



Mi Universidad

Antihistamínicos

Daniel de Jesús Berrios Jiménez

Resumen

Parcial II

Terapéutica farmacológica

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillen

Licenciatura en Medicina Humana

Cuarto Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas a 09 de abril de 2025

I. Conceptualización y Mecanismo de Acción

Los antihistamínicos constituyen un grupo terapéutico esencial en el tratamiento de las reacciones alérgicas e inflamatorias. Su mecanismo de acción se fundamenta en la **antagonización competitiva de los receptores H₁**. De este modo, estos fármacos evitan que la histamina—un mediador clave en la respuesta alérgica—se una a sus receptores, lo que reduce o impide la cascada de respuestas fisiológicas que incluyen:

- **Vasodilatación y aumento de la permeabilidad vascular:** La histamina provoca la dilatación de vasos y el escape de líquido a los tejidos, generando edema.
- **Contracción del músculo liso:** Especialmente en el bronquio, contribuyendo a la dificultad respiratoria en condiciones como el asma.
- **Estimulación nerviosa:** La activación de terminaciones nerviosas que conduce a picazón y dolor en las zonas afectadas.

El nivel de eficacia de estos medicamentos depende de la afinidad que estos tengan por los receptores H₁ y de la concentración alcanzada en los tejidos diana. Además del bloqueo directo, algunos antihistamínicos pueden modular la liberación de otros mediadores inflamatorios, reforzando la reducción de la respuesta alérgica.

2. Clasificación según Generación

Se distingue dos generaciones principales de antihistamínicos, resaltando diferencias estructurales y de perfil farmacológico que repercuten en su uso clínico:

Antihistamínicos de Primera Generación

- **Características Químicas y Farmacocinéticas:** Presentan alta lipofilia, lo que facilita su paso a través de la barrera hematoencefálica. Esto, si bien permite una rápida acción en tejidos periféricos, también da lugar a la penetración en el sistema nervioso central (SNC), ocasionando efectos sedantes pronunciados.
- **Efectos Adicionales:** Además de su acción antagonista en los receptores H₁, estos fármacos ejercen efectos anticolinérgicos y, en ocasiones, antiadrenergicos. Dichos efectos se

manifiestan en alteraciones como boca seca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento.

- **Ejemplos** **Clínicos:**
Entre los representativos se encuentran la difenhidramina y la clorfeniramina, cuya eficacia en el alivio rápido de síntomas alérgicos se ve contrarrestada por la limitación de su uso en actividades que requieran alerta, como la conducción.

Antihistamínicos de Segunda Generación

- **Optimización del Perfil Farmacológico:**
Estos agentes fueron diseñados para reducir la capacidad de cruzar la barrera hematoencefálica, minimizando así la incidencia de sedación y otros efectos secundarios del sistema nervioso central.
- **Efectos en el SNC:**
Al presentar una menor actividad en el cerebro, permiten su uso en pacientes que requieren mantener la concentración y la alerta, incluso en tratamientos prolongados.
- **Ejemplos** **Clínicos:**
La loratadina, cetirizina y fexofenadina son algunos de los fármacos más utilizados, manteniendo la eficacia en el control de síntomas alérgicos sin comprometer la funcionalidad diaria del paciente.

3. Propiedades Farmacocinéticas y Farmacodinámicas

Aunque ambos grupos comparten el mecanismo central de acción sobre los receptores H1, existen diferencias determinantes en sus propiedades farmacocinéticas y farmacodinámicas que influyen en la selección terapéutica:

Absorción y Distribución

- **Biodisponibilidad:**
Los antihistamínicos se absorben de forma rápida y completa tras la administración oral, con variaciones según la formulación y la presencia de alimentos.
- **Distribución** **Tisular:**
La rápida penetración en los tejidos periféricos y, en algunos casos, en el SNC, es una característica fundamental, ya que determina la prontitud con la que se alivian

los síntomas alérgicos. Se menciona que la distribución depende, en parte, del grado de lipofilia del fármaco.

Metabolismo Hepático y Eliminación Renal

- **Procesos Metabólicos:**

La mayoría de los agentes se metabolizan en el hígado, predominando la acción de enzimas del citocromo P450. Esta característica es crucial para predecir posibles interacciones medicamentosas, especialmente en pacientes que usan múltiples fármacos.
- **Excreción:**

La excreción principalmente renal subraya la importancia de ajustar las dosis en pacientes con insuficiencia renal o hepática. Las diferencias en la vida media entre los agentes determinan la frecuencia de administración, lo que es esencial para la planificación terapéutica.

Duración de la Acción

El tiempo que permanece el fármaco en plasma, definido por su vida media, varía entre las generaciones y se traduce en diferentes regímenes de dosificación:

- **Primera Generación:**

Usualmente tienen una vida media más corta, lo que puede requerir dosis más frecuentes.
- **Segunda Generación:**

Ofrecen una duración de acción prolongada, favoreciendo regímenes de dosificación que mejoran la adherencia del paciente al tratamiento.

4. Indicaciones Terapéuticas y Usos Clínicos

El manejo clínico con antihistamínicos se extiende a diversas manifestaciones del espectro alérgico, y el libro destaca las principales indicaciones para su uso:

Tratamiento de Reacciones Alérgicas

- **Síntomas y Condiciones:**

Se utilizan en la rinitis alérgica, urticaria, conjuntivitis y otras manifestaciones cutáneas o sistémicas donde la histamina desempeña un rol central.

- **Intervención en Episodios Agudos:**
En situaciones de crisis alérgica, el rápido alivio de la sintomatología es fundamental, razón por la cual se prefiere en ciertos escenarios la administración de agentes de primera generación, a pesar de sus efectos secundarios.

Aplicaciones en Protocolos Preventivos

- **Prevención en Vacunaciones y Procedimientos:**
Algunos protocolos incluyen la administración profiláctica de antihistamínicos para reducir la posibilidad de reacciones adversas o anafilácticas durante procedimientos invasivos o en la vacunación, mejorando la seguridad del paciente.

Complementos en Otras Condiciones Clínicas

- **Trastornos del Sueño:**
Debido a sus propiedades sedantes, algunos antihistamínicos de primera generación se emplean en el tratamiento a corto plazo de trastornos del sueño, aunque se recomienda precaución en función del riesgo de dependencia o de alterar el ciclo natural del sueño.
- **Enfermedades Gastrointestinales:**
En ciertos casos, se aprovechan sus efectos anticolinérgicos para paliar síntomas relacionados con hiperactividad del tracto gastrointestinal, como el síndrome del intestino irritable, aunque esta no es su indicación principal.

Es importante elegir el agente adecuado en función de la condición a tratar y del perfil del paciente, así como la necesidad de ajustar la dosificación y la frecuencia según la intensidad y duración de los síntomas.

5. Efectos Adversos y Consideraciones Clínicas

Pese a su eficacia terapéutica, el uso de antihistamínicos puede estar acompañado de una serie de efectos secundarios que deben ser monitoreados:

Efectos de Tipo Sedante y Anticolinérgico

- **Sedación:**
Más marcada en los antihistamínicos de primera generación, la sedación puede interferir en actividades que requieren atención y coordinación. El libro aborda la necesidad de advertir a pacientes que operan maquinaria o conducen vehículos.

- **Síntomas** **Anticolinérgicos:**
Se incluyen efectos como boca seca, visión borrosa, retención urinaria, estreñimiento y, en algunos casos, confusión, sobre todo en pacientes de edad avanzada. Estas reacciones reflejan el impacto en el sistema nervioso autónomo y requieren una monitorización constante.

Interacciones Farmacológicas

- **Metabolismo** **y** **Enzimas** **Hepáticas:**
La interacción con otros fármacos que se metabolizan a través del citocromo P450 es un aspecto crítico señalado en el libro. Se recomienda evaluar el historial farmacológico del paciente para evitar riesgos de toxicidad o disminución en la eficacia del tratamiento.
- **Uso** **en** **Polifarmacia:**
Es fundamental en pacientes crónicos, que suelen recibir múltiples tratamientos, ajustar la medicación considerando los posibles solapamientos en los perfiles de eliminación y metabolismo.

Contraindicaciones y Precauciones

- **Poblaciones** **Vulnerables:**
Se destacan precauciones especiales en niños, mujeres embarazadas y pacientes de edad avanzada, en quienes las diferencias en la farmacocinética pueden amplificar la incidencia de efectos adversos.
- **Condiciones** **Clínicas** **Preexistentes:**
Pacientes con glaucoma, hipertrofia prostática o insuficiencia hepática/renal deben ser evaluados cuidadosamente para determinar si el uso de un antihistamínico es seguro o si requiere ajustes en la dosificación.

La monitorización clínica y la evaluación continua del estado del paciente son esenciales para minimizar riesgos y garantizar la eficacia terapéutica, enfatizando la importancia del ajuste individualizado del tratamiento.

6. Evaluación y Selección Terapéutica

La selección del antihistamínico más adecuado se basa en un análisis que integra tanto las características farmacológicas del fármaco como el perfil clínico del paciente:

Consideraciones para la Selección

- **Equilibrio** **Eficacia–Seguridad:**
La decisión terapéutica debe sopesar la intensidad de la respuesta alérgica contra el potencial de aparición de efectos secundarios. Por ejemplo, en pacientes que requieren mantenerse alerta, se opta preferentemente por agentes de segunda generación.
- **Personalización del Tratamiento:**
El libro enfatiza la necesidad de adaptar la dosificación y el esquema terapéutico de acuerdo con la severidad de los síntomas, la respuesta clínica y las características individuales (como comorbilidades, edad y condición hepato-renal).

Importancia de la Monitorización

- **Seguimiento Clínico:**
Se recomienda realizar un seguimiento regular para identificar la aparición de efectos adversos, evaluar la eficacia del tratamiento y realizar ajustes en el régimen si es necesario.
- **Educación al Paciente:**
La información y asesoramiento sobre los posibles efectos secundarios y la correcta administración del medicamento son pilares fundamentales para mejorar la adherencia y seguridad del tratamiento.