



114. Farmacología: anestésicos, antisépticos, antibióticos, antiinflamatorios, drogas de acción autonómica



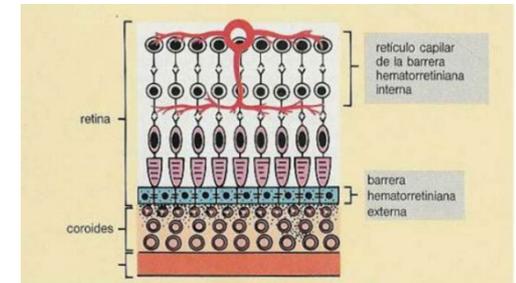
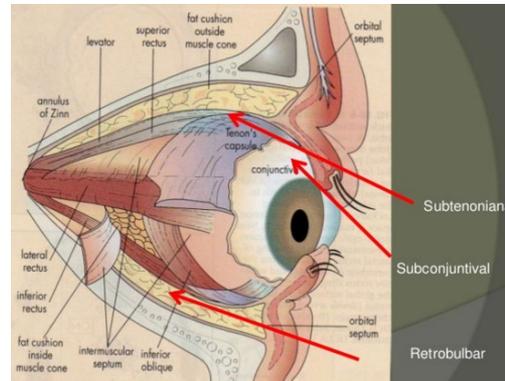
Antonio Pérez Rueda. R2.
Oftalmología.
C. H. Torrecárdenas (Almería)

ESQUEMA:

- I. Conceptos básicos
- II. Farmacología ocular básica:
 - Sistema autonómico
 - Hipotensores oculares
 - AINES
 - Esteroides
 - Antialérgicos
 - Antiinfecciosos
 - Miscelánea

I. Conceptos básicos

- **Vías de administración:**
 - Gotas y ungüentos
 - Inyecciones periorculares (subconjuntival, subtenoniana, retrobulbar)
 - Intraocular (intracamerular, intravítrea)
 - Sistémica



II. Farmacología ocular básica

I. Agentes colinérgicos:

- **Agonistas muscarínicos:**
 - Miosis
 - Aumento del drenaje del humor acuoso (↓PIO)

Acetilcolina 1%	Uso intracamerular en cirugía de catarata
Pilocarpina 1%, 2%, 4%	<ul style="list-style-type: none">• Dx pupila de Adie• Glaucoma crónico de ángulo abierto. Previene del bloqueo angular.

Fármacos midriáticos y ciclopléjicos

	Efecto máximo aproximado	Duración de acción aproximada
Midriáticos		
Fenilefrina 0'12%, 2,5%, 10%	30 min	3h
Ciclopléjicos/midriáticos		
Tropicamida 0'5%, 1%	20 min	20 min-6h
Ciclopentolato 0'5%, 1%, 2%	20-45 min	24 h
Homatropina 2%, 5%	20-90 min	2-3 días
Escopolamina	20-45 min	4-7 días
Atropina	30-40 min	1-2 semanas

2. Hipotensores/Antiglaucomatosos

- *Agentes adrenérgicos*
 - **Agonista indirecto α_2 :**
 - *Apraclonidina (IOPIMAX 1%):*
 - **Disminuye la producción de humor acuoso**
 - Uso a corto plazo (1h) y gran reducción de la PIO (23 – 39%)
 - *Brimonidina (ALFADINA, ALPHAGAN, BRIMONIDINA BRILL)*
 - **Disminuye la producción y aumenta el flujo de salida del humor acuoso**
 - Asociaciones: *Brinzolamida/Brimonidina (SIMBRINZA) Timolol/Brimonidina (COMBIGAN)*



*“Apraclonidine caused **higher hypotensive effect** after capsulotomy with YAG laser when compared with brimonidine, dorzolamide, latanoprost, pilocarpine, timolol and control group” - [Efficacy of topic ocular hipotensive agents after posterior capsulotomy].*

- **Antagonistas Beta – adrenérgicos:**
 - **Disminuyen la producción de humor acuoso:**
 - *Timolol (CUSIMOLOL, TIMOFTOL, TIMABAK)*
 - **Asociaciones:**
 - *Timolol/Bimatoprost (GANFORT)*
 - *Timolol/Brimonidina (COMBIGAN)*
 - *Timolol/Brinzolanida (AZARGA)*
 - *Timolol/Dorzolamida (COSOPT)*
 - *Timolol/Latanoprost (ARUCOM)*
 - *Timolol/Tafluprost (TAPTIQOM)*
 - *Timolol/Tavoprost (DUOTRAV)*



- **Inhibidores de la anhidrasa carbónica:**

- **Disminuyen la producción del humor acuoso**

- Sistémicos: *Acetazolamida (EDEMOX)*
- Tópicos:
 - *Dorzolamida (TRUSOPT)*
 - *Brinzolamida (AZOPT)*

- **Análogos de prostaglandinas:**

- **Aumentan el flujo uveoescleral**
- **Primera línea de tratamiento GPAA**
 - *Latanoprost (XALATAN, MONOPROST)*
 - *Travoprost (TRAVATAN)*
 - *Bimatoprost (LUMIGAN)*

- **Agentes osmóticos:**

- **Disminuyen el volumen vítreo**
 - *Manitol*



3. Antiinflamatorios:

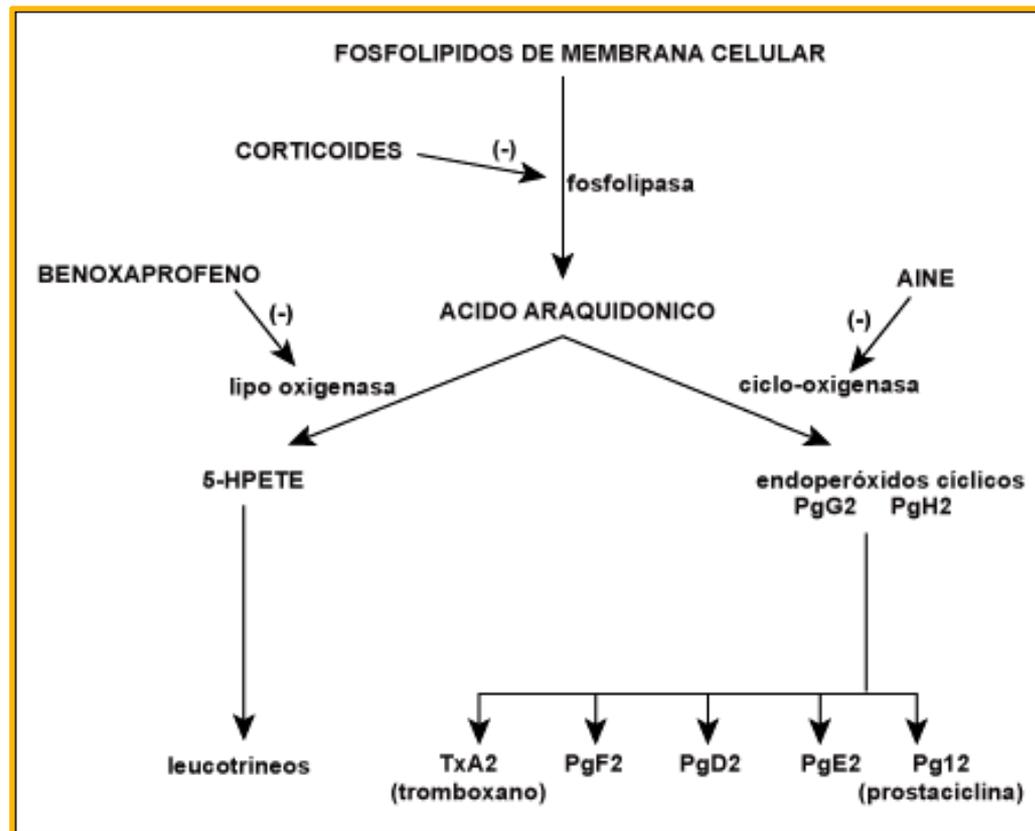
- **Glucocorticoides:**

- *Inhiben la liberación de ácido araquidónico, que se **convertiría en PG** y otros mediadores de la inflamación.*
- **Tópicos:**
 - *Fluorometolona (FML, ISOPTOFLUCON) < Dexametasona 0'1% (MAXIDEX) < Prednisolona 1% (PREFORTE)*
- **Subconjuntivales, perioculares, intravitreos:**
 - *Triamcinolona (TRIGON)*
 - *Dexametasona (OZURDEX)*
- **Sistémicos:** *Prednisona v.o., Metilprednisolona i.v.*

RAM locales	RAM sistemicas
HTO/glaucoma	Hiperglucemia
Catarata	Supresion eje adrenal
Exacerban infecciones	Insomnio, psicosis...

• AINES

- Inhiben la **producción de PG** por la vía de la ciclooxigenasa
 - *Diclofenaco (VOLTAREN, DICLOABAK)*
 - *Ketorolaco*
 - *Nepafenaco (NEVANAC)*
 - *Bromfenaco (YELLOX)*



4. ANTIALÉRGICOS

- Estabilizadores de mastocitos:
 - *Cromoglicato de sodio (CUSICROM)*
- Antihistaminico H1:
 - *Olopatadina (OPATANOL)*
 - *Ketotifeno (ZADITEN)*
 - *Azelastina (TEBARAT)*
 - *Epinastina (RELESTAT)*
- Inmunosupresor/Inmunomodulador:
 - *Ciclosporina 1%, 2%*



5. ANTIBIÓTICOS:

- Penicilinas y Cefalosporinas
- Sulfonamidas
- Tetraciclinas
- Cloranfenicol
- Aminoglucósidos
- Fluoroquinolonas



• Penicilinas y Cefalosporinas

- Penicilina G sódica i.v: Sífilis ocular
- Cefalosporinas 1G: Cefalotina, Cefalexina
- **Cefalosporinas 2G:**
 - ***Cefuroxima intracamerular (Profilaxis endoftalmitis post-cirugía cataratas)***
- **Cefalosporinas 3G:**
 - Cefotaxima
 - ***Ceftriaxona 1 – 2 g i.v. / 24 h***



“Endophthalmitis prophylaxis by intracameral antibiotics: In vitro model comparing vancomycin, cefuroxime, and moxifloxacin”

• Sulfonamidas

- Bacteriostáticos: Gram (-)
 - *Sulfacetamida 10 – 30% gotas o ungüento*
 - Buena penetración corneal
 - Tracoma

• Tetraciclinas

- Bacteriostáticas amplio espectro:
 - *Aureomicina pomada*
 - *Doxiciclina v.o.*
 - Blefaritis y rosácea ocular

• Cloranfenicol

- Bacteriostático amplio espectro
 - Penetra bien el epitelio corneal
 - *Pomada DE ICOL*

- **Aminoglucósidos:**

- *Gentamicina, Tobramicina (GENTADEXA, TOBREX)*
- *Neomicina (PREDNISONA NEOMICINA)*
 - No penetran la barrera hematorretiniana
 - Gram (-)



- **Fluoroquinolonas:**

- Gram (+), Gram (-)
- **Mejor penetración epitelio corneal**
 - 2G:
 - *Ofloxacino (EXOCIN), Ciprofloxacino (CETRAFLUX, OFTACILOX)*
 - 3G: *Levofloxacino v.o./i.v.*
 - 4G: *Moxifloxacino (VIGAMOX)*



• ANTIFÚNGICOS:

- Polienos:
 - *Natamicina 5% suspensión tópica*
 - *Anfotericina B 0'25 – 0'50 %*
- Imidazoles:
 - *Itraconazol oral*
 - *Ketoconazol oral o preparación tópica*
 - *Voriconazol oral, i.v. o preparación tópica*



• ANTIVIRALES

- *Aciclovir ungüento (ZOVIRAX) o sistémico*
- *Ganciclovir (VIRGAN) tópico*
- *Ganciclovir/Foscarnet i.v.*



6. ANESTÉSICOS:

- Tópicos: *Tetracaína-Oxibuprocaina*
- Regional:
 - *Lidocaína (rápido)*
 - *Mepivacaína (intermedio)*
 - *Bupivacaína (lento)*



Fármaco	Preparación	Inicio y duración del efecto	Comentario
Proparacaína	Sol 0.5%	20 seg y dura 10-15 min	Menor irritación
Oxibuprocaina	Sol 0.2%		
Tetracaína	Sol 0.5% y ungüento	1 min y dura 15-20 min	La de mayor irritación
Benoxinato	Sol 0.4%	1-2 min y dura 10-15 min	
Lidocaína	Sol 1%	1 min y dura 1-2 hrs	Efecto 2 veces □ procaína
Bupivacaína	Sol 0.5% y 0.75%	2-3 min y dura 6-10 hrs	Mayor duración de efecto

	pKa	Latencia (min)	Duración (min)	Potencia relativa
Mepivacaina	7,6	10-15	90-180	2
Lidocaína	7,9	5-10	60-120	2
Bupivacaina	8,1	20-30	180-360	8

FARMACOLOGÍA DE LOS ANTIINFLAMATORIOS EN LA PROFILAXIS POST – CIRUGÍA DE CATARATA

- *Revisión sistemática: “Prevención de la inflamación y del edema macular tras la cirugía de catarata con esteroides y AINES tópicos”*



Post-cataract Prevention of Inflammation and Macular Edema by Steroid and Nonsteroidal Anti-inflammatory Eye Drops

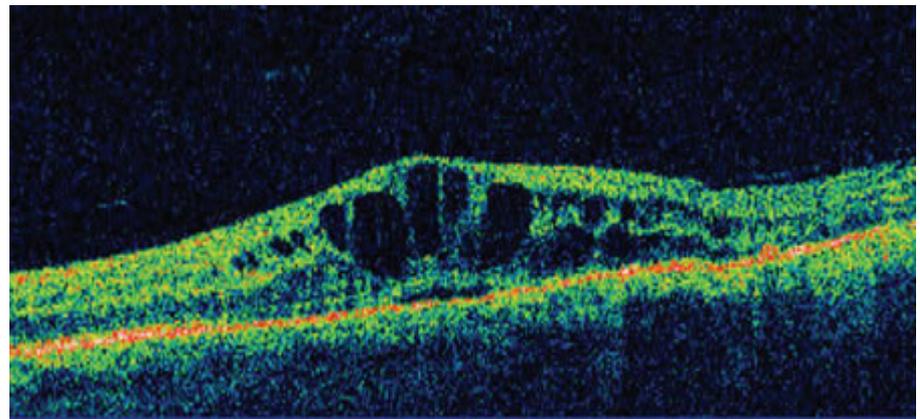
A Systematic Review

Se trata de una revisión sistemática de la literatura buscando en *Medline*, *CINAHL*, *Cochrane* y *EMBASE databases* identificando 15 estudios aleatorizados publicados del 1996 en adelante comparando corticoesteroides y AINES tópicos para el control de la inflamación y la prevención del EM Cistoide post-cirugía de catarata

IDEAS CLAVE:

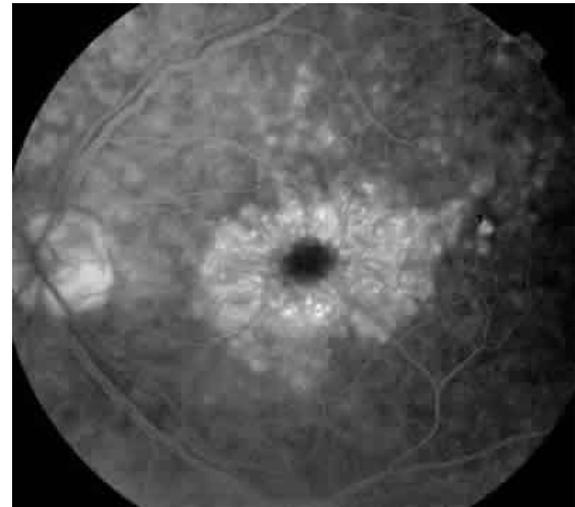
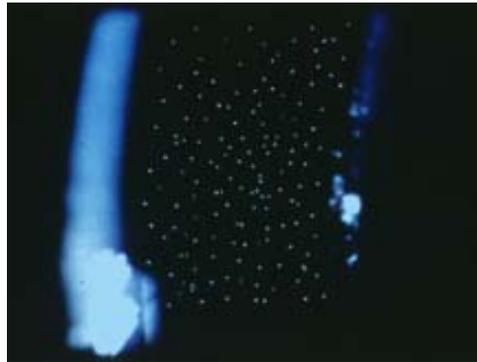
- La *inflamación* postoperatoria fue *menor* en pacientes con AINES tópicos
- La prevalencia de *EM Cistoide* fue *mayor* en pacientes con corticoides que con AINES
- *No hay diferencias estadísticamente significativas* en el número de efectos adversos en los dos grupos de tratamiento

1. Los AINES actúan inhibiendo la ciclooxigenasa, que cataliza la formación de PG y tromboxanos. **Si disminuimos la formación de PG reduciremos la inflamación.**
2. El **EM Cistoide pseudofaquico (síndrome de Irvine-Gass)** ocurre semanas-meses después de la cirugía. *Su incidencia varía de un 20 % con AGF hasta un 2% cuando solo tenemos en cuenta pérdida de AV.*
3. La mayoría de los casos de EMC es *subclínico y autolimitado*, pero puede *cronificarse*.
4. Causas:
 - Cirugía complicada
 - Utilización de análogos de PG en el tratamiento del Glaucoma
 - Uveítis
 - Trauma iridiano
 - OVR, MER
 - DVP (FP)?



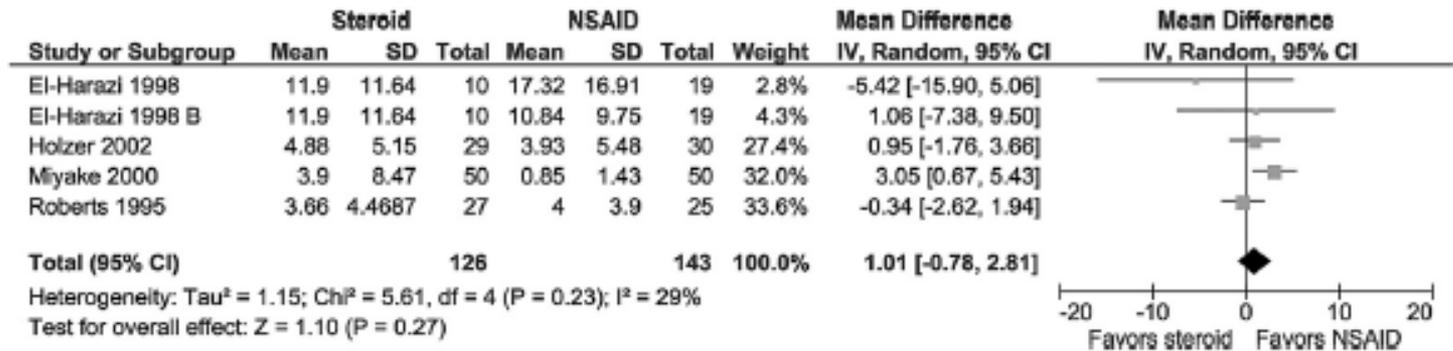
Revisión sistemática:

- Se incluyeron *todos los tipos de corticoides y todos los tipos de AINES* utilizados en postoperatorios de catarata
- No se comparó *Corticoides + AINES* frente a un tratamiento unico
- La inflamación se midió por el *número de células (tyndall) y flare en CA* a los 2-8 días postcirugía
- El EMC se midió con AGF, OCT y AV

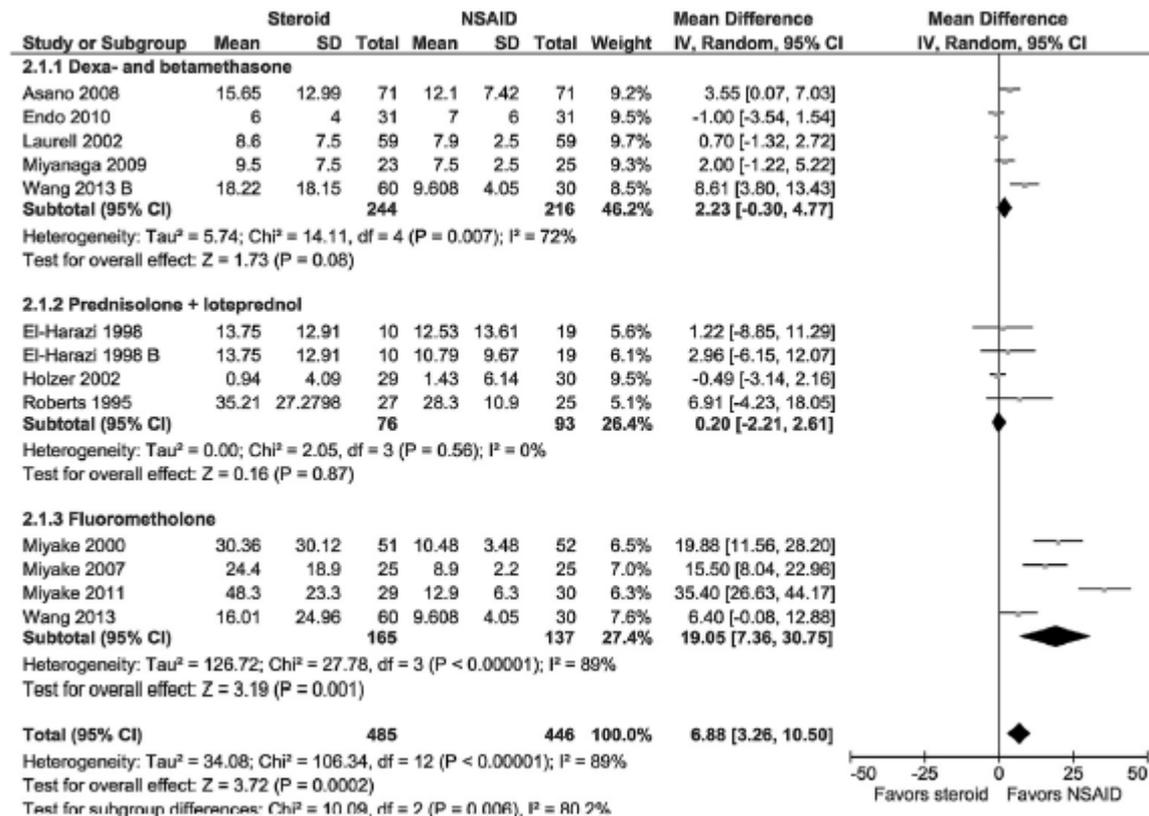


Resultados:

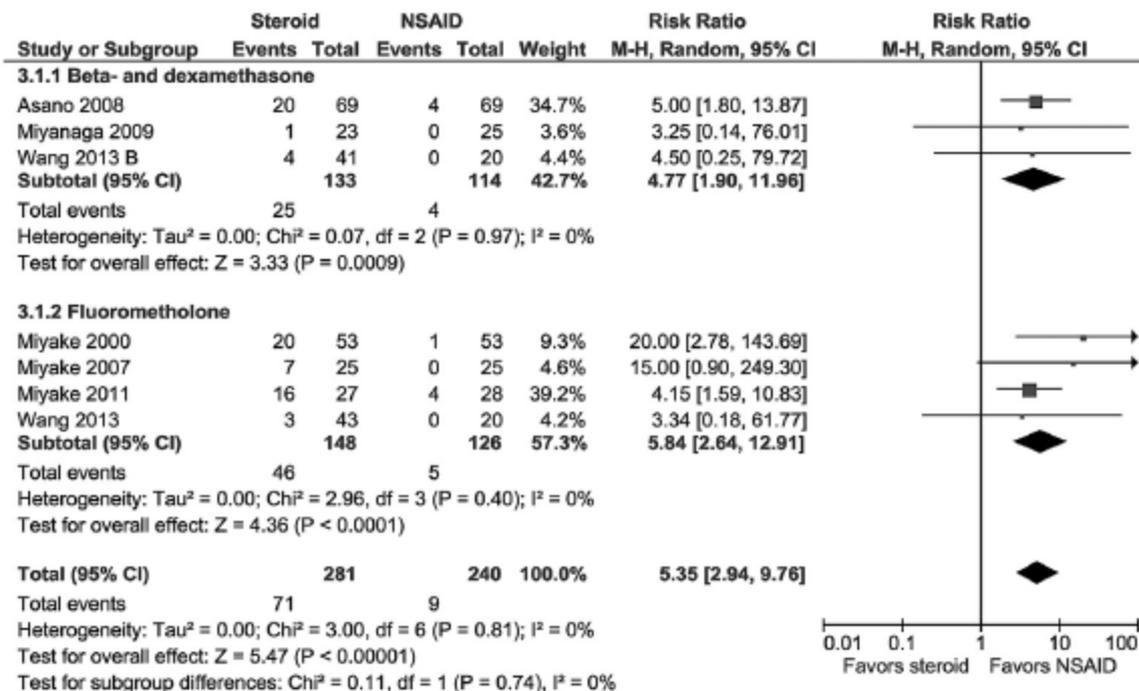
- No se encontraron diferencias significativas en el número de células a la semana postoperatoria entre pacientes con AINES y corticoides



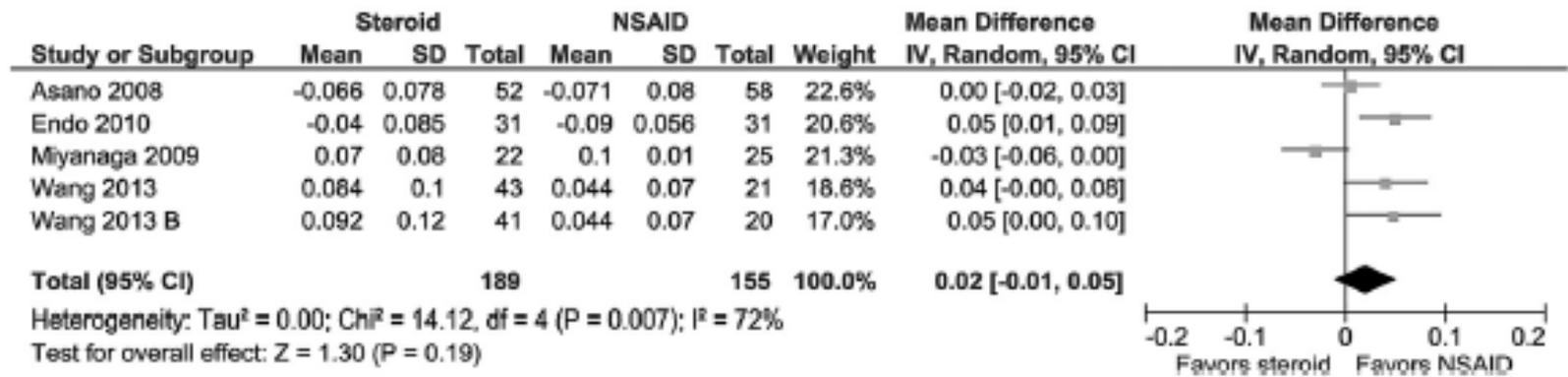
- Los esteroides de media y alta potencia (*betametasona*, *dexametasona*, *loteprednol* y *prednisolona*) no mostraban diferencias significativas con los AINES para el flare. Los esteroides de menor potencia (*fluorometolona*) si mostraban diferencias significativas con los AINES por ser menos efectivos en la reducción del flare



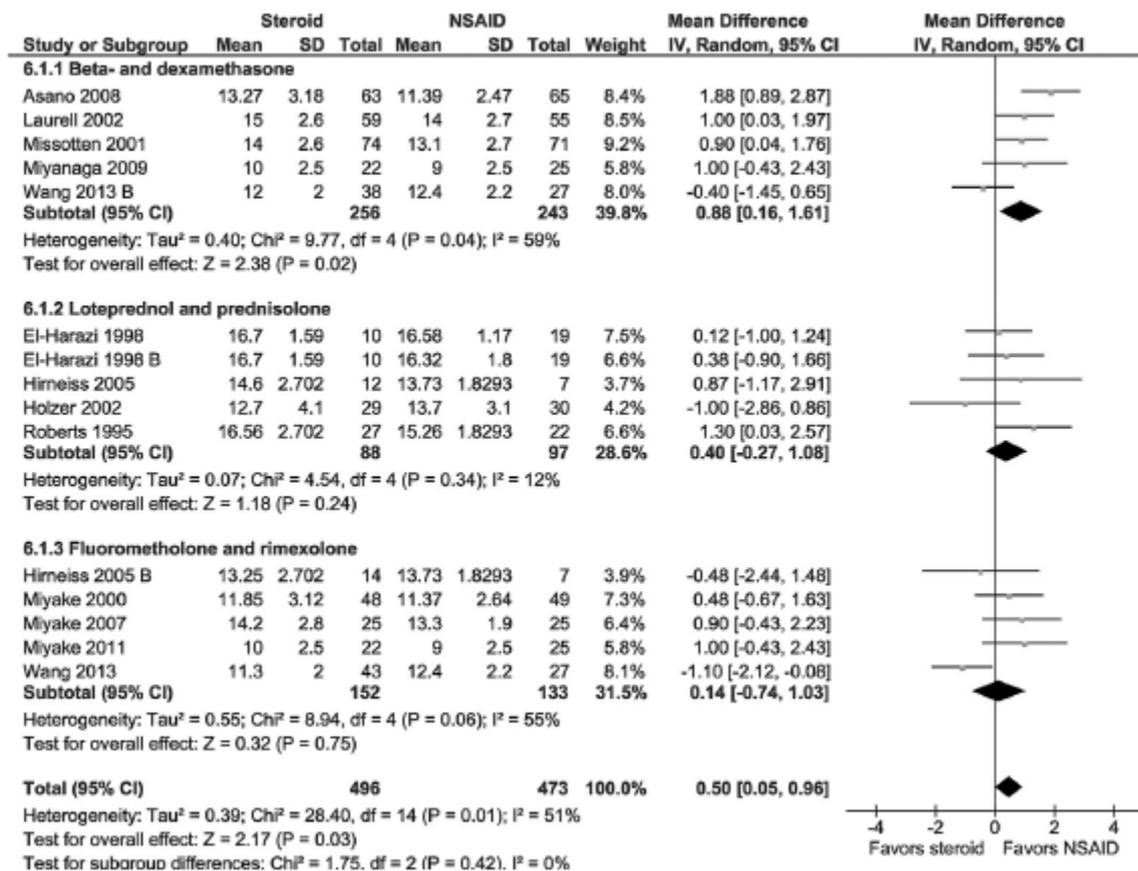
- En el grupo de corticoides, el **25,3%** de pacientes tenía **EMC** al mes frente al **3,8%** en el grupo de **AINES** (RR=5,35; IC 95%, 2,94 – 9,76)



- No se encontraron diferencias significativas en AV a las 6-8 semanas de la cirugía en los dos grupos de tratamiento (**P=0.19**)



- Hay diferencias estadísticamente significativas en las PIOs, al ser mas altas en los pacientes con corticoides si las comparamos con los que tomaron AINES



Discusión:

1. ¿Hay un mayor aumento de **queratitis en el tratamiento prolongado con AINES** en el postoperatorio de cirugía de catarata con respecto a los corticoides?
2. ¿Existen **diferencias raciales** en la respuesta a AINES/corticoides que pudieran modificar los resultados?
3. Sabemos que no existen diferencias significativas entre corticoides en función de su potencia para inflamación y EMC postoperatorio, pero **¿qué AINE es el más indicado para el postoperatorio de cirugía de catarata?**
4. **¿Cuándo empezar el tratamiento con el AINE?, sabiendo que...**
 - La inflamación se ve más reducida si se empieza el día de la cirugía o el día después.
 - La incidencia de EMC es menor si se empieza de 1 a 3 días después de la cirugía
5. No se han considerado pacientes con **retinopatía diabética**, especialmente susceptibles a un edema macular. ¿Cambiarían los resultados en estos pacientes?