

ANTI-HISTAMINICOS H1

Cristina Rubio

CLASIFICACIÓN¹:

De primera generación

Atraviesan la barrera hematoencefálica, deprimen el sistema nervioso central (SNC), produciendo sedación y tienen acciones anticolinérgicas (disminución de reactividad del músculo liso).

1. Etanolaminas: carbinoxamina, clemastina, dimenhidrinato, difenhidramina, doxilamina
2. Etilendiaminas: pirilamina, tripelenamina, cloropiramina
3. Alquilaminas: maleato de clorfenamina, maleato de bromofeniramina
4. Piperazinas: clorhidrato de hidroxicina, pamoato de hidroxicina, clorhidrato de ciclizina, lactato de ciclizina, clorhidrato de meclizina
5. Fenotiazinas: prometazina

De segunda generación o sin efecto sedante

Tienen poco efecto sobre el SNC al atravesar poco la barrera hematoencefálica, no tiene efectos anticolinérgicos o sedantes.

1. Alquilaminas: acrivastina
2. Piperazinas: cetirizina
3. Piperidinas: terfenadina, astemizol, clorhidrato de levocabastina, loratadina, azatadina, fenindamina, ciproheptadina, difenilpiralina, ebastina

De tercera generación

Son metabolitos activos y enantiómeros de los de segunda generación, como la levocetirizina, la fexofenadina, desloratadina, y en estudio se encuentra el tecastemizol (respectivamente son metabolitos de la cetirizina, terfendina, loratadina y astemizol).

USOS de los antihistamínicos:

- Sobre todo para tratar las reacciones alérgicas
- También se usan para tratar el prurito, el vértigo periférico y contra el insomnio. Ocasionalmente se usa como droga de abuso por sus efectos alucinógenos.

Puede ocurrir a través de rutas orales, parenterales o dérmicas (parches o cremas).

FARMACOLOGÍA: antagonista competitivo de los receptores de histamina (H1 y H2).

TOXICOLOGÍA: los efectos anticolinérgicos (principalmente antimuscarínicos). Se desarrollan en una sobredosis debido al antagonismo de los receptores centrales H1. La difenhidramina, pueden causar antagonismo de los canales de sodio².

EFFECTOS

- ADVERSOS: COMUNES: sedación leve, mareos, coordinación alterada y efectos anticolinérgicos leves. La excitación paradójica puede desarrollarse en algunos pacientes.

- TÓXICOS

ENVENENAMIENTO MODERADO A MODERADO: Somnolencia, efectos anticolinérgicos (es decir, midriasis, fiebre, sequedad de boca y disminución de los ruidos intestinales), taquicardia, hipertensión leve y náuseas y vómitos son comunes después de una sobredosis. La agitación, la confusión y las alucinaciones pueden desarrollarse con intoxicación moderada.

ENVENENAMIENTO GRAVE, en caso de envenenamientos por ingerir grandes dosis de forma deliberada, pueden provocar: delirio agitado, psicosis, convulsiones, coma, hipotensión, ensanchamiento de QRS y arritmias ventriculares, incluyendo "torsade de puntas". En pacientes con agitación prolongada, coma o convulsiones pueden desarrollar rabiomiolisis e insuficiencia renal.

CONTROLES y MONITORIZACIÓN.

Ingreso en Observación de 6-8 horas en pacientes sintomáticos e ingesta deliberada:

- A) Controle los signos vitales (incluida la temperatura) y el estado mental.
- B) Los niveles plasmáticos de antihistamínicos no son clínicamente útiles ni fácilmente disponibles.
- C) Realizar un ECG y monitorización cardíaca continua en pacientes con toxicidad de moderada a grave.
- D) Controles de CPK en los casos con agitación, convulsiones o coma prolongados y de la función renal.

TRATAMIENTO

DESCONTAMINACIÓN

- 1) PREHOSPITAL: No se recomienda debido a la posibilidad de somnolencia y convulsiones.
- 2) HOSPITAL: carbón activado si es reciente, ingestión sustancial y paciente capaz de proteger las vías respiratorias. Considere el lavado gástrico en ingestión reciente, grande (más de 1 g), pero primero proteja la vía aérea.

MANEJO DE LA TOXICIDAD LEVE A MODERADA

La mayoría de las sobredosis de antihistamínicos requieren solo cuidados de apoyo:

- Carbón activado
- Sedación con benzodiazepinas para agitación y delirio. La hipertensión y la taquicardia son generalmente leves y bien toleradas, y no requieren un tratamiento específico.

TRATAMIENTO DE LA TOXICIDAD GRAVE

- Intubación orotraqueal para la protección de las vías respiratorias debe realizarse temprano.
- El lavado gástrico con aislamiento de vías aéreas y administrar carbón activado.
- El delirio grave puede desarrollarse y requerir grandes dosis de benzodiazepinas para la sedación.
- Las convulsiones (raramente pueden progresar a estado epiléptico) pueden requerir el uso agresivo de benzodiazepinas, propofol y/o barbitúricos.
- El ensanchamiento del QRS y las arritmias ventriculares; tratar con bicarbonato de sodio intravenoso (dosis inicial de 1 a 2 mEq / kg en bolo, titulación en la sangre pH 7,45 a 7,55), o lidocaína si el bicarbonato de sodio no tiene éxito.
- Trate la hipertermia con sedación agresiva con benzodiazepinas para controlar la agitación y el enfriamiento externo.

ANTIDOTO

La **fisostigmina** tiene un efecto corto de 45-60 minutos y revierte los efectos centrales (delirio anticolinérgico) causados por dosis tóxicas.

PRECAUCIÓN: Si se ingieren antidepresivos tricíclicos, la fisostigmina puede precipitar convulsiones y disritmias. El ECG no debe tener alteraciones (QRS ancho, QT largo, Bradicardia), sin hipotensión y con delirio anticolinérgico.

DOSIS ADULTO: BOLO: 1-2 mg IV a una velocidad controlada lenta (durante al menos 5 minutos), no más de 1 mg/min.

NIÑO: 0.02 mg / kg (máximo 0.5 mg) por inyección IV lenta, a una velocidad no mayor a 0.5 mg / minuto (recomendación del fabricante) o durante al menos 5 minutos. Repita la dosificación a intervalos de 5 a 15 minutos, siempre que el efecto tóxico persista y no haya signos de efectos colinérgicos.

DOSIS MÁXIMA: 2 mg en total. **PRECAUCIÓN:** una administración intravenosa rápida de fisostigmina puede provocar bradicardia, hipersalivación y dificultades respiratorias y convulsiones.

Hemodiálisis o hemoperfusión no tienen ningún valor.

Se ha descrito en caso de intoxicación por Dosilamina con Rabdomiolisis precisando hidratación masiva y temprana alcalinización urinaria³.

BIBLIOGRAFIA:

1. <https://es.wikipedia.org/wiki/Antihistam%C3%ADnico>
2. http://www.micromedexsolutions.com/micromedex2/librarian/CS/B5D306/ND_PR/evidencexpert/ND_P/evidencexpert/DUPLICATIONSHIELDSYNC/AB58A5/ND_PG/evidencexpert/ND_B/evidencexpert/ND_AppProduct/evidencexpert/ND_T/evidencexpert/PFActionId/evidencexpert.IntermediateToDocumentLink?docId=680&contentSetId=51#indepthpanelprint
3. Kim E, Choi YH, Lim JY, Lee J, Lee DH. The effect of early urine alkalinization on occurrence rhabdomyolysis and hospital stay in high dose doxylamine ingestion. Am J Emerg Med. 2017 Nov 27. pii: S0735-6757(17)30968-3. doi:10.1016/j.ajem.2017.11.058. [Epub ahead of print]