

**Ministère de l'enseignement supérieur et de la recherche
scientifique
Université Oran1
Faculté de médecine d'Oran
Département de Pharmacie**

ANTI-HISTAMINIQUE H1

2019-2020

Introduction

- Réactions allergiques: fréquentes.
- Manifestations cliniques:

Systémiques

Œdème de quik, choc
anaphylactique.

Localisées

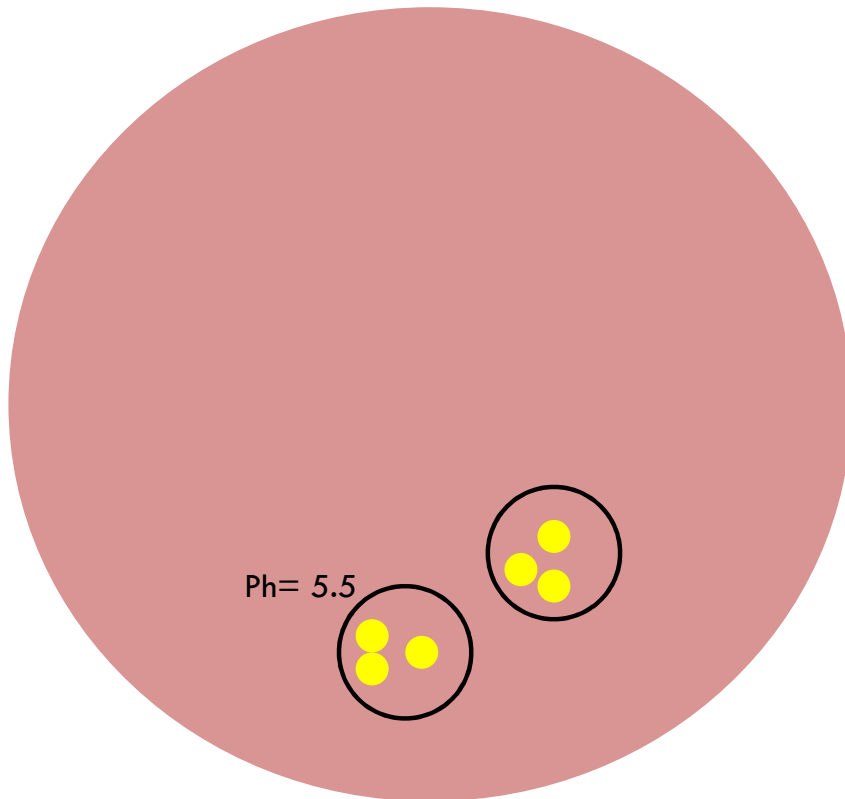
Œil (conjonctivite allergique),
peau (eczema, urticaire...), tube
digestif(urticaire colique...), nez(
sinusite, rhinite).



ANTIHISTAMINIQUES H1

Rappel sur l'histamine

SYNTHESE / STOCKAGE



Mastocytes / basophiles

- Poumon
- Foie
- Peau
- Cerveau

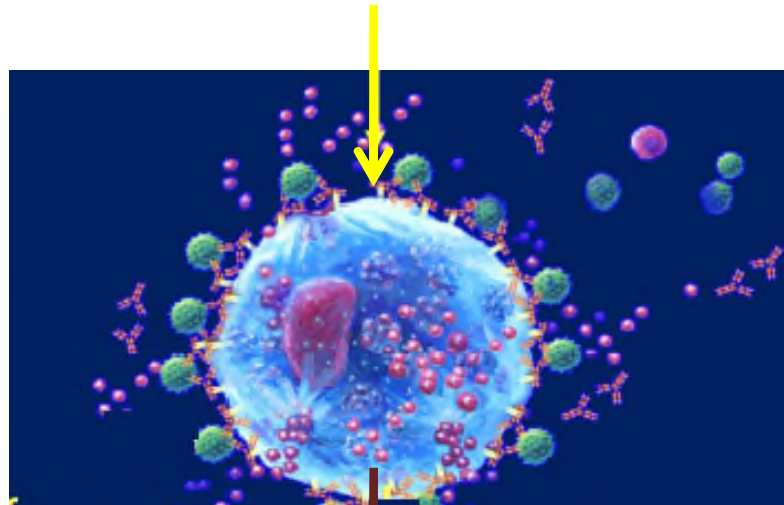
Autres sites:

- Cellules de l'épiderme
- Cellules de la muqueuse gastrique
- Neurones du SNC
- Tissus en phase de régénération ou à croissance rapide

Rappel sur l'histamine

LIBERATION DE L'HISTAMINE

- Activation: immunologique (IgE: R° d'hypersensibilité de type 1), certain réactifs ou médicaments, venins.



Histamine

EFFETS PHYSIOLOGIQUES DE L'HISTAMINE

Tissus	Récepteurs	Effets biologiques
Poumon	H ₁	Broncho constriction Œdème et sécrétion du mucus
Estomac	H ₂	Hyperacidité, ulcère
Intestin	H ₁	contraction
SNC	H ₁	stimulation de l'éveil diminution de l'appétit
	H ₂	Inhibition de la sécrétion de prolactine
	H ₁ et H ₂	Vomissement hypothermie sécrétion de la vasopressine
Muqueuse nasale	H ₁	Vasodilatation, sécrétion
Peau	H ₁ + H ₂	Vasodilatation (érythème), œdème, douleur

Antihistaminiques

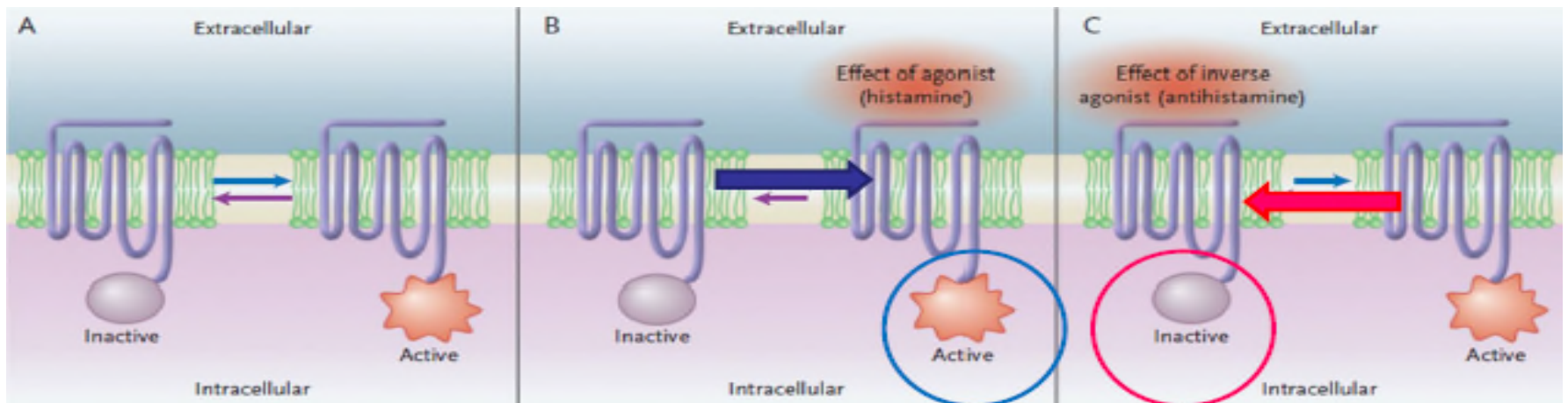
Antihistaminique H1

Antihistaminique H2
Antiulcéreux

Antihistaminique H1 (anti H1)

Mécanisme d'action

Récepteurs H1 à l'histamine



Récepteur H1 équilibre: **état activé/état inactivé**

- Les Anti H1 sont des **agonistes inverses** (et pas des antagonistes des récepteurs H1) généralement compétitifs \longrightarrow **état inactif**

Classification des anti-H1

1. Antihistaminiques de 1ere génération

- Diphenhydramine
- Hydroxyzine
- Prométhazine
- Alimémazine...

- Passage barrière hémato-encéphalique : **sédatifs (somnolence)**
- Faible spécificité pour les récepteurs H1 (**action anticholinergique, adrénolytique α**)
- Durée d'action courte
- ↗ des effets secondaires

Classification des anti-H1

Antihistaminiques de 1ere génération



Récepteur H₁ du SNC:
↘ neurotransmiss^o:
Hypersomnie,
↘ vigilance,
↘ F^o cognitives et
psychomotrices

Récepteurs
muscariniques:
Sécheresse
buccale, rétent^o
urinaire,
Tachycardie sin
Diskynésies

Récepteurs α
adrénergiques:
hypotens^o,
vertiges,
Tachycardie
réflexe

Récepteurs
sérotonine:
↗ de l'appétit

Canaux
calciques:
↗ espace QT, pfs
arythmies

Classification des anti-H1

2. Antihistaminiques de 2ere génération

- Loratadine et son métabolite la desloratadine
- Mizolastine
- Cétirizine et son énantiomère lévocétirizine

- Ne traverse pas la BHE
- **Moindre sédation**
- **Pas d'effets anti cholinergiques**

Antihistaminiques H1

- Pharmacocinétique

- ✓ Bonne absorption digestive
- ✓ Largement distribué dans tous l'organisme
- ✓ La plupart sont éliminés sous forme de métabolites dans les urines

- ✓ **Les antiH1 de 2^{ème} génération :**
 - * Ont une demi-vie plus longue
 - * Très faible diffusion dans le SNC
 - * Métabolites actifs

Antihistaminiques H1

- Indications

- ❑ Les affections allergiques
- ❑ Mal de transport
- ❑ Les troubles de l'équilibre vestibulaire et les vertiges
- ❑ antitussif (toux non productive)
- ❑ Traitement des insomnies occasionnelles ou transitoires
- ❑ Antiémétique
- ❑ Asthme allergique
- ❑ Prémédication, anxiolytique (hydroxyzine)

Antihistaminiques H1

- Effets secondaires

- Effets indésirables liés aux éventuels effets centraux :
 - Sédation, sensation fatigue, une incoordination, une vision trouble, un état de nervosité.
- Effets indésirables liés à une action anti cholinergique :
 - Incidents digestifs, broncho pulmonaire, urogénital, oculaire, cardiovasculaire
- Effets cardiaques:
 - torsade de point
- Autres effets:
 - une allergie souvent lors d'une application topique

Antihistaminiques H1

- Contre-indications

- Alcoolisme
- Troubles de la miction (hypertrophie de la prostate)
- Glaucome à angle fermé