



**Nombre de alumnos: Mayra Jeannette
Ramírez Santiago**

**Nombre del profesor: Felipe Antonio
Morales Hernández**

Nombre del trabajo: Ensayo

Materia: Farmacología

PASIÓN POR EDUCAR

Grado: 3er cuatrimestre

Grupo: "B"

OPIOIDES

El dolor es un componente de prácticamente todos los trastornos clínicos y el tratamiento del dolor es un imperativo clínico principal. Los opioides representan el componente fundamental del tratamiento del dolor, pero dependiendo del estado doloroso, el tratamiento puede comprender antiinflamatorios no esteroideos, anticonvulsivos o antidepresivos. Los analgésicos opioides son considerados patrón oro en analgesia sistemática por su acción para calmar el dolor severo.

Los opioides son considerados analgésicos ya que tienen la función principal de calmar el dolor severo gracias a su composición química, así mismo, por su acción en el organismo. Estos analgésicos realizan sus acciones farmacológicas en los receptores μ -opioides, MOP, y algunas en el κ -receptor opiáceo, KOP. El receptor principal de los opioides es principalmente la proteína G acoplada y está compuesta por siete regiones transmembrana las cuales están clasificadas de la siguiente manera: DOP o receptor delta δ , KOP o receptor kappa κ , MOP o receptor mu μ . Estos receptores se localizan en el SNC, cerebro medio, áreas del tronco cerebral relacionada con las vías moduladoras descendentes y en el cuerno dorsal de la médula espinal. Existen sitios periféricos como: los conductos deferentes, articulación de la rodilla, el tracto gastrointestinal, el corazón y el sistema inmunológico. Cuando se activan los receptores opioides del cerebro medio son capaces de estimular indirectamente las vías descendentes inhibitorias, las cuales involucran la transmisión serotoninérgica y noradrenérgica, como dato importante, los opioides son capaces de actuar directamente sobre las neuronas nociceptivas en la asta dorsal y la periferia. Los eventos intracelulares se dan una vez que el ligando se ha unido al receptor opioide, la proteína G asociada es activada, debido a esta unión, disminuye la producción de monofosfato de adenosina cíclico y reducción en la conductancia de calcio a través de la membrana celular. Todo esto trae como consecuencia hiperpolarización celular, y excitabilidad neuronal reducida con liberación disminuida de neurotransmisores. Existe la proteína quinasa la cual es considerada un segundo sistema mensajero para la activación de los receptores opioides, esta proteína es activada por mitógenos y la fosfolipasa C, las cuales dirigen la formación de inositol trifosfato y diacil glicerol. La administración de opioides a largo plazo trae como consecuencia múltiples adaptaciones en los sistemas de señalización de los segundos mensajeros, lo cual podría ser responsable de la tolerancia, sensibilización, y síntomas de abstinencia, existen segundos mensajeros como la proteína quinasa intracelulares las cuales son responsables de la fosforilación aguda de los receptores opioides MOP y los DOP, provoca tolerancia a los efectos de los agonistas.

Existe la hiperalgesia inducida por opioides la cual es una respuesta paradójica a los agonistas opioides por lo cual en lugar de que ocurra un efecto analgésico, o antinociceptivo, hay un aumento en la percepción del dolor. Para dar continuación con el tema es importante mencionar las características de algunos opioides específicos, principalmente encontramos la morfina la cual se deriva del fenantrenico, es agonista de los receptores MOP y KOP. Cuenta con una biodisponibilidad del 15-50%, esto debido a un extenso metabolismo en el primer pasaje dado en el hígado como la morfina-3- glucuronido, morfina-6-glucuronido, y normorfina. M-6-G los cuales produce efectos analgésicos, y M-3-G efectos excitatorios. La hidromorfina es otro opioide parecida a la morfina ya que su farmacocinética y duración de acción es similar, aunque es considerada 5 veces más potente y tiene un comienzo de acción mínimamente más potente, encontramos la glucuronización la cual ocurre únicamente en la posición 3, tolerado en pacientes con fallo renal debido a la ausencia de un metabolito activo. Así mismo, encontramos el fentanilo, remifentanilo y alfentanilo estos son opioides agonistas MOP, son usados especialmente en el periodo perioperatorio. Tienen un rápido comienzo de acción y rápida finalización del efecto. Remifentanilo tiene una corta vida media sensible al contexto, debido a su metabolismo por esterasas tisulares y plasmáticas no específicas. Remifentanilo ha sido usado para generar un modelo experimental de hiperalgesia. Encontramos la buprenorfina es un derivado sintético del alcaloide tebaína esta tiene alta afinidad, pero baja actividad intrínseca a los receptores KOP y su administración se prefiere por vía sublingual. Se metaboliza en el hígado por dealquilación con subsecuente conjugación o glucuronidos; los conjugados polares parecen ser excretados en la bilis e hidrolizados por bacterias en el tracto gastrointestinal. Penúltimamente encontramos la metadona es un opioide sintético creada en los años 1942 es considerada una droga básica y lipofílica, existe una mezcla racémica de dos enantiómeros, R-metadona y S-metadona. La R-metadona agonista potente de los receptores MOP y DOP. El enantiómero de la S-metadona es inactivo como agonista para el receptor MOP, pero actúa como antagonista de los receptores NMDA, 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 conjugada 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 y para el manejo del dolor la dosis diaria es dividida en 2 o 3 administraciones. Por último, está el tramadol y tapentadol, el tramadol es un antagonista parcial MOP con una acción adicional, inhibe la recaptación de serotonina y noradrenalina, el tapentadol es un agonista MOP con inhibición de la recaptación de noradrenalina. Considero que las siguientes características de estos

principales analgésicos opioides son de suma importancia para ser conocedores de su farmacocinética, mecanismo de acción, su disponibilidad, su eficacia y efectos secundarios, entre otros aspectos farmacológicos, los cuales dan lugar en nuestro organismo.

En conclusión, los opioides son fármacos de gran importancia en el manejo del dolor agudo y oncológico gracias a sus componentes son capaces de lograrlo, personalmente, es de suma importancia conocer a profundidad las características de estos analgésicos ya que conoceremos los beneficios y efectos adversos/secundarios que nos ocasione en nuestro organismo, así mismo, como estudiantes de enfermería nos ayudara para identificar las diferencias farmacológicas entre los opioides para una analgesia efectiva, y para la seguridad del paciente.

Bibliografía:

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