



I přes nevýhody nízké biodostupnosti léčiv (absorbováno je průměrně méně než 5 % léčiva) a nutnosti časté aplikace (pulzní profil účinku léčiva), patří oční kapky (především vodné roztoky) mezi nejoblíbenější topické oční přípravky. Jejich formulace je relativně jednoduchá, stejně jako výroba a většina pacientů nemá problémy s jejich aplikací. I tak je ale pacienty nutné o správné aplikaci při výdeji náležitě poučit. Zvýšení biodostupnosti může podpořit i pacient, pokud po aplikaci kapky zavře oko a provede na několik málo minut nasolakrimální okluzi (stažení slzných kanálků prsty). Výrazně se tak sníží odplavení přípravku z oka reflexním mrkáním a slzní drenáží. Nasolakrimální okluze se ale nedoporučuje pacientům trpícím syndromem suchého oka (2).

Polotuhé oční přípravky

Masti i gely prodlužují mnohonásobně kontaktní čas léčiva s rohovkou a zvyšují tak významně biologickou dostupnost. Technologicky se jedná o jednofázové přípravky, pokud je léčivo v základu rozpuštěné, nebo vícefázové přípravky, pokud je léčivo suspendováno nebo emulgováno. Mastovými základy bývají kombinace bílé vazelíny, tekutého a tvrdého parafínu, tuku z ovčí vlny, cetylalkoholu, cholesterolu nebo dalších emulgátorů. Vzhledem k citlivosti rohovky musí být základ pro aplikaci, tj. při 32 °C, měkký a dobře roztíratelný po povrchu oční bulvy (2).

Nevýhodou očních mastí je změna ostrosti vidění po aplikaci, variabilita aplikované dávky, která souvisí s obtížemi při aplikaci dávky, a riziko blokády slzných kanálků. Odstranění některých výše zmíněných nedostatků poskytuje aplikace gelových přípravků, jejichž základy tvoří hydrofilní polymery; výhodné jsou zejména polymery s mukoadhezivními vlastnostmi. Mukoadhezivní polymery vykazují adhezi na mucinovou

vrstvu oka díky různým fyzikálním a chemickým mechanismům, jako je například tvorba iontové vazby, tvorba vodíkových můstků nebo van der Waalsových vazeb, prolínání řetězců polymeru a mucinu atd., a tím zajistí prodloužení kontaktu s rohovkou a spojivkou. Vodné roztoky mukoadhezivních látek se pomalu rozpouštějí a jsou odplavovány slzami. Léčivé látky zůstávají v oku, dokud se mucinová vrstva neobnoví nebo přípravek není odstraněn mrkáním. Tím se zlepšuje biodostupnost a snižují se vedlejší účinky. Nejčastěji používanými polymery jsou deriváty celulózy (hypromelóza, methylcelulóza), polyvinylalkohol, karbomery a kyselina hyaluronová, která má navíc kromě lubrikačních vlastností i hojivý efekt (7, 8, 9). I gelové systémy vykazují určité nevýhody, z nichž jmenujme např. zvýšení odporu při pohybu očních víček, tvorbu krust a depozit, slzení a ovlivnění zrakového vnímání. Podobně jako u mastí bývá i dávkování variabilní. Jsou však obvykle měkčí, a navíc rohovku hydratují.

Novější přístup k úpravě viskozity očních přípravků je in situ gelace, kdy ke zvýšení viskozity dojde až po aplikaci na rohovku. V přípravku, který má povahu vodného roztoku s normální, případně jen velmi mírně zvýšenou viskozitou, se použijí takové polymerní látky, které vykazují fázovou změnu sol-gel. Během krátké doby po aplikaci přecházejí z kapalného stavu (sol) na vysoce viskózní gel, který vytváří na povrchu rohovky depo léčiva. K tomuto přechodu dochází vlivem teploty (methylcelulóza, poloxamer, xyloglukan), změnou pH (karbomery, polykarbofil) nebo reakcí s fyziologickými mono- a divalentními ionty (gelanová klovatina, alginát sodný). Výhodou je snazší zpracování, aplikace a dávkování přípravku (10). Komerční příklady zahrnují přípravek k terapii glaukomu Rysmon TG® nebo Timoptic-XE®, oba obsahují timolol, Visine unavené