

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	DIRECTIL® (Citrato de sildenafil)
Forma farmacéutica:	Tableta
Fortaleza:	50,0 mg
Presentación:	Estuche por un blíster de PVC/AL con 2 tabletas.
Titular del Registro Sanitario, país:	ESTABLECIMIENTOS ANCALMO S.A. DE C.V., LA LIBERTAD, EL SALVADOR.
Fabricante, país:	LABORATORIOS ANCALMO, LA LIBERTAD, EL SALVADOR.
Número de Registro Sanitario:	M-10-157-G04
Fecha de Inscripción:	5 de Octubre de 2010
Composición:	
Cada tableta contiene:	
Sildenafil	50,0 mg
Lactosa monohidratada	213,0 mg
Plazo de validez:	36 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C.

Indicaciones terapéuticas:

Directil está indicado para el tratamiento asintomático de la disfunción eréctil, que consiste en la incapacidad para lograr y mantener la erección suficiente del pene y tener un rendimiento sexual satisfactorio; restaura la función eréctil afectada, dando lugar a una respuesta natural al estímulo sexual.

Contraindicaciones:

Directil está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad conocida a cualquiera de los componentes de la fórmula.

En pacientes que usan medicamentos que contengan óxido nítrico, nitratos o nitritos orgánicos en cualquier forma por sus efectos conocidos sobre la vía del óxido nítrico, de potenciar los efectos hipotensivos de los nitratos y en pacientes con trastornos hemorrágicos o con úlcera péptica activa.

Está contraindicado en pacientes con insuficiencia renal grave e insuficiencia hepática.

Contiene Lactosa, no administrar en pacientes con intolerancia a la Lactosa.

Precauciones:

Pacientes con diabetes mellitus.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Diagnosticar el trastorno de la erección, por medio de una historia médica minuciosa y hacer un examen físico para determinar sus causas primarias potenciales e identificar el tratamiento apropiado.

Antes de iniciar cualquier tratamiento para trastornos de erección considerar el estado cardiovascular del paciente.

En pacientes con deformaciones anatómicas del pene (como angulación, fibrosis cavernosa o enfermedad de Peyronie) o en pacientes con afecciones que pueden predisponerlos al priapismo (por ejemplo anemia drepanocítica, mieloma múltiple o leucemia).

Directil debe usarse bajo supervisión médica.

Directil no debe ser usado en hombres que no es aconsejable la actividad sexual.

No es recomendable combinar Directil con otros tratamientos para la disfunción eréctil.

A la dosis recomendada Directil no tiene efectos de ausencia de estimulación sexual, no está indicado en menores de 18 años de edad.

Efectos indeseables:

Los más comúnmente reportados son: Cefalea, rubefacción, dispepsias, desordenes visuales, mareos y congestión nasal.

Pueden presentarse ocasionalmente rash cutáneo, diarrea, astenia, dolor abdominal, artralgia, mialgia e insomnio.

Puede predisponer al infarto agudo del miocardio, la mayoría de veces, en hombres mayores de 65 años.

Posología y método de administración:

1 tableta (50 mg), aproximadamente una hora antes de la actividad sexual, una vez al día.

Dosis máxima al día: 2 tabletas (100 mg) en dosis única.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

La co-administración de 50 mg de Sildenafil con Cimetidina, puede aumentar las concentraciones plasmáticas de Sildenafil en alrededor del 56%.

Asimismo, los inhibidores más potentes del CYP3A4 como eritromicina, ketoconazol, itraconazol o mibefradil tienen la capacidad de reducir la eliminación del Sildenafil.

La administración del sildenafil con inductores del CYP3A4 como la rifampicina puede disminuir los niveles plasmáticos de éste.

La administración de una dosis única de antiácidos que contienen hidróxido de aluminio o de magnesio no afecta la biodisponibilidad del Sildenafil.

Los inhibidores del CYP2C9 (tolbutamida, warfarina) o del CYP2D6 (inhibidores selectivos de la recaptación de serotonina, antidepresivos tricíclicos), los diuréticos tiazídicos, los inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina o los bloqueantes de los canales de calcio no afectan la farmacocinética del Sildenafil.

El área bajo la curva (ABC) de su metabolito activo, el N-desmetil-sildenafil, se incrementa en un 62% con el uso de diuréticos ahorradores de potasio o diuréticos del asa y en un 102% con la administración de beta bloqueantes no selectivos.

Sin embargo, no se prevé que estos efectos sobre el metabolito activo del Sildenafil tengan consecuencias clínicas significativas.

No se han encontrado interacciones significativas con tolbutamida o warfarina. Sildenafil en las dosis recomendadas no potencia el efecto de 150 mg de aspirina sobre la coagulación.

Tampoco potencia el efecto hipotensor del alcohol en voluntarios sanos.

No se han hallado diferencias significativas en el perfil de efectos adversos presentado por los pacientes con o sin medicación antihipertensiva bajo tratamiento con Sildenafil.

Uso en Embarazo y lactancia:

No se indica el uso en niños ni mujeres.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No procede.

Sobredosis:

Los síntomas de una dosis excesiva pueden incluir mareos intensos, desmayos o erecciones prolongadas.

La FDA recomienda: La mayoría de los estudios del Sildenafil para el tratamiento de la disfunción eréctil excluidos a los pacientes con insuficiencia cardíaca congestiva, angina inestable, infarto de miocardio reciente, hipertensión que requieren varios medicamentos, miocardia obstructiva o cardiopatía valvular grave. En esos pacientes de alto riesgo, la actividad sexual y el uso de Sildenafil deberían retrasarse hasta que la condición cardíaca ha sido estabilizada. En algunos de estos pacientes y en otros de menor riesgo, pruebas de estrés pueden ser útiles tanto para el paciente como para que el médico pueda evaluar aún más el potencial de isquemia con la actividad sexual. En los pacientes de bajo riesgo, incluyendo aquellos con enfermedad coronaria estable que no están siendo tratadas no nitratos, Sildenafil parece ser segura.

Propiedades farmacodinámicas:

Directil es un inhibidor selectivo de la Fosfodiesterasa tipo 5 (PDE5) la cual es responsable de la degradación de Monofosfato de guanosa cíclico (GMPc) ocasionando un aumento en las concentraciones de éste en el cuerpo cavernoso, resultando una relajación del músculo liso y aumento de flujo sanguíneo.

Directil no ejerce un efecto relajante directo sobre el cuerpo cavernoso aislado, sino que aumenta el efecto del óxido nítrico (ON) al inhibir a la Fosfodiesterasa tipo 5 (PDE5). El mecanismo fisiológico responsable de la erección del pene implica la liberación del óxido nítrico (ON) en el cuerpo cavernoso durante el estímulo sexual. En consecuencia, el óxido nítrico activa a la enzima guanilato ciclasa, lo que da lugar a concentraciones mayores de monofosfato de guanosa cíclico (GMPc), ocasionando la relajación del músculo liso del cuerpo cavernoso, favoreciendo el flujo de sangre.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

El Sildenafil se administra por vía oral, absorbiéndose rápidamente siendo su biodisponibilidad absoluta del 40%. La farmacocinética es lineal dentro del rango de dosis recomendadas, siendo las concentraciones plasmáticas máximas alcanzadas a los 30-120 minutos de la administración en ayunas. Cuando el fármaco se toma con la comida, la velocidad de la absorción se reduce, con un retraso de 1 hora en llegar a las concentraciones plasmáticas máximas y una reducción de las mismas en un 29%. Una vez en la circulación sistémica, el Sildenafil se distribuye ampliamente por todo el organismo, con un volumen de distribución de 105L.

Tanto el Sildenafil como su principal metabolito, el N-demetil-sildenafil, que tiene la misma actividad que el fármaco nativo aunque es menos potente, se unen extensamente a las proteínas del plasma (96%). Menos del 0.001% de la dosis administrada se recupera a los 90 minutos en el semen de los voluntarios.

El Sildenafil es metabolizado por las isoenzimas hepáticas del citocromo P450, siendo la más importante la CYP3A4, aunque también participa la CYP2C9. El desmetilmetabolito

activo participa en un 20% en la efectividad clínica del fármaco, siendo posteriormente metabolizado a compuestos inactivos que se excretan primariamente en las heces.

Tanto el Sildenafil como su metabolito activo tienen una semi-vida de eliminación de unas 4 horas. En la orina se recupera tan solo el 13% de la dosis administrada. Los pacientes de más de 65 años muestran un aclaramiento reducido del Sildenafil con unas concentraciones plasmáticas y un área bajo la curva casi el doble que las obtenidas en sujetos más jóvenes. De igual forma, en pacientes con cirrosis hepática (tipos A y B de la clasificación de Child-Plugh), muestran un aumento tanto las concentraciones plasmáticas (47%) como de la AUC (84%) en comparación con los sujetos "normales".

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 30 de noviembre de 2015.