

# 13. Ikasgaia

## Farmako analgesiko opioide

Farmakologia Fisioterapian

OpenCourseWare

UPV/EHU OCW-2018



Iván Manuel Vicente  
María Torrecilla Sesma  
Farmakologia Saila, UPV/EHU



## Edukiaren laburpena:

**1.- Orokortasunak:** Mina, sistema opioide, hartzeileak eta ekintza mekanismoa

**2.- Farmako opioideen sailkapena:**

**2.1.-Agonista osoak ( $\mu$ ):**

Morfina:

farmakozinetika

ekintzak farmakologikoak

erabilgarritasun terapeutikoak eta eraginkaltegarriak

Beste  $\mu$  agonistak: Metadona, Fentaniloa, Kodeina, Tramadol, Oxikodona...

**2.2.- Agonista partzialak ( $\mu$ ):** Buprenorfina

**2.3.- Antagonistak ( $\mu$ ):** Naloxona, Naltrexona, Metilnaltrexona

**3.- Kontsiderazio batzuk fisioterapian**

# 1.- Orokortasunak: Mina, sistema opioide, hartzailleak eta ekintza mekanismoa

“ Bi min mota daude: nirea, jasanezina, eta bestearena beti gehiegizkoa dena ”. *J. Perich (umorista)*

Zer da mina? estimulu kaltegarrien pertzepzio subjektiboa



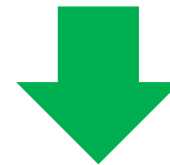
# 1.- Orokortasunak: Mina, sistema opioide, hartzaileak eta ekintza mekanismoa

Min prozesua errazten duten barneko sustantzien sintesia **inhibitzea**



Ekintza periferikoa  
**AIEEak**

Barneko sustantzi “analgesikoen” antzeko ekintza sorraraztea



Ekintza zentrala  
**Opiazeoak**

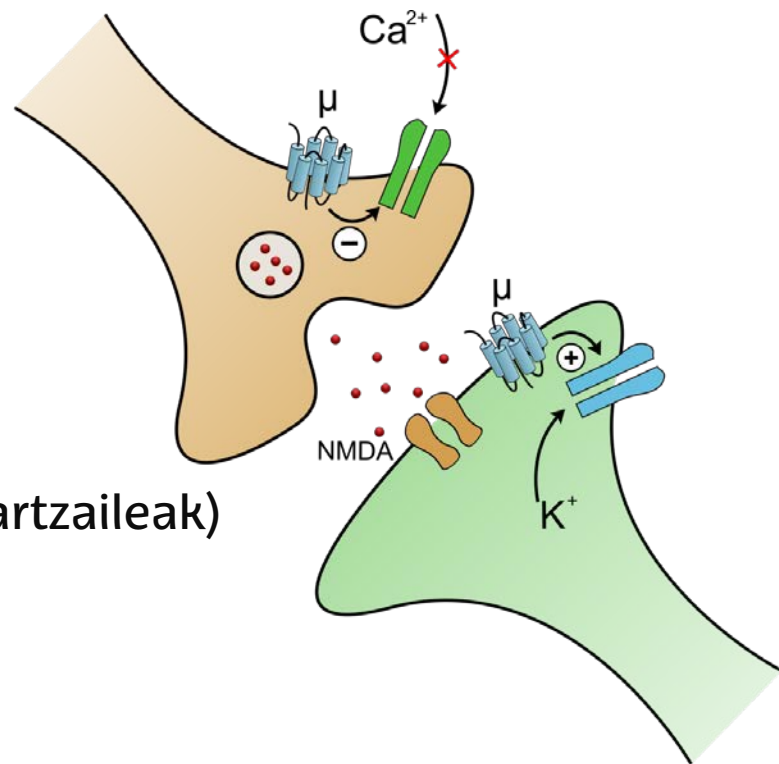
# 1.- Orokortasunak: Mina, sistema opioide, hartzaileak eta ekintza mekanismoa

## ▪ HARTZAILE OPIOIDEAK (itu farmakologikoak) AZPIMOTAK:

$\mu$  (MOR)  
 $\delta$  (DOR)  
 $\kappa$  (KOR)

## ▪ BARNE-LIGANDOAK/PEPTIDO OPIOIDEAK

- $\beta$ -endorfina (hartzaileak)
- Met-entzefalina eta Leu-entzefalina (eta hartzaileak)
- Dinorfinak (hartzaileak)



## ▪ EKINTZA MEKANISMOA:

- Neuronen kitzikapena inhibitu:  $K^+$  erretenen zabalkuntza = hiperpolarizazioa)
- Neurotransmisoreen askapena inhibitu:  $Ca^{2+}$  erretenen (-)

## 2.- Farmako opioideen sailkapena:

### 2.1. Agonista osoak ( $\mu$ ):

morfina, metadona, fentanilo, kodeina, tramadol

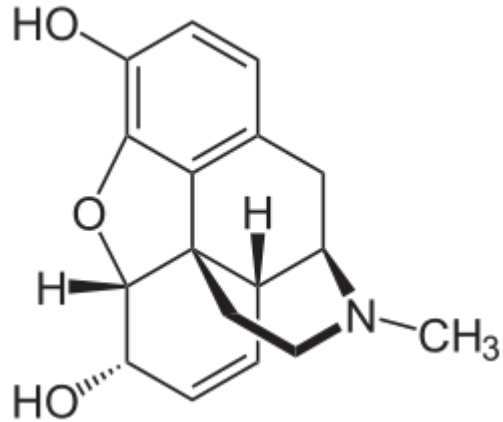
### 2.2. Agonista partziala ( $\mu$ ): buprenorfina

### 2.3. Antagonistak ( $\mu$ ): naloxona, naltrexona

## 2.- Farmako opioideen sailkapena:

### 2.1. $\mu$ HARTZAILE OPIOIDEEN AGONISTA OSOAK

- MORFINA (prototipoa)



Opioaren alkaloide nagusiak:

morfina %10-15

kodeina %0,5

tebaina %1

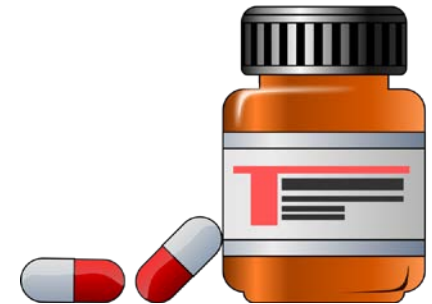
papaberina %1

noskapina %10

Morfinaren egitura kimikoa  
F. Sertürnerrek isolatua 1803an

# Morfinaren ezaugarri farmakozinetikoak

- Aho-bidetik (min kronikoetan)
  - $T_{1/2}$  2-3h
  - BE %15-64 (**aldakorra!!**)
  - Gibelesko lehenengo-pausuko gertakaria (**%70!!**)
  - Retard prestakinak (8-12h adm)
- Gibelesko metabolismoa- M3G, M6G\*
- Iraizketa: gernu bidez
- Gibel-hesteko zirkulazioa





# Morfinaren ekintza farmakologikoak

## 1) Nerbio Sistema Zentralean:

- **ANALGESIA** (sabai altua, minaren osagai fisikoa)
- **Euforia** (ongizatea- osagai psikikoa) eta **sedazioa**
- **Arnas depresioa** (hilgarria izan daiteke)
- **Eztul-kontrakoa**
- **Goragale eta goitikak**
- **Miosia**
- **Tolerantzia eta Menpekotasuna: abstinentzia sindromea**

Kontuz, beste depresore nahastearekin (alkohola)!



## 2) Periferian:

- **Idorreria eta gernu erretentzioa**
- **Jakien liseriketa eta urdaileko hustearen atzerapena**
- **Bronkouzkurdura eta basozabalkuntza (histamina)**
- **Bihotz-gastua jaitsi (hipotentsioa)**

**Abstinentzia sindromea:** Loezina, Disforia, Sukarra, Mialgiak, Rinorrea Beherakoak, Midriasia, Iletentetzea, Botaka

## **Gaindosietan**

1, Arnas-depresioa

2, Miosia

3, Konorte-depresioa (koma)

Tratamendua: hartzaile opioidearen antagonista (b.b)

## **Morfinaren erabilgarritasun terapeutikoa**

### **Min handietan**

Min akutuetan: traumatismoetan, ebakuntza ostekoan, erdiminak, bihotzekoan, kolikoetan

Min kronikoetan: neoplasietan eta beste analgesikoekiko erresistenteak diren minak

# Beste $\mu$ hartzaile opioideen agonista osoak

- Metadona (agonista osoa)

FZ: - BE handiagoa aho-bidetik

- **erdi bizia** (18-24h), Tdu kronikoetan ~47h
- Adminstrazio tartea: 12-24h (erosoago)

Erabilgarritasun terapeutikoa:

- Menpekotasunean
- Mina arintzeko

## ■ Fentaniloa (agonista osoa)

- **Oso potentea** – morfina baino potenteagoa

- **Liposolugarria** - analgesia **azkarra** (partxeak, zurrupatu, arnas-bidea...)

Kontuz, masajeak ematean- xurgapena ↑



- Aho bidea gomentatzen da

- Erabilgarritasun terapeutikoa: ANALGESIA

Errestake-tdu moduan: bat-bateko min onkologiko

Anestesian; hasiera azkarra (b.b. 30" → 30-60')

Adm. Kronikoa mugatua!! → menpekotasuna



- Kodeina (metilmorfina) → → → Glukuronidoak (%90-95)

CYP2D6 → morfina (%5-10)

FZ: Aho bidez BE ona

NSZ gutxiago deprimitu, menpekotasuna?

Erabilgarritasun terapeutikoa:

- EZTUL-KONTRAKOA
- Min ertaina (elkartuta AIEE)



Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios  
**AEMPS**

**CODEÍNA: NUEVAS RESTRICCIONES DE USO  
COMO ANTITUSÍGENO EN PEDIATRÍA**

(Recomendaciones del Comité para la Evaluación de Riesgos en  
Farmacovigilancia europeo-PRAC)

Fecha de publicación: 13 de marzo de 2015

Categoría: MEDICAMENTOS DE USO HUMANO, SEGURIDAD.  
Referencia: MUH (FV) 3/2015

*Tras la revisión del balance beneficio-riesgo de codeína para el tratamiento de la tos asociada a procesos catarrales en población pediátrica se han recomendado las siguientes restricciones de uso:*

- No utilizar codeína en menores de 12 años de edad, en pacientes metabolizadores ultrarrápidos del CYP2D6 ni en mujeres durante la lactancia.
- No se recomienda el uso de codeína en pacientes de 12 a 18 años de edad que presenten compromiso de la función respiratoria.

Nota informativa

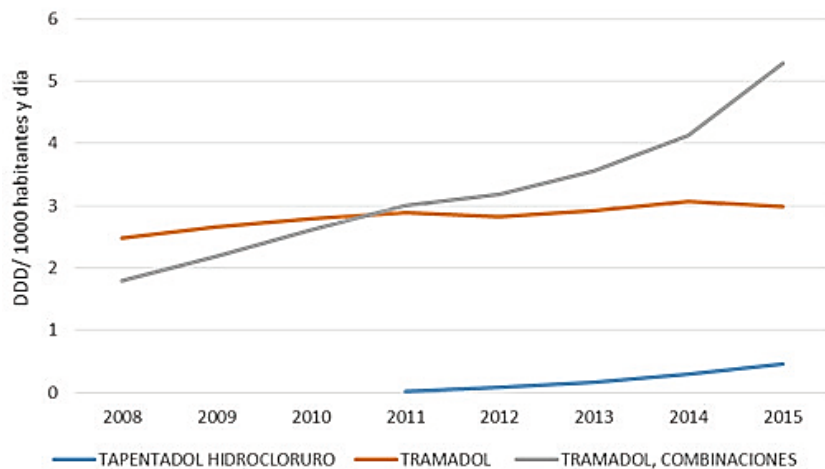
## ■ Tramadol – gehien erabitzen dena (parazetamolarekin elkartua)

- Opiazeoa + NA eta 5-HT bixurgapena (-)

- Min ertaina-handia kroniko

- ED ohizkoak: zorabioak, goragaleak (%10), logurea, konbultsioak, Síndrome 5-HT

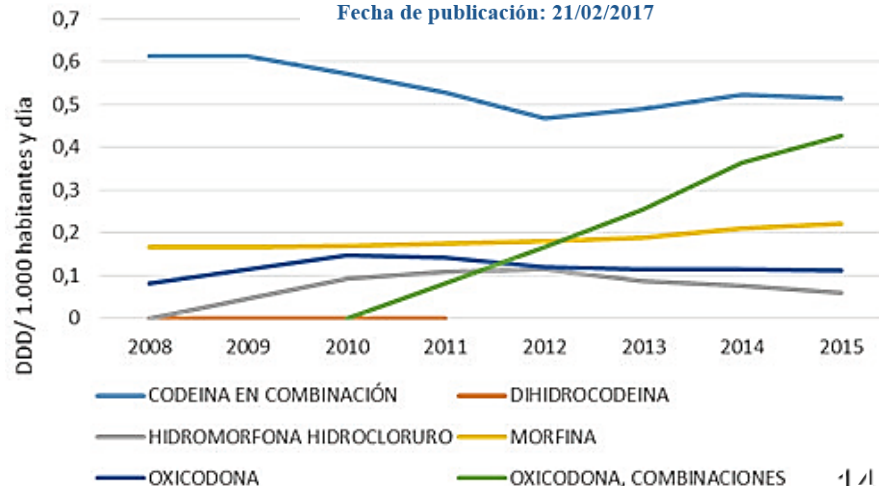
- Arnas-depresioa ez, menpekotasunik ez ¿?



INFORME DE UTILIZACIÓN DE MEDICAMENTOS  
U/OPI/V1/13022017

Utilización de medicamentos  
opioides en España durante el  
periodo 2008-2015

Fecha de publicación: 21/02/2017



## 2.- Farmako opioideen sailkapena:

### 2.2. AGONISTA PARTZIALAK ( $\mu$ )

#### Buprenorfina

- AFINITATE HANDIA
- ANALGESIA IRAUNKORRA baina atzeratuta
- Liposolugarria  
(mihi-bidetik, partxeak...) – masajeak!!
- Erabilgarritasuna terapeutikoa:  
**Min kroniko (ertaina)**



## 2.- Farmako opioideen sailkapena:

### 2. 3. ANTAGONISTAK

#### 1. Naloxona\*

BE-a.b. baxua

Ekintza laburra

Bide parenteralez

#### 2. Naltrexona

Ekintza luzea

Aho-bidetik



#### Erabilgarritasun terapeutikoa:

- Opiazeo gaindosietan\*
- Menpekotasunean (naltrexona)
- KONTUZ: Abstinentsia



### 3.- Kontsiderazio batzuk fisioterapian

Saioa egin gehienezko eragin analgesikoa denean – erabilera pasiboa erraztuz

Eragin kaltegarriak: sedazioa, idorreria, arnas depresioa

- Analgesiak eragin kaltegarriak berdintzen ditu- sedazioa
  - Saio denborak egokitu etekin handiagoak lortzeko
- Jardurea fisikoa egotekotan – arnasketa zaindu
- Hezur muina lesioetan – idorreria (gehigarria)
- Abstinentzia sindromean, muskulu eta giltzadura minak
  - fisioterapia aringarria (beroa, elektroterapia, masoterapia...)

El país: la epidemia de EEUU

El confidencial: fentanilo