

Sildenafil

Ethical

COMPOSICION

Cada comprimido contiene:

Sildenafil citrato 50 mg y 100 mg , respectivamente
Excipientes, c.s.

PROPIEDADES

Es un inhibidor potente y específico de la fosfodiesterasa 5 (FD5), enzima responsable de la degradación del GMPC en los cuerpos cavernosos. De esta manera aumenta los efectos de óxido Nítrico (NO) y favorece la erección. No actúa en ausencia de estimulación sexual.

FARMACOCINETICA

Se absorbe rápidamente luego de la administración oral en ayunas. Las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan alrededor de una hora después de la administración (30-90 minutos).

Los alimentos grasos retrasan la absorción. La biodisponibilidad absoluta es de alrededor del 40%. El volumen de distribución es de 105 L. Tanto esta sustancia como su metabolito principal N-desmetil circulan casi completamente (96%) unidos a las proteínas plasmáticas. Se elimina principalmente por metabolismo hepático (principalmente por la isoenzima 3A4 del citocromo P450 y secundariamente por la isoenzima 2C9) y es convertido en un metabolito activo al que se considera responsable de alrededor del 20% de los efectos farmacológicos. La vida media terminal es de 4 horas. Se excreta principalmente por las heces (el 80% de la dosis) bajo la forma de metabolitos y en menor proporción (13%) en la orina. En los pacientes de 65 años o mayores se observó una disminución del aclaramiento y concentraciones plasmáticas más elevadas que en los individuos más jóvenes. También se informó disminución del aclaramiento aumento de la AVC (84%) y de la Cmáx. (47%) en individuos con cirrosis hepática.

TOXICOLOGIA

Se realizaron estudios genéticos de toxicidad a un grupo standar de animales, los resultados discutidos con detalles en la revisión y farmacológica no arrojaron resultados clínicos seguros.

No fue carcinogénico cuando se la administró a ratas durante 24 meses dosis de hasta 60 mg/kg. En ratones dosis de hasta 30 mg/kg no reveló hallazgos carcinogénicos, pero se observó mortalidad que fue mayormente atribuida a la dilatación gastrointestinal.

No hubo deterioro de la fertilidad en ratas hembras que lo recibieron en dosis de hasta 60 mg/kg/día durante 36 días y durante 102 días en los machos, una dosis que produce un valor del área bajo la curva de más de 25 veces al área bajo la curva de los varones humanos. No hubo efecto sobre la motilidad y la morfología espermática después de una dosis única de 100 mg por vía oral en voluntarios sanos.

También fue administrado a perros durante diez días, un mes y doce meses dosis orales de hasta 100, 80 y 50 mg/kg, dando como resultados disminución de la presión sanguínea, aumento de los latidos del corazón, aumentos de la masa del hígado y periarteritis (inflamación de los tejidos que forman la pared externa de una arteria).

INFORMACION CLINICA

INDICACIONES

Para aumentar y mantener por más tiempo la fuerza de la erección y la calidad del acto sexual.

CONTRAINDICACIONES

Está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad conocida a esta sustancia. Debido a sus efectos sobre la vía del óxido nítrico/GMPC y a que éste ha mostrado potenciar los efectos hipotensores de los nitratos y nitritos, está contraindicado en pacientes en tratamiento con estos fármacos.

EFFECTOS INDESEABLES

Los efectos indeseados observados son generalmente transitorios y de naturaleza leve a moderada. Los observados en los estudios clínicos con mayor frecuencia fueron: cefalea, rubor facial, dispepsia, congestión nasal, infección urinaria, visión anormal, diarrea, vértigo y rash.

Además inhibe la FDG, que es una enzima localizada en la retina, lo cual explica los trastornos relacionados con la visión de colores, cuando se emplean las dosis más altas o cuando se alcanzan concentraciones plasmáticas elevadas.

Otras reacciones adversas fueron infección del tracto respiratorio, dolor lumbar, síndrome gripal y artralgia. Otras reacciones ocurridas en menos del 2% de los pacientes fueron:

Cardiovasculares: Angina de pecho, bloque AV, migraña, síncope, taquicardia, palpitaciones, hipotensión, isquemia miocárdica trombosis cerebral, paro cardíaco, insuficiencia cardíaca, etc.

Digestiva: Vómitos, glositis, colitis, disfagia, gastritis, gastroenteritis, esofagitis, estomatitis, sequedad bucal, etc.

Metabólicas y Nutricionales: Sed, edema, gota, diabetes inestable, hiperglucemia, edema periférico y hipernatremia.

Musculoesqueléticas: Artritis, artrosis, mialgia, rotura tendinosa, dolor óseo, miastenia, sinovitis.

Nerviosas: Ataxia, hipertonia, neuralgia, neuropatía, parestesia, temblor, vértigo, depresión, insomnio, somnolencia, reflejos disminuidos.

Respiratorias: Asma, disnea, laringitis, faringitis, sinusitis, bronquitis, aumento de la expectoración, tos aumentada.

De la piel y anexos: Urticaria, herpes simple, prurito, sudoración, úlcera de la piel.

Urogenitales: Cistitis, nicturia, aumento de la frecuencia urinaria, agrandamiento mamario, incontinencia urinaria, eyaculación anormal, edema genital y anorgasmia.

PRECAUCIONES

El médico debe considerar el estado cardiovascular de los pacientes antes de iniciar

COMPRIMIDOS

TRATAMIENTO DE LA DISFUNCION ERECTIL

cualquier tratamiento con este producto para la disfunción de la erección, pues existe un grado de riesgo cardíaco asociado con la actividad sexual más intensa.

Debe ser administrado con precaución a pacientes con deformaciones anatómicas del pene (angulación, fibrosis cavernosa o enfermedad de peyronie) y a aquellos que presentan condiciones que pueden predisponer al priapismo (anemia microdrepanocítica, mieloma múltiple o leucemia).

Debe ser administrado con precaución a pacientes con trastornos hemorrágicos o úlcera péptica activa.

USO EN EMBARAZO Y LACTANCIA

No está indicado.

INTERACCIONES

Su metabolismo es mediado por el citocromo P450 (CYP) isoformas 3A4 (vía principal) y 2C9 (vía menor). Por lo que los inhibidores de estas isoenzimas pueden reducir el aclaramiento.

La cimetidina, inhibidor no específico del CYP causó un aumento de las concentraciones plasmáticas.

La eritromicina, inhibidor específico del CYP3A4, produjo aumento pronunciado de su AUC. Se cree que los inhibidores más potentes del CYP3A4, como el ketoconazol, el itraconazol y el mibefradil, pueden ejercer efectos todavía mayores, por lo que deben ser administrados con precaución.

Es posible que los inductores del CYP3A4, como es la rifampicina, disminuyan las concentraciones plasmáticas. Los antiácidos (hidróxido de magnesio/hidróxido de aluminio) no afectan su biodisponibilidad.

No potencia el aumento del tiempo de sangrado causado por la aspirina, ni el efecto hipotensor del alcohol, ni interacciona con la amlodipina, ni con otros antihipertensivos.

SOBREDOSIS

Luego de la cuidadosa evaluación clínica del paciente, de la valoración del tiempo transcurrido desde la ingesta, de la cantidad de tóxicos ingeridos, el médico decidirá la realización o no del tratamiento general, lavado gástrico, administración de carbón activado.

Control clínico y tratamiento de soporte.

La hemodiálisis carecerá de valor porque éste y su metabolito activo se encuentran unidos a las proteínas plasmáticas.

USO Y DOSIS

Tomar un comprimido de 50 mg ó 100 mg aproximadamente una hora antes de iniciar la estimulación y la actividad sexual.

El aumento de la fuerza de erección permanecerá durante unas 3 horas aproximadamente.

La dosis máxima diaria recomendada es de 100 mg.

VIA DE ADMINISTRACION

Oral.

Antes de consumir este o cualquier otro medicamento, debe siempre consultar a su médico.

En caso de un marcado efecto secundario, sea este por sobredosis o reacción particular, acuda inmediatamente a su médico.

INFORMACION FARMACEUTICA

DURACION DE ESTABILIDAD

Ver fecha de vencimiento señalada en el envase.

PRECAUCIONES ESPECIALES PARA SU CONSERVACION

Conservar a una temperatura menor o igual a los 30°C, proteger de la luz.

PRESENTACION

Caja conteniendo 2 tirillas de 6 comprimidos para detallar.

NOTA IMPORTANTE

Este producto se encuentra envasado y protegido en una adecuada y rigurosa laminación, especialmente diseñada para evitar su exposición con la luz y humedad, descartando además que por descuidos involuntarios los niños puedan acceder al mismo.

NUMEROS DE REGISTRO SANITARIO

Comprimidos de 50 mg: 2002-0598

Comprimidos de 100 mg: 2004-1928

Registro Industrial No. 14109

Venta por receta médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Fabricado por Ethical Pharmaceutical, S.R.L.
de República Dominicana.

Doc. No.: YDP2169

Rev.: H

Aprob. por: Gte. Desarrollo de Productos / Gte. Mercadeo

Ethical

PI000258