



Mi Universidad

Resumen

Ramón de Jesús Aniceto Mondragón

Parcial II

Terapéutica Farmacológica

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillen

Medicina Humana

4to Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas a 9 de abril de 2025

ANTIISTAMINICOS

Para hablar de antihistamínicos debemos hacer un recordatorio de la respuesta inmunitaria mediada por histamina, un tipo de amina endógena, que forma parte de las citocinas proinflamatorias, que se libera por desgranulación de los mastocitos y en menor parte de los basófilos, la cual se distribuye por todos los tejidos, generando así manifestaciones clínicas de importancia en el ámbito farmacológico. Esta histamina ejerce su acción por un efecto sobre receptores específicos, denominados RH1, RH2, RH3 Y RH4, pertenecientes a la familia de los receptores acoplados a proteína G.

Los RH1 se localizan en la membrana de células musculares lisas de vasos sanguíneos, células endoteliales, bronquios y tracto gastrointestinal, en el tejido de conducción del corazón, algunas células secretoras, en terminaciones nerviosas, en el SNC.

Los RH2 se encuentran en las membranas de las células parietales de la mucosa gástrica, en el musculo liso de los vasos sanguíneos, en células del miocardio y del nodo sinusal en el SNC, leucocitos, mastocitos y basófilos, donde actúan como autorreceptores.

Los RH3 se han detectado en diversos, como pulmón, estómago, intestino, páncreas y SNC.

RH4 en medula ósea, en células hematopoyéticas (eosinófilos y mastocitos) y, en menor proporción, el aparato digestivo.

Según los mecanismos, se clasifican en: a) antagonistas de los receptores de histamina (H1, H2, H3 y H4) y b) inhibidores de la liberación de histamina.

Los antagonistas H1, a su vez se clasifican en generaciones, yendo desde primera generación o también llamados sedantes hasta la segunda generación que son no sedantes. El uso de cada uno, varia entre el riesgo-beneficio, suponiendo la situación terapéutica utilizable, los de primera generación, han limitado su uso debido a los efectos adversos de cada de los fármacos, por su efecto sedante, promueve la somnolencia, esto debido a que en su farmacocinética, atraviesan la barrera hematoencefálica, causando estos efectos, a diferencia

de los de segunda generación, los cuales causan muchos menos efectos sedantes, por lo que han sido de más utilidad en cuadros clínicos, que necesiten de atención.

La mayor parte de estos fármacos, son administrados por vía enteral.

Cuando hablamos de los antagonistas H₁ de los receptores de la histamina, durante una reacción alérgica, que es el antagonismo terapéutico buscado por cada fármaco. Su acción no es selectiva ya que pueden inhibir también a receptores colinérgicos periféricos y centrales, y a otros receptores, como los serotoninérgicos.

Los fármacos de primera generación poseen efectos adversos no deseados como el aumento de peso, y debido a que atraviesan la barrera hematoencefálica, tienen acción sedante e hipnótica, aunque en niños y a dosis elevadas en adultos pueden producir paradójicamente, estimulación del sistema nervioso, que se manifiesta con inquietud, nerviosismo e insomnio. A nivel periférico inhiben el aumento de la permeabilidad capilar, el prurito, broncoconstricción y la contracción intestinal, cuando el principal mediador inflamatorio es la reacción alérgica es la histamina. La mayoría de ellos tienen un efecto anticolinérgico, que varía dependiendo del fármaco, debido a su dificultad por los receptores muscarínico, que origina sequedad de boca y mucosas, dificultades de micción y otros efectos según la dosis.

Los de segunda generación en cambio bloquean de manera mucho más selectiva a los receptores H₁, tienen escasa actividad anticolinérgica y no atraviesan la barrera hematoencefálica, por lo que carecen de los efectos sedantes a las dosis recomendadas habituales. Ninguno de ellos se utiliza en forma inyectable, por lo que se indican en tratamiento de mantenimiento.

Generalmente se administran vía oral, aunque en situaciones de urgencia puede usarse la vía intravenosa. También se aplican tópicamente, atomizadores nasales y gotas oftálmicas.

Los antihistamínicos H₁, de primera generación se absorben por vía oral y tienen una buena biodisponibilidad menor del 50% debido a su efecto de primer paso, las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan en 2-3 horas. Tienen metabolismo hepático, principal por el citocromo P450. La mayor parte del tiempo su acción varía entre 4 y 6 horas y tienen excreción renal.

En los antihistamínicos de primera generación, tienen efectos adversos vinculados a la farmacocinética en su distribución y su atravesamiento por la barrera hematoencefálica, llevando a cabo las manifestaciones nerviosas, por estimulación del sistema nervioso central, donde se destaca de primera intención la somnolencia, astenia, adinamia, debilidad, ataxia, visión borrosa, diplopía y vértigo, algunos estudios se han descrito cierto tipo de manifestaciones atípicas como taquicardia, extrasístoles, hipertensión e hipotensión arterial, a nivel de aparato digestivo se producen náuseas, molestias epigástricas, vómitos, pérdida del apetito, diarrea o estreñimiento, por su demás estimulación anticolinérgica, la inhibición de la secreción glandular, espesamiento de las secreciones bronquiales y retención urinaria. Rara vez alteraciones hematológicas, como leucopenia, agranulocitosis y anemia hemolítica.

A su vez los antagonistas H1 de segunda generación debido a su bajo efecto anticolinérgico, por ser muy selectivos, son fármacos de primera elección gracias a sus efectos adversos nulos.

Algunos fármacos como las fenotiazinas, por su actividad anticolinérgica y la combinación con depresores, se puede causar un efecto hipotensión, hipotermia y depresión respiratoria.

La acción sedante de los antihistamínicos H1, de primera generación es aditiva a todos los depresores centrales, como los barbitúricos y el alcohol. Se debe evitar la ingestión conjunta de bilastina y fexofenadina con ciertos fármacos (verapamilo, probenecid o cimetidina) y alimentos (zumos de naranja amarga o pomelo) pueden modificar su biodisponibilidad.

En base a todo lo anterior visto, rasgos como la farmacocinética, farmacodinamia y efectos adversos y secundarios, las aplicaciones terapéuticas de cada fármaco antihistamínico se usan principalmente para el tratamiento de procesos alérgicos exudativos, mediados por histamina.

- Rinitis
- Conjuntivitis
- Rinorrea
- Estornudo
- Prurito
- Urticaria

- Dermatitis
- Situaciones graves de coadyuvante como el shock anafilático
- Cinetosis

TABLA DE ANTIHISTAMINICOS

FARMACOCINETICA ANTIHISTAMINICOS HI			
FARMACO	VIDA MEDIA	CONCENTRACION PLASMATICA MAXIMA	DURACION DE LA ACCION
Primera generación			
Difenhidramina	3-5 h	2-4 h	3-6 h
Clorfenamina	13-20 h	2-3 h	4-6 h
Segunda generación			
Cetirizina	7-10 h	1 h	12-24 h
Desloratadina	27 h	2-3 h	24 h
Fexofenadina	5-10 h	2-3 h	12
Levocetirizina	7 h	7 h	15-24 h
Loratadina	8-15 h	8-15 h	24 h

Referencia bibliográfica:

1. *Castells-Hernández. Farmacología en enfermería. (2024). Google Books. 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=true>