



Mi Universidad

ANTIISTAMÍNICOS

Dannia Gissela Díaz Díaz

2do Parcial

Bases Farmacológicas

Doctor: Adolfo Bryan Medellín Guillén

Medicina Humana

4to Semestre, Grupo "A"

Comitán de Domínguez, Chiapas a 09 de abril del 2025

ANTIHIITAMÍNICOS

Antes de comenzar es necesario definir qué son los antihistamínicos, estos son medicamentos que actúan bloqueando los receptores de histamina en el cuerpo. La histamina es una amina, que actúa en nuestro cuerpo tanto como hormona como neurotransmisor, que está implicada en diversas funciones fisiológicas y patológicas, principalmente en las reacciones alérgicas, inflamatorias y la secreción gástrica de ácido. Los antihistamínicos se dividen en dos grupos: los antagonistas de los receptores H₁ y los antagonistas de los receptores H₂.

Los antagonistas H₁ se utilizan principalmente en el tratamiento de enfermedades alérgicas como la rinitis alérgica, la urticaria, la conjuntivitis alérgica y en algunas situaciones como antieméticos o sedantes, mientras que los H₂ son fundamentales en el manejo de problemas gástricos relacionados con la producción excesiva de ácido. Ahora bien, entre los antihistamínicos H₁ de primera generación, tienen un mayor riesgo de somnolencia debido a su capacidad para atravesar la barrera hematoencefálica, estos actúan como antagonistas competitivos de los receptores H₁ de la histamina, al momento de bloquear estos receptores, previenen la activación de respuestas alérgicas mediadas por histamina, como vasodilatación, aumento de la permeabilidad capilar y contracción del músculo liso. Además, estos se absorben bien por vía oral, alcanzando concentraciones plasmáticas máximas en 1 a 2 horas, distribuyéndose de una mejor manera en el organismo. Los de primera generación atraviesan la barrera hematoencefálica, mientras que los de segunda generación tienen una penetración limitada en el sistema nervioso central, su metabolismo es hepático, a través de enzimas del citocromo P450, y su excreción es a través de la vía renal, con vidas medias que varían entre 4 y 24 horas, dependiendo del fármaco.

Por otro lado, además de antagonizar los efectos de la histamina, los antihistamínicos H₁ de primera generación pueden interactuar con otros receptores, como los colinérgicos, adrenérgicos o serotoninérgicos, lo que explica algunos de sus efectos adversos y usos terapéuticos adicionales, entre los fármacos de primera generación destaca la difenhidramina, misma que no solo tiene propiedades antialérgicas, sino también efectos sedantes importantes, ya que actúa como un antagonista competitivo de los receptores H₁,

debido a su alta lipofilia, cruza fácilmente la barrera hematoencefálica, lo que explica su marcado efecto sedante. Se une a los receptores H₁ en el sistema nervioso central y periférico, bloqueando la acción de la histamina, responsable de reacciones alérgicas; este fármaco se utiliza en el tratamiento de reacciones alérgicas agudas, así como en trastornos del sueño y náuseas. Sin embargo, su uso prolongado puede provocar efectos adversos como alteraciones en la conducción cardíaca, somnolencia excesiva, sequedad bucal, y en casos graves, coma y muerte. Otro antihistamínico de esta generación es la clorfenamina es otro antagonista de los receptores H₁, con la ventaja de presentar una intensidad sedante moderada en comparación con otros de la primera generación. Este fármaco inhibe la acción de la histamina en tejidos al bloquear los receptores H₁, reduciendo síntomas de la respuesta alérgica. Se utiliza frecuentemente en combinación con descongestionantes en fórmulas para el tratamiento de resfriados comunes y en casos de rinitis alérgica y urticaria. Otro fármaco que destacan son la hidroxizina destaca no solo por sus propiedades antihistamínicas, sino también por sus efectos ansiolíticos y sedantes, ya que, de igual manera, bloquea los receptores H₁, reduciendo la acción de la histamina en el organismo y aliviando síntomas alérgicos y de prurito, por tanto, también se emplea en el manejo de la ansiedad leve, en premedicación preoperatoria y en situaciones que requieran sedación moderada. Su capacidad para cruzar la barrera hematoencefálica genera efectos sedantes, lo que puede limitar su uso en actividades que requieran atención.

Por otro lado, los antihistamínicos de segunda generación, tienen una mejor biodisponibilidad y menor metabolismo hepático que los de primera generación, se diseñaron para ser más selectivos por los receptores periféricos H₁, lo que les permite causar menos sedación y reducir los efectos secundarios típicos de los fármacos de primera generación. La loratadina, por ejemplo, es uno de los antihistamínicos más populares en el manejo de alergias, por su eficacia y bajo potencial sedante, este actúa bloqueando selectivamente los receptores H₁, impidiendo la acción de la histamina sin afectar significativamente el SNC, es eficaz para el tratamiento de la rinitis alérgica y la urticaria, síntomas como estornudos, picazón nasal y ocular, lagrimeo y urticaria. Mientras tanto, la desloratadina es el principal metabolito activo de la loratadina y posee una mayor afinidad por el receptor H₁, al igual que la loratadina, bloquea de forma selectiva los receptores H₁

sin afectar el SNC. Se utiliza en el tratamiento de alergias estacionales y la urticaria crónica, y en algunos casos se prefiere por su mayor potencia, presenta muy pocos efectos adversos. Mientras que la cetirizina, es un derivado de la hidroxizina que presenta un equilibrio entre eficacia y tolerabilidad, este bloquea los receptores H1, reduciendo la respuesta histamínica en condiciones alérgicas. Se utiliza para tratar rinitis alérgica, urticaria y otras reacciones alérgicas con un inicio de acción rápido, tiene un mayor potencial para inducir somnolencia en algunas personas, especialmente en dosis altas. Otro antihistamínico importante de esta generación es la levocetirizina, este es el isómero activo de la cetirizina, este antihistamínico bloquea los receptores H1, es utilizada en el tratamiento de la rinitis alérgica y la urticaria, ofreciendo alivio de los síntomas con un riesgo menor de efectos secundarios. La fexofenadina se caracteriza por su bajo potencial sedante, este inhibe los receptores H1 de forma selectiva, lo que reduce significativamente los síntomas alérgicos sin afectar el sistema nervioso central, no cruza la barrera hematoencefálica, por lo que tiene un riesgo mínimo de sedación. Es bien tolerada, aunque algunos pacientes pueden experimentar dolor de cabeza, náuseas o mareos. También se recomienda no tomarla junto con jugos de frutas, ya que pueden disminuir su absorción.

Por otro lado, los antihistamínicos H2, son fármacos actúan en receptores H2 localizados principalmente en las células parietales del estómago, donde la histamina estimula la secreción ácida, entre estos encontramos la ranitidina fue uno de los fármacos más usados en la inhibición de la secreción gástrica, bloquea de forma competitiva los receptores H2 en las células parietales, reduciendo la producción de ácido gástrico. Se utilizó en el tratamiento de úlceras gástricas y duodenales, reflujo gastroesofágico y en el manejo del síndrome de Zollinger-Ellison. La famotidina es un antihistamínico H2 que se utiliza ampliamente debido a su eficacia y seguridad, este actúa bloqueando los receptores H2, lo que disminuye la estimulación de las células parietales y, en consecuencia, la producción de ácido, es empleada en el tratamiento de úlceras, reflujo gastroesofágico y otras afecciones hipersecretoras del ácido gástrico.

Referencias Bibliográficas:

1. Margarita H. (2024). Fármacos antihistamínicos y antiserotónicos.
<https://books.google.es/books?hl=es&lr=&id=KAEFEQAAQBAJ&oi=fnd&pg=PA98-IA2&dq=antihistaminicos&ots=dqYaG4Amz7&sig=IGGdmJ6mLI0Z3H0Dszp6p8dqufs#v=onepage&q&f=false>