

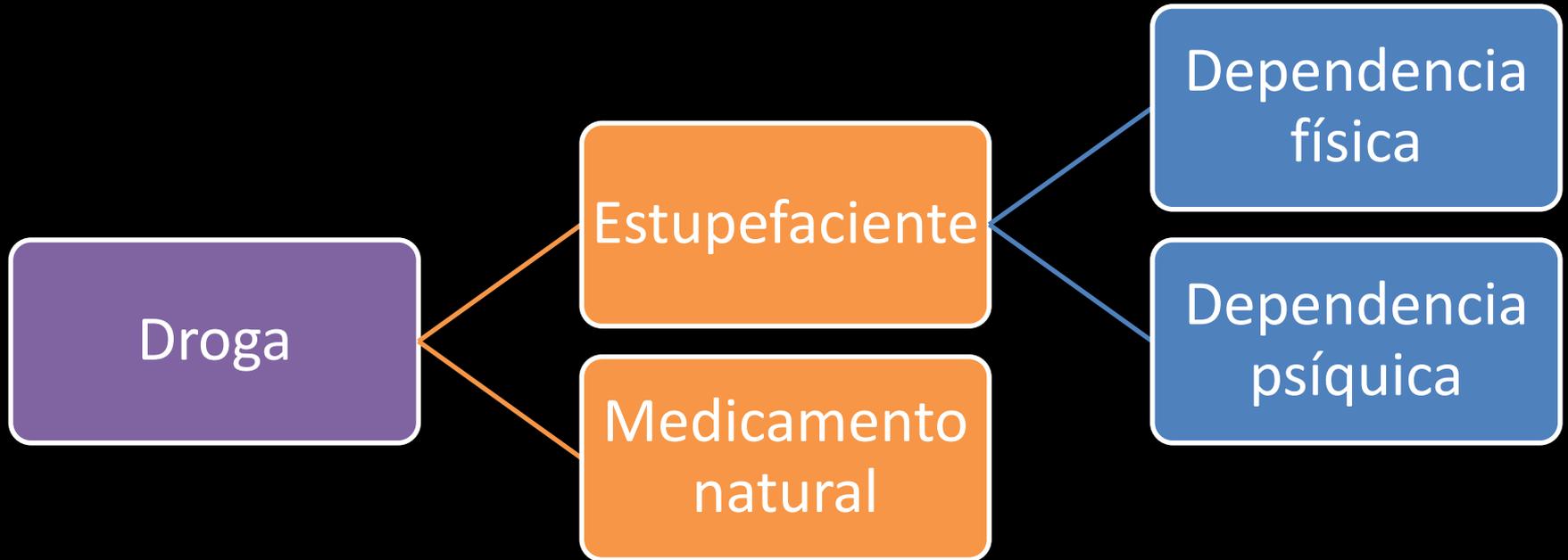
# Opioides

Victor Mauricio León Serpa MVZ; Esp Sanidad  
Animal

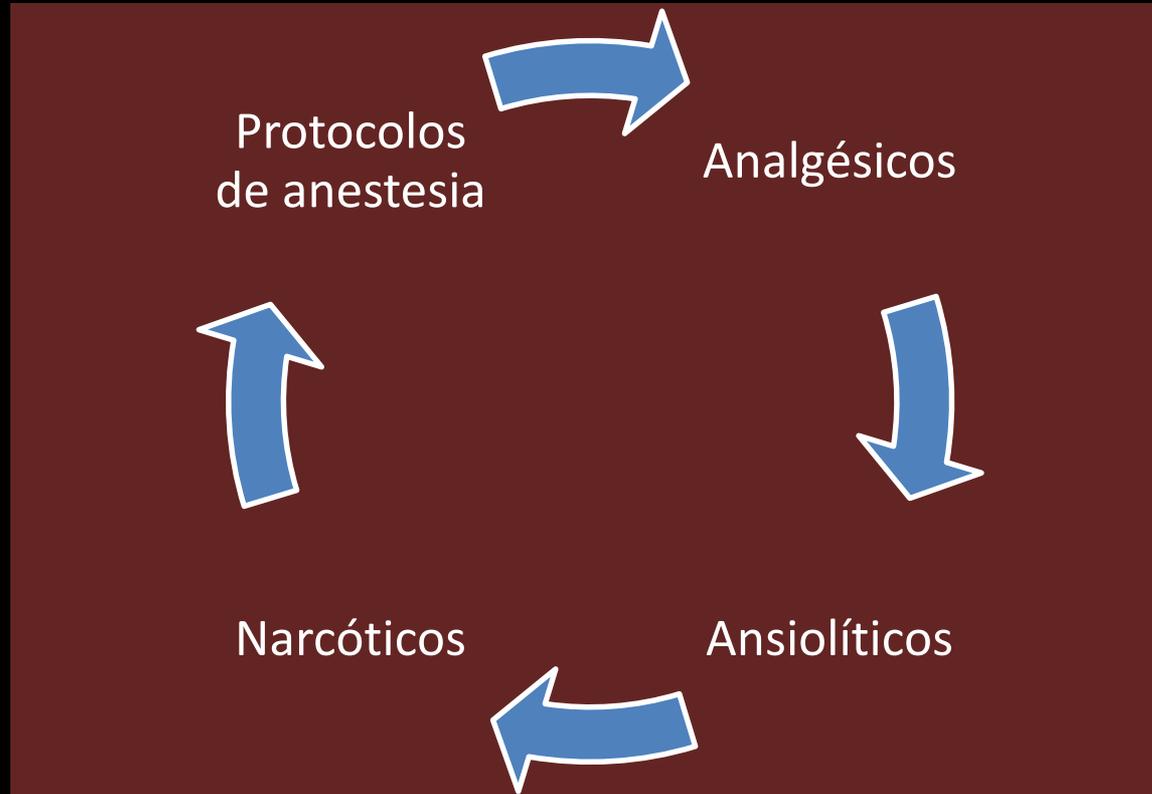
# Son derivados del Opio



# Que es el opio



# Usos Opiáceos



# Receptores específicos de péptidos opioides

$\mu$

- Endorfinas

$\delta$

- Encefalinas

$\kappa$

- Dinorfinas

Nociceptina

- Otros: Nociceptina / orfanina

# Péptidos opioides

Péptidos opioides

```
graph LR; A[Péptidos opioides] --- B[Preproopiomelanocortina (POMC)]; A --- C[Preproencefalina]; A --- D[preprodinorfina]; B --- E[Endorfinas]; C --- F[Encefalinas]; D --- G[Dinorfinas];
```

Preproopiomelanocortina  
(POMC)

Endorfinas

Preproencefalina

Encefalinas

preprodinorfina

Dinorfinas

# MECANISMOS DE ACCIÓN

# Nomenclatura

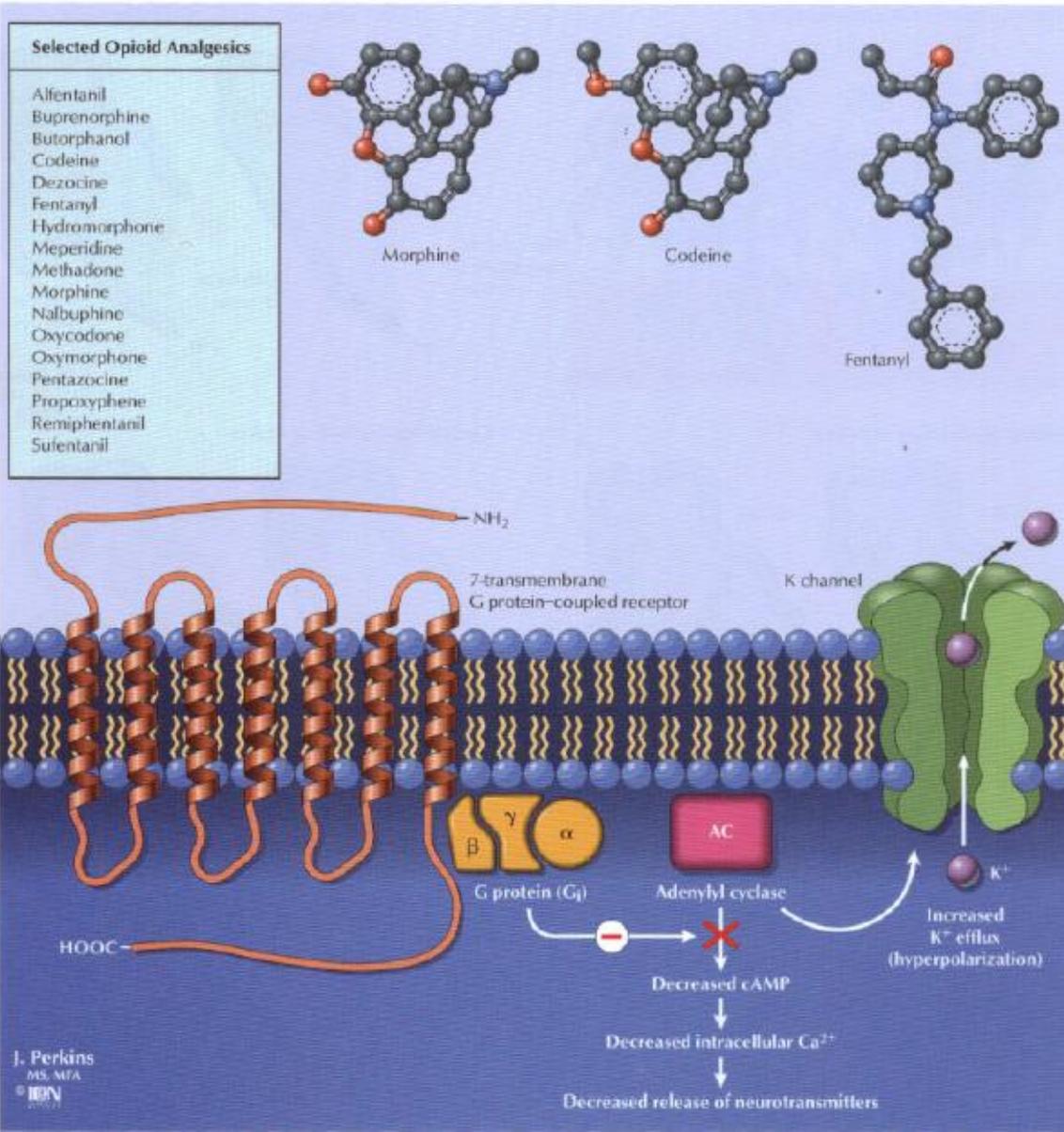
International Union of Basic and Clinical Pharmacology (IUPHAR)

Griego	Común
μ O P	M O P
κ O P	K O P
δ O P	D O P
N O P	N O P

La cuarta familia de receptores (NOP), ha sido cuestionado, ya que las acciones de N/OFQ no son antagonizadas por la naloxona, como ocurre en los otros casos, sin embargo se considera una subcategoría de los receptores opiáceos.

# Tipo de receptor opiáceo

Receptores acoplados a proteínas G, y por tanto, se asocian a la señal activada por proteínas  $G_i/G_o$ .



# EFECTOS FARMACOLÓGICOS

## Efectos de los receptores opiáceos

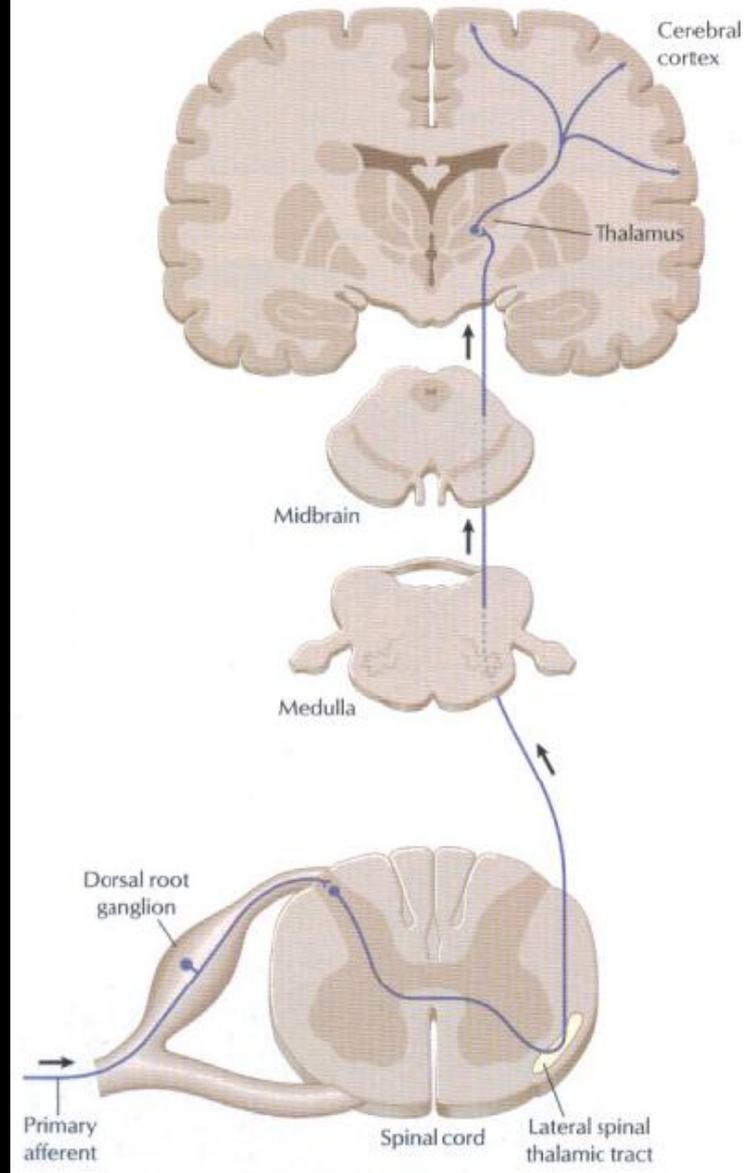
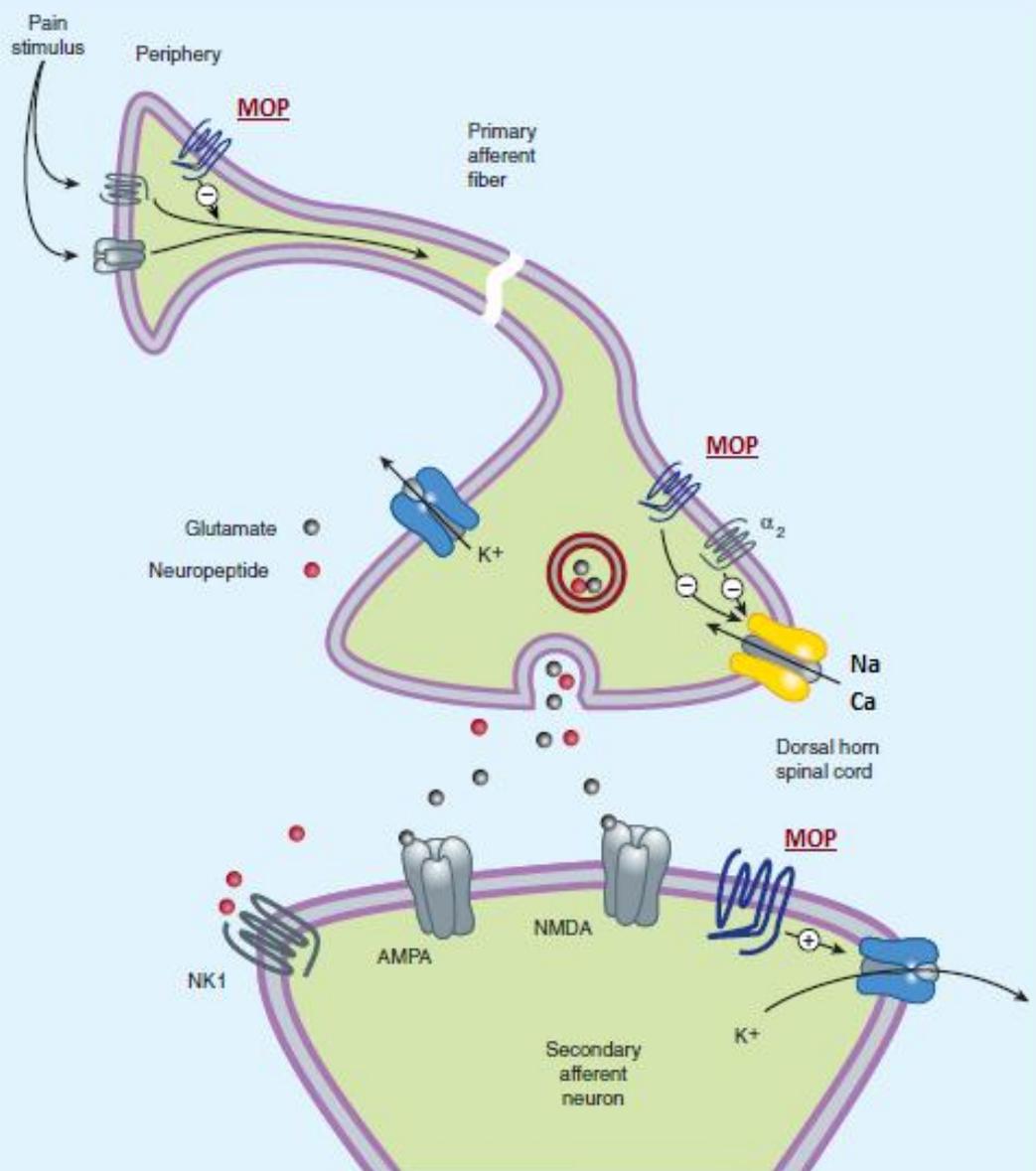
Effects	Receptor Types		
	$\mu$	$\kappa$	$\delta$
<b>Analgesia</b>			
Supraspinal	+	+	+
Spinal	+	+	+
Sedation	+	+	0
↓Respiration	+	0	0
↓GI transit	+	0	0
Diuresis	0	+	0
<b>NT Release</b>			
↓Acetylcholine	+	0	0
↓Dopamine	+	0	+
<b>Hormone Release</b>			
Prolactin	+	0	0
Growth hormone	+	0	+
↓Vasopressin	0	+	0
Euphoria	+	0	0
Dysphoria	0	+	0
Miosis (dogs)	+	+	0
Vasodilatation	+	0	0
Bradycardia	+	0	0

# Principales receptores opioides, agonistas endógenos y efectos asociados

Receptores		Agonista endógeno	Efecto
$\mu$	MOP	Endorfina	Analgesia, Sedación, Efectos gastrointestinales, Depresión respiratoria, Euforia, dependencia, Inhibición de la tos.
$\delta$	DOP	Encefalina*	Analgesia (menor implicación), Euforia, Depresión respiratoria, Efectos gastrointestinales, Células inmunitarias, Músculo liso.
$\kappa$	KOP	Dinorfina	Analgesia espinal, Sedación, Modificaciones en la pupila, Efectos gastrointestinales, Disforia, Ansiedad, Inhibición de la tos.

\*También se unen a los receptores  $\mu$

**ANALGESIA**



- ↓ Sensación del dolor (excepto el neuropático)
- Analgesia por estimulación  $\mu$ ,  $\delta$  (sin utilidad clínica) y  $\kappa$  (también disforia).
- No son antiinflamatorios.

# **EFFECTOS RESPIRATORIOS**

- ↓ Sensibilidad a dióxido de carbono en el centro respiratorio, por acción  $\mu$  y  $\delta$ .
- Depresión respiratoria
  - ↓ volumen minuto
  - Frecuencia
  - Ritmo
  - Patrón respiratorio
- Efecto antitusígeno, por acción  $\delta$ .

# **EFFECTOS CARDIOVASCULARES**

- Bradicardia por efecto central.
- Liberación de histamina → hipotensión.
- ↑ presión intra craneal → vasodilatación cerebral y periférica.
- En caballos hipertensión y taquicardia

# **EFFECTOS GASTROINTESTINALES**

# Intestino

- ↓ peristaltismo
- ↑ tono de esfínteres
- ↓ secreciones

- ↑ los movimientos no propulsivos y ↓ los propulsivos.
- ↑ absorción de agua → estreñimiento

## Vesícula biliar

- Contraen esfínter biliar
- Aumenta la presión de las vías biliares

## Estomago

- ↓ motilidad
- Retardan vaciamiento

**ACTIVIDAD MOTORA**

Efecto

Actividad Motora

Característica

Incremento

Disminución

Especie

Equinos

Bovinos

Ovinos

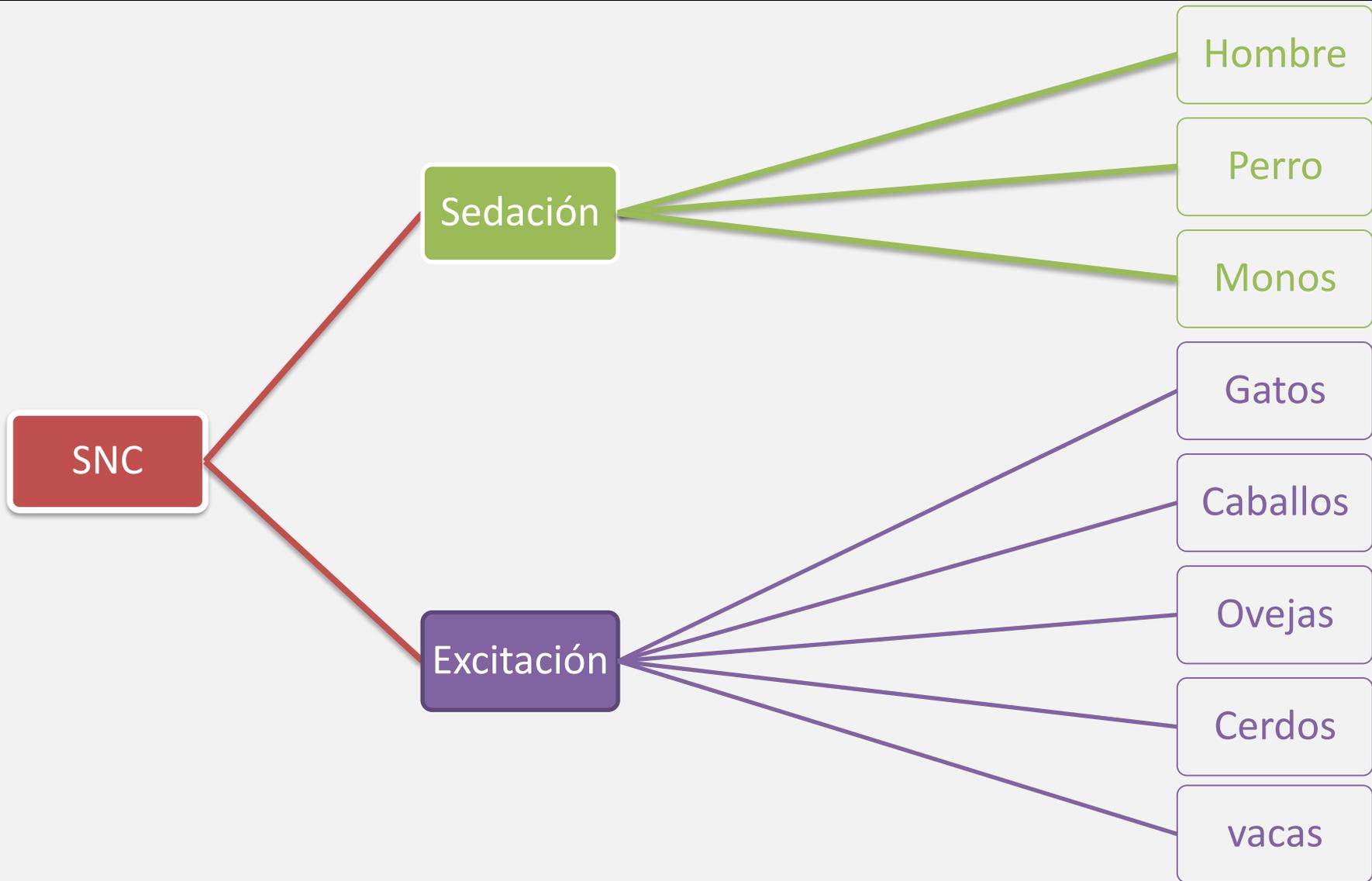
Perro

Gato

Hombre

**OTROS EFECTOS**

- Contracción uretral y reduce diuresis.
- Contracción esfínteres urinarios, produce retención de orina.
- Altera el funcionamiento inmunológico.
- En dosis elevadas puede causar convulsiones



# FÁRMACOS AGONISTAS DE RECEPTORES OPIOIDES

- Morfina
- Codeina
- Etorfina
- Oxycodona
- Petidina o meperidina
- Difenoxilato
- Loperamida

- Metadona
- Propoxifeno
- Fentanilos (fentanilo, alfentanilo y remifentanilo).
- Tramadol
- Tapentadol

# FÁRMACOS AGONISTAS DUALES DE RECEPTORES OPIOIDES

- Butorfanol
- Nalbufina
- Pentazocina
- Buprenorfina

# FÁRMACOS ANTAGONISTAS DE RECEPTORES OPIOIDES

- Naloxona
- Naltrexona
- Diprenorfina

# **EFFECTOS ADVERSOS**

## Efectos adversos de los fármacos opioides y excepciones

Efectos adversos de los opioides	Excepciones
Depresión respiratoria	
Liberación de histamina (morfina y meperidina)	Fentanilo: no provoca liberación de histamina
Estreñimiento	
Reducción de diuresis y retención urinaria	
Sedación y sueño: perros	Excitación: gatos, caballos, ovejas, cerdos y vacas
Efectos cardiovasculares variables (bradicardia y vasodilatación central y periférica)	Etorfina: hipertensión y taquicardia en caballos
Náuseas y vómitos	Butorfanol: antiemético en perros
Reducción actividad motora: perro	Incremento actividad motora: caballos, vacas y ovejas
Hipotermia: perro	Hipertermia: gatos, cabras, vacas y caballos
Miosis: perro	Midriasis: gatos, ovejas y caballos

# APLICACIONES FARMACOLÓGICAS

## Aplicaciones de los fármacos opioides más utilizados en terapéutica veterinaria

Fármaco	Especie	Aplicaciones terapéuticas
Morfina	Perros, gatos, cerdos, caballos	Analgesia, sedación y preanestesia
Codeína	Perros	Antitusivo
Oximorfona	Perros, gatos, cerdos, caballos	Analgesia, cólico equino, neuroleptoanalgesia
Petidina	Perros, gatos, cerdos, caballos, ganado vacuno	Analgesia, preanestesia, cólico equino, neuroleptoanalgesia
Metadona	Perros, gatos, caballos	Analgesia, sedación, neuroleptoanalgesia
Fentanilo	Perros, gatos	Analgesia, preanestesia, neuroleptoanalgesia
Etorfina	Animales salvajes	Analgesia, sedación
Tramadol	Perros, gatos, caballos	Analgesia leve o moderada
Buprenorfina	Perros, gatos, cerdos	Analgesia postoperatoria
Butorfanol	Perros, gatos, cerdos, caballos	Analgesia leve o moderada, preanestesia, cólico equino
Pentazocina	Perros, gatos, cerdos, caballos	Analgesia visceral, cólico equino
Nalbufina	Perros, gatos	Analgesia