NOUVEL HAY MAGAZINE
SANS FRONTIÈRES

Les antihistaminiques H1 de seconde génération n'ont pas d'effet sédatif (somnolence) sauf exceptionnellement

Les antihistaminique H1, cétirizine, lévocétirizine, loratadine, desloratadine et féxofénadine n'ont pas d 'effet sédatif du fait de leur faible pénétration dans le cerveau, ne sont pas atropiniques et n'ont pas en principe d'effet sur la repolarisation cardiaque.

La cétirizine, dérivé carboxylé de l'hydroxyzine qui est utilisé comme sédatif et anxiolytique (Atarax*), outre son effet antihistaminique H1, inhibe la libération de diverses cytokines et de leucotriènes. La cétirizine est un racémique et la lévocétirizine, un isomère (énantiopur) de ce racémique.

La loratadine agit en grande partie par l'intermédiaire d'un de ses métabolites, la décarboéthoxyloratadine ou desloratadine, également commercialisée. En cas de surdosage, la loratadine peut donner une sédation et des effets atropiniques.

La féxofénadine, métabolite actif de la terfénadine, n'a pas les inconvénients cardiaques de cette dernière.

Cétirizine	VIRLIX* Cp ZYRTEC* Cp, Gouttes
Lévocétirizine	XYZALL * Cp
Loratadine	CLARITYNE* Cp, Sirop (enfant)

Desloratadine	AERIUS * Cp
Féxofénadine	TELFAST* Cp

La mizolastine et l'ébastine n'entraînent pas, à posologie habituelle, d'allongement de l'espace QT; cependant en cas de surdosage un tel effet est possible. La prise concomitante de médicaments pouvant ralentir leur catabolisme est à éviter, notamment macrolides et antifongiques imidazolés. L'ébastine est transformée dans l'organisme en un métabolite actif, la carébastine.

Mizolastine	MIZOLLEN* Cp
Ebastine	KESTIN* Cp KESTINLYO* Cp
Bilastine	BILASKA* Cp
Rupatadine	WYSTAMM* Cp

Le méquitazine, Primalan*, possède parallèlement à son activité antihistaminique H1, un effet atropinique par exemple par une sécheresse de la bouche ou un trouble de l'accommodation. Elle peut entraîner un allongement de l'espace QT et à dose un peu plus élevée avoir un effet sédatif. On ne voit guère son intérêt!

Les antihistaminiques H1 non sédatifs ont une demi-vie plasmatique longue et une assez longue durée d'action pour que, en principe, une seule administration quotidienne suffise.

Antihistaminiques H1 à usage local

Un certain nombre d'antihistaminiques H1 sont utilisés localement, en collyres, solution nasale ou crèmes. Une partie du produit actif présent dans un collyre ou une solution nasale peut être absorbée et passer dans la circulation générale et être à l'origine d'effets indésirables généraux.

- Collyres
  Les antihistaminiques H1 utilisés en collyre sont l'azélastine, la lévocabastine, l'émédastine et l'olapatadine ; cette dernière inhiberait

aussi la libération de médiateurs de l'inflammation. Leur indication commune est les conjonctivites allergiques.

Azélastine	ALLERGODIL* Collyres
Lévocabastine	LEVOPHTA* Collyre
Olapatadine	OPATANOL* Collyre

- Solution nasale
  L'azélastine, précédemment citée, existe aussi en solution pour pulvérisation nasale, destinée au traitement des rhinites allergiques.

Azélastine	ALLERGODIL* Sol nasale

- Préparations dermatologiques
  La prométhazine et la diphenhydramine existent en préparations pour application cutanée.

Prométhazine	Phénergan* crème
Diphenhydramine	Butix* Gel

Effets indésirables

Les nouveaux antihistaminiquesH1 n'entraînent qu'exceptionnellement une somnolence. Cette possibilité, même rare, doit cependant être prise en compte lors d'une première prescription. Il n'est pas conseillé de prescrire un antihistaminiqueH1 sédatif chez l'enfant de moins de 1 an car, bien que ceci ne soit pas démontré, il pourrait augmenter le risque de mort subite. A titre

d’exemple, selon leur RCP, le Phénergan* sirop peut être utilisé à partir de 1 an, le Zyrtec* solution buvable et la Clarityne* sirop, à partir de 2 ans.

Pour les effets indésirables de type atropinique, voir Atropine.

Les antihistaminiques H1 non sedatifs, terfénadine et astémizole, pouvaient donner, surtout en cas de surdosage, par inhibition des canaux potassiques, des anomalies de la conduction cardiaque avec allongement de l’intervalle QT, voire même des torsades de pointes. Ils ont été retirés du commerce.

Divers autres effets indésirables des antihistaminiques H1 ont été signalés, notamment des réactions allergiques.

source : pharmacorama



photo : D.R.