หน่วยกิตการศึกษาต่อเนื่องสำหรับ
ผู้ประกอบวิชาชีพเภสัชกรรม

เรื่อง: Desloratadine Oral Solution: New Formulation of Antihistamine for Children

รหัส: 1013-1-000-004-06-2568
จำนวน: 2.50 หน่วยกิตการศึกษาต่อเนื่อง
วันที่รับรอง: 15 มิถุนายน 2568
วันที่หมดอายุ: 14 มิถุนายน 2569

เรียบเรียงโดย: ภก.อนันต์ชัย อัศวเมฆิน
คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล

บทคัดย่อ

Desloratadine Oral Solution ประกอบด้วยตัวยา desloratadine ขนาด 0.5 มิลลิกรัม/มิลลิลิตร เป็นยาต้านฮีสตามีน ใช้สำหรับบรรเทาอาการต่าง ๆ ของจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ในเด็กตั้งแต่ 6 เดือนจนถึงผู้ใหญ่ มีระยะเวลาในการออกฤทธิ์นาน รับประทานวันละครั้ง เวลาใดก็ได้ โดยไม่ทำให้ง่วงนอนในผู้ป่วยส่วนใหญ่ และถูกออกแบบให้เป็นสูตรตำรับที่ปราศจากน้ำตาลและสีสังเคราะห์ จึงช่วยลดความเสี่ยงต่อการเพิ่มระดับน้ำตาลในเลือด การทำให้ฟันผุ และอาการแพ้ต่อสีสังเคราะห์ ให้กับผู้ใช้ยาทั้งในเด็ก และผู้ใหญ่

วัตถุประสงค์

เพื่อให้เข้าใจถึง desloratadine oral solution และนำไปประยุกต์ใช้ในการแนะนำให้กับผู้ป่วย

Keywords Desloratadine Oral Solution, Desloratadine, Sugar & dye free

Desloratadine Oral Solution มีตัวยาสำคัญอะไร?

ตัวยาสำคัญ คือ desloratadine ความเข้มข้น 0.5 มิลลิกรัม/มิลลิลิตร ซึ่งเป็นยาต้านฮีสตามีนรุ่นที่ 2 ที่ไม่ทำให้ง่วงนอน ใช้ในการบรรเทาอาการแพ้จากโรค เช่น โรคจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ (allergic rhinitis) และลมพิษ (urticaria)[1-2]

Desloratadine มีกลไกการออกฤทธิ์อย่างไร?

Desloratadine เป็นยาต้านฮีสตามีน (antihistamine) ต่อตัวรับฮีสตามีนชนิดที่ 1 (H1-receptor) แบบ inverse agonist หรือยาจะปิดกั้นไม่ให้ฮิสตามีนจับกับตัวรับ และยังส่งผลให้สัดส่วนของตัวรับอยู่ในภาวะ inactive มากขึ้น จึงลด basal activity ของตัวรับนั้น[3]

Desloratadine เป็นรูปที่แสดงฤทธิ์ของ loratadine มีโครงสร้างทางเคมีเป็นกลุ่มอนุพันธ์ของ piperidine ซึ่งเป็นกลุ่มเดียวกับ fexofenadine, azelastine และ bilastine

เภสัชจลนศาสตร์ของ Desloratadine เป็นอย่างไร?

Desloratadine ชนิดรับประทานจะถูกดูดซึมได้ดีจากทางเดินอาหาร มี onset of action เท่ากับ 2 ชั่วโมง ระดับยาในเลือดสูงสุด (time to maximum concentration, Tmax) ประมาณ 3 ชั่วโมงหลังจากได้รับยา (ตารางที่ 1) การให้ยาในขนาด 5 มิลลิกรัม วันละครั้ง ระดับความเข้มข้นของยาในเลือดจะถึงระดับ steady-state ภายในหนึ่งสัปดาห์ การดูดซึมของยานี้ไม่ถูกรบกวนด้วยอาหาร จึงสามารถจะรับประทานเวลาใดก็ได้ตามสะดวก[3-4]

เมื่อยานี้ถูกดูดซึมไปแล้วจะจับกับโปรตีนในเลือด (plasma protein binding) ร้อยละ 83 - 87 และกระจายตัวได้ดีในเนื้อเยื่อต่าง ๆ ของร่างกาย โดยมีค่าครึ่งชีวิต (elimination half-life, T1/2) ยาว 26.8 ชั่วโมง

ยา desloratadine ถูกดูดซึมผ่าน blood brain barrier เข้าสู่สมองได้น้อย จึงไม่ส่งผลให้เกิดอาการง่วงนอนหลังการใช้ยา จากการศึกษาของกลุ่มผู้เชี่ยวชาญ Consensus Group of New Generation of Antihistamine (CONGA) ได้ศึกษาการจับของยาต้านฮิสตามีนกับตัวรับฮิสตามีน H1 ในสมอง (brain H1 receptor occupancy, H1RO) ใช้เกณฑ์การวัดการผ่านเข้าสมองของยาต้านฮิสตามีน[5] โดยแบ่งยาต้านฮิสตามีนออกเป็น 3 กลุ่ม ได้แก่ 1.กลุ่มที่ไม่ทำให้ง่วงนอน (non-sedating) มีค่า H1RO น้อยกว่าร้อยละ 20, 2.กลุ่มที่ทำให้ง่วงนอนน้อย (less-sedating) มีค่า H1RO ระหว่างร้อยละ 20 - 50 และ 3. กลุ่มที่ทำให้ง่วงนอน (sedating) มีค่า H1RO ตั้งแต่ร้อยละ 50 ขึ้นไป พบว่า desloratadine ในขนาด 5 มิลลิกรัม มีค่า H1RO อยู่ที่ 6.47 จัดอยู่ในกลุ่มที่ไม่ทำให้ง่วงนอน

Desloratadine ส่วนใหญ่จะถูกเปลี่ยนแปลงที่ตับไปเป็น 3-hydroxydesloratadine ผ่านเอ็นไซม์ CYP3A4 และ CYP2D6[3] จากการศึกษาทางคลินิก พบว่า การให้ desloratadine ร่วมกับยาที่ยับยั้ง CYP3A4 เช่น erythromycin และ ketoconazole ส่งผลเพิ่มระดับของ desloratadine เพียงเล็กน้อย และไม่พบการเปลี่ยนแปลงของคลื่นไฟฟ้าหัวใจ[6] ยา desloratadine และ 3-hydroxydesloratadine ถูกขับออกทางปัสสาวะ และอุจจาระ

ตารางที่ 1 เภสัชจลนศาสตร์ของ desloratadine

เภสัชจลนศาสตร์	Desloratadine
• Brain H1 receptor occupancy (H1RO)	6.47
• Onset of action	2 ชั่วโมง
• ระดับยาในเลือดสูงสุด (Tmax)	3 ชั่วโมง
• Plasma protein binding	83 - 87%
• ค่าครึ่งชีวิต (elimination half-life, T1/2)	26.8 ชั่วโมง
• Duration of action	24 ชั่วโมง

Desloratadine มีข้อบ่งใช้อย่างไร?

Desloratadine ใช้บรรเทาอาการดังต่อไปนี้[7]

1. โรคจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ (allergic rhinitis) ลดอาการคัดจมูก น้ำมูกไหล คันจมูก แน่นจมูก จาม คันคอ คันตา น้ำตาไหล และตาแดง

2. โรคลมพิษ (urticaria) ลดอาการคันและผื่นแดงจากลมพิษ

ขนาดยาและวิธีใช้ยา Desloratadine อย่างไร?

ขนาดยา desloratadine Oral Solution (0.5 มิลลิกรัม/มิลลิลิตร) ที่แนะนำสำหรับกลุ่มอายุแตกต่างกัน ดังนี้[8]

เด็กอายุ 6 - 11 เดือน	ครั้งละ 2 มิลลิลิตร	วันละ 1 ครั้ง
เด็กอายุ 1 - 5 ปี	ครั้งละ 2.5 มิลลิลิตร	วันละ 1 ครั้ง
เด็กอายุ 6 - 11 ปี	ครั้งละ 5 มิลลิลิตร	วันละ 1 ครั้ง
ผู้ใหญ่และเด็กอายุ 12 ปีขึ้นไป	ครั้งละ 10 มิลลิลิตร	วันละ 1 ครั้ง

สามารถรับประทานยาได้ทั้งก่อน หรือหลังอาหาร หรือเวลาใดก็ได้ตามสะดวก

Desloratadine มีผลข้างเคียงอย่างไร?

Desloratadine ขนาด 5 มิลลิกรัม เป็นยาที่มีความปลอดภัยสูง แต่ยังอาจพบผลข้างเคียงบางประการ เมื่อเปรียบเทียบกับยาหลอก[7,9] ได้แก่ ปวดศีรษะ (พบได้ร้อยละ 14) ปากแห้ง (ร้อยละ 3) อ่อนเพลีย (ร้อยละ 2 - 5) และในเด็กบางรายอาจพบอาการท้องเสียและนอนไม่หลับ

ตั้งแต่ได้รับอนุมัติให้ใช้ทางการแพทย์ มีรายงานพบผู้ป่วยใช้ยานี้แล้วเกิดอาการแพ้น้อยมาก ซึ่งรวมถึงอาการแพ้อย่างรุนแรง และการเกิดผื่น นอกจากนี้ ยังมีรายงานพบได้น้อยมาก ได้แก่ ภาวะหัวใจเต้นเร็ว ใจสั่น ชัก ไม่อยู่นิ่ง ภาวะเอ็นไซม์จากตับ และบิลิรูบินเพิ่มสูงขึ้น ตับอักเสบ และความอยากอาหารเพิ่มขึ้น

อย่างไรก็ตาม หากพบอาการแพ้รุนแรง เช่น ผื่นคัน หายใจลำบาก หรือบวมที่ใบหน้าให้หยุดยาและพบแพทย์ทันที

Desloratadine มีข้อควรระวังอย่างไร?[8]

1. ควรใช้ยานี้ด้วยความระมัดระวังในผู้ป่วยโรคไตรุนแรงที่มีค่า GFR น้อยกว่า 30 มิลลิลิตร/นาที
2. ควรหลีกเลี่ยงการใช้ในสตรีมีครรภ์ และให้นมบุตร ถึงแม้ว่าในการศึกษาในสัตว์ทดลองที่ได้รับยาในขนาดสูงจะไม่ส่งผลต่อทารกในครรภ์ก็ตาม แต่ยังไม่มีรายงานความปลอดภัยการใช้ยานี้ในสตรีตั้งครรภ์ และมียาบางส่วนขับออกทางน้ำนม
3. ควรระมัดระวังการใช้ยานี้ในผู้ป่วยที่มีประวัติชัก หรือเคยมีประวัติครอบครัวประวัติชัก โดยเฉพาะอย่างยิ่งในเด็กเล็กอาจจะไวต่อการเกิดอาการชักใหม่ได้
4. ยานี้อาจจทำให้ง่วงนอนในผู้ป่วยบางราย ผู้ป่วยควรประเมินก่อนว่าใช้ยานี้แล้วไม่ง่วงนอน ก่อนการขับขี่รถยนต์ หรือทำงานเกี่ยวกับเครื่องจักร หรือทำงานที่เสี่ยงต่อการพลัดตกจากที่สูง

Desloratadine Oral Solution-sugar free

สูตรตำรับยาสำหรับเด็กในการรักษาโรคภูมิแพ้และโรคต่าง ๆ ส่วนใหญ่จะเป็นรูปแบบน้ำเชื่อมที่มีส่วนประกอบของน้ำตาล และสีสังเคราะห์ เพื่อปรุงแต่งรสชาติให้อร่อย หอมหวาน รับประทานได้ง่าย อย่างไรก็ตาม ผลเสียของน้ำตาลในสูตรตำรับมีความสัมพันธ์กับอุบัติการณ์การเกิดฟันผุของเด็กอย่างเป็นที่ประจักษ์[10] และมีการรณรงค์ให้คิดค้นสูตรตำรับของผลิตภัณฑ์ยาที่ปราศจากน้ำตาล[11 - 12]

นับตั้งแต่ปลายทศวรรษที่ 1980 หน่วยงานของรัฐและองค์กรทางวิชาชีพด้านสุขภาพของประเทศตะวันตกเริ่มแนะนำให้หลีกเลี่ยงยาน้ำชนิดรับประทานที่มีส่วนประกอบของน้ำตาล ต่อมาในปี ค.ศ. 1989 คณะกรรมการนโยบายด้านอาหารทางการแพทย์ของอังกฤษมีมติว่า ผู้ปกครองและแพทย์ควรหลีกเลี่ยงยาน้ำที่มีน้ำตาลเป็นส่วนประกอบสำหรับผู้ป่วยเด็ก[13] และในปี ค.ศ. 1999 สมาคมทันตกรรมแห่งสหรัฐอเมริกาให้คำแนะนำอย่างหนักแน่นให้กำจัดน้ำตาลออกจากยาน้ำและสูตรยาอื่น ๆ[14]

จากแนวคิดดังกล่าว **desloratadine oral solution ถูกคิดค้นและพัฒนาให้ปราศจากน้ำตาล เพื่อลดความเสี่ยงทั้งในระยะสั้นและระยะยาว ลดผลกระทบต่อน้ำตาลในเลือดและปัญหาฟันผุ**

Desloratadine Oral Solution- synthetic dye free

อีกประเด็นหนึ่งที่เกี่ยวข้องกับสุขภาพของผู้ใช้ยา คือ สีสังเคราะห์ (synthetic dye) ถึงแม้จะเป็นองค์ประกอบย่อย ๆ แต่มีรายงานเหตุการณ์ไม่พึงประสงค์ที่อาจเกิดขึ้นที่เกี่ยวข้องกับสีย้อม ซึ่งมีอุบัติการณ์ของการแพ้ต่อสีย้อมของระบบทางเดินอาหาร เช่น ปวดท้อง อาหารไม่ย่อย อาเจียน และปฏิกิริยาทางผิวหนัง[15]

จากความเสี่ยงเรื่องสีสังเคราะห์ สมาคมกุมารแพทย์แห่งสหรัฐอเมริกา (American Academy of Pediatrics) จึงเสนอแนะให้บังคับกับฉลากผลิตภัณฑ์ยาทั้งในโรงพยาบาล และในร้านยา จะต้องแสดงองค์ประกอบของสารต่าง ๆ ในตำรับทั้งสารสำคัญ และองค์ประกอบอื่น ๆ ทั้งหมด รวมถึงสีสังเคราะห์ด้วย[15] และคณะกรรมาธิการยุโรปว่าด้วยผลิตภัณฑ์ยาสำหรับมนุษย์ได้ออกแนวทางกำหนดให้มีฉลากชี้แจงเกี่ยวกับโอกาสที่จะเกิดการแพ้ต่อสีสังเคราะห์ที่ผสมในผลิตภัณฑ์ยา[16]

Desloratadine oral solution จึงเป็นสูตรตำรับที่สอดคล้องกับแนวทางข้างต้น โดยเป็นสูตรตำรับยาที่ไม่มีสีสังเคราะห์และปราศจากน้ำตาล เพื่อหลีกเลี่ยงอาการแพ้สีสังเคราะห์และลดความเสี่ยงต่อฟันผุ ปัจจัยเหล่านี้นำไปสู่การคิดค้น desloratadine oral solution ซึ่งเป็นนวัตกรรมใหม่ของยาแก้แพ้ที่ออกแบบมาเพื่อเด็กโดยเฉพาะ

สรุป

Desloratadine oral solution ประกอบด้วยตัวยา desloratadine เป็นยาต้านฮีสตามีนที่เหมาะสำหรับการรักษาโรคภูมิแพ้ในเด็กตั้งแต่ 6 เดือนจนถึงผู้ใหญ่ มีจุดเด่นในด้านการออกฤทธิ์ยาวนาน ใช้เพียงวันละ 1 ครั้ง ไม่ทำให้ง่วงนอนในผู้ป่วยส่วนมาก จึงเหมาะสำหรับเด็กที่มักจะมีกิจกรรมทำในระหว่างวัน เป็นสูตรตำรับที่ไม่มีสีสังเคราะห์และน้ำตาล ช่วยลดความเสี่ยงต่อการแพ้สีสังเคราะห์และฟันผุ

เอกสารอ้างอิง

1. Simons FE. Advances in H1-antihistamines. N Engl J Med. 2004;351(21):2203 - 2217.
2. Church MK, Maurer M. : H(1)-antihistamines and urticaria: how can we predict the best drug for our patient? Clin Exp Allergy. 2012 Oct, 42 (10): 1423-1429.
3. Estelle F, Simon R. Advances in H1-antihistamines. N Engl J Med 2004;351:2203 - 2217.
4. Geha RS, Meltzer EO. Desloratadine: A new, nonsedating, oral antihistamine. J Allergy Clin Immunol. 2001;107(4):751 - 762.
5. Holgate ST, Canonica GW, Simons FER, Taglialatela M, Tharp M, Timmerman H, Yanai K. Consensus group on new generation antihistamines (CONGA): present status and recommendations. Clin Exp Allergy 2003;33:1305 - 1324.

6. Bartra J, Valero AL, del Cuvillo A, Dávila I, Jáuregui I, Montoro J, Mullol J, Sastre J. Interactions of the H1 antihistamines. J Investig Allergol Clin Immunol 2006;16 Suppl 1:29 - 36.

7. American Pharmacist Association. Drug Information Handbook. 17th ed. Hudson: Lexi-Comp; 2008.

8. MIMs. Aerius®: full prescribing info [Internet]. 2025 [cited 2025 March 16]. Available from: https://www.mims.com/thailand/drug/info/aerius?type=full

9. Blaiss MS. Safety and efficacy of desloratadine in allergic rhinitis and chronic urticaria. Allergy Asthma Proc. 2007;28(5):505 - 512.

10. Roberts KR, Linder L, Sund ML. Glucose incorporation by human dental plaque bacteria. Caries Res 1981;15:492 - 500

11. Maguire A, Rugg-Gunn AJ. Changes in the prescribing of liquid oral medicines (LOMs) in the northern region of England between 1987 and 1992 with special regard to sugar content and long-term use in children. Community Dent Health 1997; 14:31 - 35

12. Shaw L, Glenwright HD. The role of medications in dental caries formation: need for sugar-free medication for children. Pediatrician 1989;16:153 - 155

13. Department of Health, Report on Health & Social Subjects No 37 Dietary Sugars and Human Disease. Report of the Panel on Dietary Sugars, Committee on Medical Aspects of Food Policy. London: HSMO, 1989

14. American Dental Association Position Statement. Role of sugar free foods and medications in maintaining good oral health [Internet]. 1999 [cited 1999 November 1] Available from: http://www.ada.org/prof/resources/positions/statements/sugarfre.asp

15. American Academy of Pediatrics Committee on Drugs. ‘Inactive’ ingredients in pharmaceutical products: update (subject review). Pediatrics 1997;99:268 - 278

16. European Commission. Guidelines, Volume 3B– Medicinal Products for Human Use. Excipients in the label and package leaflet of medicinal products for human use. July 2003