

¿Qué sabe usted acerca de... los Opioides?

What do you know about... Opioids?

Emma Virginia Herrera-Huerta,¹ Karla López-Narvaéz,¹ Raymundo Escutia-Gutiérrez,²
Juan Francisco Rodríguez-Landa³

¹LADISER Ciencias Farmacéuticas, Facultad de Ciencias Químicas, Universidad Veracruzana

²Instituto Jalisciense de Alivio al Dolor y Cuidados Paliativos (PALIA), Secretaria de Salud de Jalisco

³Instituto de Neuroetología, Universidad Veracruzana

Preguntas

- 1.- ¿Qué son los opioides?
- 2.- ¿Qué diferencias existen entre los opioides y los opiáceos?
- 3.- ¿Cuáles son las aplicaciones clínicas de los opioides?
- 4.- ¿Cómo se clasifican los opioides?
- 5.- ¿Cuáles son los principales tipos de receptores opioides?
- 6.- ¿Cuáles son los antagonistas de los opioides de uso clínico?
- 7.- ¿Existe alguna Norma Oficial Mexicana específica para el uso de opioides y cuáles son los requisitos necesarios para la dispensación de un medicamento opioide?

Respuestas

1. Los opioides son fármacos analgésicos utilizados para el tratamiento del dolor agudo o crónico. Estas sustancias se caracterizan por la afinidad a los receptores opioides. Al unirse a esos receptores reducen las señales del dolor que llegan al cerebro, tanto por una acción central como periférica al atenuar la transducción y transmisión de la señal dolorosa, es decir, reducen o controlan el dolor, además de sus bien conocidos efectos sobre la región funcional de las áreas del cerebro que controlan las emociones, lo cual en conjunto disminuye la sensación y percepción de un estímulo doloroso.¹⁻²
2. Los opioides son una clase de compuestos que ejercen actividad farmacológica mediante su interacción con los receptores opioides. Estas sustancias incluyen agonistas (p.ej. hidromorfona, metadona y fentanilo, entre otros), antagonistas (p.ej. naloxona y naltrexona) y agonistas-antagonistas mixtos opioides (p.ej. pentazocina, butorfanol y dezocina, entre otros). Además, están incluidas las morfina endógenas (endorfinas). Por su parte, los opiáceos son principios activos de tipo alcaloides (p.ej., morfina, codeína, tebaína) obtenidos de la savia de amapola, de nombre científico *Papaver somniferum*. Todos los opiáceos son opioides, pero no todos los opioides son opiáceos.^{3-5,9}
3. En el tratamiento de dolores postoperatorio, parto, cuadros abdominales agudos crónicos, traumatismos, cólicos renales y biliares, infarto al miocardio, angina inestable, desgarres, cefalea, disnea; y su principal uso es en el control del dolor en enfermedades terminales como el cáncer.^{1,5,10,12}
4. Los opioides se pueden clasificar según su afinidad, su actividad intrínseca o su potencia en opioides débiles y opioides fuertes. Los opioides incluyen agonistas totales, agonistas parciales, y antagonistas. A los agonistas totales también se les conoce como agonistas de gran eficacia o agonistas potentes, los agonistas parciales de opioides pueden evocar efectos agonistas, pero también desplazar a los agonistas totales de su sitio de acción y reducir sus efectos biológicos, de esta manera los agonistas parciales pueden actuar como agonistas o antagonistas dependiendo de su utilidad.¹⁻²

5. Existen distintos tipos de receptores opioides, que se identifican con las letras griegas μ (*mu*), κ (*kappa*) y δ (*delta*), los cuales se encuentran distribuidos en forma irregular en todo el Sistema Nervioso Central (SNC) y fuera de éste, por ejemplo en el músculo liso. Cada uno tiene una función específica, el receptor *mu*, comprende tres subtipos (μ_1 , μ_2 , y μ_3), propicia la apertura de los canales de potasio, es responsable de diversos efectos adversos asociados al uso de opioides, además de ser el principal sitio de acción de los analgésicos opioides más utilizados. El receptor *delta*, comprende dos subtipos (δ_1 y δ_2), abre los canales de potasio, está localizado fundamentalmente en la periferia y es el más abundante en la corteza cerebral. Por otro lado el receptor *kappa*, comprende tres subtipos (κ_1 , κ_2 , y κ_3), cierra los canales de calcio, produce disforia y por ello sus agonistas son menos adictógenos y también contribuye a la analgesia espinal.^{6-7,9}
6. Aunque existen antagonistas selectivos para cada uno de los distintos tipos de receptores opioides, los de utilidad clínica son la naloxona y naltrexona, estos agentes tienen afinidad relativamente alta por los sitios de reconocimiento de opioides, poseen menos afinidad por los demás tipos de receptores, pero también pueden revertir los efectos de los agonistas en los receptores *kappa* y *delta*. La naloxona es un antagonista potente, pero con semivida corta, por lo que su uso se limita al tratamiento de la intoxicación por agonistas opioides. La semivida corta determina la necesidad de repetir su administración para evitar que aparezcan de nuevo los síntomas de toxicidad, sólo se utiliza por vía parenteral a causa de su baja biodisponibilidad por vía oral. La naltrexona es un antagonista de semivida prolongada, cuyo metabolismo da lugar a metabolitos activos que prolongan el efecto antagonista. Se administra habitualmente por vía oral y su uso fundamental es en el tratamiento de la desintoxicación opioide. En la actualidad su uso se ha ampliado al tratamiento de otras dependencias a drogas, debido a que reduce el deseo compulsivo de consumo.^{2,6,10,12}
7. No existe una normatividad específica sobre el uso de los opioides, pero se hace mención en la Norma Oficial Mexicana NOM-028-SSA2-1999, para la prevención, tratamiento y control de las adicciones, en el apartado de abuso de fármacos, en donde explica que el uso y abuso de estos fármacos se asocia con la aparición de problemas psicosociales y psiquiátricos, predisposición a contraer infecciones de transmisión sexual, criminalidad, lesiones por causa externa, alteraciones en la gestación (retraso en el crecimiento intrauterino, abortos, parto pretérmino y muerte fetal), síndrome de abstinencia en el neonato, dolores de fracturas, cambios en la funcionalidad y microestructura neuronal además de muerte súbita, entre otros. Respecto a su dispensación en México, los analgésicos opioides (grupo I) necesitan receta especial, la cual debe cumplir requisitos como recetas con código de barras, firmadas por médicos autorizados por la Secretaría de Salud, deben contener número de folio del recetario el cual debe aparecer en el original y las copias. También debe incluir la fecha de prescripción, nombre del médico, institución que otorgó el título profesional, cédula profesional, especialidad (si se tiene), domicilio particular y teléfono, nombre y domicilio del paciente, diagnóstico, nombre comercial y genérico del medicamento, cantidad y dosificación, presentación y forma farmacéutica, duración del tratamiento, vía de administración, firma autógrafa del médico.^{8,11}

Referencias

1. Hardman JG, Limbird LE, Gilman AG. Las bases farmacológicas de la terapéutica. 11a ed. Nueva York: McGraw-Hill Interamericana; 2006.
2. Katzung BG. Farmacología básica y clínica. 11a ed. México: Manual moderno; 2010.
3. Ling JL. Secretos de la toxicología. 1ª ed. USA: Mc Graw Hill; 2001, p. 113 – 117.
4. Salcedo A. Intoxicación por opioides. Asociación Colombiana para el estudio del Dolor; 2009, p.153-169.
5. Flórez J. Farmacología Humana. 4ª ed. Madrid: Masson; 2005, p. 461 – 478.
6. Lorenzo P, Velázquez MA. Farmacología Básica y Clínica. 18ª ed. Barcelona: Editorial Medica Panamericana; 2010, p. 213 – 227.
7. Conn PM, Gebhart GF. Principios de la Farmacología. 1st ed. USA: Manual Moderno; 1991, p. 173 – 180.
8. Diario Oficial de la Federación. Norma Oficial Mexicana NOM-028-SSA2-1999, para la prevención, tratamiento y control de las adicciones. Acceso 30 mayo 2013.
9. Lüllmann H, Mohr K, Hein L. Farmacología Texto y Atlas. 6ª ed. España: Editorial Medica Panamericana; 2010, p. 194-199.
10. Bonal de Falgas J. Farmacia Clínica 1ª ed. España: Editorial Síntesis. p. 277–282. (vol II).
11. Escutia-Gutiérrez R. Guía práctica del Uso Racional de Analgésicos Opioides. 1ª ed. México: Tecnofarma; 2011.
12. Godínez-Cubillo NC. Opioides y Cannabinoides. Uso clínico en el alivio del dolor. 1ª ed. México: Editorial PyDESA; 2012.