostępu: 12.02.2023].
2. Szepietowski J, Padjas A, Gliński W. Pokrzywka. <https://www.mp.pl/interna/chapter/B16.II.17.4>. [data dostępu: 12.02.2023].
3. Nowicki RJ, Porębski G, Padjas A. Obrzęk naczynioruchowy. <https://www.mp.pl/interna/chapter/B16.II.17.5>. [data dostępu: 12.02.2023].
4. Świerczyńska-Krępa M. Lista leków stosowanych w chorobach alergicznych. *Medycyna praktyczna*. <https://www.mp.pl/pacjent/alergie/chorobyalergiczne/choroby/57988,lista-lekow-stosowanych-w-chorobach-alergicznyc> [data dostępu: 12.02.2023].
5. Dougherty JM, Alsayouri K, Sadowski A. *Allergy. StatPearls [Internet]*. Treasure Island (FL): StatPearls Publishing; 2022 Jan-. <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/books/NBK545237/> [data dostępu: 12.02.2023].
6. Mekori YA. Introduction to allergic diseases. *Crit Rev Food Sci Nutr*. 1996;36 Suppl:S1-18.
7. Bilastyna. *Medycyna praktyczna. Indeks leków*. <https://indeks.mp.pl/leki/desc.php?id=11882> [data dostępu: 12.02.2023].
8. Charakterystyki produktów leczniczych zawierających bilastynę [data dostępu: 12.02.2023].
9. Jáuregui I, Ramaekers JG, Yanai K, et al. Bilastine: a new antihistamine with an optimal benefit-to-risk ratio for safety during driving. *Expert Opin Drug Saf*. 2016;15(1):89-98.
10. Sádaba Díaz de Rada B, Azanza Perea JR, Gomez-Guiu Hormigos A. Bilastine for the relief of allergy symptoms. *Drugs Today (Barc)*. 2011;47(4):251-62.

■ Podsumowanie

Alergie występują, gdy układ odpornościowy nadmiernie reaguje na kontakt z alergenami, które u większości osób nie wywołują wygórowanej odpowiedzi immunologicznej. W części przypadków objawy alergii są dość łagodne, u innych osób mogą być bardzo uciążliwe.

Bilastyna jest długo działającym selektywnym antagonistą obwodowych receptorów histaminowych H₁, lekiem II generacji. Po podaniu doustnym szybko wchłania się z przewodu pokarmowego. Jest to lek bezpieczny. Jego dawka nie musi być zmniejszana u osób starszych