

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

PILOCARPINA CLORHIDRATO

- Formula Molecular:** $C_{11}H_{16}N_2O_2 \cdot HCl$
- Peso Molecular:** 244,72
- Datos Físico-Químicos:** Polvo cristalino, blanco o casi blanco, o cristales incoloros, higroscópico. Muy soluble en agua y en etanol al 96 %. Rotación específica: (+89,0°) - (+93,0°). Punto de fusión: aprox. 203 °C.
- Propiedades y usos:** Se trata de un parasimpaticomimético de acción directa, con los efectos muscarínicos de la acetilcolina.
Las semividas de eliminación descritas son de 0,76 y 1,35 h después de la administración oral de dosis de 5 y 10 mg del hidrocloreuro, respectivamente. La inactivación de la pilocarpina se supone que tiene lugar en la sinapsis neuronal y probablemente en el plasma. La pilocarpina y sus metabolitos inactivos, incluido el ácido pilocárpico, se excretan por la orina.
Instilado en el ojo, produce una miosis al cabo de 10 – 30 min con una duración de 4 – 8 h, mientras que la máxima reducción intraocular ocurre a los 75 min, persistiendo generalmente 4 – 14 h.
Es el agente de primera elección cuando se pretende reducir la presión intraocular en el tratamiento del glaucoma de ángulo abierto, administrándose normalmente con agentes adrenérgicos o betabloqueantes tópicos. También se usan sistemas de liberación controlada insertados en el caso conjuntival, y geles oftálmicos.
Puede emplearse como parte de la terapia de emergencia en ataque agudos de glaucoma de ángulo cerrado, antes de la intervención quirúrgica.
Su capacidad miótica puede utilizarse para antagonizar los efectos de midriáticos y ciclopléjicos, y en cirugía ocular.
Además se usa por vía oral en el tratamiento de la xerostomía.
Así mismo, se ha empleado por vía tópica en solución en casos de alopecia y psoriasis.
- Dosificación:** Vía oftálmica, en colirios al 0,1 – 10 % o en geles al 4 %.
Vía oral, a la dosis de 15 – 30 mg/día para la xerostomía.
- Efectos secundarios:** Puede producir visión borrosa, cambios en la visión próxima o lejana, y dolor ocular. En ocasiones después de su instilación ocular se ha observado irritación, cefalea y signos de absorción sistémica como náuseas, vómitos, diarrea, sudoración, y temblor.
- Contraindicaciones:** Contraindicado en aquellos casos en que no sea deseable una constricción pupilar, como en casos de iritis aguda, uveítis aguda o anterior, y algunas formas de glaucoma secundario.
- Precauciones:** La terapia con mióticos de larga duración debe ser interrumpida quirúrgicamente, porque existe un alto riesgo de hipema.

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Debe administrarse con extrema precaución en individuos con historial de desprendimiento de retina y en pacientes jóvenes con miopía.

Debido a la dificultad de adaptación a la oscuridad, no se aconseja durante el tratamiento la conducción de vehículos por la noche, o la realización de trabajos arriesgados o peligrosos con escasa iluminación.

No debe utilizarse en individuos que usen lentes de contacto blandas.

Para evitar una excesiva absorción sistémica, presionar con el dedo el saco conjuntival durante 1-2 min después de la aplicación.

Interacciones:

Los fármacos que poseen actividad bloqueante neuromuscular como los aminoglicosidos, clindamicina, colistina, ciclopropano y los anestésicos halogenados inhalados, pueden antagonizar los efectos de la pilocarpina.

Algunos fármacos, como quinina, cloroquina, hidroxiclороquina, quinidina, procainamida, propafenona, litio, y betabloqueantes que potencialmente puede agravar la miastenia grave, pueden reducir la efectividad del tratamiento con parasimpaticomiméticos. En pacientes que toman betabloqueantes, ha aparecido bradicardia prolongada después de la administración de pilocarpina.

Los inhibidores de la colinesterasa, como la pilocarpina clorhidrato, pueden inhibir el metabolismo de suxametonio, y potenciar y prolongar su acción.

El uso concomitante de inhibidores de la colinesterasa por vía oftálmica, debe aplicarse con cuidado en pacientes que toman pilocarpina por vía sistémica para tratar la miastenia grave, para evitar así una posible toxicidad adicional.

Los antimuscarínicos como la atropina antagonizan los efectos muscarínicos de la pilocarpina.

Incompatibilidades:

Álcalis, acetato de clorhexidina, yodo, sales de plata, sales de fenilmercurio, y cloruro mercurioso.

Observaciones:

Es fotosensible.

Conservación:

En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Loción para la alopecia seborreica

Pilocarpina clorhidrato	0,5 %
Tintura capsicum	10 %
Ácido salicílico	0,2 %
Sol. hidroalcohólica 70 % c.s.p.	100 ml

Gotas oculares de pilocarpina

Pilocarpina clorhidrato	0,5 %
Sol. Benzalconio cloruro	0,02 %
EDTA sal disódica	0,05 %

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Sodio cloruro 0,8 %
Agua purificada c.s.p. 10 ml

Esterilizar en autoclave

Cápsulas para la xerostomía

Pilocarpina clorhidrato 5 mg
para una cápsula nº20

Modus operandi:

Puede utilizarse lactosa como excipiente y cápsulas del nº4.

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Formulación magistral de medicamentos*, COF de Vizkaia, 5ª ed. (2004).
- *Monografías Farmacéuticas*, C.O.F. de Alicante (1998).
- *Formulario básico de medicamentos magistrales*, M.ª José Llopis Clavijo y Vicent Baixauli Comes (2007).
- *Formulario médico farmacéutico*, PharmaBooks, 2010.