抗組織胺(antihistamine)

組織胺是組胺酸(L-Histidine)去羰基化而來，廣泛分布於組織中。儲存組織胺的主要部份為肺、皮膚、胃中的黏膜層；主要儲存細胞為肥大細胞，次者為嗜鹼性球。組織胺和肝素、軟骨素(Chondroitin sulfate E)形成複合體成為肥大細胞內顆粒主要成分。當組織胺被釋放時，藉由和組織胺受體結合，幾分鐘內便可見到其生物效應。目前已知的組織胺受體可分 4 型，而大部分跟過敏反應有相關的是第 1 型受體；另外第 4 型受體亦可能和過敏相關，其為新進研究的受體機制，目前已知可調控肥大細胞的趨化性(Chemotaxis)，在組織發炎、水腫的初期可能扮演一定的角色，其拮抗劑也已經正在發展當作和肥大細胞、嗜酸性球(eosinophiles)相關的消炎藥。

在過敏反應中當組織胺和 H1 受體結合後:

在腸道和支氣管引起平滑肌收縮。([Ca2+]i 濃度上升和 protein kinase C 的活化)小動脈、靜脈平滑肌舒張→毛細血管通透性上升及搔癢感。刺激杯細胞(Goblet cell)分泌黏液。

臨床上使用的抗組織胺藥物包括 H1 和 H2-抗組織胺兩大類，在過敏疾病中主要使用的是 H1-抗組織胺藥物。

H1-抗組織胺

過去認為此類藥物是組織胺受體的競爭性拮抗劑，但最近研究傾向大部分的 H1-抗組織胺作用是藉由至少兩種途徑產生。一為受體拮抗劑，作用包括向下調節細胞核轉譯因子、Cytokine 與附著蛋白質的合成等。；另一種為反向致效劑，

會抑制肥胖細胞與嗜鹼性細胞釋放出介質其可以鬆弛已收縮的腸道和支氣管、阻斷血管擴張/毛細血管通透性增加帶來的水腫、預防感覺神經的興奮，抑制癢的感覺等。其他藥理作用包括鎮靜和抗暈車船(止吐)等作用。所有此類藥物和血漿蛋白的結合率高(≥60%)、皆被 cytochrome 450 代謝。

依習慣抗組織胺可分為第一代和第二代的藥物：

第一代藥物：在生理 pH 值範圍內呈非離子態，易通過血腦障蔽，產生中樞神經的鎮靜副作用。常見的有乙醇胺類的 diphenhydramine(Vena®)、哌嗪類的Hydroxyzine(Atarax® 、Vistaril®)、Meclizine/Meclozine、烷基胺類的 Chlorphenamine 等。第二代藥物：此類藥物為胃酸分泌的抑制劑，對 H1 受體的作用很小。常經口投藥，處理胃及十二指腸潰瘍、藥物引起的潰瘍性胃炎、十二指腸-胃的逆流或食道逆流等。獸醫禪建的用藥有 cimetidine、ranitidine、nizatidine 和 famotidine