@ Korea Pharmaceutical Information Center

항히스타민제

요약

항히스타민제는 두드러기, 발적, 소양감 등의 알레르기성 반응에 관여하는 히스타민의 작용을 억제하는 약물이다. 알레르기성 질환 외에도 콧물, 재채기, 불면, 어지러움증, 구토, 멀미 등을 완화하는데 사용된다. 약물의 종류에 따라 정도가 다르기는 하지만 대표적인 부작용은 졸음, 진정작용과 같은 중추신경계 부작용이다.

외국어 표기

antihistamines(영어)

유의어·관련어: 알레르기약, antiallergic drug, 멀미약, anti-motion sickness drug, 두드러기약, anti-urticaria drug 콧물약, drug for runny nose, 비염약, drug for rhinitis

$$R^{1}-X-C-C-N$$
 R^{2}
 R^{3}

대부분의 항히스타민제 - 에틸아민 (ethylamine) 그룹의 구조식

약리작용

히스타민(histamine)은 세포증식, 분화와 혈구 생성, 염증반응, 조직 재생과 신경전달 등에 관여하는 단백질 이다. 우리 몸에서 히스타민은 H_1 , H_2 , H_3 , H_4 의 4가지 수용체를 통하여 작용을 나타낸다. 혈관확장과 혈관 의 투과성 증가, 피부신경 자극에 의한 소양증(搔痒症, 피부 가려움증) 등은 H1-히스타민 수용체를 통하여 작용을 나타내는 대표적인 증상이다. 세티리진(cetirizine)이나 로라타딘(loratadine) 등의 항히스타민제 (antihistamines)는 이러한 H₁-수용체를 차단하여 알레르기성 비염, 두드러기, 발적*, 소양감 등의 알레르

기성 반응을 치료하는데 사용되다. 또한 코막힘을 개선해주는 약물과 함께 코감기, 알레르기성 비염으로 인한 재채기, 콧물, 코막힘 등에도 사용된다. 그 밖에 디펜히드라민(diphenhydramine)은 일시적 불면증의 치료제로 사용되며, 디멘히드리네이트(dimenhydrinate), 메클리진(meclizine) 등은 구토, 현기증, 멀미 등에 사용되고 있다. 항히스타민제의 효과와 부작용은 종종 개인마다 다르게 나타나므로 복용 후 약효와 부작용을 잘 관찰 하여 개인별로 적합한 약물을 찾는 것이 도움이 된다.

* 발적: 모세혈관의 충혈에 의하여 피부 및 점막이 붉은색을 피는 현상

효능·효과

알레르기 질환(알레르기성 비염과 알레르기성 결막염, 두드러기), 코감기에 의한 콧물, 재채기, 불면, 어지러움 증, 구토, 멀미 등에 다양하게 사용된다.

종류

1940년대 이후 개발된 1 세대 항히스타민제와 1980년대 이후에 개발된 2 세대 항히스타민제로 통상 분류 된다. 1 세대 항히스타민제는 약효지속시간이 짧아서 여러 번 투여를 해야 하는 반면, 체내 반감기가 길어서 졸음이나 기억력 저하 등의 중추신경계에 대한 작용은 지속되는 경향이 있다. 2 세대 항히스타민제는 혈액-뇌 장벽(blood-brain barrier, BBB)*을 투과하는 특성이 매우 낮거나 없어 진정작용이 매우 낮다. 또한 대부분 약효지속시간이 길어서 하루 1~2회 투여한다.

Table 1. 항히스타민제 분류

구분	약물명
1 세대 항히스타민제	클로르페니라민(chlorpheniramine), 트리프롤리딘(triprolidine), 피프린히드리네이트(piprinhydrinate), 히드록시진(hydroxyzine), 메퀴타진(mequitazine), 디펜히드라민(diphenhydramine), 디멘히드리네이트(dimenhydrinate), 메클리진(meclizine)
2 세대 항히스타민제	세티리진(cetirizine), 로라타딘(loratadine), 레보세티리진(levocetirizine), 에바스틴(ebastine), 케토티펜(ketotifen), 펙소페나딘(fexofenadine), 아젤라스틴(azelastine), 데스로라타딘(desloratadine), 베포타스틴(bepotastine), 올로파타딘(olopatadine), 에메다스틴(emedastine), 에피나스틴(epinastine), 레보카바스틴(levocabastine)

* 혈액-뇌 장벽(blood-brain barrier. BBB): 혈액과 뇌 사이의 장벽을 칭하며. 혈액-뇌 장벽을 투과하는 약물의 경우 졸음, 진정작용과 같은 중추신경계 부작용을 나타낼 수 있다.

부작용

항히스타민제의 가장 흔한 부작용은 진정, 졸음, 피로감, 기억력 감퇴, 집중장애 등의 중추신경계 부작용 이다. 이러한 중추신경계 부작용은 항히스타민제 권장 용량에서도 흔하게 나타날 수 있으나 때로는 이러한 부작용이 알레르기 증상을 완화시키는데 도움이 되기도 한다. 2 세대 항히스타민제는 1 세대에 비하여 진정 등의 중추신경계 부작용은 상대적으로 낮다. 항히스타민제의 중추신경계 부작용은 여성, 고령자, 작은 체구, 간과 신장기능 저하, 중추신경계 이상이 있는 경우에 더 흔하므로 투여 시 주의해야 한다.

항히스타민제는 심장 내의 칼륨 통로(potassium channel)를 차단하여 부정맥 등의 심장 독성 부작용을 유발 할 수 있다. 1 세대 항히스타민제 중 디펜히드라민, 히드록시진 등이 용량의존적으로 심장 독성을 나타내며. 국내에서는 디펜히드라민 과량 복용에 의한 심실 부정맥이 보고된 적이 있으므로 주의가 필요하다.

기타 부작용으로 변비, 설사, 메스꺼움, 구토 등의 소화기계 부작용이 나타날 수 있다. 항콜린 (anticholinergic) 작용*에 의한 입, 코, 목의 건조함, 드물지만 배뇨 곤란이나 시력장애, 빈맥(빠른 맥박) 등도 나타날 수 있다.

그 외에 부작용에 관한 상세한 정보는 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다. 부작용이 발생 하면 의사, 약사 등 전문가에게 알려 적절한 조치를 취할 수 있도록 한다.

* 항콜린(anticholinergic) 작용: 부교감신경 말단에서 분비되는 신경전달 물질인 아세틸콜린(acetylcholine) 수용체를 차단 하여 그 작용을 억제한다. 혈압 상승, 소화관 연동운동 저하, 침을 비롯한 소화액 분비 감소, 호흡기 근육 이완, 호흡기 내 분비물 억제 작용 등이 대표적이다.

주의사항

• 졸음, 주의력, 집중력 저하가 일어날 수 있으므로 자동차 운전이나 위험을 수반하는 기계조작, 집중을 요 하는 작업에 종사하는 사람들은 복용하지 않도록 한다.

- 항콜린 작용에 의한 배뇨 및 시력장애가 나타날 수 있으므로 전립선비대증 환자나 녹내장 환자에게는 투여 하지 않도록 한다.
- 중추신경억제제 또는 항콜린성 약물과 병용투여 시 용량 조절이 요구될 수 있다.
- 졸음, 진정작용과 같은 중추신경계 부작용이 증가될 수 있으므로 항히스타민제 복용 시 알코올을 섭취하지 않도록 한다.

항히스타민제 장기 복용 시 안전성

항히스타민제는 알레르기성 질환이나 상기도 감염 등 여러 증상에 빈번하고 다양하게 사용된다. 따라서 항히스 타민제 장기 복용 시 약물의 내성이나 중독성에 대해 우려하는 경우가 종종 있다. 대부분의 2세대 항히스타 민제의 경우 장기 복용 시 내성이나 중독성은 나타나지 않으나 복용 중단 후에도 3~4일 정도 약효가 유지 되기도 한다. 1세대 항히스타민제에 대해서는 알려진 바가 없다.