



Nombre de alumnos: Brenda Jaquelin Velázquez Salas

Nombre del profesor: LE Felipe Antonio Morales Hernández.

Nombre del trabajo: Ensayo de analgésicos opioides.

Materia: Farmacología.

Grado: 3er cuatrimestre

Grupo: B

Comitán de Domínguez Chiapas a 02 de Agosto de 2020.

ANALGESICOS OPIOIDES

Para iniciar comenzaré describiendo acerca de los analgésicos opioides que más que nada son medicamentos para aliviar dolor severo agudo, tiene una variedad de compuestos diferentes que sirven de uso clínico en todo el mundo, también se dice que puede causar diferentes reacciones si se consumen sin autorización médica y en un tiempo largo, es fundamental recalcar la importancia de los receptores opioides que más adelante abordaremos, así como también los eventos intracelulares que pueden ocurrir y los principales medicamentos que abarcan en esta familia. En este ensayo se pretende dar a conocer información relevante de los analgésicos opioides para poder comprender de mejor manera este tema.

Los analgésicos opioides son considerados prácticamente para aliviar el dolor agudo, para poder comprender mejor los opioides pueden ser naturales y sintéticos, se encuentra en el zumo de las semillas de la adormidera, el término opioide se utiliza para designar aquellas sustancias exógenas o endógenas que tienen un efecto análogo muy parecido al de la morfina en otras palabras son una clase de droga y se relacionan químicamente e interactúan con los receptores de opioides en las células nerviosas del cuerpo y del cerebro, existe una variabilidad intrapaciente y entre los pacientes en respuesta a los opioides, es considerable poder tener conocimientos de las diferencias farmacológicas entre los opioides esto más que nada para poder seleccionar el fármaco adecuado para el entorno clínico y así poder minimizar el impacto que puede causar los efectos secundarios, como bien ya mencionaba los opioides pueden tener muchos efectos secundarios en nuestro organismo de igual manera que existen variedad de medicamentos de la misma rama, estos analgésicos ejercen sus acciones farmacológicas mediante el receptor μ -opioide, MOP, pero también hay algunas que tienen actividad del κ -receptor. Continuamos con los receptores opioides que más que nada es una proteína G acoplada y cuenta con siete regiones transmembrana, se clasifica en: DOP o receptor delta s tiene un efecto de analgesia espinal y suprarrenal así como también la reducción de la mortalidad gástrica, KOP o receptor kappa κ tiene un efecto de analgesia espinal, diuresis y dosforia y MOP o receptor μ u tiene un efecto de analgesia, sedación, así como también efectos endocrinos que incluyen la regulación de prolactina y algunas hormonas del crecimiento, estos receptores se encuentran ubicados dentro del sistema nervioso central específicamente en las áreas del tronco cerebral, pero también en los sitios periféricos como

el tracto gastrointestinal, el corazón, en las articulaciones de las rodillas y en el sistema inmunológico. La activación de los opioides actúa desde el medio del cerebro estimulando las vías descendentes inhibitorias como consecuencias estas involucran a la transmisión de serotonérgica y noradrenérgica, algo importante es que los opioides también pueden actuar directamente sobre las neuronas nociceptivas. En los eventos intracelulares, aquí una vez que el ligando se ha unido al receptor opioide la proteína asociada en este caso la G es activada, debido a la unión se disminuye la producción de monofosfato de adenosina cíclico y todo esto va a producir hiperpolarización celular y poca excitabilidad neuronal provocando la liberación disminuida de neurotransmisores. También para la activación de los receptores puede ser participe la proteína quinasa que es activada por mitógenos y la fosfolipasa. Para continuar en la administración de los opioides si se consume por un largo periodo puede conducir a múltiples adaptaciones en los sistemas de señalización lo cual podría generar sensibilización y síntomas de abstinencia. A continuación mencionare algunos opioides más utilizados y describiré algunas de sus principales características como la morfina que es un derivado fenantrenico, tiene una biodisponibilidad del 15-50% esto es debido a su extenso metabolismo y ocurre en el hígado produciendo efectos analgésicos y efectos excitatorios, además la excreción mayormente ocurre por la orina como un conjugado glucuronido y muy pocas veces aparece en materia fetal. El efecto pico analgésico ocurre a los 30-60 minutos después de su administración parenteral y puede durar de 3-4 horas. La hidromorfona es otro analgésico opioide que tiene una farmacocinética y duración similar al de la morfina pero tiene una característica que lo hace diferente y es que es 5 veces más potente y empieza a actuar ligeramente más rápido, además es más apropiado para pacientes con fallas renales esto debido a la ausencia de un metabolito activo. Continuamos con el fentanilo, remifentanilo y alfentanilo son opioides agonistas MOP, tienen más eficacia y son más utilizados en periodo de perioperatorio, son medicamentos que tienen un rápido comienzo de acción pero también un efecto rápido. El siguiente es la buprenorfina es un derivado del alcaloide tebanía, tiene una alta afinidad pero muy baja actividad intrínseca a los receptores KOP, mayormente se prefiere la vía sublingual, además cuenta con una biodisponibilidad muy variable, su metabolismo ocurre en el hígado por dealquilación y es excretada por materia fecal. Para ya ir finalizando continuare con metadona que es un opioide sintético que fue desarrollado hace mucho tiempo se dice que en los años de 1942, además es tratada como una droga básica y lipofílica, tiene una biodisponibilidad alta por vía oral cerca del 85%, a diferencia de la mayoría de las ya mencionadas este analgésico es biotransformado en el hígado antes de ser conjugado con una dosis diaria menor a 55mg, la excreción renal es variable y pH dependiente,

la eliminación de la metadona es bifásica y su duración de analgesia es de 8-12 horas. Finalmente el tramadol y el tapentadol son antagonistas parcial MOP con una acción adicional, el tramadol inhibe la recaptación de serotonina y noradrenalina, además es metabolizado a un metabolito activo M1 y el tapentadol inhibe la recaptación de noradrenalina. Es importante conocer cada una de las características de los medicamentos opioides ya que cada una es diferente y por lo tanto puede provocar diferentes reacciones a nuestro organismo.

En conclusión los opioides son el componente clave del manejo del dolor agudo y el dolor oncológico, algo fundamental es que los opioides se unen a proteínas G acopladas a receptor, para producir analgesia se da por la inhibición directa de neuronas nociceptoras periféricas. Es importante contar con los conocimientos que caracterizan a los opioides ya que es información muy necesaria que nos servirá de mucho para poder desarrollar y mejorar en esta disciplina.

Bibliografía:

UDS. Universidad del sureste, (2020. Actualización en la Farmacología de los Opioides. Anaesthesia. PDF. Plataforma digital. Recuperado el 02 de Agosto de 2020.