

UNIDAD III: ALERGIA, INFLAMACIÓN E INMUNIDAD

Lección 11

Histamina y antihistamínicos

Guión

1. HISTAMINA.

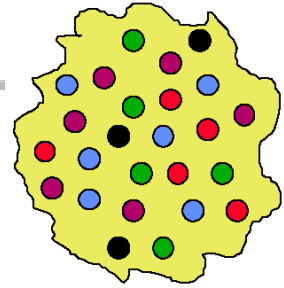
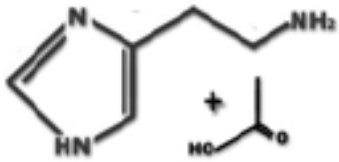


2. FÁRMACOS ANTIHISTAMÍNICOS H₁.



1. HISTAMINA

- El grupo de los **mediadores celulares** (autacoides)
 - Amplia distribución por todo el organismo
 - **Mal conocida su función fisiológica**
 - Participan **procesos patológicos**
- Histamina; serotonina; eicosanoides; angiotensina, linfocinas, óxido nítrico, etc



- Síntesis y almacenamiento:

- A partir de la histidina por la histidina descarboxilasa

- a) Mastocitos y basófilos: mayoría de los tejidos del organismo.

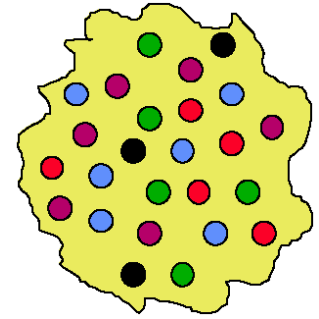
Pulmón-Piel-Aparato digestivo

- b) Histaminocitos del estómago.

- c) Neuronas histaminérgicas del SNC.

Liberación de histamina

Inflamación y anafilaxia



- Desde los mastocitos:
 - Reacciones alérgicas (IgE – Ag) o inflamatorias
 - Fármacos o compuestos exógenos
 - Morfina
 - Tubocurarina
 - Expansores plasmáticos
 - Tóxicos/Venenos

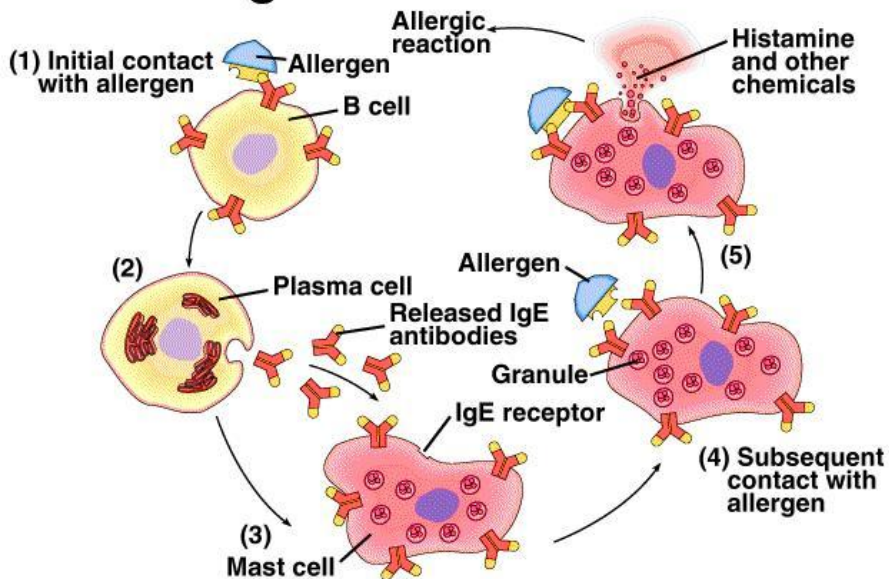
Reacción de pseudoalergia

Anafilaxia no alérgica

Liberación de histamina

Ricki Lewis, Life, 3e. Copyright © 1998 The McGraw-Hill Companies, Inc. All rights reserved.

An Allergic Reaction — Overview

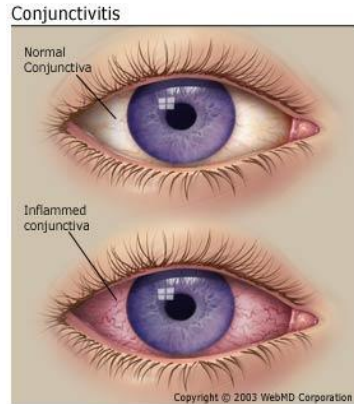
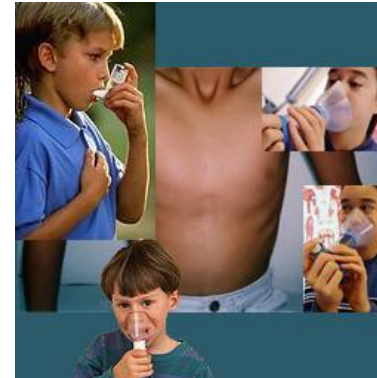
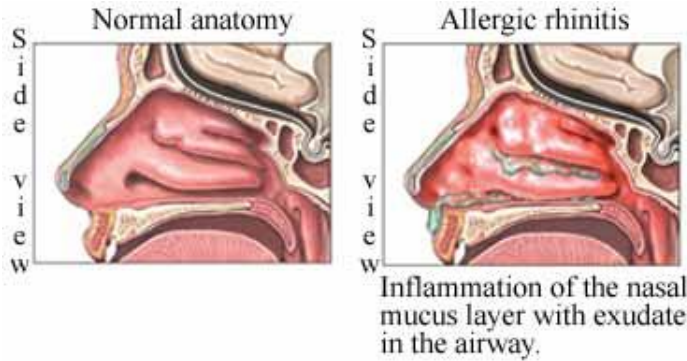


- Desde los mastocitos:

- Reacciones alérgicas (IgE – Ag): anafilaxia

...Pero los mastocitos también poseen otros mediadores...

Manifestaciones: rinoconjuntivitis, urticaria, asma



Anafilaxia no alérgica



Receptores

- Efectos mediados por **receptores específicos** en la células diana
 - **H₁**: distribución periférica y central
 - **H₂**: **célula parietal** de la mucosa gástrica y en el SNC
 - **H₃**: SNC
 - **H₄**: médula ósea, tejidos linfoides, linfocitos B

• H₁: Patogenia procesos alérgicos y respuesta inflamatoria

- Vasodilatación
- ↑ permeabilidad vascular (“habones” o edema)
- Contracción del músculo liso bronquial (broncoconstricción).
- Manifestaciones de irritabilidad local: prurito y dolor.

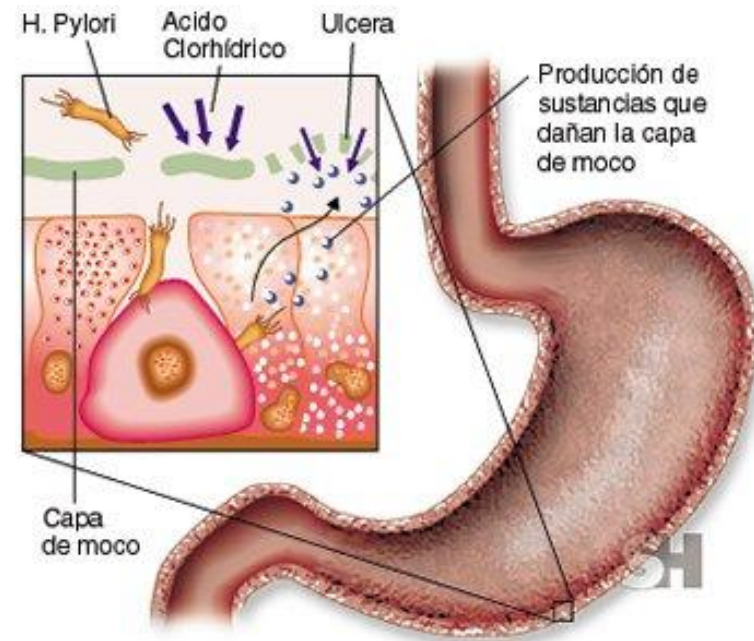
Papel: fisiológico y fisiopatológico

- H_2 : Estimula la secreción jugo gástrico
 - Patogenia de la úlcera gastroduodenal

- SNC:

- H_1 , H_2 , H_3 (Histamina como neurotransmisor)

- Alerta y la vigilia
 - Ingesta de alimentos
 - Termorregulación
 - Etc



Clasificación fármacos antihistamínicos

- Antagonistas receptores H_1
(Antihistamínicos H_1)
- Antagonistas receptores H_2
- Antagonistas receptores H_3 (en estudio)

Todos son *antagonistas competitivos* de la histamina sobre sus receptores.

2. FÁRMACOS ANTIHISTAMÍNICOS H₁.

Clasificación y acciones

- Primera generación

- **Difenhidramina**

- Prometacina

- Hidroxicina

- Segunda generación

- **Cetiricina**

- Loratadina

¿Diferencias?

Alivio de los efectos nocivos
provocados por la histamina

- Otras acciones

- **Sedantes**

- Antiemético

- Antimuscarínico

Principalmente los de 1ª generación

Farmacocinética



- Buena absorción tras **administración oral** o parenteral.
 - Preparados **uso tópico** (ojos, piel o nariz)
- Los de 2ª generación **atraviesan mal** la BHE.
- Metabolización por CYP450.
 - **Posibilidad de sufrir interacciones**



Usos clínicos

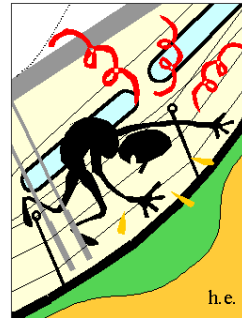
Poco útiles en el asma

- Alivio síntomas alérgicos:
 - Urticaria, dermatitis
 - Rinitis
 - Conjuntivitis
- Tratamiento sintomático de la tos y del resfriado

Ineficaces en la anafilaxia grave



- Antieméticos
 - Cinetosis
 - Vértigo
- Hipnóticos



RAM

1) **Sedación** (suele desaparecer con el tratamiento)

¡Advertir al paciente!...



2) Secundarias a la actividad antimuscarínica

- **Sequedad de boca**
- Retención urinaria y estreñimiento, visión borrosa (**no es frecuente**)

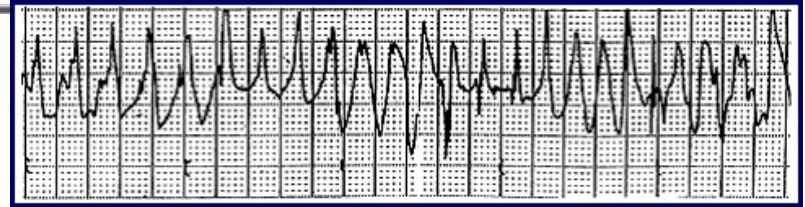
¡Ancianos!

3) Excitación paradójica: niños pequeños

4) Reacciones alérgicas: por **tratamiento tópico repetido**



RAM



5) Arritmias cardíacas graves

- Consecuencia de interacciones
 - **Fármacos que inhiben el metabolismo del antihistamínico: CYP-450 (CYP3A4)**
 - pueden existir diferencias entre los distintos compuestos.
 - **Terfenadina (++++)**
- Raras
- Pacientes de riesgo

- ✓ Arritmias previas
- ✓ Ancianos
- ✓ Insuficiencia hepática