

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA MARKETING	
RIPOL			
Fecha: JUNIO 2001	Página: 1	Producto N° 722	Versión : 01

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL

1.- Denominación:

Nombre RIPOL

Forma Farmacéutica Comprimidos Recubiertos

Principios Activos : SILDENAFIL COMO CITRATO



2.- Composición:

Cada comprimido recubierto contiene:

Sildenafil 50 y 100 mg
Excipientes c.s.

3.- Categoría : Vasodilatador

4.- Indicaciones:

Tratamiento de la disfunción eréctil.

5.- Posología:

En pacientes adultos, se recomienda una dosis de 50 mg (rango 25-100 mg, según tolerancia y eficacia), por vía oral tomados una hora antes de la relación sexual. En pacientes ancianos, con insuficiencia renal grave o con insuficiencia hepática leve o moderada se recomienda una dosis inicial de 25 mg.

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA MARKETING	
Fecha: JUNIO 2001	Página: 2	Producto N° 722	Versión : 01

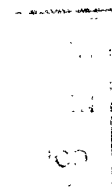
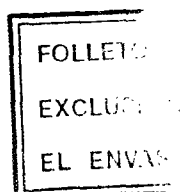
6.- Farmacología:

Mecanismo de Acción: El sildenafil en presencia de estimulación sexual, restaura la función eréctil deteriorada aumentando el 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.

7.- Farmacocinética:

Absorción: Cuando se administra por vía oral se absorbe rápidamente, su biodisponibilidad es del 41%, obteniéndose en ayuno concentraciones plasmáticas máximas a la hora. Los alimentos grasos retrasan el inicio de la acción farmacológica. El AUC y C_{máx} aumentan proporcionalmente con dosis habituales (25-100 mg).

Distribución: El volumen de distribución es de 105 l. El grado de unión a las proteínas de Sildenafil y su metabolito circulante es de 96%.



LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA MARKETING	
Fecha: JUNIO 2001	Página: 3	Producto N° 722	Versión : 01

Metabolismo: 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 su potencia. La concentración plasmática de este metabolito es un 40% de la del Sildenafil. Este metabolito sufre posteriores metabolizaciones.

Excreción: Sildenafil se excreta mayoritariamente metabolizado con las heces (80%), y en menor medida con la orina (13%). La vida media plasmática es de 3-5 h.

8.- Información para su prescripción:

Precauciones:

En pacientes con hipotensión, Sildenafil produce disminución leve y transitoria de la presión arterial. La hipotensión puede ser especialmente peligrosa cuando se asocia a nitratos.

Se deberá evaluar la idoneidad del tratamiento en pacientes con deformidades anatómicas del pene (enfermedad de Peyronie, fibrosis cavernaria) o predisposición al priapismo (ej: anemia falciforme, mieloma múltiple o leucemia). Pacientes con trastornos hemorrágicos o úlcera péptica activa: se desconoce el efecto de Sildenafil en estos pacientes, pero se ha observado in vitro que Sildenafil aumenta los efectos antiagregantes plaquetarios del nitroprusiato sódico.



LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA MARKETING	
Fecha: JUNIO 2001	Página: 4	Producto N° 722	Versión : 01

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 casos: 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), al igual que en embarazo y lactancia.

Contraindicaciones

- Pacientes que estén utilizando concomitantemente nitratos.
- Está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad a Sildenafil o cualquier otro componente de este medicamento.
- Niños y adolescentes.

Advertencias:

Para que sildenafil sea efectivo es necesaria la estimulación sexual. Sildenafil puede producir mareos y trastornos visuales. Por no haber experiencia suficiente no está indicado en mujeres.

Interacciones con otros fármacos:

Sildenafil cuando se administra conjuntamente con inhibidores de las enzimas citocromo P450 tales como cimetidina, eritromicina, ketoconazol, itraconazol y mibefradil: es posible una reducción de su clearance y aumento de la concentración plasmática. Con nitratos o dadores de óxido nítrico (nitroglicerina, isosorbida, etc.) administrados en conjunto con Sildenafil: posible potenciación del efecto hipotensor (uso contraindicado).

Rifampicina puede disminuir los niveles de Sildenafil.

LABORATORIO CHILE S.A.

EXCLUSIVAMENTE

ENVASE

LABORATORIO CHILE S.A. SANTIAGO - CHILE		GERENCIA MARKETING	
Fecha: JUNIO 2001	Página: 5	Producto N° 722	Versión : 01

9.- Reacciones Adversas:

Las reacciones adversas son, en general, de carácter leve y transitorio y dependientes de dosis. Se ha informado de las siguientes reacciones adversas más frecuentes:

Cardiovasculares: cefalea, rubor, sofoco, mareo. Dermatológicas: erupciones exantemáticas. Digestivas: dispepsia, diarrea. Genitourinarias: infecciones del tracto urinario. Otorrinolaringológicas: congestión nasal. Oculares: alteraciones visuales, leves y transitorios, predominantemente percepción anormal de los colores, aumento de la percepción de la luz o visión borrosa. Sexuales: Excepcionalmente priapismo.

Adicionalmente se ha observado dolor muscular cuando se administra con más frecuencia de la aconsejada.

10.- Información Toxicológica:

Sobredosis:

Síntomas: Los síntomas de sobredosis son similares a las reacciones adversas, exacerbadas, descritas con dosis normales, con aumento de la incidencia y gravedad: cefalea, mareos, rubor, alteraciones visuales.

Tratamiento: El tratamiento debe ser sintomático y realizado en un centro asistencial con monitoreo de las funciones comprometidas.

11.- Bibliografía:

- Micromedex Vol -106 2001
- Drug Facts and Comparisons
- British National Formulary

