

# FARMACOLOGIA DE LA HISTAMINA

## OBJETIVOS Y COMPETENCIAS:

Al finalizar el estudio de este Tema el alumno deberá ser capaz de:

- 1.- Juzgar la importancia del papel fisiopatológico de la Histamina.**
- 2.- Clasificar a los antihistámicos según su mecanismo de acción.**
- 3.- Deducir las indicaciones de los Anti-H de 1ª y 2ª generación, en base a sus propiedades cinéticas y tipo de receptor bloqueado.**
- 4.- Valorar la problemática actual de los Vasoconstrictores Nasales**

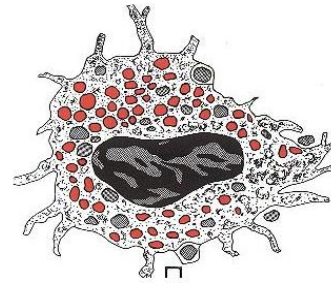


# HISTAMINA

## ORIGEN. DISTRIBUCION. RECEPTORES

### ORIGEN:

- + A PARTIR DEL AMINOACIDO HISTIDINA.
- + HISTIDIN-DECARBOXILASA INTRACELULAR.



### DISTRIBUCION:

#### + CELULAS DE SINTESIS Y ALMACENAJE:

- \* MASTOCITOS Y BASOFILOS.
- \* EN GRANULOS DE DEPOSITO.

#### + CELULAS DE SINTESIS Y LIBERACION CONTINUA:

- \* CELULAS DE LA EPIDERMIS.
- \* HISTAMINOCITOS MUCOSA GASTRICA
- \* NEURONAS HISTAMINERGICAS.

### RECEPTORES HISTAMINERGICOS:

H1 , H2, (H3 Y H4) : CENTRALES Y PERIFERICOS.



# **HISTAMINA**

## **ACCIONES FARMACOLOGICAS 1**

### **- A NIVEL CARDIACO: H2**

- + INOTROPISMO (+).**
- + TAQUICARDIA.**
- + PELIGRO DE ARRITMIAS.**

### **- SOBRE LOS VASOS SANGUINEOS:**

#### **+ H1: SITUADOS EN ENDOTELIO:**

- \* PRODUCEN NO Y PROSTACICLINA.**
- \* RELAJACION F.M.L.**

#### **+ H2: SITUADOS EN F.M.L.:**

- \* PRODUCEN RELAJACION DIRECTA.**

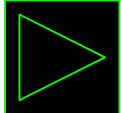
#### **+ VASODILATACION GENERALIZADA:**

- \* DISMINUCION PRESION ARTERIAL.**
- \* TAQUICARDIA REFLEJA.**
- \* RUBOR Y CALOR CUTANEO.**
- \* CEFALEAS.**



# HISTAMINA

## ACCIONES FARMACOLOGICAS 2

- SOBRE CELULAS ENDOTELIALES DE LAS VENULAS POSTCAPILARES: **H1**
  - + CONTRACCION CELULAS ENDOTELIALES
  - + AMPLIAS SEPARACIONES INTER-CELULARES.
  - + AUMENTO PERMEABILIDAD.
  - + EXTRAVASACION DE AGUA, ELECTROLITOS, PROTEINAS PLASMATICAS Y LEUCOCITOS.
  - + **EDEMAS** LOCALIZADOS O GENERALIZADOS. 
- SOBRE TERMINACIONES NERVIOSAS SENSITIVAS DE LA PIEL: **H1**
  - + **PRURITO.**
  - + **DOLOR.**



# **HISTAMINA**

## **ACCIONES FARMACOLOGICAS 3**

**- SOBRE LA F.M.L. GASTROINTESTINAL: H1**

**+ AUMENTO DEL TONO Y MOTILIDAD**

**GASTROINTESTINAL:**

**\* DOLORES ABDOMINALES.**

**\* NAUSEAS Y VOMITOS.**

**- SOBRE LAS F.M.L. BRONQUIALES: H1 Y H2**

**+ BRONCOCONSTRICCIÓN MODERADA.**

**+ MAS INTENSA BRONCOCONSTRICCIÓN  
EN ASMATICOS.**



# HISTAMINA

## ACCIONES FARMACOLOGICAS 4

### - SOBRE LAS CELULAS SECRETORAS

#### GASTRICAS:

##### + PARIETALES: **H2**

- \* PRODUCCION ABUNDANTE DE JUGO GASTRICO MUY ACIDO.

##### + PRINCIPALES: **H2**

- \* AUMENTO SECRECION PEPSINOGENO

### - A NIVEL DEL S.N.C.:

- + **H1**:
  - POTENCIA EL ESTADO DE VIGILIA,
  - INHIBE EL APETITO Y
  - ESTIMULA EL VOMITO Y
  - ESTIMULA LA TOS.



# ANTIISTAMINICOS

## CONCEPTO Y CLASIFICACION

### CONCEPTO:

- BLOQUEAN RECEPTORES HISTAMINA.
- ANTAGONIZAN EFECTOS HISTAMINA ENDOGENA.
- ANTAGONISMO DE TIPO COMPETITIVO.

### CLASIFICACION:

#### 1º.- BLOQUEANTES DE RECEPTORES H1:

+ DE 1ª GENERACION : 3-4 VECES AL DIA.

- \* DEXTROCLORFENIRAMINA.
- \* DIMENHIDRINATO. PROMETAZINA.
- \* CIPROHEPTADINA.

DIF

+ DE 2ª GENERACION: 1 VEZ AL DIA.

- \* TERFENADINA (FEXOFENADINA).
- \* LORATADINA (DESLORATADINA).
- \* AZELASTINA.

#### 2º.- BLOQUEANTES DE RECEPTORES H2.





# **ANTIISTAMINICOS H1**

## **ACC.FARMAC. Y EFEC.ADVERSOS 1**

### **A NIVEL PERIFERICO:**

**1º.- ANULAN EFECTOS NOCIVOS HISTAMINA**  
**POR: BLOQUEO H1 ( YA VISTOS)**

**\*VASCULARES.**

**\*SINTOMAS CUTANEOS.**

**\* GASTROINTESTINALES.**

**\* BRONQUIALES.**

**2º.- TIENEN EFECTOS ANTICOLINERGICOS**  
**POR: BLOQUEO M**

**\* SINDROME ANTIMUSCARINICO PERIF.**

**\* SOLO LOS DE 1ª GENERACION**

**\* EXCEPCION: TAMBIEN LA AZELASTINA**  
**DE 2ª GENERACION.**







# **ANTIISTAMINICOS H1**

## **ACC.FARMAC. Y EFEC.ADVERSOS 2**

**A NIVEL S.N.C.:**

**SOLO LOS DE 1ª GENERACION**

**ATRAVIESAN LA B.H.E.:**

**1º.- POR BLOQUEO H1:**

**+ ACCION DEPRESORA: SEDACION Y  
SOMNOLENCIA:**

- DIFICULTAN ACTIVIDAD DIARIA.**
- PELIGRO CONDUCCION AUTOMOVIL.**
- POTENCIACION CON ALCOHOL.**

**+ ACC. ANTIEMETICA Y ANTIVERTIGINOSA**

**+ ESTIMULANTE DEL APETITO.**

**+ ACCION ANTITUSIGENA.**

**2º.- POR BLOQUEO M:**

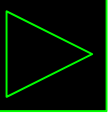
**+ SINDROME ANTIMUSCARINICO CENTRAL**



# ANTIISTAMINICOS H1

## OTROS EFECTOS ADVERSOS

### DE LOS ANTIISTAMINICOS DE 2ª GENERACION:

- ALARGAMIENTO ESPACIO QT DEL E.C.G. 
- TAQUICARDIA VENTRICULAR POLIMORFICA
- SOLAMENTE TERFENADINA.
- ACTUA PRINCIPALMENTE POR METABOLITOS ACTIVOS (FEXOFENADINA).
- ES CASI “PROFARMACO”. **FUN**
- EN CASO DE SOBREDOSIS O BLOQUEO DEL METABOLISMO HEPATICO.
- EXCESO DE PROFARMACO CAUSA LA TVP.
- INHIBORES DEL METABOLISMO:
  - + ERITROMICINA. CLARITROMICINA.
  - + KETOKONAZOL.



# ANTIISTAMINICOS H1.

## USOS TERAPEUTICOS 1

**1º.- EN PROCESOS CARACTER ALERGICO:**

**+ GRADO DE EFICACIA VARIABLE SEGÚN SEA LA PARTICIPACION DE HISTAMINA.**

**+ ANAFILAXIA. EDEMA DE GLOTIS:** 

**- ADRENALINA PARENTERAL.**

**- CORTICOIDES: NO EFECTO EN 30min.**

**- ANTI-H1: NO EFECTO EN 30min.**

**+ RINITIS Y CONJUNTIVITIS ALERGICAS:**

**- POLINOSIS: FIEBRE DEL HENO, OTRAS.**

**+ URTICARIA AGUDA.** 

**+ DERMATITIS ATOPICA Y POR CONTACTO**

**+ REACCIONES ALERGICAS A:** 

**- FARMACOS.**

**- MEDIOS DE CONTRASTE.**

**- TRANSFUSIONES DE SANGRE.**



# ANTIISTAMINICOS H1.

## USOS TERAPEUTICOS 2

**2º.- EN PROCESOS NO ALERGICOS PERO CON LIBERACION DE HISTAMINA:**

- + ERITEMA SOLAR.**
- + PICADURAS DE INSECTOS O ARACNIDOS.**
- + CONTACTO CON PLANTAS, MEDUSAS.**

**3º.- EN LA RINITIS CATARRAL O GRIPAL:**

- + CONTROL DE LAS SECRECIONES.**
- + POR BLOQUEO  $M_3$  GLANDULAS SECRETORAS DE MOCO NASALES.**
- + SOLO LOS ANTI-H1 ANTIMUSCARINICOS.**
- + INTERES AZELASTINA 2ª GENERACION.**

**FUN**



# **ANTIISTAMINICOS H1.**

## **USOS TERAPEUTICOS 3**

**4º.- COMO ESTIMULANTES DEL APETITO:**

**+ CIPROHEPTADINA.**

**+ POR BLOQUEO DE RECEPTORES H<sub>1</sub>  
EN S.N.C.**

**5º.- EN CASO DE VERTIGO, NAUSEAS Y  
VOMITOS:**

**+ POR CINETOSIS:MAREO POR MOVIMIENTO**

**+ EN EL POSTOPERATORIO.**

**+ POR RADIOTERAPIA.**

**+ POR FARMACOS: ANTICANCEROSOS ETC.**

**+ EN EL EMBARAZO.**

**+ SE USA: DIMENHIDRINATO.PROMETAZINA.**

**6º.- COMO HIPNOTICOS.**

**7º.- COMO ANTITUSIGENOS.**



# ANTIISTAMINICOS H1

## BIBLIOGRAFIA

**1.- J.Flórez**

**Farmacologia Humana**

**5ª Edicion 2008**

**2.- Lorenzo P, Moreno A, et all.**

**Velazquez. Farmacologia Basica y Clinica (8ª Edicion).**

**Panamericana, 2008.**

**3.- Rang HP, Dale MM, Ritter JM.**

**Farmacologia (6ª Edicion).**

**Elsevier, 2008.**

**4.- Mendoza Patiño N.**

**Farmacologia Medica (1ª Edicion).**

**Panamericana, 2008.**

**5.- Goodman&Gilman**

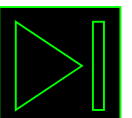
**Las Bases Farmacologicas de la Terapeutica (11ª Edicion)**

**McGraw-Hill, 2006.**

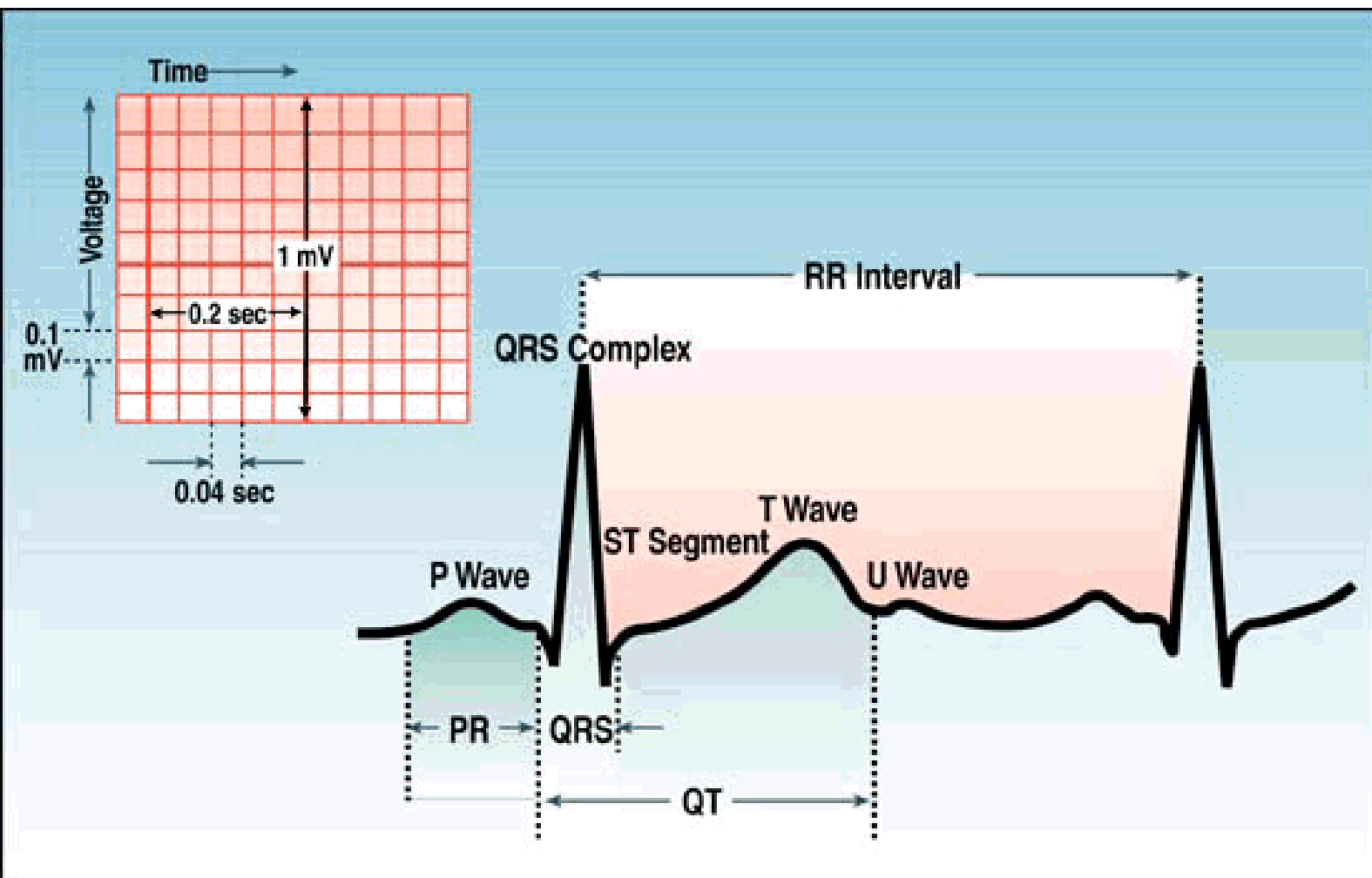
**6.- Hendeles L.**

**Pharmacotherapy. 1993**

**Selecting a decongestant.**



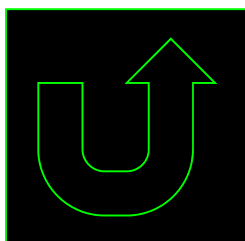
# TAQUICARDIA VENTRICULAR POLIMORFICA



- **QT ALARGADO.**
- **ALTERACION REPOLARIZACION VENTRICULAR.**
- **POR BLOQUEO DE LA CORRIENTE DE SALIDA DE POTASIO  $I_{Kr}$  :**  
**(RECTIFICADORA TARDIA DE ACTIVACION RAPIDA)**

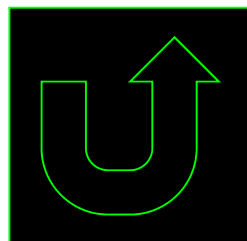


# EDEMA LOCALIZADO

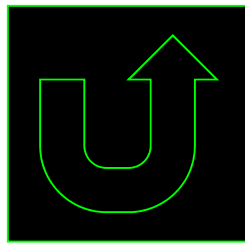




# ANGIOEDEMA



# URTICARIA



# DERMATITIS ATOPICA





# DERMATITIS DE CONTACTO

