

## Antagonistas en Fármaco-Dependencia de Drogas Morfinosímiles\*

AMALIA G. DE VAZQUEZ y LUIS E. BRUNO BLANCH

*Cátedra de Farmacoquímica, Departamento de Ciencias Biológicas,  
Facultad de Ciencias Exactas, Universidad Nacional de La Plata,  
calles 47 y 115, La Plata 1900, Argentina.*

**RESUMEN.** El uso indebido de drogas narcóticas del tipo de los morfinosímiles es un significativo problema social de carácter internacional. Desde el año 1929, conocida la fórmula de la morfina, prototipo activo de alta complejidad molecular, el farmacoquímico realiza estudios sistemáticos en la búsqueda de opioides no adictivos para el tratamiento de los síndromes de retiro en individuos opiáceo-dependientes. Los métodos clásicos realizan variaciones estructurales manteniendo el sistema pentacíclico de la morfina. Los más modernos se fundamentan en retener el grupo analgesióforo y por el método de la Simplificación Molecular, eliminar porciones estructurales contenidas en la molécula de la morfina, por considerarlas responsables de acciones secundarias indeseables. Todos estos análogos estructurales fueron considerados como pro-drogas que, posteriormente funcionalizadas, se ensayaron para el tratamiento de la drogadicción en evaluaciones clínicas por instituciones estatales y privadas en el orden internacional.

**SUMMARY.** The widespread use and abuse of Narcotic Drugs identified opiate addiction is a significant social problem. Since the first systematic studies of opioid SAR (structure-activity relationship), the isolation and structure elucidation of morphine coupled with the rise of syntetic organic chemistry, had led to an intensive effort directed at compounds that dissociated the pain-relieving and addictive properties of the opioids. Early attempts were able to produce only the basic carbocyclic skeleton of morphine. The last synthetic efforts discovered that potent analgesic activity could be retained in structures lacking the furan ring of morphine. The "Molecular Simplification Method" removes structural portions of the morphine molecule, which have concomitant effects. All these structural analogs were use by Private and of State Institutes in the international order. The clinical methodology was developed for the evaluation of analgesic efficacy and opiod dependence liability.

### INTRODUCCION

La Organización Mundial de la Salud (O.M.S.), por intermedio del Consejo Nacional de Investigaciones de Evaluación Clínica de Antagonistas Narcóticos de los EE.UU. y en colaboración con otras instituciones afines de otros

países, estatales o privadas, consideran la adicción opiácea como un significativo problema social y centralizan los datos de evaluaciones clínicas de individuos opiáceo-dependientes con nuevos antagonistas narcóticos.

En nuestro país la drogadicción

\* Presentado al II Congreso Argentino y Latinoamericano de Psicotrópicos, noviembre de 1982, La Plata, Argentina.

**PALABRAS CLAVE:** Morfinosímiles; Morfina, antagonistas  
**KEY WORDS:** *Morphine-like substances; Morphine, antagonists*