

# 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 antihistánnicos según su mecanismo de acción.**
- 3.- Deducir las indicaciones de los Anti-H de 1<sup>a</sup> y 2<sup>a</sup> generación, en base a sus propiedades cinéticas y tipo de receptor bloqueado.**
- 4.- Valorar la problemática actual de los Vasoconstrictores Nasales**

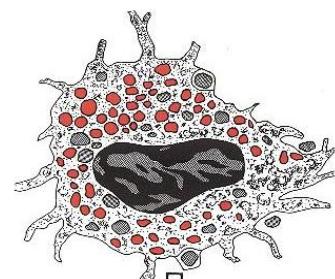


# **HISTAMINA**

## **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: H<sub>2</sub>

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

### - SOBRE LOS VASOS SANGUINEOS:

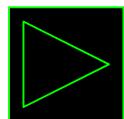
- + H<sub>1</sub>: SITUADOS EN ENDOTELIO:
  - \* PRODUCEN NO Y PROSTACICLINA.
  - \* RELAJACION F.M.L.
- + H<sub>2</sub>: SITUADOS EN F.M.L.:
  - \* PRODUCEN RELAJACION DIRECTA.
- + VASODILATACION GENERALIZADA:
  - \* DISMINUCION PRESION ARTERIAL.
  - \* TAQUICARDIA REFLEJA.
  - \* RUBOR Y CALOR CUTANEO.
  - \* 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 ASMÁTICOS.**



# **HISTAMINA**

## **ACCIONES FARMACOLOGICAS 4**

**- SOBRE LAS CELULAS SECRETORAS**

**GASTRICAS:**

**+ PARIETALES: H<sub>2</sub>**

**\* PRODUCCION ABUNDANTE DE JUGO  
GASTRICO MUY ACIDO.**

**+ PRINCIPALES: H<sub>2</sub>**

**\* AUMENTO SECRECION PEPSINOGENO**

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

**+ H<sub>1</sub>: - POTENCIA EL ESTADO DE VIGILIA,**

**- INHIBE EL APETITO Y**

**- ESTIMULA EL VOMITO Y**

**- ESTIMULA LA TOS.**



# ANTIHISTAMINICOS

## CONCEPTO Y CLASIFICACION

### CONCEPTO:

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

### CLASIFICACION:

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

+ DE 1<sup>a</sup> GENERACION : 3-4 VECES AL DIA.

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

**DIF**

+ DE 2<sup>a</sup> GENERACION: 1 VEZ AL DIA.

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

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



# ANTIHISTAMINICOS H1

## ACC.FARMAC. Y EFEC.ADVRSOS 1

### A NIVEL PERIFERICO:

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

\* VASCULARES.

\* SINTOMAS CUTANEOS.

\* GASTROINTESTINALES.

\* BRONQUIALES.

2º.- TIENEN EFECTOS ANTOCOLINERGICOS

POR: BLOQUEO M

\* SINDROME ANTIMUSCARINICO PERIF.

\* SOLO LOS DE 1<sup>a</sup> GENERACION

\* EXCEPCION: TAMBien LA AZELASTINA  
DE 2<sup>a</sup> GENERACION.



# ANTIHISTAMINICOS H1

## ACC.FARMAC. Y EFEC.ADVERSOS 2

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

**SOLO LOS DE 1<sup>a</sup> 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:**

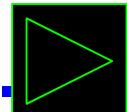
**+ SINDROME ANTIMUSCARINICO CENTRAL**



# ANTIHISTAMINICOS H1

## OTROS EFECTOS ADVERSOS

### DE LOS ANTIHISTAMINICOS DE 2<sup>a</sup> GENERACION:

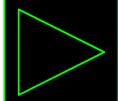
- ALARGAMIENTO ESPACIO QT DEL E.C.G. 
- TAQUICARDIA VENTRICULAR POLIMORFICA
- SOLAMENTE TERFENADINA.
- ACTUA PRINCIPALMENTE POR METABOLITOS ACTIVOS (FEXOFENADINA).
- ES CASI “PROFARMACO”. 
- EN CASO DE SOBREDOSIS O BLOQUEO DEL METABOLISMO HEPATICO.
- EXCESO DE PROFARMACO CAUSA LA TVP.
- INHIBORES DEL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



# ANTIHISTAMINICOS H1. USOS TERAPEUTICOS 1

## 1º.- EN PROCESOS CARACTER ALERGICO:

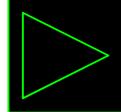
+ GRADO DE EFICACIA VARIABLE SEGÚN  
SEA LA PARTICIPACION DE HISTAMINA.

+ ANAFILAXIA.EDEMA DE GLOTIS: 

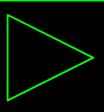
- ADRENALINA PARENTERAL.
- CORTICOIDES: NO EFECTO EN 30min.
- ANTI-H1: NO EFECTO EN 30min.

+ 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.



## **ANTIHISTAMINICOS 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 2<sup>a</sup> GENERACION.**

**FUN**



## **ANTIHISTAMINICOS 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.**



# ANTIHISTAMINICOS H1

## BIBLIOGRAFIA

**1.- J.Flórez**

**Farmacologia Humana**

**5<sup>a</sup> Edicion 2008**

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

**Velazquez. Farmacologia Basica  
y Clinica (8<sup>a</sup> Edicion).**

**Panamericana, 2008.**

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

**Farmacologia (6<sup>a</sup> Edicion).**

**Elsevier, 2008.**

**4.- Mendoza Patiño N.**

**Farmacologia Medica (1<sup>a</sup> Edicion).**

**Panamericana, 2008.**

**5.- Goodman&Gilman**

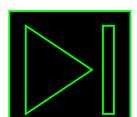
**Las Bases Farmacologicas de la  
Terapeutica (11<sup>a</sup> Edicion)**

**McGraw-Hill, 2006.**

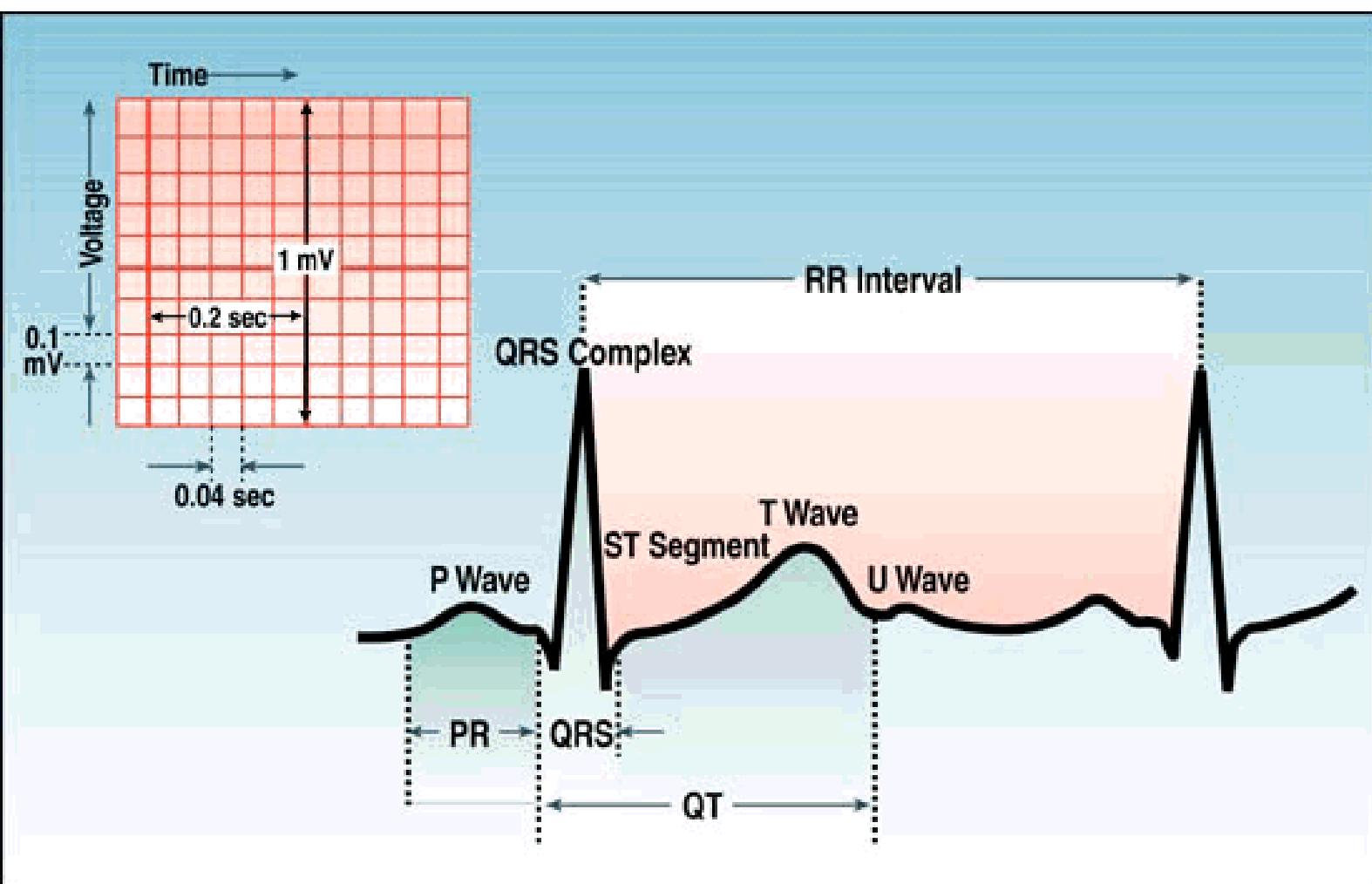
**6.- Hendeles L.**

**Pharmacotherapy. 1993**

**Selecting a decongestant.**



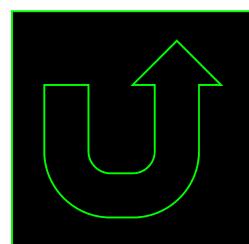
# TAQUICARDIA VENTRICULAR POLIMORFICA



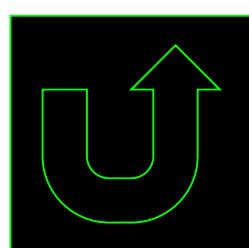
- QT ALARGADO.
- ALTERACION REPOLARIZACION VENTRICULAR.
- POR BLOQUEO DE LA CORRIENTE DE SALIDA DE POTASIO  **$I_{Kr}$**  :  
(RECTIFICADORA TARDIA DE ACTIVACION RAPIDA)



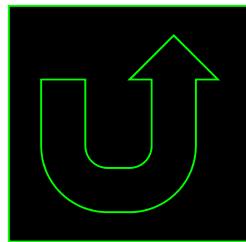
# EDEMA LOCALIZADO



# ANGIOEDEMA



# URTICARIA



# DERMATITIS ATOPICA





# DERMATITIS DE CONTACTO

