

VIAGRA 100 MG 4 COMPRIMIDOS

COMPOSICION

ACCION Y MECANISMO

FARMACOCINETICA

INDICACIONES

POSOLOGIA

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

EFFECTOS ADVERSOS

ADVERTENCIAS ESPECIALES

INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO

EMBARAZO

MADRES LACTANTES

USO EN NIÑOS

USO EN ANCIANOS

COMPOSICION POR UNIDAD

SILDENAFILO , CITRATO	100,00	MILIGRAMOS
LACTOSA (EXCIPIENTE)		

ACCION Y MECANISMO

El sildenafil en presencia de estimulación sexual, restaura la función eréctil deteriorada mediante el aumento del flujo sanguíneo al pene. El mecanismo fisiológico responsable de la erección del pene implica la liberación de óxido nítrico (NO) en los cuerpos cavernosos durante la estimulación sexual. El óxido nítrico activa la guanilatociclasa, lo que origina un aumento de los niveles de GMPc produciendo una relajación del músculo liso en los cuerpos cavernosos del pene. Sildenafil es un inhibidor potente y selectivo de la fosfodiesterasa 5 (PDE5), enzima específica de los cuerpos cavernosos responsable de la degradación de GMPc. Sildenafil no tiene efecto relajante directo sobre los cuerpos cavernosos humanos aislados, pero aumenta el efecto relajante del NO en este tejido.

FARMACOCINETICA

Vía oral: Se absorbe rápidamente, su biodisponibilidad oral es del 41%, obteniéndose en ayuno concentraciones plasmáticas máximas a la hora (rango 30-120 minutos). Los alimentos retrasan el inicio de la acción farmacológica. El AUC y C_{máx} aumentan proporcionalmente con dosis habituales (25-100 mg). El volumen de distribución V_d es de 105 l. El grado de unión a las proteínas de sildenafil y su metabolito circulante es del 96%. Se metaboliza mayoritariamente en el hígado, principalmente por las isoenzimas hepáticas CYP3A4, originando, entre otros, el derivado N-desmetilo de sildenafil, metabolito con similar selectividad sobre fosfodiesterasas que sildenafil y la mitad de potencia. Las concentraciones plasmáticas de este metabolito son un 40% de las observadas con sildenafil. Este metabolito sufre posteriores metabolizaciones. Sildenafil se excreta mayoritariamente metabolizado con las heces (80%), y en menor medida con la orina (13%). La semivida plasmática es de 3-5 h.

Farmacocinética en grupos especiales de pacientes:

- Ancianos: Se observó disminución del aclaramiento plasmático, con concentraciones plasmáticas de sildenafil y su metabolito activo un 90% mayores que en voluntarios jóvenes sanos. También se observó un aumento del 40% de sildenafil libre, por disminución de unión a proteínas plasmáticas debido al envejecimiento.

- Insuficiencia renal: Modificaciones poco significativas en insuficiencia renal leve o moderada. En insuficiencia renal grave se observaron aumentos significativos de AUC y C_{máx} (100% y 88%) para sildenafil y 79% y 200% para el metabolito N-desmetilo.

- Insuficiencia hepática: En cirrosis hepática leve o moderada, se redujo el aclaramiento de sildenafil, resultando aumentos del AUC (84%) y C_{máx} (47%). No estudiado en insuficiencia hepática grave.

INDICACIONES

- Disfunción eréctil.

POSOLOGIA

Adultos, oral: 50 mg (rango 25-100 mg, según tolerancia y eficacia), tomados a demanda, una hora antes de la relación sexual.

- Ancianos, insuficiencia renal grave, insuficiencia hepática leve o moderada: dosis inicial 25 mg, que pueden incrementarse a 50-100 mg, según eficacia y tolerancia.
- Normas para la correcta administración: Tomar una vez al día, una hora antes de la relación sexual. Los alimentos retrasan el comienzo de la acción.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Asociación con nitratos (hay potenciación de efectos hipotensores), hombres en los que la actividad sexual esté desaconsejada (ej: cardiopatías graves).

No se ha estudiado la seguridad de sildenafil en los siguientes pacientes, estando, por tanto, su uso desaconsejado: insuficiencia hepática grave, hipotensión (<90/50 mmHg), historia reciente de accidente isquémico cerebral o infarto de miocardio, alteraciones retinianas de origen hereditario, como retinitis pigmentaria (una minoría de estos pacientes tienen alteración de las fosfodiesterasas de la retina).

Precauciones:

- Hipotensión: sildenafil produce disminución de la presión arterial (según algunos estudios relacionada con la dosis). La hipotensión puede ser especialmente peligrosa cuando se asocia a nitratos.
- Deformidades anatómicas del pene (enfermedad de Peyronie, fibrosis cavernaria) o predisposición al priapismo (ej: anemia falciforme, mieloma múltiple o leucemia). Estos pacientes deberán consultar al urólogo la idoneidad del tratamiento.
- Trastornos hemorrágicos o úlcera péptica activa: se desconoce el efecto de sildenafil en estos pacientes. Se ha observado in vitro que sildenafil aumenta los efectos antiagregantes plaquetarios del nitroprusiato sódico.
- Situaciones especiales: advertir al paciente que sildenafil puede producir mareos y trastornos visuales.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

- Inhibidores del citocromo P450 (CYP) isoformas 3A4 (principalmente) y 2C9 (en menor grado), tales como cimetidina, eritromicina, ketoconazol e inhibidores de la proteasa (ritonavir, saquinavir): posible reducción del aclaramiento. Cimetidina: aumento del 56% en la concentración plasmática. Eritromicina: aumento del 182% en el AUC. Ritonavir: aumento de hasta el 1000% en el AUC. Saquinavir: aumento del 210% en el AUC. Aunque no se ha observado un aumento de la incidencia de efectos adversos, se aconseja iniciar el tratamiento con la dosis de 25 mg.

- Nitratos o dadores de óxido nítrico (nitroglicerina, isosorbida, etc.): sildenafil ha demostrado potenciar los efectos hipotensores cuando se administra con fármacos dadores de óxido nítrico (como el nitrito de amilo) o con nitratos, de acuerdo con sus conocidos efectos sobre la vía óxido nítrico/guanosina-monofosfato cíclico (GMPc). De igual forma se desaconseja su uso con molsidomina o nicorandil, al producir un incremento intracelular de GMP cíclico.

- Antihipertensivos: considerar que existe el riesgo potencial de efectos hipotensores aditivos. En un paciente tratado con doxazosina se ha observado hipotensión severa y prolongada tras el uso concomitante de sildenafil. La Asociación Americana de Cardiología aconseja precaución en pacientes tratados con varios antihipertensivos.

- Ahorradores de potasio, ciertos beta-bloqueantes: se han observado aumentos de las concentraciones plasmáticas del metabolito mayor del sildenafil en un 62% y 102% respectivamente, aunque no se ha observado aumento de efectos adversos.

- Simvastatina: hay algún estudio en el que se ha registrado una posible interacción con riesgo de aumento de toxicidad por simvastatina con riesgo de rabiomilosis por posible inhibición de su metabolismo hepático.

- Alcohol: Su seguridad no ha sido adecuadamente estudiada. La administración concomitante a voluntarios sanos no ha producido efectos hipotensores aditivos.

EFFECTOS ADVERSOS

Las reacciones adversas son, en general, de carácter leve y transitorio y dependientes de dosis.

Se ha informado de las siguientes reacciones adversas con una incidencia >1%:

- Cardiovasculares: cefalea (12.8%), rubor, sofoco (10.4%), mareo (1.2%).
- Dermatológicas/alérgicas: erupciones exantemáticas (2%).
- Digestivas: dispepsia (4.6%; 12% con dosis de 100 mg), diarrea (3%).
- Genitourinarias: infecciones del tracto urinario (3%).
- Otorrinolaringológicas: congestión nasal (4%).
- Oculares: alteraciones visuales (1.9%; 11% con dosis de 100 mg), leves y transitorios, predominantemente percepción anormal de los colores, aumento de la percepción de la luz o visión borrosa, cambio reversible en el electroretinograma (voluntarios, dosis de 100 mg).
- Sexuales: Excepcionalmente, priapismo.

Adicionalmente se observó dolor muscular cuando se administró con más frecuencia de la aconsejada.

El índice de abandonos por efectos adversos fue similar con sildenafil y placebo (en torno al 2%).

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Para que sildenafil sea efectivo es necesaria la estimulación sexual. No está indicado en mujeres.

INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO

Síntomas: en estudios realizados en voluntarios sanos utilizando dosis únicas de 800 mg, las reacciones adversas fueron similares a las encontradas con dosis menores, aunque aumentó la incidencia y gravedad (cefalea, mareos, rubor, alteraciones visuales, etc).

Tratamiento: de apoyo. No es dializable.

EMBARAZO

No procede el uso de sildenafil en mujeres.

MADRES LACTANTES

No procede el uso de sildenafil en mujeres.

USO EN NIÑOS

No está indicado en menores de 18 años.

USO EN ANCIANOS

En pacientes ancianos puede haber aumento de concentraciones plasmáticas (véase farmacocinética) con posible aumento de la acción y/o toxicidad. Los ancianos pueden ser más sensibles a los efectos hipotensores del preparado. La edad media de casos fatales asociados al uso de sildenafil es de 64 años (según datos de la FDA).