

## Allergische Rhinitis und Urtikaria

# Behandlung mit nachweislich nicht sedierendem Antihistaminikum

**Als nachweislich nicht sedierendes Antihistaminikum der 2. Generation eignet sich zur symptomatischen Behandlung der saisonalen allergischen Rhinitis und der Urtikaria bei über 12-jährigen Jugendlichen und bei Erwachsenen Bilastin\*. Experten äusserten sich zum Einfluss der Substanz auf zentralnervöse Funktionen und zur Frage, ob diese auch bei Kindern zwischen 2 und 12 Jahren eingesetzt werden könnte.**

Um sicherzustellen, dass ein Antihistaminikum wirklich nicht sedierend wirkt, muss untersucht werden, ob es subjektiv nicht schläfrig macht, ob es objektiv die kognitiven und psychomotorischen Funktionen nicht beeinträchtigt und ob es die zerebralen H<sub>1</sub>-Rezeptoren nur geringfügig besetzt. Es besteht eine enge Korrelation zwischen der H<sub>1</sub>-Rezeptor-Besetzung in der Positronen-Emissions-Tomografie (PET) und der sedierenden Wirkung, sagte Professor Dr. med. Mario Sánchez-Borges, Centro Medico-Decente La Trinidad, Caracas, Venezuela. Wenn ein Antihistaminikum mehr als 50 Prozent der H<sub>1</sub>-Rezeptoren im ZNS besetzt, ist mit einer hohen Prävalenz an Nebenwirkungen wie Schläfrigkeit und kognitiver Beeinträchtigung zu rechnen, zwischen 20 und 50 Prozent wird ein Antihistaminikum als «weniger sedierend» und bei weniger als 20 Prozent als «nicht sedierend» eingestuft.

### Klinische Studien

In klinischen Studien wurde bezüglich des sedativen Effekts kein Unterschied zwischen Bilastin (Bilaxten®) und Plazebo festgestellt. Eine gepoolte Analyse zeigte, dass es mit Ersterem signifikant seltener zur Somnolenz kommt als mit Cetirizin (1). In einer randomisierten Doppelblindstudie kam Somnolenz bei Patienten mit saisonaler allergischer Rhinitis darunter signifikant seltener vor als in der Cetirizingruppe (1,8% vs. 7,5%) (2). Das Potenzial Schläfrigkeit auszulösen sei bei Cetirizin und Levocetirizin grösser als bei anderen Antihistaminika der 2. Generation, sagte der Referent. Mit Bilastin ist keine Verstärkung der zentralnervösen Effekte von Alkohol oder Lorazepam zu befürchten (2). In einer doppelblinden, plazebokontrollierten Crossoverstudie wurden bei gesunden Freiwilligen nach 7 konsekutiven Tagen mit Einnahme von 20 mg oder 40 mg Bilastin in objektiven psychomotorischen Tests im Vergleich zu Plazebo keine Beeinträchtigungen festgestellt (1). In einer doppelblinden, plazebokontrollierten Studie mit Fahrtests auf der Strasse beeinflusste es (20 mg bzw. 40 mg als Einzeldosis und nach 8 Einnahmetagen) die Fahrtüchtigkeit nicht (1).

### Auch für Kinder geeignet?

Es ist keine Seltenheit, dass schon 2-jährige Kinder von allergischer Rhinitis betroffen sind. Sichere, effektive und nicht sedierende Medikamente werden auch für Kinder mit allergischer Rhinitis benötigt, sagte Professor Dr. med. Piotr Kuna, Medical University, Lodz, Polen. Bislang fehlten aber Informationen für Kinder zur adäquaten Dosierung von Bilastin, zu Arz-

neimittelinteraktionen, zu Nebenwirkungen und zur Langzeitsicherheit. Auch waren bislang keine geeigneten Kinderformulierungen verfügbar. Deshalb wurden jetzt mit neu entwickelten, pädiatrischen Formulierungen (oral dispersible Tabletten und orale Lösung) 2 multizentrische klinische Studien bei Kindern durchgeführt.

Eine internationale Pharmakokinetikstudie (in Deutschland, Schweden, Spanien und Australien) diente der Evaluierung der Dosis, die bei Kindern im Alter zwischen 2 und 12 Jahren adäquat ist. Es stellte sich heraus, dass 10 mg täglich im gesamten Altersspektrum (2 bis 12 Jahre), unabhängig vom Körpergewicht, dieselbe systemische Exposition wie bei Erwachsenen ergeben. Kuna wies darauf hin, dass die Substanz nicht in der Leber metabolisiert wird und die Elimination über die Nieren erfolgt. Eine internationale, randomisierte, plazebo-kontrollierte Doppelblindstudie kümmert sich zudem um die Sicherheit und die Nebenwirkungen von Bilastin (einmal täglich 10 mg) bei 2- bis 12-jährigen Kindern mit allergischer Rhinokonjunktivitis oder chronischer Urtikaria. Die Wiederholung von Wirksamkeitsstudien, die bei Erwachsenen erfolgreich durchgeführt wurden, werde von der EMA (European Medicine Agency) bei Kindern nicht verlangt, sagte Kuna.

*Alfred Lienhard*

\*Bilastin (Bilaxten®) ist in der Schweiz ab 12 Jahren zugelassen.

**Referenzen:** [www.rosenfluh.ch](http://www.rosenfluh.ch)

Quelle: «Bilastine: pursuing excellence in the risk-benefit equation», Satellitensymposium der Firma Menarini, EAACI-Kongress, Kopenhagen, 8.6.2014.

### PET zeigt zerebrales Bindungspotenzial

Mit Hilfe von intravenösen Injektionen von radioaktiv markiertem Doxepin (einem trizyklischen Antidepressivum mit hoher Affinität für zerebrale H<sub>1</sub>-Rezeptoren) kann die Besetzung von H<sub>1</sub>-Rezeptoren durch H<sub>1</sub>-Antihistaminika berechnet werden. Wenn ein Antihistaminikum die Blut-Hirn-Schranke durchdringt und eine hohe Affinität für zerebrale H<sub>1</sub>-Rezeptoren aufweist (z.B. Hydroxyzin), reduziert es die Besetzung der Rezeptoren mit dem radioaktiv markierten Doxepin. In einer randomisierten, doppelblinden, plazebo-kontrollierten Crossoverstudie mit gesunden Freiwilligen wurde nach peroraler Einnahme von 20 mg Bilastin in allen mit PET untersuchten Hirnarealen eine Rezeptorbesetzung von nahezu null festgestellt, ähnlich wie mit Plazebo. Es weise von allen getesteten H<sub>1</sub>-Antihistaminika das geringste zerebrale Bindungspotenzial auf, sagte der Referent.