

# FARMACOLOGIA DE LOS OPIOIDES

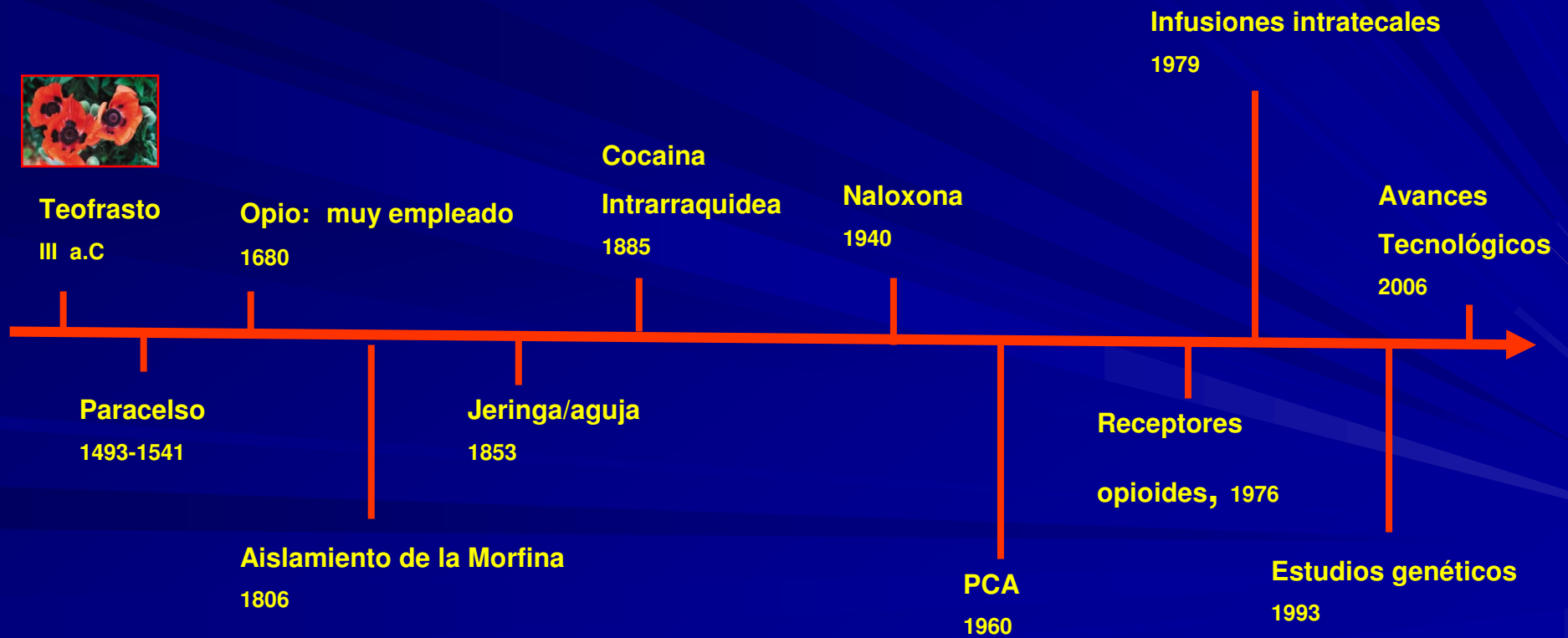
Tutor: Dr. Sergio Telles Ribeiro

## GRUPO 1

Gloria Garcia de Estevez  
Giner Vanessa González  
José Ernesto Picado Ovares  
Marta Castro Rodríguez  
Marcos Cabrera  
Vitor Jorge Woytuski



# HISTORIA



## TERMINOLOGIA

---

**OPIOIDE:** El término genérico es preferido al referirse sustancias exógenas naturales ó sintéticas cuyos efectos son mediatizados por receptores específicos (OP) en los Sistemas Nervioso Central y Periférico.

**OPIACEO:** Es un término más restringido que designa a los alcaloides del fenantreno del opio y sus derivados. Algunos incluyen a las sustancias endógenas (morfinosímiles) tales como encefalinas, endorfinas, dinorfinas y otros pentapéptidos similares con acción biológica.

# CLASIFICACION

## I- DERIVACION DE LA DROGA.

### NATURALES

DERIVADOS del FENANTRENO

MORFINA, CODEINA

DERIVADOS BENZILISOQUINOLINICOS

PAPAVERINA

TEBAINA ?

### SEMISINTETICOS

DERIVADOS de MORFINA

OXYMORFONA (dihidrohoxymorfinona)

HIDROMORFONA (dihidromorfinona)

HEROÍNA (diacetilmorfina)

### SINTETICOS

MORFINAN

LEVORFANOL, NALBULFINA, NALOXONA, NATRELXONA

BENZOMORFAN

PENTAZOCINA

FENILHEPTYLAMINA

METADONA, PROPOXIFENO

FENILPIPERIDINA

MEPERIDINA, FENTANIL, ALFENTANIL, REMIFENTANIL

# OPIOIDES

Analgésicos opioides	$\mu$	$\delta$	$\kappa$
<b>Agonistas</b>			
• <b>Potentes</b>	Morfina Sufentanilo	Morfina -	Morfina -
• <b>Débiles</b>	Codeína Tramadol	Codeína -	Codeína -
<b>Antagonistas</b>	Naloxona Naltrexona	Naloxona Naltrexona	Naloxona Naltrexona
<b>Agonistas parciales</b>	Buprenorfina	-	-
<b>Agonistas/antagonistas</b>	Pentazocina	-	Pentazocina

OPIOIDE

ESP NA

- AGONISTAS PUROS
- AGONISTA PARCIAL
- AGONISTA-ANTAGONISTA
- ANTAGONISTA PURO

## FARMACOCINÉTICA

### ■ Absorción:

- i.v. e i.m. 100% biodisponibilidad
- v.o. paso hepático
- s.a. y epidural
- Nasal??
- Transdérmica
- Lipofílicos
- Unión a proteínas

### ■ Distribución:

- BHE: liposolubilidad y tpte pasivo
- Volumen del espacio central
- Placenta
- Vm de eliminación corta

### ■ Biotransformación:

- Metabolización hepática
- Remifentanilo: esterasas
- ↓ con la edad
- OH dosis mayores

### ■ Excreción:

- Filtración glomerular
- Secrección tubular activa
- Morfina: 7-10% heces
- Leche materna

# Farmacocinética comparativa

	Morfina	Fentanil	Sufentanil	Alfentanil	Meperidina	naloxone
Meia-vida	10-20	5-10	5-15	5-10	10-20	
Volume de distribuição de distribuição	3,4	4,0	1,7	0,7	4,4	1,8
Depuração	10-20	10-20	10-12	3-8		30,1
Meia vida de eliminação	1,7	3,5	2,7	1,6	6,7	1,1

# FARMACODINÁMICA

## ■ SNC:

- Analgesia
- Alt. del humor
- Náuseas/Vómitos
- Distermia/Diaforesis
- Antitusígeno
- Miosis

## ■ Sist. Respiratorio:

- Depresión
  - ↓ Freq
  - = Fuerza
- Rigidez torácica
- ↓ Aclaramiento mucociliar

## ■ Sist. Cardiovascular:

- Vasodilat a-v
- Bradicardia
- = Inotropismo

## ■ Tracto G-I:

- Estreñimiento
- ↓ Vaciamiento gástrico

## ■ Piel:

- Rubor y prurito

## ■ Sist. genitourinario:

- Retenciones
- ↓ Contracciones





- Sufentanilo 500-1000
- Remi / Fentanilo 80-100
- Alfentanilo 70
- Buprenorfina 30-50
- Heroína 3-4
- Metadona 1.5
- Morfina 1
- Tramadol 0.1-0.5
- Meperidina 0.5
- Dextropropoxifeno 0.2
- Codeina 0.1



# Consideraciones en el anciano

- **Liberación:** vía de administración (vo menor biodisponibilidad, sc, iv, transdérmico o intratecal y epidural)
- **Absorción:** la etapa menos afectada (integridad e hidratación de las mucosas)
- **Distribución:** aumento masa grasa, disminución masa magra y agua; unión a proteínas (desnutrición proteica)
- **Metabolismo:** CYP P450, apenas se modifica (no ajustar en insuf. Hepática leve)
- **Eliminación:** la que más condiciona (insuficiencia renal)

# *Futuro*

**Reducción del  
dolor y  
mejor calidad  
de vida**

**Prevención  
y  
Tratamiento  
del  
Cáncer**

