



Mi Universidad

**RESUMEN
ANTIHIISTAMINICOS**

Michelle Roblero Álvarez

Parcial II

Terapia Farmacológica

Dr. Adolfo Bryan Medellín

Medicina Humana

4to Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas a 09 de abril de 2025

Introducción

Los antihistamínicos constituyen un grupo de fármacos esencial para el tratamiento de múltiples procesos patológicos, principalmente de origen alérgico. La histamina, según la bibliografía consultada es una amina biogénica presente en numerosos tejidos, esta es liberada como respuesta a estímulos inmunológicos o físicos, provocando efectos sobre receptores específicos que desencadenan manifestaciones como prurito, broncoconstricción, secreción nasal y vasodilatación. En este contexto, los antihistamínicos actúan como antagonistas competitivos de los receptores de histamina, impidiendo su unión y bloqueando sus efectos fisiológicos.

La histamina y sus receptores

La histamina es sintetizada a partir del aminoácido histidina por acción de la enzima histidina descarboxilasa. Se almacena principalmente en los mastocitos, basófilos, células enterocromafines del estómago y neuronas del sistema nervioso central. Su liberación, mediada por procesos inmunológicos (como en las reacciones alérgicas de tipo I), provoca efectos sobre sus cuatro tipos de receptores que son: H1, H2, H3 y H4. Los antihistamínicos de uso clínico se centran principalmente en los receptores H1 y H2.

Los receptores H1 están ampliamente distribuidos en el músculo liso, endotelio vascular, sistema nervioso central y periferia. Su activación provoca síntomas típicos de reacciones alérgicas como broncoconstricción, aumento de la permeabilidad capilar, vasodilatación, urticaria y prurito.

Antihistamínicos H1: Mecanismo de acción y clasificación

Los antihistamínicos H1 actúan como antagonistas competitivos o inversos de los receptores H1, es decir, se unen a estos receptores y estabilizan su conformación inactiva, disminuyendo así los efectos inducidos por la histamina. No impiden la liberación de histamina, sino que bloquean su acción a nivel del receptor.

Se clasifican en dos generaciones:

- **Primera generación:** Incluyen fármacos como difenhidramina, clorfenamina, hidroxicina, prometazina y dimenhidrinato. Se caracterizan por su alta liposolubilidad, lo que les permite atravesar la barrera hematoencefálica con facilidad. Esto provoca efectos sedantes significativos, ya que actúan sobre receptores H1 del sistema nervioso central. Algunos de ellos también presentan actividad anticolinérgica, antiemética y antiparkinsoniana.
- **Segunda generación:** Comprenden loratadina, desloratadina, cetirizina, levocetirizina, fexofenadina y ebastina. Tienen una estructura química más polar, lo que reduce su penetración en el sistema nervioso central y, por ende, minimiza los efectos sedantes. Su selectividad por los receptores H1 periféricos los hace más seguros, con menos efectos secundarios y mejor tolerados, incluso con tratamientos prolongados.

Usos terapéuticos de los antihistamínicos H1

Los antihistamínicos H1 son ampliamente utilizados en el tratamiento de:

- Rinitis alérgica: Al bloquear los efectos de la histamina sobre la mucosa nasal, reducen la congestión, estornudos y rinorrea. Son efectivos tanto en rinitis estacional como perenne.
- Urticaria aguda y crónica: Disminuyen el prurito y el tamaño de las ronchas, siendo el tratamiento de primera línea.
- Dermatitis atópica y otras dermatosis pruriginosas: Utilizados como complemento para el control del prurito.
- Conjuntivitis alérgica: Reducen la hiperemia ocular, lagrimeo y prurito.
- Anafilaxia: Aunque no son el tratamiento principal, se emplean como adyuvantes tras la administración de epinefrina.
- Mareo por movimiento y náuseas: Algunos antihistamínicos de primera generación, como la meclizina y el dimenhidrinato, son útiles por su acción sobre el sistema vestibular.

- Insomnio: Difenhidramina e hidroxicina se utilizan ocasionalmente por su efecto sedante.
- Síntomas del resfriado común: Aunque la histamina no es el principal mediador en estas infecciones virales, su efecto anticolinérgico y sedante puede aliviar síntomas como la rinorrea y el insomnio asociado.

Efectos adversos de los antihistamínicos H1

Los efectos secundarios varían según la generación del fármaco:

- **Primera generación:** Provocan sedación, somnolencia, disminución de la concentración, visión borrosa, sequedad de boca, retención urinaria, estreñimiento y taquicardia. Estos efectos se deben a su acción sobre receptores muscarínicos, colinérgicos y adrenérgicos. También pueden presentar efectos extrapiramidales y paradójicamente, en niños, causar agitación.
- **Segunda generación:** Presentan menor incidencia de efectos adversos, pero ocasionalmente pueden causar cefalea, fatiga y molestias gastrointestinales. La fexofenadina, por ejemplo, tiene un buen perfil de seguridad.

Precauciones e interacciones

Algunos antihistamínicos pueden potenciar los efectos de otros depresores del sistema nervioso central como el alcohol, benzodiacepinas y barbitúricos. En el caso de los de primera generación, debe evitarse su uso en personas que requieran atención constante (como conductores) por su efecto sedante.

Los antihistamínicos H1 deben emplearse con precaución en pacientes con glaucoma de ángulo cerrado, hipertrofia prostática, obstrucción intestinal o retención urinaria. Además, ciertas combinaciones, como la de loratadina con inhibidores de la CYP3A4, pueden alterar la farmacocinética del medicamento, aumentando el riesgo de efectos adversos.

Antihistamínicos H2

Los antihistamínicos H2 (como ranitidina, famotidina y cimetidina) se utilizan para el tratamiento de afecciones gástricas, al inhibir la secreción ácida del estómago, estos

fármacos lo hacen bloqueando los receptores H₂ en las células parietales gástricas, reduciendo la secreción de ácido clorhídrico. Se utilizan en el tratamiento de úlceras gástricas y duodenales, enfermedad por reflujo gastroesofágico y condiciones hipersecretoras como el síndrome de Zollinger-Ellison. Su mecanismo y usos clínicos son distintos de los H₁, y su relevancia ha disminuido con la introducción de inhibidores de la bomba de protones.

Conclusión

Los antihistamínicos H₁ constituyen una familia farmacológica diversa, con usos clínicos que tratan más allá de las reacciones alérgicas. Su evolución desde la primera hasta la segunda generación ha permitido mejorar su perfil de seguridad y tolerancia, reduciendo los efectos sedantes y mejorando la adherencia terapéutica. Su acción como antagonistas de los receptores H₁ es clave para controlar una amplia gama de síntomas derivados de la acción de la histamina en los tejidos. El conocimiento detallado de su farmacodinamia, efectos adversos y posibles interacciones es esencial para garantizar una prescripción y administración segura y eficaz en los pacientes, reduciendo así la mayor cantidad de efectos secundarios que ciertos fármacos puedan tener.

Bibliografía

Castells Hernández, J. (2021). "Farmacología en enfermería" (6.^a ed.). Editorial Elsevier.