

## NUEVAS DROGAS

## BROMFENAC



## 1. CLASE FARMACOLOGICA

S01BC11: Órganos sensoriales. Oftalmológicos. Agentes antiinflamatorios no esteroideos. Bromfenac.

## 2. CARACTERISTICAS ORGANOLEPTICAS Y CONSERVACION

Bromfenac sódico sesquihidratado es un polvo cristalino de color amarillo-anaranjado, inodoro, cuyo peso molecular es 383,17.

Es altamente soluble en agua, soluble en metanol, ligeramente soluble en etanol anhidro y prácticamente insoluble en acetonitrilo y éter.

pKa:4.29

No hay evidencias de polimorfismo.

La solución oftálmica tiene una osmolaridad de 300 mOsmol/kg y debe conservarse a temperatura ambiente entre 15° y 25° C.

## 3. ACCION FARMACOLOGICA

El bromfenac es un antiinflamatorio no esteroídico (AINE)

## 4. MECANISMO DE ACCION

Actúa inhibiendo la síntesis de prostaglandinas, principales mediadores de la inflamación ocular inducida por la incisión quirúrgica en la extracción de cataratas. Concretamente, inhibe reversiblemente la ciclooxigenasa, enzima clave en el proceso de síntesis de las prostaglandinas. En este sentido, es unas cuatro veces más potente que la indometacina y unas 10 que el pranoprofeno en el cuerpo ciliar del iris en pruebas experimentales sobre animales <conejos>.

El bromfenac presenta una selectividad 30 veces superior hacia la isoforma 2 <COX-2> de la ciclooxigenasa, la forma típicamente inducible de la enzima, frente a la isoforma constitucional o permanente <COX-1>. Esto podría implicar que la acción del bromfenac es más marcada durante los procesos inflamatorios, en los que se produce un incremento de la expresión de COX-2.

## 5. INDICACION

Para el tratamiento de la inflamación ocular postoperatoria tras extracción de catarata en adultos.

## 6. DOSIS

La dosis en adultos recomendada es de 1 gota, 1 vez por día, según criterio médico.

Para el tratamiento de la inflamación y el dolor postoperatorios, la posología es de 1 gota en el/los ojo/s afectado/s 1 vez por día, co-

menzando 24 horas antes de la operación, y continuando durante las primeras 2 semanas del período posoperatorio.

El tratamiento no deberá superar 2 semanas puesto que no se dispone de datos de seguridad más allá de este intervalo de tiempo.

Dosis pediátrica: No hay datos disponibles.

## 7. VIAS DE ADMINISTRACION

TOPICA: ocular

No se deben utilizar lentes de contacto durante el tratamiento con el colirio

## 8. FARMACOCINETICA

El bromfenac atraviesa eficazmente la córnea de los pacientes con cataratas una dosis única produjo una concentración media máxima en el humor acuoso de  $79 \pm 68$  ng/ml a los 150-180 minutos tras la administración. Las concentraciones se mantuvieron durante 12 horas en el humor acuoso con niveles medibles hasta 24 horas en los principales tejidos oculares, incluyendo la retina. Tras la administración dos veces al día del colirio de bromfenac las concentraciones plasmáticas no fueron cuantificables. El bromfenac muestra una elevada unión a las proteínas plasmáticas. In vitro, el 99,8 se unió a proteínas en plasma humano.

No se observó ninguna unión a melanina relevante in vitro. Estudios en conejos utilizando bromfenac radiomarcado han demostrado que las concentraciones más altas tras la administración tópica se observan en la córnea, seguida por la conjuntiva y el humor acuoso. Solamente se observaron concentraciones bajas en el cristalino y el humor vítreo. La enzima CYP2C9 fue identificada como la principal enzima responsable del metabolismo in vitro de bromfenac.

En estudios in vivo realizados en animales luego de la administración ocular, se encontraron 4 metabolitos de menor actividad farmacodinámica.

Aproximadamente 20-50 % de la dosis es excretada por vía urinaria en ratas y monos luego de la administración oral e IV.

Tras la administración ocular la semivida del bromfenac en el humor acuoso es de 1,4 h lo que indica una eliminación rápida.

## 9. INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

No se registraron interacciones con otras drogas en los estudios clínicos, pero no se han notificado interacciones con colirios antibióticos utilizados en conjunción con la cirugía.

## 10. ADVERTENCIAS

EMBARAZO: No se dispone de datos adecuados sobre la utilización de bromfenac en mujeres embarazadas. Debe evitarse durante el último trimestre del embarazo.

LACTANCIA: Se desconoce si el bromfenac o sus metabo-

litos se excretan en la leche materna. Sin embargo no se conocen efectos adversos en lactantes por lo que podría ser usado con precaución.

PEDIATRIA: No se ha establecido seguridad y eficacia en pacientes pediátricos.

GERIATRIA: No se han observado diferencias clínicas en la seguridad y eficacia entre los pacientes geriátricos y otros pacientes adultos.

OTROS: Puede suceder que la visión sea borrosa de modo pasajero con la instilación. Si aparece visión borrosa con la instilación, el paciente debe abstenerse de conducir o utilizar máquinas hasta que la visión sea clara.

## 11. EFECTOS COLATERALES O ADVERSOS

Las reacciones adversas más frecuentes observadas durante el desarrollo clínico fueron sensaciones anormales en el ojo, erosión corneal <leve a moderada>, prurito ocular, enrojecimiento, dolor, iritis y edema macular.

No se detectaron efectos adversos sistémicos relacionados con el tratamiento, ni variaciones en los valores analíticos.

Los pacientes con evidencia de ruptura epitelial corneal deben interrumpir inmediatamente la utilización del colirio y se les debe realizar un estrecho seguimiento del estado de salud de la córnea.

## 12. CONTRAINDICACIONES

Está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad al bromfenac o a cualquier otro componente de la formulación

## 13. SINTOMAS DE SOBREDOSIS

No existe información disponible de sobredosificación en humanos. En el caso de sobredosificación con solución oftálmica de bromfenac 0.09 se debe instituir tratamiento sintomático.

Si se ingiere accidentalmente, se deben tomar líquidos para diluir el medicamento.

## 14. PRESENTACION

Frasco gotero conteniendo 2.5 ml, 5 ml y 10 ml de solución oftálmica estéril. <equivalente a 90 mg de bromfenac ácido cada 100 ml>

## 15. CONDICIONES DE EXPENDIO

Bajo receta.

## 16. BIBLIOGRAFIA

- Martindale. Guía Completa de Consulta Farmacoterapéutica. 3ª ed. (2008)

- P.R. Vademécum (2014)

- Manual Farmacoterapéutico (2014)

- Disposición ANMAT 48/12, información del producto

NATAX.