

TERAPEUTICA FARMACOLOGICA

ANALGESICOS OPIOIDES

**ROLANDO DE JESUS PEREZ
MENDOZA**

**DR LUSVIN IRVIN JUAREZ
GUTIERREZ**

**UDS UNIVERSIDAD DEL
SURESTE**

**SAN CRISTOBAL DE LAS
CASAS**

17 DE ABRIL DEL 2021



LA FARMACOLOGÍA DE LOS ANALGÉSICOS OPIÁCEOS

Los opiáceos son medicamentos que imitan la actividad de las endorfinas, que son unas sustancias que produce el cuerpo para controlar el dolor.

Los opiáceos se usan para aliviar el dolor agudo relacionado con la cirugía y otras intervenciones médicas, así como para aliviar el dolor persistente (crónico) y el dolor súbito de moderado a intenso.

Se administran de modo permanente siguiendo un cronograma establecido, ya sea que sientas o no dolor en ese momento. Si se presentan eventos de dolor súbito, también puede indicarse un segundo opiáceo de acción inmediata

El dolor persistente se trata habitualmente con opiáceos de acción prolongada que se liberan en el organismo lentamente y controlan el dolor durante largos períodos.

El opio es una droga analgésica y narcótica que se extrae de la adormidera, *Papaver somniferum*. La adormidera o planta del opio es una planta herbácea anual que puede crecer hasta el metro y medio, y sus flores son blancas, rosas o violetas. La cápsula, redonda y gruesa, contiene numerosas semillas pequeñas y negras.



MECANISMO DE ACCION

Los receptores opioides están localizados en los terminales presinápticos en el sistema nervioso central (cerebro, tronco cerebral y áreas medulares), vías sensitivas periféricas, y otros territorios (plexo mientérico y médula adrenal).

Se han identificado cinco clases, denominados μ (μ_1 y μ_2), κ , δ , σ , y ϵ , aunque sólo se aceptan como auténticos receptores opioides los tres primeros.

.Los receptores μ , κ y σ , son activados por los opioides exógenos y los δ por las endorfinas

Según su actividad intrínseca (eficacia), los opioides se clasifican en

Agonistas: reconocen un determinado receptor y producen una respuesta celular que se traduce en un efecto farmacológico

Agonistas parciales: reconocen el receptor, pero la respuesta biológica es inferior al efecto máximo. Son esencialmente agonistas parciales para los receptores μ y agonistas para el resto.

Agonistas-antagonistas: activan parcial o totalmente unos receptores y bloquean otros. La acción agonista es, en general, sobre los receptores κ , comportándose sobre los μ como antagonistas o agonistas parciales.

Antagonistas: reconocen un determinado receptor y lo ocupan sin inducir los cambios celulares que traducen el efecto farmacológico

FARMACOCINETICA

Administración sistémica
Absorción y transporte: En general se absorben bien por vía oral (p.a.), aunque algunos presentan un primer paso hepático que sustrae de la circulación sistémica una porción variable, influyendo en su ulterior biodisponibilidad

Para las vías subcutáneas (s.c.) e intramuscular (i.m.) el grado de absorción depende de la circulación local. Si la circulación local está alterada por vasoconstricción periférica, hipovolemia o hipotensión, la absorción es pobre necesitándose más droga para obtener un efecto dado

Vías transmucosa y transdérmica: sólo son posibles en los opiodes con elevada liposolubilidad, elevada potencia y bajo peso molecular como el fentanilo.

Vía intravenosa (i.v.): Es la que ofrece una mayor disponibilidad y es la más adecuada para el tratamiento con opiodes del dolor agudo.

Distribución, acceso a los receptores y redistribución: desde el plasma los opiodes se distribuyen inicialmente por los tejidos altamente perfundidos (pulmón, corazón, cerebro, hígado y riñón)

El acceso a los receptores opiodes tiene lugar durante la distribución inicial y depende de la cantidad de fármaco disponible para atravesar la barrera hematoencefálica (BHE) y de su capacidad para atravesarla, lo que depende, en gran parte, de sus propiedades fisicoquímicas

Biotransformación y eliminación: a partir del estado de equilibrio las concentraciones séricas y tisulares disminuyen en paralelo debido a los procesos de biotransformación y eliminación

Definiéndose esta segunda etapa por la llamada vida media de eliminación o $T_{1/2 \beta}$. Esta variable depende del volumen de distribución (V_d) y del aclaramiento (Cl) según la fórmula $T_{1/2 \beta} = 0,693 \times V_d / Cl$,

FARMACODINAMIA

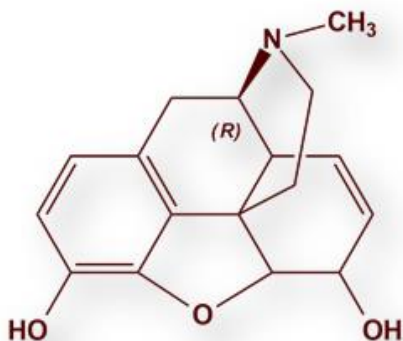
Los opioides disminuyen la percepción del estímulo doloroso determinando un estado con ausencia de dolor o un dolor muy leve

Además, modulan la sensación emocional subjetiva al dolor, y disminuyen su impacto en el individuo, creando una especie de indiferencia

A dosis analgésica los opiáceos producen también miosis, sedación consciente y a menudo náuseas y vómitos, disminuyendo la respuesta autonómica (sudoración, taquicardia e hipertensión arterial) al dolor

Concentración analgésica mínima efectiva (MEAC): es el mínimo nivel plasmático de opioide necesario a partir del cual se puede atenuar el dolor en un paciente dad

DOSIS



Opioide	Dosis equivalente (mg)	Factor de conversión
Morfina	30	1
Codeína	200	0.15
Oxicodona	20	1.5
Hidromorfona	6	5
Meperidina	300	0.1
Metadona y Tramadol	Dosis equivalentes no claras	
Fentanilo transdérmico	60-134 mg morfina = 25 mcg/h 135-179 mg morfina = 37mcg/h 180-224 mg morfina = 50 mcg/h 225-269 mg morfina = 62 mcg/h 270-314 mg morfina = 75 mcg/h 315-259 mg morfina = 87 mcg/h 360-404 mg morfina = 100 mcg/h	

EFECTOS SECUNDARIOS

El más temido e importante es la depresión respiratoria (DR), siendo el resto más leves y de menor repercusión clínica.

La cara de la persona está muy pálida y/o se siente fría y húmeda al tacto

Empieza a vomitar o hace ruidos de gorgoteo

No puede despertar o es incapaz de hablar

Debilidad, fatiga

Su respiración o latidos cardíacos se hacen más lentos o se detienen

EJEMPLOS

Entre los ejemplos, se incluyen:

Contin, Oramorph, Avinza, Kadian, Roxanol (nombre genérico: morfina); codeína; Dolophine (nombre genérico: metadona); Opana, Opana ER, Numorpahn HCl (nombre genérico: oximorfona); Dilaudid (nombre genérico: hidromorfona); Levo-Dromoran (nombre genérico: levorfanol); OxyContin, OxyIR o Roxicodone (nombre genérico: oxycodona); Demerol (nombre genérico: meperidina); Duragesic, Actiq o Fentora (nombre genérico: fentanilo)

Algunos analgésicos narcóticos combinan un opiáceo con aspirina, paracetamol o ibuprofeno.

Entre los ejemplos, se incluyen: Percodan (nombre genérico: oxycodona y aspirina), Percocet y Roxicet (nombre genérico: oxycodona y acetaminofeno), Vicodin, Lorcet y Lortab (nombre genérico: hidrocodona y paracetamol)

BIBLIOGRAFIA:

A. Valdivielso Serna . (1998). Farmacocinética y farmacodinamia de los analgésicos opioides. 2021, de EDUCACIÓN CONTINUADA Sitio web: <https://www.aeped.es/sites/default/files/anales/48-4-22.pdf>