



Mi Universidad

Resumen

Erwin Emmanuel Pérez Pérez

Parcial II

Farmacología

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillén

Medicina Humana

Cuarto Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas a 9 de abril de 2025

Introducción

A lo largo de la historia de la medicina moderna, pocas clases de fármacos han tenido un impacto tan significativo y versátil como los antihistamínicos. Estos compuestos, desarrollados en el siglo XX, han transformado el abordaje terapéutico de numerosas afecciones, en particular las relacionadas con reacciones alérgicas e inflamatorias. La histamina, una amina biogénica descubierta a principios del siglo pasado, cumple múltiples funciones fisiológicas y patológicas dentro del organismo humano. Está implicada en procesos de inflamación, regulación gástrica, neurotransmisión y, muy especialmente, en reacciones de hipersensibilidad inmediata. La capacidad de bloquear los efectos de la histamina mediante el uso de antagonistas selectivos ha dado origen a una categoría farmacológica esencial para la práctica clínica. Los antihistamínicos han evolucionado desde formulaciones primitivas con efectos secundarios notorios, hasta compuestos sofisticados, selectivos y seguros que actualmente se utilizan no solo para tratar la rinitis alérgica o la urticaria, sino también para intervenir en condiciones tan diversas como el insomnio, las náuseas, las enfermedades gastrointestinales e incluso trastornos neurológicos en fase de investigación. De esta manera, su campo de aplicación se ha expandido conforme la ciencia ha avanzado en la comprensión de los receptores de histamina y sus múltiples subtipos. En este contexto, el presente ensayo tiene como objetivo ofrecer un análisis detallado de los antihistamínicos: su origen histórico, su clasificación según los receptores involucrados, los mecanismos de acción que justifican su eficacia terapéutica, las indicaciones clínicas donde se emplean, los efectos adversos que pueden producir, y finalmente, las prometedoras perspectivas futuras que se vislumbran en el desarrollo de nuevos antagonistas más eficaces y personalizados.

Base a la clasificación va a depender de los mecanismos de acción ya que se clasifican en.

- a) Antagonistas de los receptores de histamínicos H1, H2, H3, H4
- b) Inhibidores de la liberación de histamina

Así mismo los antihistamínicos desarrollados inicialmente o de primera generación producen ya sea de mayor grado o menor lo que son la sedación y somnolencia por lo que

de esta manera limita su uso, luego de eso se comenzaron a fabricar los antihistamínicos de segunda generación que los cuales a diferencia de los de primera generación se diferencian en que tienen mayor afinidad por los receptores H1 y estos de segunda generación no atraviesan la barrera hematoencefálica por lo que de esta manera no van a causar sedación y ni somnolencia.

El mecanismo de acción es que los antagonistas de los receptores histamínicos H1 poseen un grupo alquilamina parecida a la cadena lateral de la histamina y que estos van a actuar desplazando competitiva y reversiblemente a la histamina de aquellos receptores, así mismo su acción no es selectiva ya que puede inhibir receptores colinérgicos periféricos y centrales.

La farmacocinética de los antihistamínicos varía según su generación y tipo. Los parámetros farmacocinéticos principales incluyen:

a) Absorción: Los antihistamínicos se absorben rápidamente tras la administración oral, con una biodisponibilidad que oscila entre el 40% y el 70%, dependiendo del compuesto. La presencia de alimentos puede retardar la absorción, pero no afecta significativamente la cantidad total absorbida.

b) Distribución: Los antihistamínicos de primera generación son lipofílicos y cruzan con facilidad la barrera hematoencefálica, lo que explica su efecto sedante. Los de segunda generación tienen menor penetración en el sistema nervioso central debido a su baja lipofilia y a la acción de las bombas de eflujo.

c) Metabolismo: La mayoría de los antihistamínicos son metabolizados en el hígado a través de enzimas del citocromo P450. Algunos compuestos, como la loratadina, generan metabolitos activos que contribuyen a su efecto terapéutico.

d) Eliminación: Se excretan predominantemente por la orina, ya sea como metabolitos o en forma inalterada. La vida media varía considerablemente: Primera generación: 4-12 horas. Segunda generación: 12-24 horas, lo que permite una administración diaria.

Los efectos secundarios de los antihistamínicos dependen de su generación y del receptor que antagonizan:

Antihistamínicos H1 de primera generación: Sedación, mareos, boca seca, visión borrosa y retención urinaria. Su uso prolongado puede causar tolerancia.

Antihistamínicos H1 de segunda generación: Son menos sedantes, pero pueden causar dolor de cabeza y molestias gastrointestinales en algunos casos.

Antihistamínicos H2: Estos están relativamente libres de efectos adversos y en dado caso de que exista sobredosis parecen pocos efectos tóxicos, algunos de los efectos adversos que puede que lleguen a presentarse son diarrea, mareos, mialgias.

Los antihistamínicos tienen aplicaciones amplias en la medicina como: Enfermedades alérgicas: Tratan condiciones como la fiebre del heno, la conjuntivitis alérgica y el angioedema.

En la rinitis y conjuntivitis alérgica de tipo estacional alivian la rinorrea el estornudo y el picor de ojos, nariz y garganta. Para los antihistamínicos de segunda generación también se ha visto aplicación en la rinoconjuntivitis perenne.

Gastroenterología: Los H2 son efectivos en el manejo de la dispepsia funcional y el síndrome de Zollinger-Ellison.

Neurología y psiquiatría: Los H1 de primera generación son útiles para el tratamiento del vómito, el mareo por movimiento y el insomnio.

Enfermedades cutáneas: Se emplean para controlar el prurito asociado con enfermedades como la dermatitis atópica y la psoriasis.

Por otra parte tenemos a los Antihistamínicos H3 que estos compuestos bloquean los receptores H3, que se encuentran principalmente en el sistema nervioso central y periférico. Los receptores H3 actúan como autorreceptores, regulando la liberación de histamina y otros neurotransmisores como dopamina, serotonina y acetilcolina. Los antagonistas de H3 tienen potencial terapéutico en enfermedades como la narcolepsia, el trastorno por déficit de atención con hiperactividad (TDAH), y alteraciones cognitivas relacionadas con el Alzheimer. Así mismo los receptores H4 están predominantemente en células del sistema inmune, como mastocitos, eosinófilos y linfocitos T. Su activación está relacionada con la modulación de la respuesta inflamatoria y la quimiotaxis de células inmunes hacia los sitios de inflamación.

Algunos de los Antihistamínicos mas usados son los siguientes:

H1 de Primera Generación:

- Difenhidramina, Clorfeniramina, Prometazina

Antihistamínicos H1 de Segunda Generación:

- Loratadina, Cetirizina, Fexofenadina

Antihistamínicos H2:

- Ranitidina, Famotidina

H3 y H4: Son más conocidos por sus posibles aplicaciones terapéuticas en trastornos neurológicos e inflamatorios. Aún están en fase de investigación clínica y no son de uso común en la práctica médica

Conclusión

Los antihistamínicos son fármacos fundamentales en la medicina moderna debido a su capacidad para bloquear los efectos de la histamina, una molécula implicada en numerosos procesos fisiológicos y patológicos, especialmente en las reacciones alérgicas y la regulación ácida gástrica. A lo largo de los años, la investigación sobre los antihistamínicos ha permitido su clasificación en diferentes generaciones, cada una con características particulares que determinan su uso clínico y sus efectos secundarios.

La farmacocinética de los antihistamínicos es otro aspecto crucial que determina su eficacia y seguridad. Los antihistamínicos de primera generación, con su mayor capacidad de penetración en el sistema nervioso central, son útiles para tratar trastornos como el insomnio y las náuseas, pero conllevan riesgos de efectos adversos, como la sedación y la somnolencia. Los antihistamínicos de segunda generación han sido diseñados para reducir estos efectos, proporcionando alivio de los síntomas alérgicos sin afectar tanto al sistema nervioso central, lo que los hace preferibles en situaciones en las que la sedación es un efecto no deseado.

En conclusión, los antihistamínicos son una clase de fármacos imprescindibles en el tratamiento de una amplia variedad de trastornos alérgicos y no alérgicos. Aunque los avances en la investigación han permitido el desarrollo de antihistamínicos de segunda generación más seguros y efectivos, la diversidad de sus aplicaciones clínicas y sus efectos secundarios requieren un enfoque personalizado en su uso. El continuo estudio de los antagonistas de los receptores H3 y H4 abre nuevas puertas en el tratamiento de enfermedades neuropsiquiátricas e inflamatorias, lo que podría llevar a una mejora significativa en la calidad de vida de los pacientes que sufren de condiciones crónicas.

Bibliografías:

1.- Katzung, B. G., Trevor, A. J. (2015). *Basic and Clinical Pharmacology* (13th ed.). McGraw-Hill Education.

2.- MedlinePlus en español. (s.f.). *Antihistamínicos para las alergias*. Biblioteca Nacional de Medicina de EE. UU.