

EXPIT[®]
SILDENAFIL CITRATO

Comprimidos Recubiertos
Comprimidos Masticables
Venta bajo receta archivada
Industria Argentina

Fórmula:

Cada comprimido masticable de 50 mg contiene:

Sildenafil citrato (Equivalente a 50 mg de Sildenafil): 70,24 mg;
Manitol: 90,00 mg; Lactosa monohidrato CD: 350,26 mg;
Dispersión de Poliacrilato al 30%: 33,33 mg; Aspartame: 42,00 mg;
Esencia de Mentol: 9,00 mg; Esencia de Menta: 6,00 mg;
Colorante indigo carmin: 1,50 mg; Croscarmelosa sódica: 12,00 mg;
Estearato de Magnesio: 9,00 mg.

Cada comprimido recubierto de 50 mg contiene:

Sildenafil citrato (Equivalente a 50 mg de Sildenafil): 70,24 mg;
Celulosa microcristalina: 128,00 mg; Povidona: 12,00 mg; Fosfato dibásico de calcio: 70,00 mg; Croscarmelosa sódica: 16,00 mg;
Estearato de magnesio: 3,76 mg; Opadry: 38,30 mg; Laca indigo carmin: 1,70 mg.

Cada comprimido recubierto de 100 mg contiene:

Sildenafil citrato (equivalente a 100 mg de Sildenafil): 140,48 mg;
Celulosa microcristalina: 256,00 mg; Povidona 24,00 mg; Fosfato dibásico de calcio: 140,00 mg; Croscarmelosa sódica: 32,00 mg;
Estearato de magnesio: 7,52 mg; Opadry: 76,60 mg; Laca indigo carmin: 3,40 mg.

Acción terapéutica:

Terapia oral para la disfunción eréctil.

ADVERTENCIAS

Luego de la comercialización de drogas tales como sildenafil, tadalafil o vardenafil (inhibidores de la fosfodiesterasa tipo 5 PDE 5) se ha observado muy raramente que pacientes que ingirieron estos medicamentos mostraron una disminución o pérdida de la visión causada por una neuropatía óptica isquémica anterior no arterítica (NOIANA). La mayoría de estos pacientes presentaban factores de riesgo tales como bajo índice excavación / disco ("disco apretado", en el fondo de ojo), edad por encima de los 50 años, hipertensión arterial, enfermedad coronaria, hiperlipidemia y/o hábito de fumar. No se ha podido aún establecer una relación causal entre el uso de inhibidores de la PDE5 y la NOIANA. El médico deberá informar a sus pacientes con factores de riesgo sobre la posibilidad de padecer NOIANA; y que, en caso de presentar una pérdida repentina de la visión de uno o ambos ojos mientras están tomando inhibidores PDE5 (incluyendo sildenafil, tadalafil o vardenafil, según corresponda), deben suspender la medicación y consultar a un médico especialista.

Acción farmacológica:

El mecanismo fisiológico de la erección peniana implica la liberación de óxido nítrico (ON) en el cuerpo cavernoso durante la estimulación sexual. El ON activa la enzima guanilato ciclasa, aumentando los niveles de monofosfato cíclico de guanosina (GMPc), lo que provoca la relajación del músculo liso cavernoso y permitiendo la entrada de sangre. El sildenafil no posee efecto relajante directo sobre el cuerpo cavernoso humano aislado, sino que incrementa el efecto del ON por inhibición de la fosfodiesterasa de tipo 5 (PDE5), responsable de la degradación del GMPc en el cuerpo cavernoso. En las dosis recomendadas, el sildenafil no presenta efecto en ausencia de estimulación sexual.

Los estudios in vitro han demostrado que el sildenafil es selectivo de la PDE5. Su efecto es más potente respecto de la PDE5 que sobre otras fosfodiesterasas conocidas (> 80 veces respecto de la PDE1, >1,000

veces respecto de la PDE2, PDE3 y PDE4). La selectividad aproximadamente 4,000 veces mayor respecto de la PDE5 versus la PDE3 es importante puesto que esta PDE está involucrada en el control de la contractilidad cardíaca. El sildenafil solo es alrededor de 10 veces más potente respecto de la PDE5 que respecto de la PDE6, una enzima hallada en la retina; se cree que esta menor selectividad es la base de las anomalías relacionadas con la visión de los colores, que se observa con dosis o niveles plasmáticos más altos.

Farmacocinética:

El sildenafil es rápidamente absorbido después de su administración oral, con una biodisponibilidad absoluta de aproximadamente 40%. En el rango de dosis recomendado, su farmacocinética es proporcional a la dosis. Se elimina predominantemente por metabolización hepática (sobre todo mediante el citocromo P450 3A4) y se convierte en un metabolito activo con propiedades similares a la droga madre, el sildenafil. Tanto el sildenafil como el metabolito presentan vidas medias de alrededor de 4 horas. Absorción y distribución: El sildenafil es absorbido rápidamente. Las concentraciones plasmáticas máximas observadas se alcanzan en el término de 30 a 120 minutos (mediana: 60 minutos) de la administración oral en ayunas. Cuando el sildenafil se ingiere junto con una comida rica en grasas, el índice de absorción se reduce, con un retraso medio de T_{max} de 60 minutos y una reducción media de C_{max} del 29%. El volumen de distribución medio en estado estable (V_{ss}) del sildenafil es de 105 litros, lo cual indica distribución en los tejidos. El sildenafil y su principal metabolito circulante, N-desmetilado, se hallan unidos a proteínas plasmáticas en aproximadamente un 96%. La unión a proteínas es independiente de las concentraciones totales de la droga.

De acuerdo con las mediciones de sildenafil en semen de voluntarios sanos 90 minutos después de su administración, puede aparecer en el semen de los pacientes menos del 0,001% de la dosis administrada. Metabolismo y excreción: El sildenafil es excretado predominantemente mediante las isoenzimas microsomales hepáticas CYP3A4 (vía principal) y CYP2C9 (vía accesoria). El principal metabolito circulante es resultado de la N-desmetilación del sildenafil, y también es metabolizado. Este metabolito posee un perfil de selectividad por las PDE5 similar al del sildenafil y una potencia in vitro respecto de la PDE5 aproximadamente equivalente al 50% de la correspondiente a la droga madre. Las concentraciones plasmáticas de este metabolito son de alrededor del 40% de las observadas respecto del sildenafil, de modo que el metabolito es responsable de aproximadamente el 20% de los efectos farmacológicos del sildenafil.

A continuación de la administración por vía oral o intravenosa, el sildenafil es excretado como metabolitos predominantemente por vía fecal (aproximadamente un 80% de la dosis oral administrada) y, en menor extensión, por la orina (aproximadamente un 13% de la dosis oral administrada).

• Genitria:

Los voluntarios mayores de 65 años presentaron un clearance reducido del sildenafil, siendo las concentraciones plasmáticas libres aproximadamente 40% mayores que las observadas en voluntarios sanos más jóvenes (18 a 45 años de edad).

• Insuficiencia renal:

En voluntarios con deterioro renal leve (CL_{cr}= 50-80 ml/min) y moderado (CL_{cr}= 30-49 ml/min), la farmacocinética de una dosis oral única de sildenafil (50 mg) no se modificó. En voluntarios con deterioro renal severo (CL_{cr} < 30 ml/min), el clearance del sildenafil se redujo, siendo aproximadamente el AUC y la C_{max} del doble.

• Insuficiencia hepática:

En voluntarios con cirrosis hepática (Child - Pugh A y B) el clearance de sildenafil se redujo, dando lugar a aumentos en el AUC (84%) y C_{max} (47%) en comparación con voluntarios de la misma edad sin alteración hepática.

Indicaciones

EXPIT[®] está indicado para el tratamiento de la disfunción eréctil.

Posología y forma de administración:

Para los comprimidos masticables de 50 mg: Para la mayoría de los pacientes la dosis usual media es de 50 mg (1 comprimido). El momento de administración debe ser alejado de las comidas, entre 15 y 30 minutos antes de la actividad sexual.

Los comprimidos masticables de **EXPIT[®]** deben ser masticados para permitir su disgregación, desintegración y disolución en la saliva, lo cual facilita su deglución y absorción. Asimismo mantiene su actividad durante 4 horas. Según la eficacia y tolerancia se puede aumentar la dosis a 100 mg (2 comprimidos) o disminuirla a 25 mg (1/2 comprimido).

Para los comprimidos recubiertos de 50 mg: En la mayoría de los pacientes, la dosis recomendada es de 50 mg según necesidad, aproximadamente una hora antes de la actividad sexual. Sin embargo, el sildenafil puede ser ingerido en cualquier momento entre 0.5 y 4 horas antes de ella. La frecuencia posológica máxima recomendada es de una vez por día. Los siguientes factores se asocian con niveles plasmáticos aumentados de sildenafil: Edad > 65 años (incremento de 40% del AUC), alteración hepática (por ejemplo cirrosis, 80%), deterioro renal severo (CL_{cr} < 30 ml) y uso concomitante de inhibidores potentes del citocromo P450 3A4 (entromicina, ketoconazol, itraconazol, 200%). Puesto que los niveles plasmáticos más elevados pueden incrementar tanto la eficacia como la incidencia de los efectos adversos, debe considerarse en estos pacientes una dosis inicial de 25 mg. Se demostró que sildenafil potencia los efectos hipotensores de los nitratos, por lo que su administración a pacientes que emplean donantes de óxido nítrico o nitratos en cualquier forma está contraindicado.

Contraindicaciones:

El uso de **EXPIT[®]** está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad conocida a cualquier componente del comprimido. Junto con sus efectos conocidos sobre el mecanismo óxido nítrico/GMPc el sildenafil puede potenciar los efectos hipotensivos de los nitratos y su administración está contraindicada en pacientes que utilizan concurrentemente nitratos orgánicos en cualquier forma (nitroglicerina, isosorbida mono y dinitrato, pentaeritritil tetranitrato, etc.). No se ha establecido el intervalo de seguridad para la administración de nitratos en caso de necesidad luego de la ingesta de sildenafil. Se recomienda especial precaución en los siguientes casos: edad mayor de 65 años, insuficiencia hepática (por ejemplo, cirrosis), insuficiencia renal severa (clearance de creatina <30ml/minuto), tratamiento concomitante con medicamentos inhibidores potentes del citocromo P450 3A4 (entromicina, ketoconazol, itraconazol) pues el perfil farmacocinético y los niveles plasmáticos de sildenafil hallados en tales pacientes han sido 3 a 8 veces mayores que los voluntarios sanos a las 24 horas de la administración de la dosis.

Advertencias:

El uso de este producto no ofrece protección alguna contra enfermedades de transmisión sexual. Se debe aconsejar a los pacientes sobre medidas de precaución necesarias contra enfermedades de transmisión sexual incluido la infección contra Virus de Inmunodeficiencia (HIV). Existe un potencial de riesgo cardíaco debido a la actividad sexual en pacientes con enfermedad cardiovascular preexistente. Por lo tanto, en general no deben utilizarse tratamientos para la disfunción eréctil, incluido sildenafil, en hombres para los cuales no es recomendable la actividad sexual debido a su estado cardiovascular subyacente. El sildenafil posee propiedades vasodilatadoras sistémicas que resultan en descensos transitorios de la presión sanguínea supina en voluntarios sanos (descenso máximo medio de 8,4/5,5 mmHg). Aunque esto no debería tener consecuencias en la mayoría de los pacientes, antes de prescribir **EXPIT[®]**, los médicos deberían

considerar cuidadosamente si los pacientes con enfermedad cardíaca subyacente podrían ser afectados en forma adversa por tales efectos vasodilatadores, en especial en combinación con la actividad sexual. No existen datos clínicos controlados sobre la seguridad o eficacia del sildenafil en los grupos enumerados a continuación; si se prescribe, debe hacerse con precaución:

- Pacientes que han sufrido un infarto de miocardio, accidente cerebrovascular, o arritmia con amenaza para la vida dentro de los últimos seis meses
- Pacientes con hipotensión (TA< 90/50) o hipertensión (TA> 170/110) en reposo
- Pacientes con falla cardíaca o enfermedad arterial coronaria que causa angina inestable; pacientes con retinitis pigmentaria (la minoría de estos pacientes presenta trastornos genéticos de las fosfodiesterasas retinales).

Luego de la aprobación para la comercialización del sildenafil, se han informado en forma infrecuente erección prolongada de más de 4 horas y priapismo (erecciones dolorosas de más de 6 horas de duración). Si una erección persistiera por más de 4 horas, el paciente debe solicitar inmediata asistencia médica. Si el priapismo no es tratado inmediatamente, puede ocurrir daño del tejido peneano y pérdida permanente de potencia.

La administración concomitante del inhibidor de la proteasa ritonavir causó un incremento sustancial en las concentraciones séricas del sildenafil (incremento de 11 veces de AUC). Se debe tener precaución al prescribir **EXPIT[®]** a pacientes en tratamiento con ritonavir. Existen pocos datos sobre individuos expuestos a niveles sistémicos elevados de sildenafil. En algunos voluntarios sanos expuestos a dosis altas de sildenafil (200mg-800mg) se informaron descenso de la presión sanguínea, síncope y erección prolongada. Se recomienda disminuir la dosis del sildenafil en pacientes en tratamiento con ritonavir para disminuir la probabilidad de eventos adversos (ver Interacciones, Reacciones adversas y Dosificación).

Precauciones y advertencias:

Con el fin de diagnosticar la disfunción eréctil, determinar las causas potenciales subyacentes e identificar el tratamiento apropiado deben obtenerse una historia clínica y examen físico completos. Existe cierto grado de riesgo cardíaco en asociación con la actividad sexual; en consecuencia, los médicos deberán tener en cuenta el estado cardiovascular de sus pacientes antes de iniciar cualquier tratamiento de la disfunción eréctil. Los fármacos para el tratamiento de la disfunción eréctil deben ser utilizados con precaución en los pacientes con deformidades anatómicas penianas (tales como angulación, fibrosis cavernosa o enfermedad de Peyronie) o en aquellos que presenten cuadros que puedan predisponerlos al priapismo (como anemia de células falciformes, mieloma múltiple o leucemia). La seguridad y la eficacia de la combinación del sildenafil con otros tratamientos de la disfunción eréctil no se han estudiado. Por consiguiente, no se recomienda el uso de tales combinaciones. El sildenafil carece de efecto sobre el tiempo de sangría cuando se administra sólo o con aspirina. Los estudios in vitro con plaquetas humanas indican que el sildenafil potencia el efecto antiagregante del nitroprusiato sódico (un donante de óxido nítrico). No se dispone de información de seguridad respecto de la administración de sildenafil a pacientes con trastornos hemorrágicos o úlcera péptica activa. Por consiguiente, el sildenafil debe administrarse con precaución a estos pacientes.

Se ha informado un descenso adicional de la presión arterial en pacientes hipertensos tratados concomitantemente con amlodipina (5 o 10 mg) y sildenafil 100 mg. Algunos datos de ensayos clínicos indican una reducción del clearance de sildenafil cuando se asocia con ketoconazol o itraconazol.

Una minoría de pacientes que padecen el cuadro hereditario retinitis pigmentaria presenta alteración genética de las fosfodiesterasas retinianas. No existe información de seguridad respecto de la administración de sildenafil a pacientes con dicha patología. Por consiguiente, el sildenafil debe administrarse con precaución a estos pacientes.

• **Carcinogénesis, mutagénesis, fertilidad:**

El sildenafil no fue carcinogénico cuando se lo administró a ratas durante 24 meses en una dosis que produjo la exposición sistémica total (AUC) del sildenafil no ligado y su principal metabolito, iguales a 29 y 42 veces (ratas de sexos masculino y femenino, respectivamente) a las exposiciones observadas en seres humanos (MRHD), de 100 mg. El sildenafil no fue carcinogénico cuando se lo administró a ratones durante 18 a 21 meses en dosis de hasta la Dosis Máxima Recomendada (MTD), de 10 mg / kg / día, aproximadamente igual a 0,6 veces la MRHD, expresada en mg/m².

El sildenafil resultó negativo en estudios bacterianos y en células de ovario de hámster chino in vitro, destinados a la detección de mutagenicidad, y en estudios en linfocitos humanos in vitro y en micrónucleos de ratón in vivo, destinados a la detección de clastogenicidad.

No hubo alteración de la fertilidad en ratas a las que se administró sildenafil en dosis de hasta 60 mg / kg / día durante 36 días en el caso de las hembras y 102 días en el caso de los machos, una dosis productora de un valor de AUC de más de 25 veces el AUC humana masculina. No hubo efecto sobre la motilidad o la morfología espermáticas a continuación de dosis orales únicas de 100 mg de sildenafil administradas a voluntarios sanos.

• **Embarazo, lactancia y uso pediátrico:**

EXPIT® no se encuentra indicado para su empleo en recién nacidos, niños o mujeres.

Embarazo (Categoría B). No se observaron evidencias de teratogenicidad, embriotoxicidad o fetotoxicidad en ratas y conejos que recibieron hasta 200 mg/kg/ día durante la organogénesis. Estas dosis representan, respectivamente, alrededor de 20 y 40 veces la MRHD, expresada en mg/m², para un sujeto de 50 kg. En el estudio de desarrollo prenatal y postnatal de la rata, la dosis de ausencia de efectos adversos fue de 30 mg kg / día, administrada durante 36 días. En la rata no preñada, el AUC fue con esta dosis igual a alrededor de 20 veces el AUC humana. No se dispone de estudios adecuados y bien controlados del sildenafil en mujeres embarazadas.

• **Interacciones medicamentosas:**

– Efectos de otras drogas sobre el sildenafil:

Estudios in vitro: El metabolismo del sildenafil es mediado sobre todo por las isoformas 3A4 (vía principal) y 2C9 (vía accesorio) del citocromo P450 (CYP). En consecuencia, los inhibidores de estas isoenzimas pueden reducir el clearance del sildenafil.

Estudios in vivo: *Cimetidina:* La cimetidina (800 mg), un inhibidor no específico del CYP, causó un incremento del 56% en las concentraciones plasmáticas del sildenafil cuando se la administró conjuntamente con el sildenafil (50 mg) a voluntarios sanos. *Eritromicina:* Cuando se administró una dosis única de 100 mg de sildenafil junto con eritromicina, un inhibidor específico del CYP 3A4 en estado estable (500 mg dos veces por días durante 5 días), se observó un incremento de 182% en la exposición sistémica del sildenafil (AUC).

Ketoconazol, itraconazol: Es de esperar que los inhibidores más fuertes del CYP 3A4, como el ketoconazol o el itraconazol presente efectos aún más importantes: los datos posclínicos de los pacientes de estudios clínicos indican una reducción del clearance del sildenafil cuando se lo administró conjuntamente con inhibidores del CYP 3A4 (como el ketoconazol, la entromicina o la cimetidina).

Rifampicina: Puede esperarse que la administración concomitante de inductores del CYP 3A4, como la rifampicina, reduzca los niveles del sildenafil en plasma.

Antídotos: Las dosis aisladas de antídotos (hidróxido de magnesio / hidróxido de sodio) no afectaron la biodisponibilidad del sildenafil.

Saquinavir: En un estudio llevado a cabo en voluntarios sanos de sexo masculino, la coadministración del inhibidor de la proteasa de HIV, saquinavir, también un inhibidor del CYP3A4, en estado de equilibrio (1,200mg tres veces por día) con sildenafil (dosis única de 100mg) resultó en un aumento del 140% en la C_{max} del sildenafil y un aumento del 210% en la AUC del sildenafil. El sildenafil no tuvo efecto alguno sobre la farmacocinética del saquinavir.

Ritonavir: En un estudio en voluntarios sanos del sexo masculino, la coadministración del inhibidor de la proteasa de HIV, ritonavir, que es un potente inhibidor del P450, en estado de equilibrio (500mg dos veces por día) con sildenafil (dosis única de 100mg) resultó en un aumento del 300% (de 4 veces) en la C_{max} del sildenafil y un aumento del 1,000% (de 11 veces) en el AUC plasmático del sildenafil. A las 24 horas, los niveles plasmáticos del sildenafil aún fueron de 200ng/ml aproximadamente, comparados con 5ng/ml cuando el sildenafil fue administrado solo. Esto es consistente con el efecto marcado del ritonavir sobre la amplia gama de sustratos del P450. El sildenafil no tuvo efecto alguno sobre la farmacocinética del ritonavir.

Otros: Los datos farmacocinéticos de pacientes de estudios clínicos no mostraron efectos sobre la farmacocinética del sildenafil por parte de los inhibidores del CYP 2C9 (como la tolbutamida y la warfarina), los inhibidores del CYP 2D6 (como los inhibidores de la recaptación de serotonina y los antidepresivos tricíclicos), las tiазidas y los diuréticos relacionados con ellas, los inhibidores de la ECA y los bloqueantes de los canales de calcio. El AUC del metabolito activo, el N-desmetil-sildenafil, aumentó un 62% debido a los diuréticos de asa y ahorradores de potasio y un 103% debido a los beta bloqueantes no específicos. No se espera que estos efectos sobre el metabolito tengan consecuencias clínicas.

– Efectos del sildenafil sobre otras drogas:

Estudios in vitro: El sildenafil es un inhibidor leve de las isoformas 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 y 3A4 del citocromo P450 (C₅₀ > 150 (mM)). Dadas las concentraciones plasmáticas máximas del sildenafil, de aproximadamente 1mM a continuación de las dosis recomendadas, es improbable que el sildenafil altere el clearance de los sustratos de dichas enzimas. **Estudios in vivo:** No se demostraron interacciones significativas con la tolbutamida (250 mg) o la warfarina (40 mg), ambas metabolizadas por el CYP 2C9.

El sildenafil (50 mg) no potenció el incremento del tiempo de sangría causada por la aspirina, ni el efecto hipotensor del alcohol en voluntarios sanos con alcoholemias máximas medias de 0,08%. No se observó interacción cuando se administró sildenafil (100 mg) conjuntamente con amitodipina a pacientes hipertensos. La reducción adicional media de la presión sanguínea en posición supina (sistólica 7 mm Hg) fue de magnitud similar a la observada cuando se administró sildenafil solo a voluntarios sanos. El análisis de la base de datos de seguridad no mostró diferencias en el perfil de efectos adversos en los pacientes que recibieron sildenafil concomitantemente con medicación antihipertensiva o sin ella.

Reacciones adversas:

Durante los estudios clínicos llevados a cabo en todo el mundo, el sildenafil se administró a más de 3700 pacientes (de 19 a 87 años de edad). Mas de 550 pacientes fueron tratados por mas de un año.

En los estudios clínicos controlados con placebo, el índice de

interrupciones, debidas a efectos adversos del sildenafil (2,5%) no fue significativamente diferente del correspondiente al placebo (2,3%). Los efectos adversos fueron por lo general transitorios y de naturaleza leve a moderada.

En estudios clínicos con todos los diseños, los efectos adversos informados por los pacientes que recibían el sildenafil fueron generalmente similares. En los estudios de dosis fijas, la incidencia de algunos efectos adversos aumentó con la dosis. La naturaleza de los efectos adversos en los estudios de dosis flexibles, que reflejan más estrechamente el régimen de dosis recomendadas, fue similar a la hallada en los estudios de dosis fijas.

Cuando el sildenafil se ingirió en la forma recomendada (según necesidad) se informaron los siguientes efectos adversos en estudios clínicos de dosis flexibles controlados con placebo:

Efectos adversos informados por ≥ 2% de los pacientes tratados con sildenafil y más frecuentemente con droga que con placebo en estudios PRN de fases **II/III** con dosis flexibles

* Visión anormal: Leve y transitoria, predominantemente en forma de matices en la visión de los colores, pero también sensibilidad aumentada a la luz, o visión borrosa. En estos estudios, sólo un paciente abandonó debido a visión anormal. Hubo otras reacciones adversas con una frecuencia > 2%, pero de igual incidencia que con el placebo: infección del tracto respiratorio, dolor de espaldas, síndrome gripal y artralgia.

Efecto adverso	Pacientes que informaron efectos adversos (%)	
	Sildenafil N= 734	Placebo N= 725
Cefalea	16 %	4 %
Rubor facial	10 %	1 %
Dispepsia	7 %	2 %
Congestión nasal	4 %	2 %
Infección del tracto urinario	3 %	2 %
Visión anormal*	3 %	0 %
Diarrea	3 %	1 %
Mareos	2 %	1 %
Rash	2 %	1 %

En los estudios de dosis fijas, la dispepsia (17%) y la visión anormal (11%) fueron mas frecuentes con 100 mg que con dosis menores. En dosis mayores al rango posológico recomendado, los efectos adversos fueron similares a los antes detallados, pero por lo general se los informó con mayor frecuencia.

No se informaron casos de priapismo.

Los eventos que se mencionan a continuación se presentaron en 12% de los pacientes de estudios clínicos controlados; la relación causal con el sildenafil es incierta. Los efectos informados incluyen aquellos con una relación verosímil con el uso de la droga: se omiten eventos menores e informes demasiado imprecisos como para ser significativos:

Cuerpo en general: Edema facial, reacción de fotosensibilidad, shock, astenia, dolor, escalofríos, caída accidental, dolor abdominal, reacción alérgica, dolor torácico, traumatismo accidental.

Cardiovasculares: Angina de pecho, bloqueo AV, migraña, síncope, taquicardia, palpitaciones, hipotensión postural, isquemia miocárdica, trombosis cerebral, paro cardíaco, insuficiencia cardíaca, electrocardiograma anormal, cardiomiopatía.

Digestivos: Vómitos, glositis, colitis, disfagia, gastritis, gastroenteritis, esofagitis, estomatitis, sequedad de boca, pruebas funcionales hepáticas anormales, hemorragia rectal, gingivitis.

Sanguíneos y linfáticos: Anemia y leucopenia.

Metabólicos y nutricionales: Sed, edema, gota, diabetes inestable, hiperuricemia, edema periférico, hiperglucemia, reacción hipoglucémica, hipernatremia.

Musculosquelético: Artritis, artrosis, mialgia, rotura tendinosa, tenosinovitis, dolor óseo, miastenia, sinovitis. Nerviosos: Ataxia, hipertonia, neuralgia, neuropatía, parestesias, temblor, vértigo, depresión, insomnio, somnolencia, sueños anormales, reflejos disminuidos, hipoestesia.

Respiratorios: Asma, disnea, laringitis, sinusitis, bronquitis, aumento del esputo, aumento de la tos.

Piel y apéndices: Urticaria, herpes simplex, prurito, sudoración, úlceras de la piel, dermatitis de contacto, dermatitis exfoliativa.

Sensorios: Midriasis, conjuntivitis, fotofobia, acúfenos, dolor ocular, sordera, dolor de oídos, hemorragia ocular, cataratas, sequedad ocular.

Urogenitales: Cistitis, nocturia, aumento de la frecuencia urinaria, aumento del tamaño mamario, incontinencia urinaria, eyaculaciones anormales, edema genital y anorgasmia.

Sobredosificación:

No se describen casos de sobredosificación. En estudios de dosis únicas de hasta 800 mg realizados en voluntarios sanos, los efectos adversos fueron similares a los observados con dosis menores, aun cuando se encontraron incidencias aumentadas.

En caso de sobredosis deben adoptarse medidas estandarizadas de sostén según sea necesario. No se espera que la diálisis renal acelere el clearance, ya que el sildenafil se halla fuertemente unido a proteínas plasmáticas y no es eliminado por orina.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4862-8888 / 2247
Hospital A. Posadas: (011) 4854-8648/ 4858-7777

Presentación

EXPIT® Comprimidos Recubiertos de 50 y 100 mg: Envases conteniendo 2 comprimidos recubiertos.

EXPIT® Comprimidos Masticables de 50 mg: Envases conteniendo 2 comprimidos masticables.

Conservación:

Mantener lejos del calor y la luz solar directa, en un ambiente fresco y seco, a una temperatura entre 15 y 30 °C.

Este medicamento debe ser usado bajo prescripción y vigilancia médica y no puede repetirse sin nueva receta médica.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud, Certificado N° 50.230



Dr. LAZAR y Cia. S.A.Q. e s. r. l.
Av. Vélez Sarsfield 5853/5855
B1605EP1 Munro, Poja, de Buenos Aires
Directora Técnica: Daniela A. Casas,
Farmacéutica y Bioquímica.

Última revisión del prospecto: 4/10/2006

367542
P672