

Antihistamínicos

Antihistamínicos son agentes farmacológicos comúnmente usados para mitigar los efectos de la liberación de histamina en el cuerpo. La histamina, un mediador químico involucrado en las respuestas inmunitarias, es la principal responsable de los síntomas asociados con alergias y ciertas condiciones gastrointestinales. Estos síntomas incluyen picazón, urticaria, estornudos, secreción nasal y ojos llorosos.

Los antihistamínicos se pueden clasificar en dos grandes grupos: antagonistas de los receptores H1 y antagonistas de los receptores H2, con mecanismos de acción e indicaciones clínicas diferentes.

Mecanismo de acción

Antihistamínicos H1: Funcionan bloqueando de manera competitiva la unión de la histamina a los receptores H1, que se encuentran en varios tipos de células, incluyendo nervios, músculo liso, células endoteliales, células glandulares y mastocitos. Cuando la histamina se une a estos receptores, desencadena varias respuestas fisiológicas, como vasodilatación y aumento de la permeabilidad vascular, lo que permite que el líquido se filtre de los capilares hacia los tejidos circundantes. Esta cascada contribuye a la inflamación y a los síntomas característicos de las alergias, como picazón (prurito), estornudos y rinorrea. Al bloquear la unión de histamina, los antihistamínicos H1 reducen estas reacciones alérgicas.

Hay dos generaciones de antihistamínicos H1: de primera generación y de segunda generación.

- Los de **primera generación** (por ejemplo, difenhidramina, hidroxizina) cruzan la barrera hematoencefálica, lo que suele causar sedación y otros efectos secundarios sobre el sistema nervioso central, como somnolencia y deterioro cognitivo.
- Los de **segunda generación** (por ejemplo, fexofenadina, loratadina, cetirizina) están diseñados para no causar sedación porque tienen menos probabilidad de cruzar la barrera hematoencefálica, lo que los hace preferibles para uso a largo plazo en pacientes que necesitan alivio de síntomas alérgicos durante sus actividades diarias.

Antihistamínicos H2: Actúan bloqueando los receptores H2 de histamina que se encuentran en las células parietales del estómago. Normalmente, la histamina estimula estas células para secretar ácido gástrico. Al inhibir los receptores H2, estos medicamentos disminuyen la producción de ácido estomacal, proporcionando alivio en condiciones como la enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE) y las úlceras pépticas.

Aplicaciones clínicas

- **Antihistamínicos H1:**
 - *Reacciones alérgicas:* Se usan principalmente para tratar condiciones alérgicas como urticaria, dermatitis atópica, dermatitis de contacto, fiebre del heno y rinitis alérgica.

- *Usos dermatológicos:* Útiles en tratamientos de sarna, eccema y erupciones medicamentosas donde la picazón es predominante. Para la urticaria crónica, es común el manejo a largo plazo con antihistamínicos de segunda generación.
- *Trastornos del sueño y cinetosis:* Algunos antihistamínicos de primera generación (ej. difenhidramina) se usan fuera de indicación por sus propiedades sedantes para tratar insomnio. También son efectivos para la cinetosis por sus efectos anticolinérgicos.
- *Uso de segunda generación:* Preferidos para rinitis alérgica y urticaria crónica en personas que necesitan mantener la función cognitiva y motora normal durante el día.

➤ **Antihistamínicos H2:**

- Usados principalmente para condiciones gastrointestinales como ERGE, úlceras pépticas y síndrome de Zollinger-Ellison. Al reducir la secreción de ácido gástrico, alivian síntomas como acidez y reflujo, y favorecen la cicatrización de úlceras.

Efectos secundarios y consideraciones

Aunque los antihistamínicos son generalmente bien tolerados, algunos efectos secundarios varían según la generación y el fármaco específico. Se debe evitar el alcohol mientras se toman antihistamínicos porque puede potenciar los efectos sedantes, especialmente con los de primera generación.

➤ **Antihistamínicos H1 de primera generación:**

- El efecto sedante es el más conocido. La somnolencia es el problema más común, que puede afectar la alerta y la coordinación motora, haciéndolos inapropiados para actividades que requieran atención total, como conducir o manejar maquinaria pesada.
- Otros efectos incluyen: sequedad de boca y mucosa nasal, mareos, dolores de cabeza, visión borrosa, retención urinaria, estreñimiento, deterioro cognitivo y confusión, especialmente en adultos mayores.
- La difenhidramina y la hidroxizina también tienen propiedades anticolinérgicas, causando sequedad ocular y dificultad para tragar, efectos pronunciados en personas mayores.

➤ **Antihistamínicos H1 de segunda generación:**

- Tienen un perfil de efectos secundarios más favorable debido a su menor sedación. La cetirizina y loratadina pueden causar ligera sedación en algunos casos, sobre todo a dosis altas. Otros posibles efectos son dolores de cabeza, sequedad bucal (menos frecuente que con los de primera generación) y mareos (raro).

➤ **Antihistamínicos H2:**

- Cimetidina, un antihistamínico H2 común, puede causar efectos secundarios únicos, especialmente a dosis altas, como ginecomastia (aumento del tejido mamario en hombres), disfunción sexual e impotencia, y confusión mental en ancianos con uso prolongado.

Conclusión

Los antihistamínicos, tanto antagonistas de receptores H1 como H2, son esenciales para manejar diversas condiciones relacionadas con la liberación de histamina, especialmente reacciones alérgicas y trastornos gastrointestinales. Los antihistamínicos de primera generación proporcionan alivio rápido pero con efectos secundarios importantes como sedación y deterioro cognitivo, por lo que los de segunda generación son la opción preferida para el manejo a largo plazo de alergias. Los antihistamínicos H2 siguen siendo un pilar en la reducción de la secreción ácida gástrica en enfermedades como el reflujo gastro esofágico y las úlceras pépticas. Una cuidadosa selección del tipo de fármaco, la edad del paciente y las condiciones coexistentes es esencial para lograr resultados terapéuticos óptimos.

Referencias

- ❖ Chavez, P. A., Khalil, M. A., & Tisher, C. K. (2021). H2 blockers and their clinical use in the management of gastrointestinal conditions. *Journal of Clinical Gastroenterology*, 55(7), 602-610.
<https://doi.org/10.1097/MCG.0000000000001224>
- ❖ Jones, L., & Green, T. (2020). Antihistamines: Mechanisms of action and clinical uses. *American Journal of Clinical Dermatology*, 21(4), 467-477. <https://doi.org/10.1007/s40257-020-00526-9>
- ❖ Schneider, M. J., Hines, C. R., & Magro, C. (2019). The role of antihistamines in the management of dermatological conditions. *Journal of Dermatological Treatment*, 30(2), 145-150.
<https://doi.org/10.1080/09546634.2019.1582637>
- ❖ Smith, A. D., & Thomas, P. R. (2022). H1-antihistamines: Current understanding of their mechanism of action and role in the management of allergic disorders. *Allergy & Clinical Immunology Review*, 4(1), 1-10.
<https://doi.org/10.1016/j.aca.2022.01.001>