



Úspěšná terapie očních onemocnění závisí nejen na účinnosti samotné léčivé látky, ale i na její schopnosti procházet fyziologickými bariérami oka a udržet se zde po dobu dostatečnou k terapeutickému účinku. Tuto skutečnost výrazně ovlivňuje aplikační forma léčiva a frekvence jeho dávkování. V terapii očních chorob se uplatňuje lokální (topická), systémová i injekční aplikace.

Konvenční léčivé přípravky určené k topické aplikaci v oblasti předních partií oka zahrnují oční kapky, oční vody a polotuhé přípravky (masti a gely). Určitou „předlékovou“ formu představují prášky pro oční kapky a vody, které po rozpuštění nebo dispergaci složek ve vhodném vehikulu (obvykle voda na injekci) poskytují vlastní přípravek. Poslední skupinu reprezentují oční inserty, které představují oční terapeutické systémy s prodlouženým nebo modifikovaným uvolňováním. Ke klasickým očním přípravkům jsou v tomto článku přiřazeny také oční injekce a implantáty; obě tyto skupiny jsou lékopisně začleněny mezi parenterální přípravky (1).

Oční kapky

Oční kapky jsou sterilní vodné, případně olejové roztoky, emulze nebo suspenze. Baleny jsou do vzduchotěsných zabezpečených obalů, které jsou upraveny pro jednorázovou nebo opakovanou aplikaci. Kromě léčivé látky obsahují řadu pomocných látek k úpravě osmotických vlastností, viskozity, hodnoty pH, chránících před účinkem kyslíku (antioxidanty) a mikrobiální kontaminací (protimikrobní látky). U disperzních soustav je navíc nutné přidat látky stabilizující disperzní stav (viskozitní přísady, tenzidy).

Pokud jsou léčivé látky omezeně rozpustné ve vodě, používají se ve formě suspenze. Po aplikaci se suspendované částice kumulují v slzném vaku, odkud se postupným rozpouštěním uvolňují. Dochází tak nejen

k prodloužení účinku, ale také ke snížení nežádoucích účinků, protože léčivo se dostává do slzné tekutiny a tkáně postupně a v nižší dávce. Celková doba účinku se ale obtížně predikuje a kontroluje. Protože rohovka je silně inervovaná tkáň, musí být velikost částic v suspenzích pečlivě sledována. Je známo, že částice o velikosti 30–40 μm způsobí mechanické podráždění oka a jsou rychle odplaveny reflexně vyvolaným slzením, což snižuje biodostupnost léčiva. Velikost částic navíc také ovlivňuje fyzikální stabilitu přípravku. Lékopisem stanoveným postupem se mikroskopicky hodnotí přítomnost částic větších než 25 μm , jejichž počet je limitován. Pokud jsou však částice velmi malé, jsou odplaveny stejně rychle jako roztoky. Jako optimální se jeví velikost částic 10 μm (1, 2, 3). Příkladem úspěšně formulované komerčně dostupné suspenze s vysokou stabilitou, sníženými vedlejšími účinky a prodlouženým účinkem léčiva je Betoptic® S s obsahem betaxolol hydrochloridu, který je navázán na iontovýměnnou pryskyřici. Léčivo se po aplikaci postupně uvolňuje výměnou za sodné ionty slzní tekutiny. Viskozita je zvýšena přidávkou carbomeru, který svými mukoadhezivními vlastnostmi prodlužuje kontakt léčiva s povrchem oka a fyzikálně stabilizuje suspenzi (4).

Zástupcem emulzních očních kapek je přípravek Ikervis®, olejové emulzní kapky s obsahem ciclosporinu k terapii závažné keratitidy u pacientů se syndromem suchého oka, kde terapie umělými slzami nebyla úspěšná (5). Obecně lze však říci, že emulzní přípravky jsou využívány zřídka. Výjimkou jsou emulzní přípravky, které se objevily v poslední době a ve kterých jsou kapénky vnitřní fáze velmi malé (nanometry). Tyto nanoemulze obsahují kladně nabitě tenzidy a díky tomu vzniká iontová interakce se záporným nábojem mucinové vrstvy. Příkladem jsou kapky Cationorm® nebo Retaine MGD™ k terapii syndromu suchého oka (6).