

# Preparados nasales y óticos

---

TEMA 16

*Calvo B, Esquisabel A, Hernández R, Igartua M*  
Tecnología Farmacéutica: Formas Farmacéuticas

## **Preparados nasales**

- Definición y uso
- Tecnología
- Acondicionamiento
- Control

## **Preparados óticos**

- Definición y uso
- Tecnología
- Acondicionamiento
- Control

**Preparados líquidos, semisólidos o sólidos con uno o más principios activos de administración en la cavidad nasal para ejercer un efecto local o sistémico**

- No ser irritantes ni alterar la mucosa nasal
- Generalmente isotónicos
- Pueden llevar: viscosizantes, sustancias para ajuste pH, solubilizantes, estabilizantes

**Efecto local**: descongestivos, vasodilatantes, corticoides tópicos, antibióticos antihistamínicos (tratamiento de la rinitis primaveral)

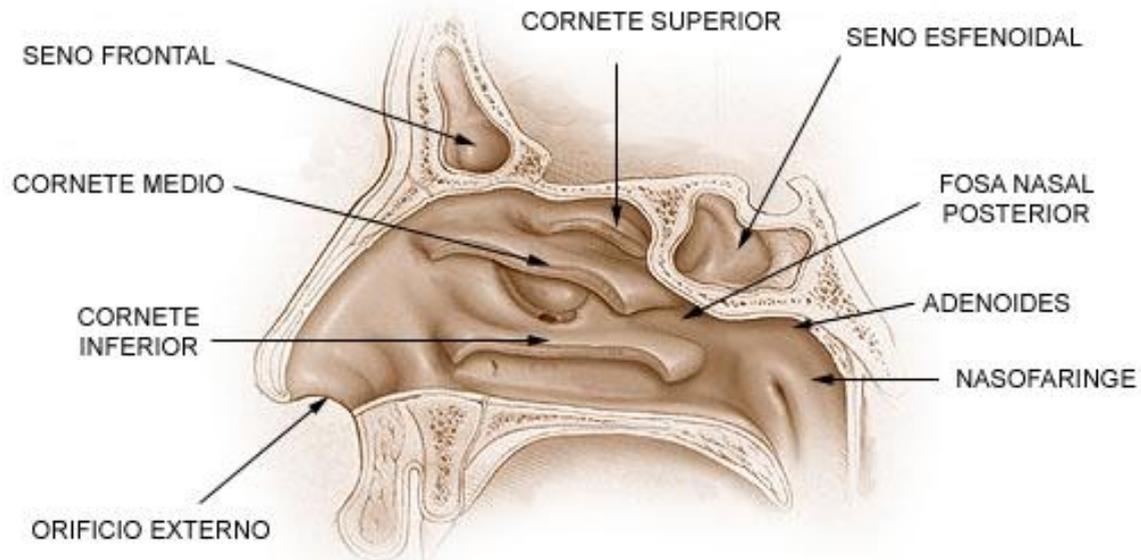
**Efecto sistémico**: péptidos y proteínas (oxitocina, calcitonina, análogos LHRH)

- Absorción rápida (muy vascularizada)
- No degradación enzimática; no efecto de primer paso

## Tipos de preparados nasales

- Gotas nasales y pulverizaciones (sprays) líquidos
- Polvos nasales
- Preparaciones nasales semisólidas
- Líquidos para lavados nasales
- Barritas nasales

## NARIZ Y CAVIDADES NASALES



[Rage](#). Imagen de dominio público.

[http://es.wikipedia.org/wiki/Fosa\\_nasal#/media/File:Illu\\_nariz\\_y\\_cavidades\\_nasales.jpg](http://es.wikipedia.org/wiki/Fosa_nasal#/media/File:Illu_nariz_y_cavidades_nasales.jpg) (consultada el 05-05-15).

**Las gotas y sprays nasales son soluciones, emulsiones o suspensiones destinadas a su instilación o nebulización en la cavidad nasal**

- **Gotas nasales:** Generalmente se presentan en envases multidosis con un aplicador adecuado.
  - **Sprays nasales:** El envase lleva un pulverizador
- 
- La composición es similar a la de los colirios
  - La mucosa nasal es menos sensible y frágil que la mucosa ocular.
    - pero posee menos mecanismos de defensa que la mucosa ocular

Los **componentes** deben ser **compatibles** con la membrana de la **mucosa nasal**:

- Soluciones isotónicas o ligeramente hipertónicas
- **pH** entre **6,5 y 8,3** (no alterar el movimiento ciliar) (Los tampones borato son tóxicos para los cilios. Más adecuados los tampones fosfato y Sistema TRIS)
- **Cosolventes**: etilenglicol, propilenglicol (< 10 %, si no tóxicos); adicionar glucosa.
- **Viscosizantes**: NaCMC, HPC, gelatina, PVP
- **Conservantes**: cloruro de benzalconio o borato de fenilmercurio
- **Antioxidantes**
- **Potenciadores de la absorción**: tensioactivos, susts. bioadhesivas (carbopol, quitosano)
- **Tensioactivos**: aumentan la humectación de las partículas

## Principios activos:

- **Vasoconstrictores, descongestivos** (fármacos adrenérgicos): efecto rebote
- **Uso de antibióticos restringido:** neomicina → tratamiento rinitis bacteriana
- Fármacos que **alteran el movimiento ciliar:** antihistamínicos

Disolución → Filtración → Llenado de envases → Esterilización

Importante → No alterar la función ciliar / Estabilidad / Esterilidad

## Esterilidad

- Cualquier preparado farmacéutico → baja carga bacteriana
- Fragilidad de la mucosa nasal
- Posibilidad de introducir gérmenes extraños en el proceso infeccioso
  - Conservantes

Gotas nasales : filtración esterilizante

# Gotas nasales

## 1. Efecto local

- Antisépticos: cloruro de benzalconio, sales de Ag, ácido benzoico y sus sales, chlorhexidina, resorcina, derivados vegetales (eucaliptol, lavanda, esencia de pino)
- Antibióticos: neomicina, polimixina B, bacitracina
- Sulfamidas: sulfanilamida, Dioctil sulfosuccinato Na
- Vasoconstrictores: efedrina, fenilefrina, oximetazolina
- Anestésicos locales: clorbutanol, lidocaína
- Otros fármacos: antihistamínicos (feniltoloxamina), corticoides

# Gotas nasales

## 2. Efecto sistémico

- Immunoterapia: lisados bacterianos
- LH-RH agonistas: buserelina
- GnRH análogos: nafarelina
- Análogos de la vasopresina : desmopresina

# Sprays nasales

## 1. Efecto local

Vasoconstrictores y corticosteroides

- Rinitis estacional: dipropionato de beclometasona, acetónido de triamcinolona, budesonida
- Alergias o inflamación nasal : dexametasona

# Controles de las gotas nasales

1. Uniformidad de masa
2. Uniformidad de contenido
3. Uniformidad de la dosis liberada (sprays)
4. Esterilidad
5. pH
6. Osmolaridad

## 1. Uniformidad de masa

### Para soluciones

- Pesar 10 envases : P1
- Vaciar el contenido completamente y pesar el envase vacío (después de lavar y secar): P2
- Calcular el contenido: P1-P2
- Calcular el peso medio

### Resultado:

- En **10 envases**, como máx. 2 pueden desviarse  $\pm 10\%$  del peso medio, ninguno puede desviarse  $\pm 20\%$  del peso medio.

## 2. Uniformidad de contenido (F.E. 2.9.6)

- Sólo para emulsiones y suspensiones
- Calcular el contenido del fármaco en 10 envases tomados al azar utilizando un método analítico adecuado

### Resultado (test B)

#### Cumple el ensayo

- Como máximo un contenido está fuera del límite 85-115% del valor medio y
- Ninguno de los contenidos excede el 75-125 % → continua sig. diapositiva

#### No Cumple el ensayo

- Más de 3 contenidos individuales están fuera del 85-115% del valor medio o si
- Uno de los contenidos está fuera del 75-125 %

## **Uniformidad de contenido (F.E. 2.9.6)**

### **Resultado (test B) (continuación)**

- Si 2 ó 3 contenidos individuales están fuera del 85-115%, pero dentro del 75-125 %, calcular el contenido de otros 20 envases.

### **Cumple el ensayo**

- No más de 3 contenidos individuales de los 30 envases están fuera del 85-115% y ninguno está fuera del 75-125 %

### **3. Uniformidad de la dosis liberada (sprays)**

- En los sprays nasales se realizan varias pulverizaciones y se recoge el contenido descargado en un dispositivo adecuado.
- Se calcula el contenido recogido y se realiza el cálculo para ver si cumple o no.

1. Siéntese e incline la cabeza hacia atrás. Si se trata de gotas, conviene que se coloque en posición tumbada.
2. Introduzca el nebulizador en uno de los orificios nasales. Si se trata de un cuentagotas, procure que no toque la nariz. Tape con un dedo el otro orificio nasal, mediante presión lateral.
3. Sin inspirar, apriete la pera del cuentagotas (con el fin de instilar el número exacto de gotas) o presiones el nebulizador una sola vez y de forma rápida, pero sin excesiva fuerza.
4. Inspire ligeramente, sin provocar el paso del líquido a la garganta.
5. Repita el procedimiento en el otro orificio nasal.
6. Mantenga la cabeza inclinada hacia atrás durante unos minutos para evitar que el producto sea inspirado por los pulmones. Respire por la boca y procure no sonarse durante este tiempo.



## Polvos nasales

Polvos destinados a su administración nasal utilizando un dispositivo adecuado (Deben tener un tamaño de partícula adecuado)

- El tamaño de partícula es el necesario para que se deposite en la cavidad nasal. Se debe verificar mediante un método adecuado de determinación del tamaño de partícula.

### Control

- Finura del polvo (F.E. 2.9.12) u otro método adecuado

## Lavados nasales

Soluciones acuosas generalmente isotónicas para el lavado de la cavidad nasal

- Deben ser estériles si se utilizan en heridas u operaciones quirúrgicas

### Control

- Masa o volumen liberado (F.E. 2.9.28)



Jalaneti .Publicada en Wikimedia Commons con licencia Creative Commons  
Genérica de Atribución/Compartir-Igual 3.0

[http://en.wikipedia.org/wiki/Nasal\\_irrigation#/media/File:Jalaneti.JPG](http://en.wikipedia.org/wiki/Nasal_irrigation#/media/File:Jalaneti.JPG)

(consultada el 5-05-2015)

## Barritas nasales

### Preparaciones sólidas destinadas para aplicación local

- Barritas o preparaciones cónicas que contienen una o varias sustancias activas solas o bien disueltas o dispersas en una base adecuada.
- Pueden disolverse o fundir a temperatura corporal



Imagen: Calvo Hernández, B.

## Solución salina (nasal)

Cloruro sódico	650 mg
Fosfato potásico monobásico	40 mg
Fosfato potásico dibásico	90 mg
Cloruro de benzalconio	10 mg
Agua para inyección	c.s.p. 100 mL



Robin. Publicada en Wikimedia Commons con licencia Creative Commons Genérica de Atribución/Compartir-Igual 3.0 [http://en.wikipedia.org/wiki/Nasal\\_spray#/media/File:Action\\_photo\\_of\\_nasal\\_spray\\_on\\_a\\_black\\_backgrounGotas\\_nasales\\_d.jpg](http://en.wikipedia.org/wiki/Nasal_spray#/media/File:Action_photo_of_nasal_spray_on_a_black_backgrounGotas_nasales_d.jpg). (consultada el 5-05-2015)

## Spray nasal

Imagen: Calvo Hernández, B.

## Acondicionamiento

- Vidrio
- Plástico
  - Fijación de conservantes
  - Evaporación de la solución
  - Permeabilidad al O<sub>2</sub>

Es más recomendable la nebulización

Volumen: 15 – 20 mL

Validez: 12 días

---

# Formas óticas

## **Preparados líquidos, semisólidos o sólidos para instilación, pulverización o aplicación en el conducto auditivo**

- Los preparados para aplicación en el oído lesionado (si está perforado el tímpano) o antes de una intervención quirúrgica son estériles, no llevan conservantes y se presentan en envases unidosis.

El **dispositivo de administración** → está diseñado para evitar la introducción de contaminantes

## Tipos de preparados óticos

- Gotas y sprays óticos
- Preparados óticos semisolidos
- Polvos óticos
- Lavados óticos

## Fármacos:

- Antibióticos, antisépticos, anestésicos locales, corticoides



Imagen: Calvo Hernández, B.



[Imagen de dominio público.](#)

<http://spd3eso-elsistemaauditivo.wikispaces.com> (consultada el 10-05-15).

# Gotas óticas

**Soluciones, emulsiones o suspensiones de uno o más p.a. en líquidos adecuados para aplicación en el conducto auditivo**

- **Fármacos**

Antibióticos, antisépticos sólo o con corticoides o con anestésicos locales

- **Vehículo**

Agua (purificada), glicerol, propilenglicol, aceites

- **Excipientes**

Viscosizantes: metilcelulosa

Ajuste de pH

Isotonizantes

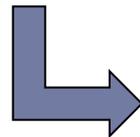
Humectantes (facilitan el contacto con el conducto auditivo)

## Los preparados óticos deben ser **estériles**:

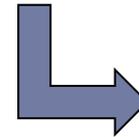
- Si se administran en el oído lesionado (ej. tímpano perforado)
- Si se usan previamente a una intervención quirúrgica
- Sin conservantes
- Si están envasados en envases unidosis

## Preparación de las formas óticas

Mezclado de los componentes



Llenado de envases



Esterilización  
(si es necesaria)



Imagen: Calvo Hernández, B.

## Acondicionamiento de las formas óticas

- Frascos cuentagotas de vidrio o plástico
- 10 mL
- Los envases multidosis llevan conservantes



Imagen: Calvo Hernández, B.

## Preparados semisólidos óticos

- Destinados a su aplicación en el conducto auditivo externo
- Su envase lleva un aplicador adecuado

## Polvos óticos

- Deben cumplir los requisitos de los polvos de aplicación cutánea

## Soluciones óticas de lavado

- Para lavado del conducto auditivo externo
- El pH debe estar en límites fisiológicos
- Si se aplican en partes dañadas o antes de intervenciones →estériles
- **Vehículo:** glicerina
- **Tensioactivos:** polisorbatos

# Controles de preparados óticos

- Contenido de principio activo
- pH
- Tamaño de partícula (en suspensiones)
- Esterilidad (si es necesario)
- Peso o volumen liberado (en soluciones de lavado óticas)

## En preparados unidosis:

- Uniformidad de contenido (si p.a. < 2 mg ó < 2% del peso)
- Uniformidad de peso (si no se realiza en ensayo anterior)

## Ej. Preparado óptico

### Mezcla ácido bórico/etanol

Ácido bórico	5 g
Etanol 70°	c.s.p. 100 mL

**Antiséptico en otitis externa**

Administración : 2-3 gotas, una o más veces / día



Imagen: Calvo Hernández, B.

1. Lavar el pabellón auditivo con una toallita húmeda y secar
2. Lavarse bien las manos
3. Atemperar las gotas a temperatura próxima a la corporal
4. Si las gotas son una suspensión turbia, agitar el envase
5. Probar el funcionamiento del cuentagotas
6. Cargar el cuentagotas con el medicamento o colocar el envase boca abajo
7. Estirar la oreja afectada o inclinar la cabeza
8. Evitar el contacto del cuentagotas con la oreja
9. Administrar la cantidad adecuada en la oreja. Tapar el oído a continuación para evitar que las gotas se pierdan
10. Mantener la cabeza inclinada durante unos minutos o tapar el oído con un algodón
11. Colocar el cuentagotas o el tapón en el envase para cerrarlo