



Rede Farmacêuticos UMP

INFO FARMÁCIA

farmaceuticos@ump.pt | www.ump.pt

Uso dos anti-histamínicos H1 na patologia alérgica

Os anti-histamínicos H1 são os medicamentos mais utilizados para o tratamento de doenças alérgicas. São classificados em anti-histamínicos de primeira geração (clorfeniramina, difenidramina, hidroxizina) e de segunda geração (bilastina, cetirizina, desloratadina, ebastina, fexofenadina, levocetirizina, loratadina, rupatadina). Estão presentes no mercado farmacêutico sob a forma de várias apresentações como comprimido, solução oral, pomada, spray nasal ou colírio, ajustando a apresentação à necessidade e alergia apresentada. Atualmente, por via oral, recomenda-se sempre o uso de anti-histamínicos de segunda geração com ação mais seletiva nos receptores H1 e baixa lipossolubilidade, o que permite uma distribuição limitada no sistema nervoso central (SNC). No entanto, os anti-histamínicos de primeira geração continuam a ser bastante utilizados na automedicação de múltiplos sintomas alérgicos. A somar a isto, alguns destes deixaram de ser usados como antialérgicos, mas comumente utilizados para situações de insónia (doxilamina) ou para aumento do apetite (Di-hexazina).

Os anti-histamínicos H1 são eficazes no tratamento da rinoconjuntivite alérgica e urticária de qualquer etiologia. A alta prevalência de rinite na população geral (20%) faz com que a prescrição médica e aconselhamento farmacêutico de anti-histamínicos seja muito elevada. Na rinite eles são mais eficazes no tratamento da congestão nasal, da mucosidade, do prurido e de espirros resultantes da congestão nasal. Os anti-histamínicos H1 também podem ser usados como tratamento para urticária crónica espontânea. Em contrapartida, esta classe de medicamentos não controla o prurido da dermatite atópica nem é tratamento de primeira linha na anafilaxia, por não demonstrarem qualquer melhoria de sintomas destas condições.

Os anti-histamínicos H1 são fármacos geralmente bem tolerados. A primeira geração atravessa a barreira hematoencefálica e pode produzir efeitos sedativos e anticolinérgicos centrais (confusão, agitação) e periféricos (retenção urinária, xerostomia). No caso em que um paciente requer tratamento anti-histamínico, é importante levar em conta a carga anticolinérgica dos medicamentos que ele toma. Isso é especialmente relevante em pacientes idosos. Outro efeito adverso potencialmente grave de alguns anti-histamínicos é o prolongamento do intervalo QT, que levou à suspensão de medicamentos como astemizol e terfenadina. Deve-se ter em mente que existem certos grupos populacionais (grávidas, lactentes, idosos, insuficientes renais e/ou hepáticos e crianças) nos quais os anti-histamínicos devem ser prescritos e utilizados com cautela, levando em conta as recomendações do resumo de características do medicamento (RCM).



Tabela comparativa de anti-histamínicos H1

| Princípio ativo | Apresentação | Dose >12 anos e adultos | Dose <12 anos | Início de ação (horas) | Duração de ação (horas) | Ajuste de dose |
|--------------------|--|------------------------------|--|------------------------|-------------------------|--------------------------------|
| 1.ª geração | | | | | | |
| Hidroxizina* | Suspensão oral 10 mg / 5 ml Comprimidos 25mg | Via oral: 25 mg / 6-8 h | Via oral: 1-2 mg / Kg / dia (a cada 6-8 h) | 2 | 24 | Insuficiência renal e hepática |
| Cetotifeno* | Suspensão oral: 1 mg / 5 ml Cápsulas: 1 mg Colírio: 0,25 mg/ml | Via oral: 2 mg / 24 h | Via oral: 6 meses-3 anos: 0,05mg/kg >3 anos: 2mg / 24 h | 0,15 - 0,30 | 12 | Insuficiência renal e hepática |
| Dimetindeno* | Gel tópico 1 mg/g Gotas orais, solução 1 mg/ml | Via oral 9 a 18 mg / 24 h | Via oral 1 mês-1 ano: 0,1mg/kg 3x/dia 1-3 anos: 1,5 a 2,25 mg / 24 h 3-12 anos: 2,25 a 3 mg/24 h | 0,5 | 24 | Insuficiência renal e hepática |
| Di-hexazina* | Comprimidos 6 mg | Via oral 18 mg / 24 h | Via oral 2-4 anos 9 mg / 24 h 4-8 anos 12 mg / 24 h 8-12 anos 18 mg / 24 h | Sem dados | Sem dados | Insuficiência renal e hepática |
| 2.ª geração | | | | | | |
| Cetirizina* | Gotas 10 g = 5 mg Solução oral 1 mg/ml Comprimidos 10 mg | Via oral: 10 mg / 24 h | Via oral: 2-5 anos 2,5 mg / 12 h 6-11 anos 5 mg / 12 h | 0,7 | >24 | Insuficiência renal |
| Loratadina* | Solução oral: 1 mg/ml Comprimidos 10 mg | Via oral: 10 mg / 24 h | Via oral: 2-11 anos < 30 kg: 5 mg / 24 h >30 kg: 10 mg / 24 h | 2 | 24 | Insuficiência hepática |
| Bilastina* | Solução oral 2,5 mg / ml Comprimidos 20 mg Comprimidos orodispersíveis 10 mg | Via oral: 20 mg / 24 h | Via oral: 6-11 anos, Se peso > 20 kg 10 mg / 24 h | 0,7 | >24 | Não é necessário ajuste |

* Princípios ativos que fazem parte do formulário da UMP



| | | | | | | |
|-------------|---|---|--|-----|----|-------------------------|
| Azelastina* | Solução por pulverização nasal: 1 mg / ml Colírio 1mg / ml | Via intranasal: 1 aplicação de 12/12 h em cada narina Via oftálmica: 1 gota em cada olho a cada 12 h Máximo 1 gota a cada 6 h | Via intranasal: ≥ 6 anos 1 aplicação de 12/12 h em cada narina Via oftálmica: ≥ 4 anos 1 gota em cada olho a cada 12h Máximo 1 gota a cada 6 h | 0,5 | 20 | Não é necessário ajuste |
|-------------|---|---|--|-----|----|-------------------------|

* Princípios ativos que fazem parte do formulário da UMP

Interações entre os anti-histamínicos H1 utilizados na patologia alérgica e outros medicamentos e/ou produtos

| Princípio ativo | Metabolismo hepático | Interações farmacológicas | Medicamentos e/ou produtos com os quais podem interagir | Efeito da interação |
|--------------------|----------------------|---------------------------|--|--|
| 1.ª geração | | | | |
| Hidroxizina* | Sim | Possíveis | Inibidores da MAO; Álcool, antidepressivos tricíclicos, barbitúricos e outros depressores do SNC; Anticoagulantes orais (antagonistas vit. K) | Diminuição grave TA; Potenciam os efeitos sedativos; Diminuem efeito dos anticoagulantes |
| Cetotifeno* | Sim | Possíveis | Álcool, antidepressivos tricíclicos, barbitúricos e outros depressores do SNC; Anticoagulantes orais (antagonistas vit. K); Antidiabéticos orais; Broncodilatadores | Potenciam os efeitos sedativos; Diminuem efeito dos anticoagulantes; Trombocitopenia reversível; Aumenta o efeito broncodilatador |
| Dimetindeno* | Sim | Possíveis | Álcool, antidepressivos tricíclicos, barbitúricos e outros depressores do SNC | Potenciam os efeitos sedativos |
| Di-hexazina* | Sim | Possíveis | Álcool, antidepressivos tricíclicos, barbitúricos e outros depressores do SNC | Potenciam os efeitos sedativos |

* Princípios ativos que fazem parte do formulário da UMP



| Princípio ativo | Metabolismo hepático | Interações farmacológicas | Medicamentos e/ou produtos com os quais podem interagir | Efeito da interação |
|-----------------|----------------------|---------------------------|---|---------------------|
|-----------------|----------------------|---------------------------|---|---------------------|

2.^a geração

| | | | | |
|-------------|-------|-----------------|---|--|
| Cetirizina* | <40 % | Pouco prováveis | Álcool, antidepressivos tricíclicos, barbitúricos e outros depressores do SNC | Potenciam os efeitos sedativos |
| Loratadina* | Sim | Possíveis | Inibidores do CYP3A4 ou CYP2D6 | Aumentam os níveis de Loratadina |
| Bilastina* | Não | Pouco prováveis | Alimentos; Sumo de toranja; Cetoconazol e eritromicina; Diltiazem | Reduzem a biodisponibilidade em 30%; Reduz a biodisponibilidade em 30%; Aumentam a disponibilidade sistémica de bilastina; Aumenta a concentração máxima de bilastina em 50% |

* Princípios ativos que fazem parte do formulário da UMP