



Mi Universidad

Resumen

Carlos Eduardo Villatoro Jiménez

Parcial II

Terapéutica farmacológica

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillen

Medicina humana

Semestre 4-A

Comitán de Domínguez, Chiapas, a 9 de abril del 2025

Antihistamínicos

Los antihistamínicos son una clase de fármacos esenciales en el manejo de diversas condiciones alérgicas y otras enfermedades. Inhiben los efectos de la histamina, una amina básica endógena que se distribuye en todos los tejidos. Se sintetiza por descarboxilación de aminoácido L-histidina, mediante la L-histidina descarboxilasa y la L-dopa descarboxilasa. Se almacena en los mastocitos de tejido conectivo, en los basófilos sanguíneos y en el sistema nervioso central. Se libera de forma fisiológica en la secreción del jugo gástrico y en diversos procesos patológicos. Se metaboliza por desaminación mediante la acción de la histaminasa, también se puede metabolizar en pequeña proporción, por acetilación.

Receptores de la histamina

La histamina ejerce su acción por un efecto sobre receptores específicos, en lo que se conocen la existencia de cuatro tipos:

- H1: musculo lizo, endotelio, cerebro, tracto gastrointestinal
- H2: mucosa gástrica, musculo lizo, células del miocardio, mastocitos, cerebro
- H3: pulmones, estómago, intestino, páncreas, SNC
- H4: medula ósea, células hematopoyéticas, aparato digestivo.

Clasificación

Según por el mecanismo de acción, se clasifican en:

- Antagonistas de los receptores histamínicos H1, H2, H3 y H4
- Inhibidores de la liberación de histamina

Los antagonistas H1, se clasifican en: primera generación o sedantes y de segunda generación o no sedantes. Los antihistamínicos de primera generación producen en mayor o en menor grado, sedación y somnolencia, lo que limita su uso. Los histamínicos de segunda generación, tienen mayor afinidad por el receptor H1, no atraviesan la barrera hematoencefálica, lo que no producen sedación o somnolencia.

■ Clasificación, dosis y vía de administración de antihistamínicos H ₁			■ Clasificación, dosis y vía de administración de antihistamínicos H ₁		
Antagonistas H ₁	Vía	Dosis habitual en adultos	Antagonistas H ₁	Vía	Dosis habitual en adultos
Primera generación (sedantes)			Primera generación (sedantes)		
Alquilaminas			Alquilaminas		
Dexclorfeniramina	v.o. s.c., i.m., i.v. lenta (diluida)	2 mg/4-6 h (máximo 12 mg/día) 5 mg repetible cada 6 h (máximo 20 mg/día)	Dexclorfeniramina	v.o. s.c., i.m., i.v. lenta (diluida)	2 mg/4-6 h (máximo 12 mg/día) 5 mg repetible cada 6 h (máximo 20 mg/día)
Dimetindeno	Tópica	2-4 aplicaciones/día	Dimetindeno	Tópica	2-4 aplicaciones/día
Doxilamina	v.o.	12,5-25 mg 30 min antes de acostarse (máximo 7 días, salvo indicación médica)	Doxilamina	v.o.	12,5-25 mg 30 min antes de acostarse (máximo 7 días, salvo indicación médica)
Etanolaminas			Etanolaminas		
Difenhidramina	v.o. i.v. Tópica	25-50 mg/6-8 h (máximo 200 mg/día) 1,25 mg/kg/6 h (máximo 50 mg/dosis) 3-4 aplicaciones/día	Difenhidramina	v.o. i.v. Tópica	25-50 mg/6-8 h (máximo 200 mg/día) 1,25 mg/kg/6 h (máximo 50 mg/dosis) 3-4 aplicaciones/día
Dimenhidrinato	v.o.	50-100 mg, 30-60 min antes del viaje. Repetir dosis cada 4-6 h (máximo 400 mg/día)	Dimenhidrinato	v.o.	50-100 mg, 30-60 min antes del viaje. Repetir dosis cada 4-6 h (máximo 400 mg/día)
Etilendiaminas			Etilendiaminas		
Mepiramina (mepifilina)	i.m. o i.v. lenta Perfusión i.v. v.o.	15-30 mg/8-12 h 60 mg diluidos en 500 ml de SF o G 5% 75-300 mg/8 h	Mepiramina (mepifilina)	i.m. o i.v. lenta Perfusión i.v. v.o.	15-30 mg/8-12 h 60 mg diluidos en 500 ml de SF o G 5% 75-300 mg/8 h
Tripelenamina	Tópica	3-4 aplicaciones/día	Tripelenamina	Tópica	3-4 aplicaciones/día
Fenotiazinas			Fenotiazinas		
Alimemazina	v.o.	10 mg (8 gotas)/8-12 h	Alimemazina	v.o.	10 mg (8 gotas)/8-12 h
Prometazina	Tópica	3-4 aplicaciones/día	Prometazina	Tópica	3-4 aplicaciones/día
Piperazinas			Piperazinas		
Hidroxizina	v.o.	25 mg/día administrados por la noche; en caso necesario, 25 mg/6-8 h	Hidroxizina	v.o.	25 mg/día administrados por la noche; en caso necesario, 25 mg/6-8 h
Meclozina (meclizina)	v.o.	25-50 mg 30-60 min antes del viaje	Meclozina (meclizina)	v.o.	25-50 mg 30-60 min antes del viaje

Antagonistas de los receptores H₁ de la histamina

La histamina liberada en una reacción alérgica, al actuar en los receptores H₁, produce un aumento de la permeabilidad capilar y liberación de sustancias bioactivas, vasodilatación y broncoespasmos. Estos antagonistas H₁ pueden inhibir en mayor o menor grado estos efectos.

Mecanismo de acción

Poseen un grupo de alquilamina parecida a la cadena central lateral de la histamina, lo que hace que actúen competitiva y reversiblemente a la histamina de estos receptores. Su acción no es selectiva, ya que pueden inhibir a los receptores colinérgicos periféricos y centrales, y a otros receptores.

Acciones farmacológicas

Ira generación:

- Poseen efectos adversos no deseados como aumento de peso, debido a que atraviesan la barrera hematoencefálica
- Tienen acción sedante e hipnótica
- En dosis altas pueden producir estimulación del sistema nervioso (inquietud, nerviosismo e insomnio)

2da generación:

- Bloquean de manera más selectiva a los receptores H1
- Tienen escasa actividad anticolinérgica
- No atraviesan la barrera hematoencefálica

Farmacocinética

Los antihistamínicos H1 de primera generación se absorben bien por vía oral con una biodisponibilidad menor del 50% y las concentraciones máximas alcanzan a las 2-3 horas, estos se metabolizan en el hígado por el citocromo P450. Su duración varía entre 4 y 6 horas excretándose por la orina.

Los antihistamínicos de segunda generación, su absorción por vía oral es buena, alcanzando concentraciones efectivas, esto debido a la liposolubilidad que presentan.

Efectos adversos

1ra generación:

- Sobre el SNC: somnolencia, astenia, debilidad, ataxia, visión borrosa, diplopía y vértigo
- Sobre el aparato cardiovascular: taquicardia, extrasístoles, hipertensión e hipotensión arterial
- Sobre el aparato digestivo: náuseas, molestias epigástricas, vómitos, pérdida de apetito, diarrea o estreñimiento
- Por efecto anticolinérgico: sequedad de boca, nariz y garganta, espesamiento de las secreciones bronquiales y retención urinaria
- Por vía tópica: alergias, eccema de contacto y reacciones de fotosensibilidad dérmica

2da generación:

Están relativamente libres de efectos adversos y en caso de sobredosis parecen tener pocos efectos tóxicos. Al ser muy selectivos a los receptores H1, no tienen efectos anticolinérgicos.

Aplicaciones terapéuticas

- Procesos alérgicos exudativos
- Rinitis y conjuntivitis alérgica estacional
- Rinoconjuntivitis
- Urticaria aguda
- Dermatitis de contacto y atópicas
- Picaduras de insectos
- Coadyuvantes de reacciones alérgicas
- Vértigo de Meniere y vómitos

Antagonistas de los receptores histamínicos H2

Actúan inhibiendo competitivamente la acción de la histamina a nivel de los receptores H2, se emplean para reducir la producción ácida gástrica en el tratamiento de la hemorragia digestiva. Son antiulcerosos eficaces, aunque están siendo desplazados por los inhibidores de la bomba de protones en el tratamiento de la úlcera.

Antagonistas de los receptores H3 y H4

Los antagonistas de los receptores H3, se ha implicado en diversas aplicaciones terapéuticas potenciales, como los trastornos del sueño y la vigilia, trastorno por déficit de atención con hiperactividad, epilepsia, deterioro cognitivo y obesidad. Los antagonistas de los receptores H4, son estructuralmente semejantes a los H3, lo que dificulta su desarrollo de moléculas específicas.

Bibliografías

- 1- Hernández M., & Castañeda J. (2024). Farmacología en enfermería. 4ta edición. ELSEVIER. Cap 8 (fármacos antihistamínicos y antiserotonínicos). Obtenido de <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>
- 2- Brunton L., Hilal-Dandan R., Knollmann B. (2019). Goodman & Gilman Las Bases Farmacológicas de la Terapéutica. 13ª edición.