



# **Produtos estéreis: colírios**

Profa. Dra. Vladi Olga  
Consiglieri

Farmacotécnica FBF 341

---

# Colírios

- Definição

- São formas farmacêuticas estéreis destinadas ao tratamento de afecções do globo ocular, incluindo pálpebras, conjuntiva e córnea, ao preparo pré-operatório, para fins diagnósticos ou à limpeza do globo ocular.

- Colírios

- Soluções, suspensões e pomadas

# Colírios

- Soluções empregadas com finalidade de limpeza e manutenção de lentes de contato devem apresentar os mesmos requisitos exigidos para colírios.
- As formas líquidas instiladas são rapidamente eliminadas pelas lágrimas, tendo ação bastante fugaz e obrigando a repetidas aplicações.

# Você sabia que...

- ...O volume normal dos fluidos oculares é de 10  $\mu\text{L}$  e o volume de uma gota é de 25 a 50  $\mu\text{L}$ ? Portanto, muito da dose administrada é perdida.
- ...Quando muito, o tempo de contato entre um colírio e o globo ocular é de 5 minutos?
- ...Quando se deve administrar mais de uma gota deve-se esperar pelo menos 5 minutos entre a primeira e segunda gotas?
- ...Que a instilação de colírios é feita no saco conjuntival?

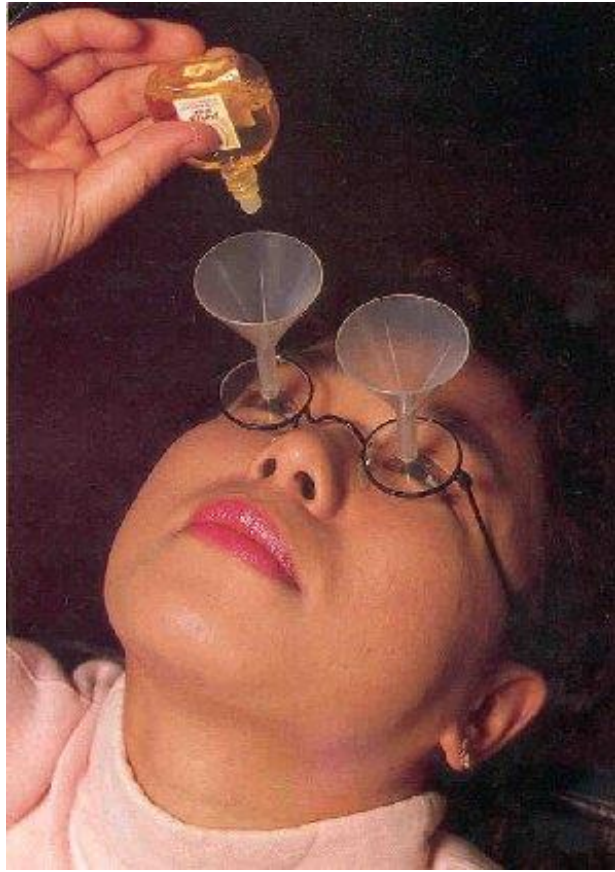
# Administração



**Gotas**

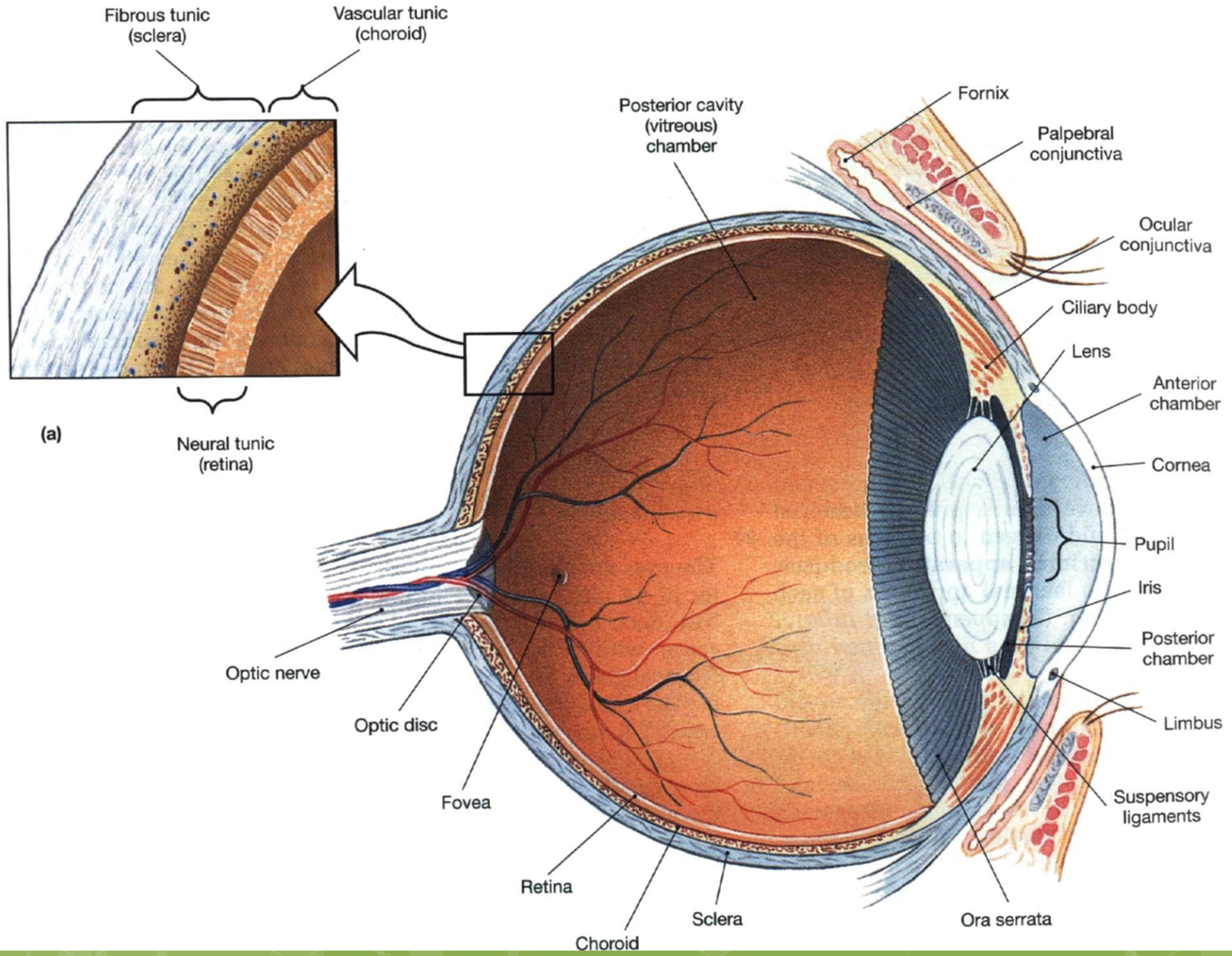


**Pomada**



# Anátomo-fisiologia do olho

- Principais estruturas:
  - Córnea
  - Conjuntiva
  - Glândulas lacrimais





# Anátomo-fisiologia do olho

- **Córnea:** membrana que reveste o globo ocular, pouco irrigada, mas muito enervada e, portanto, muito sensível a estímulos dolorosos.
- **Conjuntiva:** membrana que reveste externamente a córnea e internamente as pálpebras. Bastante vascularizada, permitindo a absorção e eliminação de fármacos e também rica em elementos mucosos.
  - A **conjuntiva** é responsável pela formação de um **filme aquoso** composto de mucopolissacarídeos, que se renova constantemente e pela manutenção da umidade do globo ocular.

# Anátomo-fisiologia do olho

- A **lágrima** é um líquido viscoso (coloidal), composto por proteínas e eletrólitos que banha o epitélio de revestimento com fim de proteção e lubrificação (Contém lisozima)
- O contato de materiais estranhos no epitélio estimula o aumento na produção de lágrimas para remoção do agente irritante para as fossas nasais.

# Anátomo-fisiologia do olho

- A **absorção** se processa pela conjuntiva e depende:
  - **Solubilidade** dos fármacos (lipo e hidro);
  - **Permeabilidade** do fármaco pelas membranas;
  - **pH e sistema tampão**;
  - **Concentração** do fármaco no colírio;
  - Presença de **estímulos irritantes** (ex. Falta de isotonia ou pH fora da faixa ótima)

# Requisitos dos colírios

- Esterilidade
- Limpidez (soluções)
- Isotonia:
  - a lágrima tem tonicidade = solução de NaCl 0,9%
  - o olho tolera tonicidade entre 0,6 a 1,8% de NaCl.
- pH:
  - Tolerância pelos tecidos e mucosas:
    - Nos olhos: pH de 4,5 a 11,5 (sem ardor de 5,5 a 11)
- Uniformidade (pomadas e suspensões)
- Estabilidade

# Composição dos colírios

## ◉ Adjuvantes

- ◉ Conservantes
- ◉ Agentes estabilizantes:
  - ◉ Anti-oxidantes
  - ◉ Quelantes de metais
- ◉ Corretivos de pH
- ◉ Corretivos da isotonia
- ◉ Agentes doadores de viscosidade

# Composição dos colírios

## ○ Conservantes

- Cloreto de benzalcônio de 0,004 a 0,02% (geralmente a adição de EDTA de 0,01 a 0,1%, aumenta sua atividade)
- Cloreto de benzetônio 0,01% (mais ativo em pHs maiores que 7)
- Clorobutanol 0,5% (geralmente a eficácia é aumentada com adição de 0,5% de feniletanol)
- Parabenos: metil (0,015 a 0,05%), propil (0,005 a 0,01%): ativos em pH de 4 a 8

# Composição dos colírios

## ○ Agentes estabilizantes

### ○ Anti-oxidantes

- Sulfito e metabissulfito de sódio;
- Tiouréia;
- Ácido ascórbico.

### ○ Quelantes de metais

- EDTA e ácido cítrico

### ○ Corretivos de pH e tampões

# Composição dos colírios

## ○ Tampões usados em oftalmologia

- Solução tampão de Palitzsch: ácido bórico/borato de sódio
- Solução tampão de ácido bórico/acetato de sódio
- Solução tampão de Sorensen (ou fosfato): fosfato de sódio/difosfato de sódio
- Solução tampão de Atkin e Pantin: ácido bórico/carbonato de sódio



# Composição dos colírios

- **Corretivos da isotonia:** NaCl, dextrose, e ácido bórico
- **Agentes doadores de viscosidade:** adicionados para permitir maior tempo de contato com a mucosa:

## *Concentração máxima*

Hidroxietilcelulose	0,8%
Hidroxipropilcelulose	1,0%
Metilcelulose	2,0%
Álcool polivinílico	1,5%
Polivinilpirrolidona	1,7%

# Composição dos colírios

- Veículos

- Solução isotônica de cloreto de sódio

Cloreto de sódio.....0,9 g

Cloreto de benzalcônio..... 1:10.000

Água estéril.....qsp..... 100 mL

- Solução de ácido bórico

Ácido bórico.....1,9 g

Cloreto de benzalcônio..... 1:10.000

Água estéril .....qsp.....100 mL

# Composição dos colírios

- Sistema tampão com quelante

Fosfato ácido de sódio.....0,560 g

Fosfato dissódico.....0,284 g

Cloreto de sódio..... 0,5 g

EDTA dissódico.....0,1 g

Cloreto de benzalcônio..... 1:10.000

Água estéril.....qsp..... 100 mL

# Colírios - suspensões

- As **suspensões oftálmicas** são planejadas quando:
  - Se quer aumentar o tempo de contato entre o fármaco e a mucosa
  - Promover a ação por mais tempo
  - O fármaco é insolúvel no veículo desejado
  - O fármaco é instável na forma de solução

# Colírios - suspensões

- As **suspensões** têm como requisitos, além daqueles exigidos para solução
  - Tamanho de partícula em torno de 10  $\mu\text{m}$  (micronizadas)
  - Distribuição homogênea e de fácil ressuspensão
  - Não deve tender a formar agregados de maiores dimensão de partículas

# Colírios

- Preparação dos colírios aquosos:
  - Dissolução ou dispersão
  - Filtração
  - Acondicionamento: vidros Tipo I ou plástico
  - Esterilização
  - Controles: teor, esterilidade, isotonia, limpidez (soluções)

# Preparo dos colírios líquidos aquosos



## Controles

- Teor
- Esterilidade
- Isotonia
- Limpidez
- pH

# Colírios - pomadas

- As **pomadas** oftálmicas são planejadas quando:
  - Se quer aumentar o tempo de contato entre o fármaco e a mucosa
  - Promover a ação por mais tempo
  - Quando o fármaco é instável em veículo aquoso



# Colírios - pomadas

- Preparação das pomadas:
  - São fabricadas com componentes esterilizados sob condições de assepsia ou esterilizados depois da fabricação
  - Bases lipofílicas: vaselina branca ou lanolina
  - O fármaco é adicionado na forma de solução ou pó finamente dividido (micronizado)

# Colírios

- Fármacos veiculados no colírios:
  - Antibióticos: cloranfenicol, ciprofloxacino
  - Antissépticos: cloreto de benzalcônio
  - Alcalóides: pilocarpina, atropina
  - Agentes de diagnóstico: corantes
  - Anestésicos: benzocaína, xilocaina

# Colírios

## ○Acondicionamento

