



Mi Universidad

Resumen antihistamínicos

Carla Sofia Alfaro Domínguez

Parcial 2

Farmacología

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillén

Medicina Humana

Cuarto semestre grupo A

La Trinitaria, Chiapas, a 05 de abril del 2025

ANTI-HISTAMINICOS

Los antihistamínicos son fármacos que bloquean la acción de la histamina, una sustancia involucrada en las respuestas alérgicas e inflamatorias del organismo. Se clasifican principalmente en dos categorías según el receptor de histamina que antagonizan: antihistamínicos H1 y H2.

Para comprender el mecanismo de estos fármacos es importante hablar sobre la histamina.

La histamina es una amina básica endógena que se distribuye en todos los tejidos. Se sintetiza por la descarboxilación del aminoácido L-histidina, mediante la L- histamina descarboxilasa y la L-dopa descarboxilasa.

Se libera de forma fisiológica en diversos procesos patológicos. La histamina ejerce su acción por un efecto sobre receptores específicos. Actualmente se conoce la existencia de 4 tipos de receptores (H1-H2-H3-H4).

Antihistamínicos H₁: Utilizados para tratar síntomas alérgicos como rinitis, urticaria y conjuntivitis.

Antihistamínicos H₂: Empleados en el tratamiento de condiciones relacionadas con la secreción gástrica, como úlceras pépticas y reflujo gastroesofágico.



Mecanismo de Acción

Los antihistamínicos actúan como antagonistas competitivos de la histamina, uniéndose a los receptores H_1 o H_2 sin activarlos, lo que impide que la histamina ejerza su efecto. Al bloquear estos receptores, se previenen o reducen los síntomas asociados a la liberación de histamina.

Clasificación y Generaciones de Antihistamínicos H_1

Los antihistamínicos H_1 se dividen en tres generaciones, cada una con características distintivas:

Primera Generación: Estos fármacos son lipofílicos y atraviesan fácilmente la barrera hematoencefálica, lo que les permite actuar en el sistema nervioso central (SNC). Debido a esto, pueden causar sedación y otros efectos adversos centrales. Además, tienen baja selectividad, interactuando con otros receptores como muscarínicos, serotoninérgicos y alfa-adrenérgicos, lo que puede provocar efectos anticolinérgicos (sequedad de boca, visión borrosa, estreñimiento) y cardiovasculares.

Ejemplos incluyen:

- Difenhidramina-----
- Clorfeniramina-----
- Prometazina-----

Segunda Generación: Más selectivos para los receptores H₁ periféricos y menos propensos a cruzar la barrera hematoencefálica, lo que reduce significativamente la sedación y otros efectos centrales. Son preferidos para el tratamiento de condiciones alérgicas debido a su perfil de seguridad mejorado.

Ejemplos incluyen:

-Loratadina-----



-Cetirizina-----



-Fexofenadina-----



Tercera Generación: Consisten en metabolitos activos o enantiómeros de los antihistamínicos de segunda generación, diseñados para mejorar la eficacia y minimizar efectos adversos. Ofrecen una mayor seguridad y son menos propensos a interacciones medicamentosas.

Ejemplos incluyen:

-Levocetirizina (metabolito activo de la cetirizina)-----



-Desloratadina (metabolito activo de la loratadina)-----



Interacciones Farmacológicas

Los antihistamínicos pueden interactuar con otros medicamentos, potenciando o disminuyendo sus efectos. Por ejemplo, los de primera generación pueden aumentar la sedación cuando se combinan con alcohol, sedantes o tranquilizantes. Además, algunos antihistamínicos H₁ de primera generación son sustratos del citocromo P450, lo que puede llevar a

interacciones con fármacos que inhiben o inducen estas enzimas, alterando sus concentraciones plasmáticas.

Aplicaciones Terapéuticas

Los antihistamínicos H₁ se utilizan en el tratamiento de diversas condiciones alérgicas, incluyendo:

- + **Rinitis alérgica:** Alivian síntomas como estornudos, picazón nasal y rinorrea.
- + **Urticaria:** Reducen el prurito y las lesiones cutáneas.
- + **Conjuntivitis alérgica:** Disminuyen el enrojecimiento y la picazón ocular.
- + **Dermatitis atópica:** Aunque su eficacia es limitada, pueden ayudar a controlar el prurito.

Grupos de Edades y Dosis

La dosificación de los antihistamínicos varía según el fármaco específico, la edad del paciente y la condición a tratar. Es esencial consultar las guías de dosificación específicas y considerar factores individuales como la función hepática y renal. En general, se recomienda precaución al administrar antihistamínicos a niños y ancianos debido a una mayor susceptibilidad a los efectos adversos. Por ejemplo, los antihistamínicos de primera generación deben usarse con cautela en niños, ya que pueden causar efectos adversos significativos, especialmente cuando se combinan con otros fármacos.

Difenhidramina:

- Adultos y adolescentes: 25-50 mg por vía oral cada 4-6 horas.
- Niños 6-12 años: 12.5-25 mg por vía oral cada 4-6 horas.
- Niños 2-6 años: 6.25 mg por vía oral cada 4-6 horas.

Loratadina:

- Adultos y niños mayores de 6 años: 10 mg una vez al día.
- Niños 2-6 años: 5 mg una vez al día

Cetirizina:

- Adultos y niños mayores de 6 años: 10 mg una vez al día.
- Niños 2-6 años: 5 mg una vez al día.

Efectos Adversos

Los efectos adversos dependen de la generación del antihistamínico:

Primera Generación: Sedación, somnolencia, mareos, efectos anticolinérgicos (sequedad de boca, visión borrosa, estreñimiento, retención urinaria), aumento del apetito y ganancia de peso.

Segunda y Tercera Generación: Generalmente mejor tolerados, con menor incidencia de sedación y efectos anticolinérgicos. Sin embargo, pueden presentarse cefaleas, náuseas y, raramente, efectos cardiovasculares como prolongación del intervalo QT en dosis elevadas o en combinación con otros fármacos que afectan el ritmo cardíaco.

Consideraciones Especiales:

Las consideraciones especiales para el uso de antihistamínicos dependen del tipo de antihistamínico (H1 o H2), la generación (primera o segunda), y el grupo de población al que va dirigido (niños, adultos mayores, embarazadas, personas con enfermedades crónicas, etc.)

I. Efectos sobre el sistema nervioso central (SNC)

- Primera generación de HI (como difenhidramina, clorfeniramina, prometazina): pueden causar sedación, somnolencia, alteración de la coordinación y confusión, especialmente en ancianos.
- Pueden disminuir el estado de alerta y afectar la conducción de vehículos o maquinaria.
- En niños, paradójicamente, pueden causar excitación o irritabilidad en lugar de sedación.

2. Embarazo y lactancia

- Muchos antihistamínicos son categoría B o C según la FDA (riesgo no descartado).
- Loratadina y cetirizina son generalmente consideradas seguras en el embarazo, especialmente en el segundo y tercer trimestre.
- Prometazina puede ser usada con precaución en embarazo para náuseas.
- En lactancia, se debe tener precaución con los antihistamínicos sedantes, ya que pueden pasar a la leche materna y provocar somnolencia o irritabilidad en el lactante, además de reducir la producción de leche.

3. Uso en adultos mayores

- Mayor riesgo de efectos anticolinérgicos: retención urinaria, sequedad de boca, visión borrosa, estreñimiento y deterioro cognitivo.
- Aumenta el riesgo de caídas por sedación y aturdimiento.
- Se prefiere el uso de antihistamínicos de segunda generación (como loratadina o fexofenadina), por su mejor perfil de seguridad.

4. Uso en pediatría

- No se recomienda el uso de antihistamínicos sedantes en menores de 2 años debido al riesgo de depresión respiratoria.
- En niños mayores, se deben usar con precaución y bajo prescripción médica.
- Algunas formulaciones en jarabe pueden contener alcohol o edulcorantes artificiales.

5. Interacciones farmacológicas

Antihistamínicos sedantes potencian el efecto de:

- Alcohol
- Benzodiacepinas
- Antidepresivos tricíclicos
- Barbitúricos
- Opiáceos

- Cimetidina (antihistamínico H₂) inhibe el citocromo P450, alterando el metabolismo de otros medicamentos como warfarina, teofilina, diazepam, entre otros.

6. Enfermedades cardiovasculares y metabólicas

- Algunos antihistamínicos de primera generación pueden causar taquicardia o hipotensión.
- En pacientes con hipertensión, arritmias o enfermedades hepáticas, se recomienda monitorización y preferencia por antihistamínicos más selectivos.
- Astenia y aumento de peso se han reportado con uso prolongado.

Recomendaciones clínicas

- Usar la menor dosis efectiva durante el menor tiempo posible.
- Preferir antihistamínicos no sedantes si el paciente necesita estar alerta (trabajo, estudios, manejo).
- Elegir según perfil del paciente: edad, comorbilidades, embarazo, etc.

CONCLUSION

Los antihistamínicos constituyen un grupo farmacológico fundamental en el manejo de diversas afecciones alérgicas y gastrointestinales. Su eficacia se basa en su capacidad para antagonizar la acción de la histamina, una amina biógena clave en los procesos inflamatorios, alérgicos y en la secreción ácida gástrica. La evolución de estos fármacos ha permitido el desarrollo de generaciones más específicas y seguras, con menos efectos adversos y mejor tolerancia, especialmente en poblaciones sensibles como los niños, adultos mayores y embarazadas.

La primera generación de antihistamínicos, aunque efectiva, está limitada por sus efectos sedantes y anticolinérgicos, mientras que la segunda generación ha revolucionado el tratamiento de enfermedades alérgicas al ofrecer eficacia clínica sin comprometer la calidad de vida del paciente por somnolencia o interferencias cognitivas. Por su parte, los antihistamínicos H₂, aunque desplazados parcialmente por los inhibidores de la bomba de protones, siguen teniendo un papel importante en enfermedades ácido-pépticas y en situaciones clínicas específicas.

Sin embargo, el uso racional de los antihistamínicos requiere considerar múltiples factores: edad, enfermedades previas, embarazo, interacciones con otros medicamentos y posibles efectos secundarios. Su automedicación puede conllevar riesgos evitables, por lo que siempre se recomienda su uso bajo prescripción médica.

REFERENCIAS BIBLIOGRAFICAS

- Castells-Hernández. Farmacología en enfermería 4^a edición.
- Mayo clinic.