



Mi Universidad

Resumen

Mireya Pérez Sebastián

Antihistamínico

Parcial II

Terapéutica Farmacológica

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillen

Medicina Humana

Cuarto Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas. 09 de Abril 2025.

ANTIHISTAMINICO

La histamina es una amina básica endógena que se distribuye en todos los tejidos. Lo que se sintetiza por descarboxilación de aminoácidos L-histidina, mediante la L-histidina descarboxilasa y la L-dopa descarboxilasa, aunque la primera tiene mayor afinidad por el aminoácido. La histamina se libera o es liberado en reacciones alérgicas. Los antihistamínicos son medicamento que bloquean la acción de la histamina, una sustancia que el cuerpo libera durante una reacción alérgica, para aliviar síntomas como picazón, estornudos y lagrimeos. La función de los antihistamínicos son fármacos que se utilizan para tratar los síntomas de las alergias, bloqueando la acción de la histamina, una sustancia química que el cuerpo libera como respuesta a un alérgeno. Existe dos tipos principales de antihistamínico;

- Antihistamínico de primera generación/ sedante/antiguo.
- Antihistamínico segunda generación/ no sedente.

Se almacena en los mastocitos del tejido conectivo, y como también el sistema nervioso central; y como de igual forma se libera de forma fisiológica de una forma del jugo gástrico. Se metaboliza mediante la acción de la histamina, o por la metilación por la enzima metiladora imidazol N-metiltransferasa.

La histamina ejerce su acción por un efecto sobre receptores específicos. Actualmente existen cuatro tipos de receptores denominados:

- H1
 - H2
 - H3
 - H4
 - Acoplados a proteína G, solo que con sistemas de señalización diferentes.
-
- H1: Se localiza en la membrana células musculares de vasos sanguíneos.
 - H2: Se localiza en la membrana células parietales de la mucosa gástrica.
 - H3: Se localiza en tejidos; como las de los pulmones, el estómago, el intestino, el páncreas y sistema nervioso central.
 - H4: Se localiza en la médula ósea y de igual forma como la célula hematopoyética (eosinófilos y mastocitos).

Clasificación: en la que se clasifica como; (antagonistas de los receptores histamínicos H1, H2, H3, H4). Y (Inhibidores de la liberación de histamina.

Y ya mencionado, los antagonistas H1, se divide en antiguos, clásico, de primera generación o sedante y antihistamínico de segunda generación o no sedante.

Los **de primera generación** producen: mayor o menor grado, sedación y somnolencia, lo que limita su uso.

Los **de segunda generación**: se diferencia de los clásicos fundamentales en que tiene una mayor afinidad por el receptor H₁, ya que no atraviesa la barrera hematoencefálica, por lo que no producen sedación ni somnolencia y carecen de efectos anticolinérgicos, y no contiene efectos antivértigo y ni antimareo.

Antagonistas de los receptores H₁ de la histamina: la histamina que se libera es una reacción alérgica, al actuar sobre los receptores H₁, producen un aumento de la permeabilidad capilar y la liberación de sustancias bioactivas (óxido nítrico), vasodilatación y broncoespasmos). Los antagonistas H₁ pueden inhibir en mayor o menor grado de efecto.

Mecanismo de acción: los antagonistas de los receptores histamínicos H₁, tiene un grupo alquilamina parecida a la cadena lateral de la histamina. Su acción no es selectiva, inhibe a receptores colinérgicos periféricos y centrales, como los serotoninérgicos.

Acciones farmacológicas:

- Primera generación: efecto no deseado, aumento de peso, tiene una acción sedante e hipnótica, aunque en niños y a dosis elevada en adulto puede producir la estimulación del sistema nervioso, que se manifiesta con inquietud, nerviosismo e insomnio. A nivel cardiovascular inhibe la vasoconstricción, a nivel periférico inhibe aumento de la permeabilidad capilar, el prurito, y el bronco constricción, y la concentración intestinal.
- Segunda generación: bloquea de manera más selectiva a los receptores H₁, tienen escasas actividades anticolinérgica y no atraviesan la barrera hematoencefálica, por lo que carece de los efectos sedantes a las dosis recomendadas habituales.

Características específicas:

Primera generación: las alquilamina, la dexclorfeniramina, posee una acción anticolinérgica, vía tópica es efectivo para el tratamiento de prurito inducido por la liberación de histamina. Las etanolaminas: producen intensa sedación, elevada la acción anticolinérgica. La etilendiaminas: presentan menos sedación, y una mayor incidencia malestar de gastrointestinal.

Segunda generación: tienen interacciones menos con otros receptores. Como los colinérgicos y serotoninérgicos, menos sedantes. Pertenecen a la familia piperidinas y grupos antihistamínicos no sedante fue la terfenadina. Se han descrito efectos cardíacos tóxicos (torsade de pointes), otros antihistamínicos de segunda generación no se encuentran, como ocurre con la cetirizina y otros.

Farmacocinética:

Se administra por vía oral, aunque en situaciones de urgencia puede usarse la vía intravenosa. Y también vía tópica; el antihistamínico de primera generación se absorbe bien por vía oral. Su biodisponibilidad menor 50% a su efecto de primer paso. Su concentración plasmática alcanza 2-3 horas. Lo cual se metaboliza en el hígado, por el citocromo P450.

Los antihistamínicos de segunda generación, se absorbe por vía oral, y alcanza su concentración máxima 3 horas, debido a su liposolubilidad. Las uniones de proteínas plasmáticas varían según el antihistamínico considerado. La levocetirizina y la ceterizina son eliminadas de forma inalteradas en la orina y tanto la rupatadina como la fexofenadina son excretadas por las heces. Se metabolizan por el citocromo P450.

Efectos adversos:

Los antihistamínicos de primera generación, por su consecuencia de su acción al sistema nervioso central, provoca: somnolencia, astenia, debilidad, ataxia, visión borrosa, diplopía, y vértigo; sobre el aparato cardiovascular provoca: taquicardia, extrasístoles, hipertensión e hipotensión arterial, y por el aparato digestivo provoca: náuseas, molestias epigástricas, vómito, diarrea, pérdida de apetito, y estreñimiento, provoca sequedad en la garganta, en la nariz, boca;

Los antihistamínicos de segunda generación, están relativamente libres de efectos adversos y en caso de sobredosis parecen tener poco efecto toxico. Pocos estudios han estudiado que puede provocar somnolencia y fatiga.

Interacciones farmacológicas:

Las fenotiazinas, por su actividad anticolinérgica, cuando se asocian a otros fármacos depresores pueden producir hipotensión, hipotermia y depresión respiratoria. La acción sedante de los antihistamínicos HI, de primera generación es aditiva a todos los depresores centrales, como los barbitúricos y el alcohol. Se debe evitar la ingesta conjunta de bilastina y fexofenadina con otros ciertos fármacos como el verapamilo y como alimentos como el consumo de zumos de naranja amarga o pomelo, ya que pueden modificar su biodisponibilidad.

Aplicaciones terapéuticas:

Se utiliza para el tratamiento de procesos alérgicos exudativos. Es posible identificar el posible agente desencadenante. En rinitis y conjuntivitis alérgica de tipo estacional, alivia la rinorrea, el estornudo y el picor de ojos, nariz y garganta. Y de acción sedante, disminuye los síntomas agudos de la picadura de insectos; y también para tratamiento de urgencia de las reacciones anafilácticas. Dosis utilizada en vía subcutánea, intramuscular, o vía intravenosa es de una dosis: 0,3 mg al 1/1.000.

Bibliografía

1. Castells-Hernández. Farmacología en enfermería. Margarita Hernández Pérez; Josefina Graciela Castañeda Suardíaz. 4ª Edición. Fármacos antihistamínicos y antiserotonínicos: M. D. López Franco.