



CEU

*Universidad
San Pablo*

BLOQUE V: FARMACOLOGÍA DEL DOLOR Y LA INFLAMACIÓN

TEMA 24. HISTAMINA. ANTIHISTAMÍNICOS

TEMA 24. HISTAMINA: ANTIHISTAMÍNICOS H₁ Y ANTIHISTAMÍNICOS H₂

1. *¿Qué es la histamina?*

- El papel de la histamina en los procesos inflamatorios
- Receptores para histamina

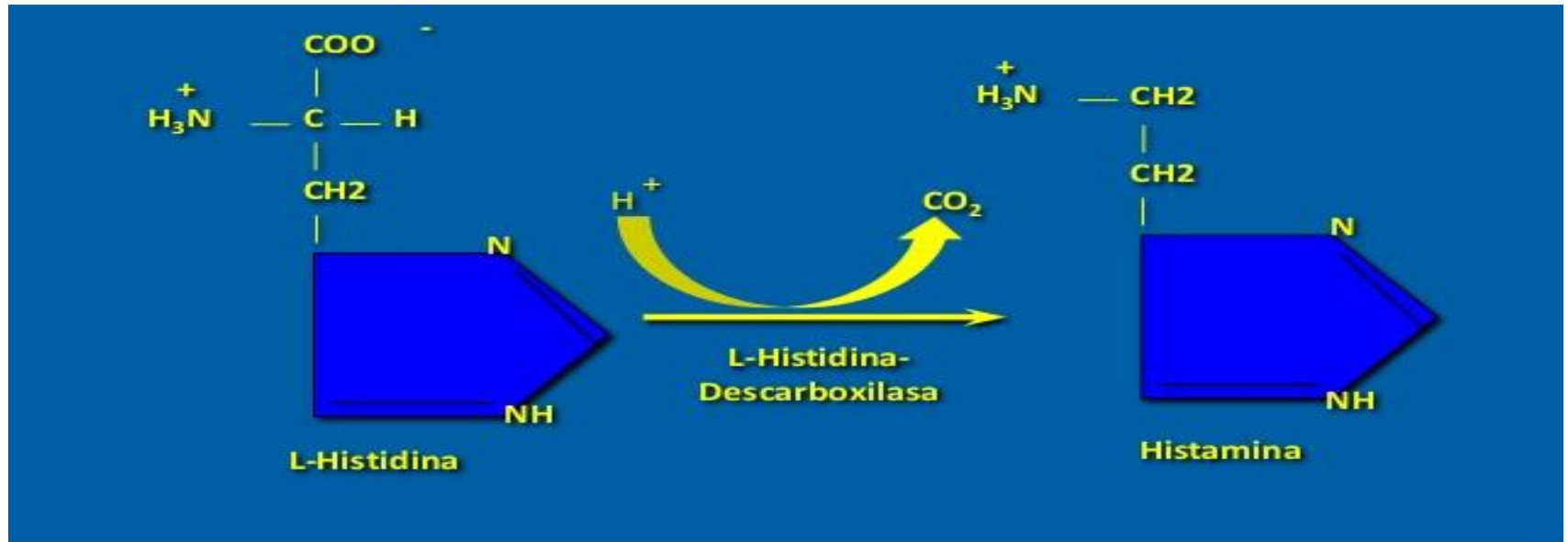
2. *Fármacos antagonistas de los receptores H₁ de histamina o antihistamínicos*

- Efectos adversos
- Utilización Clínica

BIBLIOGRAFÍA:

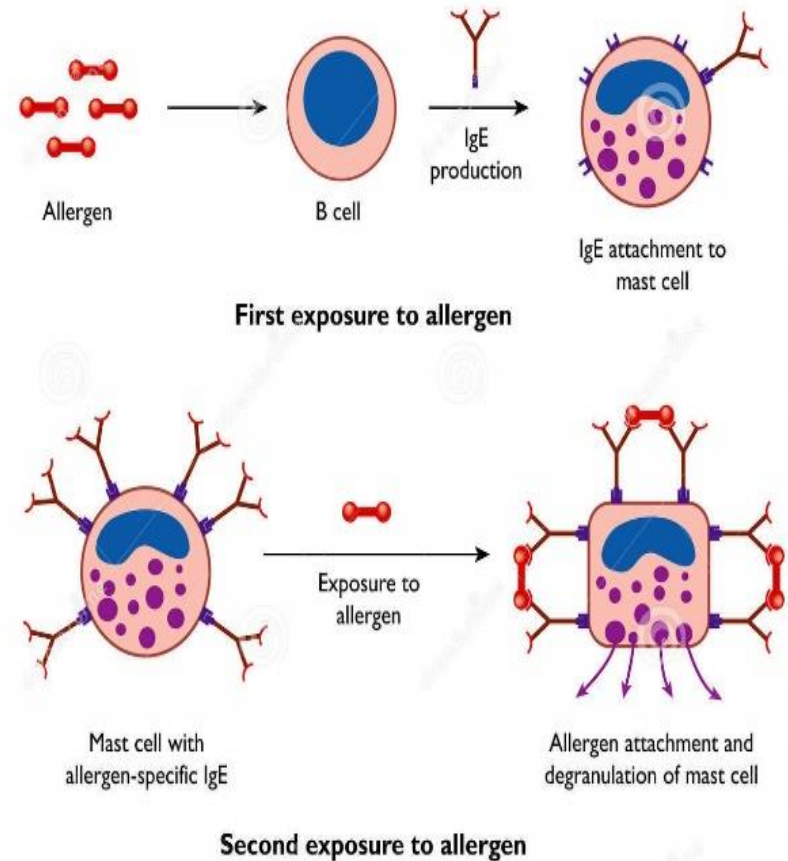
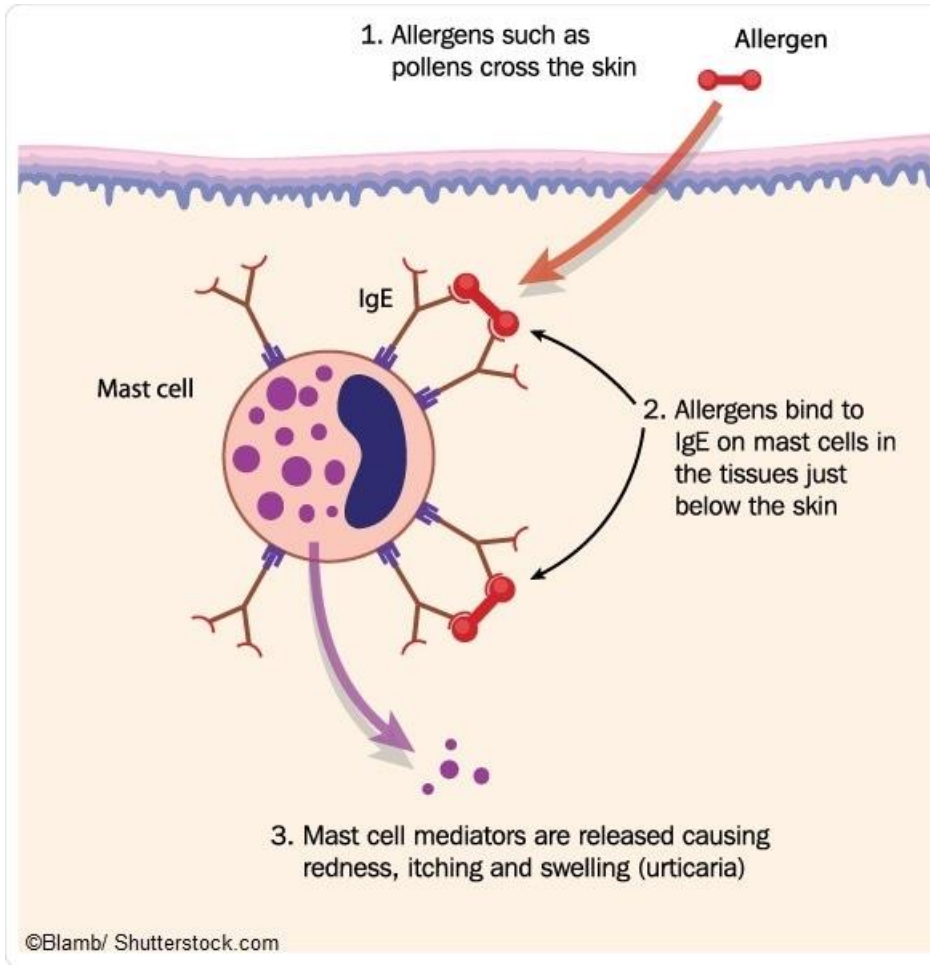
- Rang y Dale. Farmacología. 6ª ed. Ed. Elsevier. Barcelona (2008)
- Catálogo de Medicamentos. 2011

BIOSÍNTESIS DE HISTAMINA

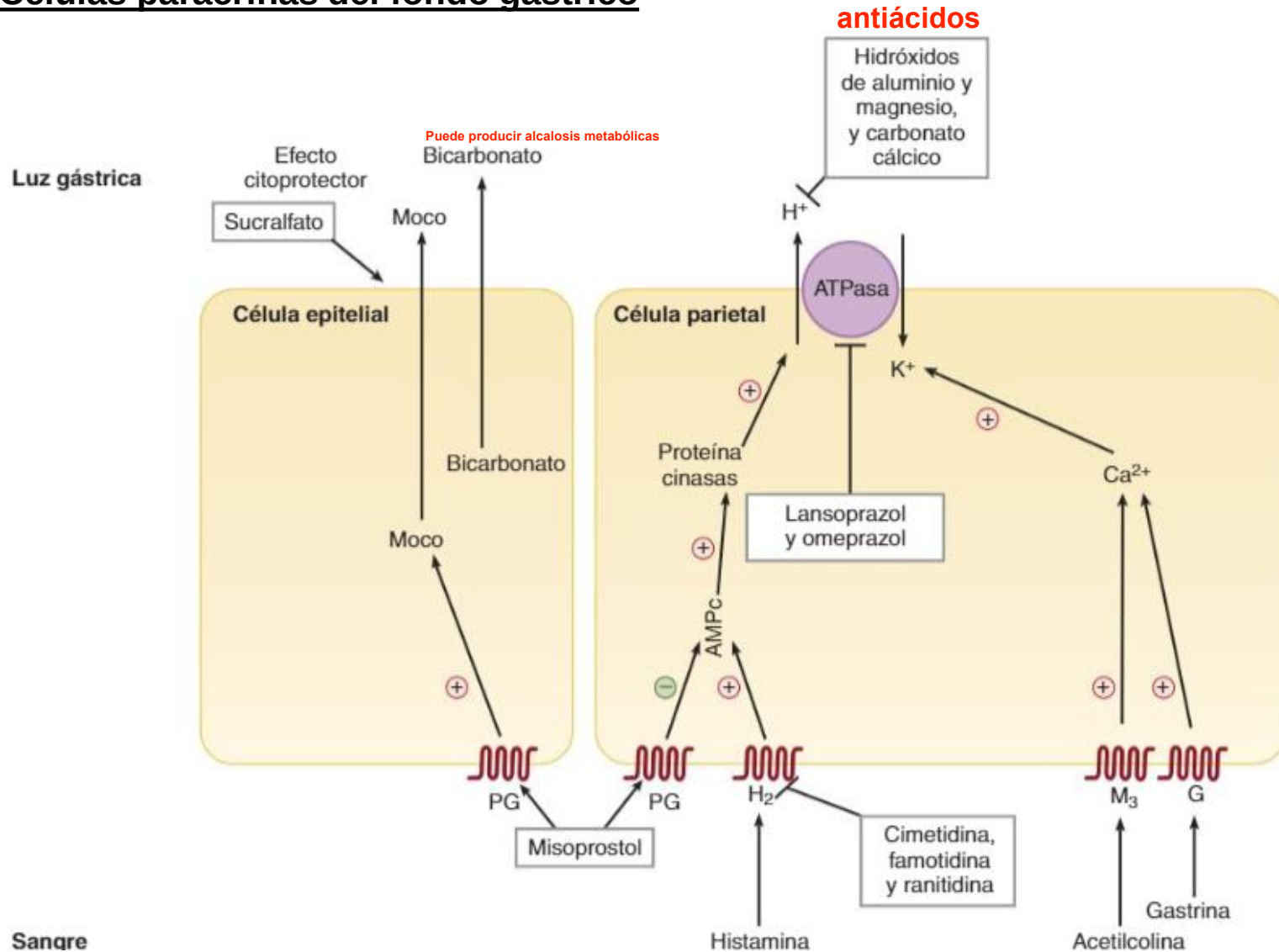


ALMACENAMIENTO Y LIBERACIÓN DE HISTAMINA

Mastocitos y basófilos (abundantes en la piel, el tubo digestivo y el ap. respiratorio)



Células paracrinas del fondo gástrico



Tomado de Brenner G.M. y Stevens C.W. (2019). Farmacología Básica. 5º ed. Ed. Elsevier

RECEPTORES DE HISTAMINA Y SUS EFECTOS

RECEPTORES H₁, su activación da lugar a:

- Piel y membranas mucosas: vasodilatación, aumento de la permeabilidad capilar (habones) y eritema (calor y enrojecimiento), congestión, edema e inflamación
- Terminaciones nerviosas mucocutáneas: prurito, y en los pulmones: inicia el reflejo de la tos
- Músculo liso bronquial y digestivo: contracción

PARTICIPA EN REACCIONES ALÉRGICAS:

- Dermatitis
- Rinitis
- Conjuntivitis y otras formas de alergia

Si se libera una cantidad suficiente de histamina plasmática: hipotensión y shock anafiláctico

RECEPTORES H₂, su activación da lugar a:

- Células parietales de la mucosa gástrica: secreción de ácido gástrico
- Corazón: aumento de la frecuencia cardiaca y la contractilidad (efectos poco significativos)

PARTICIPA EN LAS PATOLOGÍAS RELACIONADAS CON EL ÁCIDO:

- Reflujo gastroesofágico
- Úlcera péptica
- Gastritis por estrés (situación aguda)
- Síntomas dispépticos

ANTAGONISTAS DE LOS RECEPTORES H₁ (ANTIHIISTAMÍNICOS)

PRIMERA GENERACIÓN	INDICACIÓN CLÍNICA
• <u>DIMENHIDRINATO</u> +/- CAFEINA (oral) • <u>DOXILAMINA</u> con vitamina B₆ • <u>DIFENHIDRAMINA</u> (oral) <u>CLORFENAMINA</u> (oral, tópico) • <u>DEXCLORFENIRAMINA</u> (Polaramine®) (oral, i.m. profunda, IV en bolus)	✓ Náuseas por cinetosis ✓ Vértigo ✓ Náuseas/vómitos durante el embarazo ✓ Hipnótico suave ✓ Reacciones alérgicas al polen y otros alérgenos ambientales ✓ Descongestionante nasal ✓ Reacciones anafilácticas junto a adrenalina y GC ✓ Reacciones alérgicas a plasma o sangre Cuando <u>NO es practicable la vía oral</u>



SEGUNDA GENERACIÓN	INDICACIÓN CLÍNICA
• <u>EBASTINA</u> • <u>LORATADINA</u> (vía oral) • <u>AZELASTINA</u> (colirio o inhalador nasal)	✓ Rinitis alérgicas estacionales leves y/o intermitentes o perennes ✓ Procesos alérgicos de origen respiratorio ✓ Urticaria ✓ Conjuntivitis alérgica ✓ Rinitis alérgica

FÁRMACOS	EFFECTOS ADVERSOS
• <u>PRIMERA GENERACIÓN</u>	• <u>Alteraciones neurológicas</u>: • <u>Somnolencia, sedación</u>, desorientación, descoordinación • excitabilidad paradójica (especialmente en lactantes y niños): insomnio, nerviosismo, euforia, convulsiones • <u>Efectos anticolinérgicos</u> <u>La toxicidad anticolinérgica es la principal indicación de una sobredosis</u> • Pueden aparecer reacciones de hipersensibilidad y fotosensibilidad (especialmente los preparados tópicos)
• <u>SEGUNDA GENERACIÓN</u>	• Prolongación del <u>intervalo QT</u>. TERFENADINA (medicamento retirado por provocar taquicardia ventricular polimorfa: torsades de pointes)

ANTAGONISTAS DE LOS RECEPTORES H₂

RANITIDINA

INDICACIONES:

- Tratamiento de la úlcera péptica y la enfermedad por reflujo gastroesofágico (vía oral)
- Profilaxis de la hemorragia gastrointestinal debida a úlcera de estrés en pacientes graves (IV lenta, seguida de perfusión)
- En el preoperatorio, pacientes con riesgo de síndrome de aspiración ácida (Síndrome de Mendelson) (IV lenta, 45-90 min o i.m)
- Tratamiento agudo de la úlcera péptica y el reflujo en lactantes y niños (hasta 11 años) (IV cuando el tratamiento oral no es posible)



ANTAGONISTAS DE LOS RECEPTORES H₂

RANITIDINA

FARMACOCINÉTICA:

- Se toman 1-2 veces/día
- Disminuye la biodisponibilidad cuando se administra con antiácidos

Son muy seguros. Bien tolerados, tras tratamientos prolongados puede aparecer tolerancia e hipersecreción ácida de rebote