



**Nombre de alumnos: Jesús Imanol Vera Pérez**

**Nombre del profesor: Felipe Antonio Morales**

**Nombre del trabajo : Actualización de los fármacos**

**Materia: Farmacología 1**

**Grado: 3 ero**

**Grupo: B**

Comitán de Domínguez Chiapas 1 de agosto del 2020 .

## Actualización en la Farmacología de los Opioides

Son un tipo de analgésicos y denominados como el patrón dorado y su aplicación se da en el tratamiento de dolores severos o agudos , aunque todo esto no suele ser aplicado por completo en la labor clínica , son los factores del costo de producción las normas de regulaciones y la respuesta que puedan tener con los pacientes que hacen incluir las variantes que intervienen en su uso clínico directo .

Con las nuevas actualizaciones y el incremento de nuevas investigaciones el conocimiento se vuelve aún más amplio , llegando a logros estratégicos como lo son la actuación de su farmacodinamia y farmacocinética , al igual la manera de actuación de estos , encargado de causar efectos en los segundos mensajeros.

En nuestro organismo producimos lo suficiente para poder aliviar dolores leves , como por ejemplo el golpear nos el dedo, o un pequeño choque con algún objeto , es así como los receptores de las neuronas aferentes y sensitivas recogen la información y la mandan hacia el sistema nervioso central a nivel del tálamo , se podría decir que el alivio se da gracias a nuestra endorfina endógena ya que nos sirven para inducir analgesia , nosotros producimos cadenas cortas de péptidos de aminoácidos , los cuales liberan los receptores o activan a los receptores opioides.

Estos actúan a nivel de las sinapsis y cada opioide va a actuar con un receptor en específico , los mas conocidos y los mas estudiados son : endorfinas , encefalinas y las dinorfinas . Esos receptores están ubicados dentro del sistema nervioso central, en el cerebro medio, áreas del tronco cerebral asociadas con las vías moduladoras descendentes y en el cuerno dorsal de la médula espinal. También hay sitios periféricos, incluyendo los conductos deferentes, articulación de la rodilla, el tracto gastrointestinal, el corazón y el sistema inmunológico.

Cuando estos se concentran a nivel de la sinapsis , las endorfinas activan al receptor  $\mu$  , las cefalinas van a activar al receptor delta y las dinorfinas al receptor  $\kappa$ , estos receptores opioides son en estructura química, proteínas de siete segmento transmembranales acopladas a una proteína  $G_i$  , cuya función es que cuando un péptido opioide se activa; la proteína  $G_i$  se divide ( proceso de disociación ) y es así como los niveles de AMP cíclico disminuyen y le dejan el canal libre de segundos transmisores al incrementar el GMP cíclico ,este induce a la salida de potasio por medio de los canales de potasio . En general como estos son procesos intra celulares con la salida de cargas positivas dejand dentro de ellas cargas negativas , es aquí en donde me surge la pregunta ¿ como es que los opioides generan analgesia ? , como

bien se mencionaba a al inicio las neuronas nociceptivas recepta el estímulo de dolor y viaja desde de la periferia hacia la médula espinal , allí otra neurona nociceptiva dirige el impulso nervioso al tálamo , de nuevo en el tálamo otra neurona del mismo tipo se encarga de llevar el impulso al cerebro y estás consiente de que tienes dolor , al mismo tiempo las neuronas de rafé hacen sinapsis con la primera neurona y liberan serotonina al igual que péptidos opioides , y son estos péptidos opioides los que y controlan de forma negativa la transmisión de impulso nervioso disminuyendo las transmisiones hasta el tálamo , y lógico si no todos los impulsos llegan y son muy pocos los que alcanzan llegar no se produce dolor y crea una analgesia .

Como bien se sabe los fármacos opioides son inhibidores e interruptores de impulsos nerviosos , formando analgesia , pero se ha demostrado que el consumo de ellos es dañinos y complica la vida del paciente , puesto que se quería descubrir el mecanismo de la analgesia , los investigadores realizaron pruebas con ratones , las cuales consistían en colocar un botón con comida y la otra les administraba un analgésico , al inicio estos ratones accedían a la comida e ignoraban al analgésico , pero cuando colocaron una plataforma por debajo de sus patas a 45 grados inmediatamente buscaban salir de ese lugar ,es así como buscaron la inyección de opioides y se estimuló la analgesia ; con el tiempo los ratones presentaron un pérdida de peso considerable , a tal punto que ya solo buscaban las inyecciones he ignoraban a la comida , a esto se le conoce como farmacodependencia a sustancias opiáceas , estos estudios sirvieron para comprobar que al igual en humanos esta dependencia ocurría y lejos de beneficiar se convertía en un verdadero problema.

Algunos de los opioides específicos son , la morfina es un derivado fenantrenico, por lo que es agonista de los receptores MOP y KOP y 1 es una de las mas utilizadas por su eficacia casi inmediata y su excreción se da por medio de la orina . Se encuentra unido a proteínas en un 20-40%, predominantemente albumina, y su volumen de distribución es de 3.4 a 4.7 l/kg y el grado de analgesia y la concentración plasmática no está claramente relacionada.

La siguiente es la hidromorfina y esta tiene farmacocinética y duración de acción casi igual a a la morfina, pero es 5 veces más potente, con un comienzo de acción ligeramente más rápido.

Se suman a esta lista , Fentanilo, remifentanilo y alfentanilo , Buprenorfina, Metadona y Tramadol y Tapentadol ; siendo este ultimo un agonista parcial MOP con una acción adicional, inhibe la recaptación de serotonina y noradrenalina, y Tapentadol es un agonista MOP con inhibición de la recaptación de noradrenalina.

En conclusión no solamente existe un solo tipo de mecanismo de inhibición de receptores de impulsos nerviosos , pero los opioides analgésicos son los que con mas frecuencia se ocupan comúnmente , pero que en realidad generan una farmacodependencia , además de generar daños hepáticos ya que se localizan en su mayoría el proceso metabolismo en ese lugar , pero que en general no dejan de ser una de las opciones mas viables de controlar los dolores .

Bibliografía : Universidad Del Sureste. (UDS). (2020). Actualización en la Farmacología de los Opioides.

PDF recuperado de plataforma educativa UDS, el 31 de julio del 2020.