



Mi Universidad

Resumen de Antihistamínicos

Casandra Solís Pinto

Parcial 2

Farmacología Terapéutica

DR.Adolfo Brayan Medellin Guillen

Medicina Humana

Cuarto Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas a 09 de Abril del 2025 .

1. Introducción

Los antihistamínicos son fármacos diseñados para bloquear la acción de la histamina, una amina biogénica fundamental en la respuesta inflamatoria y alérgica. La liberación de histamina se produce en situaciones como reacciones alérgicas, infecciones, trauma y ciertos procesos inflamatorios, lo que desencadena síntomas que van desde el prurito y eritema hasta reacciones sistémicas en casos severos. Su empleo terapéutico es amplio y abarca desde el alivio de los síntomas nasales hasta el manejo de trastornos gastrointestinales en el caso de los antagonistas H₂.

2. Clasificación y Diferencias Generacionales

2.1 Según la Generación

Primera Generación

Ejemplos: Difenhidramina, clorfeniramina, hidroxizina.

Características: 1.-Lipofilia y Cruce de la Barrera Hematoencefálica: Debido a su alta solubilidad lipídica, estos fármacos penetran el sistema nervioso central, lo que genera efectos sedantes y, en ocasiones, deterioro cognitivo o motor.

2.-Perfil Anticolinérgico: Pueden causar sequedad bucal, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento.

3.-Aplicaciones Adicionales: Además de su uso en alergias, se emplean en el manejo de mareos, insomnio y náuseas.

Segunda Generación

Ejemplos: Loratadina, cetirizina, fexofenadina, desloratadina.

Características: 1.-Menor Penetración al SNC: La estructura química de estos fármacos limita su capacidad de atravesar la barrera hematoencefálica, reduciendo así los efectos sedantes.

2.-Mayor Selectividad Periférica: Se enfocan en bloquear receptores H₁ situados en tejidos periféricos, lo que disminuye la incidencia de efectos secundarios asociados al sistema nervioso central.

3.-Perfil de Seguridad Mejorado: Su uso a largo plazo es más seguro en poblaciones sensibles como ancianos y niños.

2.2 Según el Tipo de Receptor Bloqueado

Antihistamínicos H1: 1.-Se utilizan principalmente para contrarrestar la acción de la histamina en reacciones alérgicas y en algunas condiciones inflamatorias.

2.- Además de bloquear la acción de la histamina, pueden influir en la permeabilidad vascular y en la señalización neuronal, contribuyendo a la reducción de la inflamación y el alivio del prurito.

Antihistamínicos H2:

- Ejemplos: Ranitidina, famotidina, cimetidina.
- Mecanismo en el Sistema Digestivo: Actúan sobre los receptores H2 localizados en las células parietales del estómago, reduciendo la secreción de ácido gástrico.
- Aplicaciones Clínicas: Son fundamentales en el tratamiento de úlceras pépticas, reflujo gastroesofágico, dispepsia y en algunos casos, la prevención del síndrome de estrés en pacientes críticos.

3. Mecanismo de Acción Detallado

3.1 Bloqueo Competitivo de Receptores

- Antagonismo de Receptores H1:
Los antihistamínicos se unen de forma competitiva a los receptores H1, impidiendo que la histamina se acople a ellos. Esto lleva a una disminución de los efectos vasodilatadores y de la permeabilidad capilar, lo que se traduce en la reducción de la inflamación, enrojecimiento y prurito asociados a reacciones alérgicas.
- Interferencia en Vías de Señalización:
Al bloquear la activación del receptor H1, se impide la activación de segundos mensajeros (como el inositol trifosfato [IP3] y el diacilglicerol [DAG]) que normalmente perpetúan la respuesta inflamatoria y alérgica.

3.2 Mecanismo Específico de los Antihistamínicos H2

- Reducción de Secreción Ácida:
Al bloquear los receptores H2 en las células parietales gástricas, estos fármacos disminuyen la producción de ácido, ayudando a aliviar y prevenir lesiones en la mucosa gástrica.
- Uso como Profilaxis: Su utilización en la prevención de úlceras inducidas por estrés y en el manejo del reflujo proporciona una opción terapéutica eficaz, complementando la terapia con otros agentes anti pépticos.

4. Indicaciones Terapéuticas Ampliadas

4.1 Trastornos Alérgicos e Inflamatorios

- Rinitis Alérgica y Conjuntivitis:
Los síntomas nasales y oculares se alivian gracias a la reducción de la respuesta inflamatoria local.
- Urticaria y Dermatitis:
Ayudan a disminuir el prurito y el enrojecimiento en afecciones cutáneas.
- Alergias Alimentarias y Medicamentosas:
Aunque su uso en anafilaxia es como complemento (junto con adrenalina), pueden contribuir al manejo de reacciones menos severas.

4.2 Trastornos Respiratorios

- Asma:
Utilizados como complemento en el manejo de la rinitis alérgica concomitante, aunque no son medicamentos broncodilatadores primarios.
- Otras Condiciones Pulmonares:
En algunos casos se ha documentado su uso en la reducción de la hipersecreción nasal en infecciones respiratorias.

4.3 Aplicaciones Gastrointestinales (Antihistamínicos H2)

- Enfermedad por Reflujo Gastroesofágico (ERGE):
Reducen la secreción de ácido, aliviando síntomas de irritación y esofagitis.
- Úlceras Pépticas y Dispepsia:
Pueden formar parte del tratamiento para prevenir daños en la mucosa gástrica.

4.4 Usos Especiales y Off-Label

- Control de Náuseas y Vómitos:
Especialmente con fármacos de primera generación, aprovechando sus efectos en el sistema vestibular.
- Trastornos del Sueño:
Algunos se emplean de forma puntual para inducir el sueño en pacientes con insomnio, aunque su uso debe ser cauteloso ante la posibilidad de dependencia o tolerancia.

5. Efectos Secundarios y Perfil de Seguridad

5.1 Efectos Adversos Comunes

Fármacos de Primera Generación:

- Sedación y Somnolencia:
Debido al cruce al SNC, provocan somnolencia que puede afectar la capacidad para conducir o realizar tareas que requieran atención.
- Efectos Anticolinérgicos:
Sequedad de boca, estreñimiento, retención urinaria y visión borrosa.
- Deterioro Cognitivo:
En pacientes de edad avanzada o en quienes se usan dosis elevadas, puede presentarse confusión o disminución en la memoria.

Fármacos de Segunda Generación:

- Menor Incidencia de Efectos Centrales:
Aunque pueden causar somnolencia en dosis muy altas, el perfil sedante es significativamente menor.
- Reacciones Cutáneas y Cefaleas:
En algunos pacientes se han reportado efectos como dolor de cabeza o reacciones dermatológicas leves.

5.2 Consideraciones Específicas de Seguridad

- Interacciones Medicamentosas:
La combinación con otros depresores del SNC (alcohol, benzodiazepinas, antipsicóticos) puede potenciar la sedación. Asimismo, algunos antihistamínicos pueden interferir con el metabolismo de otros fármacos a través del sistema enzimático hepático.
- Contraindicaciones Absolutas y Relativas:
 - Pacientes con Glaucoma de Ángulo Cerrado: El efecto anticolinérgico puede aumentar la presión intraocular.
 - Hiperplasia Prostática o Retención Urinaria: Se debe tener precaución en pacientes con estos antecedentes.

- Poblaciones Vulnerables: Niños, ancianos y pacientes con comorbilidades hepáticas o renales requieren ajustes de dosificación y vigilancia estrecha.

6. Farmacodinámica: Respuesta Celular y Molecular

6.1 Interacción con Receptores

- Unión y Afinidad:
La eficacia del bloqueo histaminérgico depende en gran medida de la afinidad del fármaco por el receptor H1 o H2. Esta interacción se estudia en términos de constante de disociación (K_d), la cual determina la rapidez y fuerza con la que se inhibe la función receptor.

6.2 Efectos Secundarios Relacionados con la Estructura Molecular

- Determinantes Lipofílicos:
Los compuestos con estructuras lipofílicas potentes presentan mayor permeabilidad al SNC. Por ello, modificaciones estructurales han llevado al diseño de fármacos con mayor polaridad en la segunda generación.
- Modulación de la Respuesta Inmune:
Aunque el principal efecto es la inhibición de la acción de la histamina, algunos estudios sugieren que ciertas moléculas pueden modular la liberación de otros mediadores inflamatorios, contribuyendo a efectos antiinflamatorios secundarios.

7. Consideraciones Clínicas y Prácticas en el Uso de Antihistamínicos

7.1 Selección del Fármaco Adecuado

- Evaluación de la Historia Clínica:
Es indispensable identificar antecedentes como glaucoma, retención urinaria, disfunción hepática o renal, y uso concomitante de otros fármacos depresores del SNC.
- Tipo y Severidad de la Reacción:
En reacciones alérgicas leves o moderadas se prefiere el uso de antihistamínicos de segunda generación, mientras que en episodios agudos y severos puede justificarse el uso de agentes de primera generación (si bien se debe tener cautela por sus efectos adversos).

7.2 Herramientas Digitales y Representación Multimedia

- **Infografías y Diagramas de Flujo:**
Se recomienda el uso de materiales visuales para representar el mecanismo de acción, las diferencias estructurales y las rutas metabólicas. Las infografías pueden ayudar a comprender mejor la dinámica entre la liberación de histamina y la respuesta farmacológica.
- **Presentaciones Interactivas:**
El desarrollo de presentaciones que integren animaciones y explicaciones detalladas del proceso de bloqueo receptor permite una educación más dinámica y efectiva.
- **Recursos Multimedia y Videos Educativos:**
La incorporación de videos explicativos, simulaciones de interacción a nivel molecular y testimonios clínicos aporta diversidad a la metodología de enseñanza.

7.3 Monitoreo y Seguimiento Terapéutico

- **Vigilancia de Efectos Secundarios:**
Es fundamental realizar un seguimiento en pacientes que inician tratamiento, sobre todo en aquellos en los que se emplean fármacos de primera generación, para ajustar la dosificación o cambiar a alternativas menos sedantes.

Bibliografías

Hernández Pérez, M., & Castañeda Suardiaz, J. G. (2014). Castells-Hernández. Farmacología en enfermería. Elsevier Health Sciences. <https://books.google.es/books?hl=es&lr=&id=KAEFEQAAQBAJ>