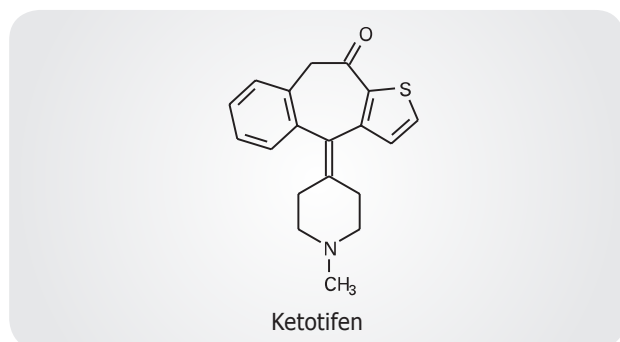


Ketotifen

Ketotifen, 4-(1-metylopiperydyno-4-ylideno)-4*H*-benzo-[4,5]cyklohepta[1,2-*b*]tiofen-10(9*H*)-on, krystaliczna substancja o temperaturze topnienia 152-153°C. Jest stosowany doustnie w postaci dobrze rozpuszczalnego w wodzie *fumaranu ketotifenu* (*ketotifenu wodorofumaranu*).



Działanie

Ketotifen posiada zróżnicowane właściwości farmakologiczne. Wykazuje silne powinowactwo do receptorów H₁ oraz słabe działanie przeciwocholinergiczne. Lek hamuje również degranulację komórek tucznych oraz aktywację eozynofili. *Ketotifen* może być stosowany wyłącznie profilaktycznie. Nie wykazuje on działania terapeutycznego w przypadkach ostrych ataków astmy i nie posiada właściwości rozszerzających oskrzela.

Farmakokinetyka

Po podaniu doustnym *ketotifen* jest wchłaniany w ok. 80%. Biodostępność leku wynosi zaledwie ok. 50%, co jest spowodowane wyraźnym efektem pierwszego przejścia (*first-pass*) w wątrobie. Lek osiąga maksymalne stężenie w osoczu po upływie 2–4 h, stopień wiązania się z białkami osocza wynosi ok. 75%. We krwi i w moczu stwierdza się obecność prawie wyłącznie dwóch izomerycznych pochodnych kwasu glukuronowego. Eliminacja jest procesem dwufazowym i wykazuje okres półtrwania 3–5 h oraz terminalny okres półtrwania wynoszący 20 h. Pełne działanie leku pojawia się dopiero po 8–12 tygodniach stosowania. Działanie pojedynczej dawki leku utrzymuje się do 12 h. *Ketotifen* przenika przez barierę krew-mózg oraz przez barierę łożyska.

Wskazania

Profilaktyka astmy alergicznej i alergicznego zapalenia oskrzeli, katar alergiczny i alergie skórne. Stosowanie *ketotifenu* ogranicza się do profilaktyki astmy u dzieci i nie jest już obecnie zalecane.

Działania niepożądane

W przypadku przyjmowania leku doustnie często może wystąpić działanie uspokajające, uczucie zagubienia i osłabienie zdolności do koncentracji uwagi. Możliwe są również objawy takie, jak suchość w jamie ustnej i zawroty głowy. Kolejnym działaniem niepożądanym jest wzrost masy ciała. W przypadku stosowania leku w postaci kropli do oczu możliwymi działaniami ubocznymi są podrażnienia, uczucie kłucia i punktowe uszkodzenia rogówki.

Interakcje

W przypadku jednoczesnego przyjmowania leków uspokajających, innych leków H₁-przeciwhistaminowych i alkoholu dochodzi do nasilenia zarówno działania leku, jak i jego działań ubocznych. W przypadku jednoczesnego przyjmowania z doustnymi lekami przeciwcukrzycowymi może dojść do spadku poziomu płytek krwi.

Przeciwwskazania

Ketotifen nie powinien być przyjmowany przez pacjentów z padaczką. Silnym przeciwwskazaniem do stosowania leku jest również okres ciąży i karmienia piersią.

Dawkowanie

Dorośli, młodzież i dzieci w wieku > 3 lat przyjmują w trakcie pierwszych 3–4 dni terapii 1 mg dziennie, wieczorem, następnie rano i wieczorem po 1 mg. Dzieci w wieku > 6 miesięcy do 3 lat – rano i wieczorem po 0,5 mg, doustnie.

Preparaty dostępne w sprzedaży

- **Ketotifen WZF**[®] (Polfa Warszawa), tabletki, syrop (Rp.)
- **Ketotifen Hasco**[®] (Hasco-Lek), syrop (Rp.)
- **Zaditen**[®] (Defilante Farmaceutica), krople do oczu, syrop, tabletki (Rp.)

Klemastyna

Klemastyna, (*R*)-2-{2-[(*R*)-4-chloro- α -metylobenzhydryloksy]etylo}-1-metylopirolidyna, jest substancją zasadową, stosowaną w terapii w postaci soli – *fumaranu klemastyny*. Występuje w postaci krystalicznego proszku o barwie białej do żółtawej, pozbawionym zapachu. Jej temperatura topnienia wynosi 177–178°C, jest słabo rozpuszczalna w wodzie, trudno rozpuszczalna w 70% etanolu i chloroformie. 10% w/v zawiesina w wodzie wykazuje wartość pH równą 3,2–4,2. Substancję należy chronić przed światłem i przechowywać w hermetycznych pojem-