

- Sistema tegumentario: prurito, sudoración, dermatitis por contacto y exfoliativa, urticaria y herpes simple.
- Metabolismo y nutrición: descompensación diabética, edemas periféricos, aumento de la sed, gota, hiperuricemia, hipoglucemia e hipernatremia.
- Organos de los sentidos: midriasis, conjuntivitis, hemorragia ocular, fotofobia, dolor ocular, cataratas, xeroftalmia, tinitus, sordera, otalgia.
- Sistema urogenital: nocturia, polaquiuria, incontinencia urinaria, edema genital, anorgasmia, trastornos de la eyaculación, tumefacción mamaria.
- Otros: edema facial, fotosensibilidad, shock, astenia, escalofríos, caídas, dolor torácico.

**Sobredosificación:** dosis de hasta 800 mg en voluntarios sanos produjeron efectos colaterales similares a los observados con dosis terapéuticas. En caso de sobredosis se recomienda adoptar terapéutica de sostén. La hemodiálisis no tiene valor en el tratamiento.

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

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/2247.

Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777.

Optativamente otros Centros de Intoxicaciones.

**Presentación:** envases con 2 y 20 comprimidos masticables.

**Forma de conservación:** conservar en lugar fresco y seco, preferentemente entre 15 y 30°C. Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Luis M. Radici - Farmacéutico.  
 MEDICAMENTO AUTORIZADO POR EL MINISTERIO DE SALUD.  
 Certificado N° 47.284 - Laboratorios CASASCO S.A.I.C. - Boyacá 237 Buenos Aires

**Este medicamento debe ser usado exclusivamente bajo prescripción médica. No puede repetirse sin nueva receta.**

LABORATORIOS CASASCO S.A.I.C  
 Boyacá 237 - Buenos Aires - Tel (5411) 4633-3838  
 Contacto Comercial: info@casasco.com.ar

E-0929-02 | D0389 | Act. 04/2013

**CASASCO**

4

# ACTIVIL® 50 SILDENAFIL

**COMPRIMIDOS  
MASTICABLES**

**Venta Bajo Receta Archivada**  
 Industria Argentina

**Fórmula:** cada comprimido masticable contiene: Sildenafil citrato 70,24 mg (Equivalente a 50,00 mg de Sildenafil). Excipientes: Lactosa 248,360 mg, Manitol 90,000 mg, Neohesperidina Dihidrochalcona 0,600 mg, Povidona K-30 18,000 mg, Croscarmelosa sódica 36,000 mg, Carboximetilcelulosa cálcica 90,000 mg, Mentol 4,800 mg, Sacarina sódica 3,000 mg, Ciclamato de sodio 21,000 mg, Aspartamo 4,800 mg, Laca aluminica azul indigo carmin 1,200 mg y Estearato de magnesio 12,000 mg.

**Acción Terapéutica:** incrementa la respuesta eréctil del pene al estímulo sexual.

**Indicaciones:** tratamiento de la disfunción eréctil.

**Acción Farmacológica:** Sildenafil inhibe la enzima fosfodiesterasa tipo 5 GMP cíclico específica en las células musculares lisas de los cuerpos cavernosos, lo que aumenta los niveles de GMP cíclico. El GMP cíclico produce la relajación de la musculatura lisa del cuerpo cavernoso, favoreciendo la erección peneana normal.

**Farmacocinética:** luego de su administración oral la droga se absorbe rápidamente alcanzando la concentración plasmática máxima en un promedio de 60 minutos. La vida media es de alrededor de 4 horas. Los alimentos con alto contenido graso reducen la absorción de la droga y la biodisponibilidad es de alrededor del 40%. El metabolismo se realiza principalmente a nivel hepático produciéndose un metabolito activo con propiedades similares a la droga original. La excreción se produce en su mayor parte a través del tubo digestivo (80%) y el resto por vía urinaria (13%). En pacientes mayores de 65 años el clearance de Sildenafil se reduce con concentraciones plasmáticas 40% mayores que aquellas observadas en voluntarios jóvenes (18 a 45 años). En pacientes con insuficiencia renal leve (clearance de creatinina de 50 a 80 mg/min) y moderada (clearance de creatinina de 30 a 49 ml/min) la farmacocinética de la droga no presenta alteraciones mientras que en aquellos pacientes con insuficiencia renal severa (clearance de creatinina < 30 ml/min) la depuración de la droga se reduce duplicándose la concentración plasmática máxima y el área bajo la curva cuando se comparó con individuos sanos. La depuración de Sildenafil también reduce en pacientes con disfunción hepática.

**Posología - Modo de administración:** si bien puede ingerirse entre 4 horas y media hora previas al acto sexual, la dosis recomendada es de 50 mg 1 hora antes de dicha actividad. La dosis puede incrementarse hasta un máximo de 100 mg o ser disminuida hasta 25 mg de acuerdo a su eficacia y tolerancia. No debe administrarse más de una vez al día. Los comprimidos masticables pueden ser masticados o deglutidos enteros. En los casos siguientes se aconseja utilizar una dosis inicial de 25 mg: mayores de 65 años, insuficiencia hepática o renal severas, tratamiento simultáneo con inhibidores del citocromo P450A4 (Eritromicina, Ketoconazol, Itraconazol).

**Contraindicaciones:** hipersensibilidad a la droga o cualquiera de los componentes del producto. Tratamiento simultáneo con nitratos orgánicos (Nitroglicerina, Isosorbida mono y dinitrato, Pentaeritrol, Tetranitrato, etc).

1

**Advertencias:** se recomienda que antes de la indicación de este producto la realización de una correcta anamnesis y examen físico completo con el fin de determinar el tratamiento adecuado de la disfunción eréctil en cada paciente en particular. El uso de la medicación no previene enfermedades de transmisión sexual (entre ellas el SIDA) por lo cual deben emplearse los métodos de profilaxis adecuados.

**Riesgo de actividad sexual:** Sildenafil no debe ser empleado en pacientes en los cuales no es recomendable la actividad sexual por presentar enfermedad cardiovascular subyacente.

**Efecto vasodilatador:** Sildenafil tiene efecto vasodilatador sistémico que produce disminución transitoria de la presión arterial. Este efecto, de escasas consecuencias en la mayoría de los pacientes en condiciones normales, puede afectar adversamente a pacientes con enfermedad cardiovascular, más aún si la vasodilatación provocada se combina con actividad sexual.

**Pacientes no estudiados en ensayos clínicos:** no existen datos de ensayos clínicos controlados que indiquen la seguridad o eficacia del Sildenafil en los siguientes grupos de pacientes, por lo que en caso de ser prescripto, deben serlo con extrema precaución:

- pacientes que hayan sufrido infarto de miocardio, accidente cerebrovascular o arritmia severa en los últimos 6 meses.
- Pacientes con hipotensión (presión arterial <90/50 mmHg o hipertensión arterial >170/100).
- Pacientes con historia de insuficiencia cardíaca o enfermedad coronaria causal de angina inestable.
- Pacientes con retinitis pigmentosa (una pequeña proporción de estos pacientes presenta alteraciones genéticas de las fosfodiesterasas de la retina) y enfermedades oculares.

**Priapismo:** raramente se han informado erecciones prolongadas de más de cuatro horas de duración y priapismo (erecciones dolorosas de más de seis horas de duración) con el uso de Sildenafil. En caso de producirse una erección de duración mayor a 4 horas debe efectuarse una consulta médica inmediata. Si esta situación no es tratada inmediatamente puede sobrevenir daño tisular del pene y pérdida permanente de la potencia sexual.

Luego de la comercialización de drogas tales como sildenafil, tadalafil o vardenafil (inhibidores de la fosfodiesterasa tipo 5PDE) 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 (NOIA-NA). 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 5PDE y la NOIA-NA. El médico deberá informar a sus pacientes con factores de riesgo sobre la posibilidad de padecer NOIA-NA; y que, en caso de presentar una pérdida repentina de la visión de uno o ambos ojos mientras están tomando inhibidores 5PDE (incluyendo sildenafil, tadalafil o vardenafil, según corresponda), deben suspenderse la medicación y consultar a un médico especialista.

**Precauciones:** debe usarse con precaución en pacientes con deformaciones peneanas (ej.: fibrosis cavernosa o enfermedad de Peyronie) o en aquellos que cursen con enfermedades tales como anemia falciforme, mieloma múltiple, leucemia u otras condiciones que predispongan al desarrollo de priapismo. También debe usarse con precaución en pacientes con trastornos de la coagulación, úlcera péptica y retinitis pigmentaria. Debe evaluarse el estado cardiovascular del paciente antes de iniciar el tratamiento. No se recomienda la combinación de Sildenafil con otros tratamientos para la disfunción eréctil ya que aún no ha sido comprobada la seguridad y eficacia de los tratamientos conjuntos.

2

Se recomienda especial precaución en los siguientes casos: edad mayor de 65 años, insuficiencia hepática (por ejemplo, cirrosis), insuficiencia renal severa (clearance de creatinina <30 ml/minutos), tratamiento concomitante con medicamentos inhibidores potentes del citocromo P450 3A4 (eritromicina, ketoconazol, itraconazol) pues el perfil farmacocinético y los niveles plasmáticos de Sildenafil hallados en tales pacientes han sido 3 a 8 veces mayores que en los voluntarios sanos a las 24 horas de la administración de la dosis. Sildenafil no influye sobre el tiempo de sangría cuando se toma solo o junto con aspirina. Los estudios in vitro con plaquetas humanas indican que Sildenafil potencia el efecto antiagregante del nitroprusiato de sodio (un donante de óxido nítrico). Se ha informado un descenso adicional de la presión arterial en pacientes hipertensos tratados concomitantemente con amlodipina (5 ó 10 mg) y Sildenafil 100 mg.

**Interacciones medicamentosas:** las drogas que inhiben el citocromo P450 pueden reducir la depuración de Sildenafil aumentando su biodisponibilidad. Entre ellas se encuentran la cimetidina, eritromicina, ketoconazol, itraconazol y mibefradil. Los inductores enzimáticos tales como la rifampicina disminuyen los niveles plasmáticos de esta droga. La biodisponibilidad de Sildenafil no se ve alterada por el uso de antiácidos. El Sildenafil no mostró interacciones farmacocinéticas con tolbutamida, warfarina, inhibidores selectivos de la recaptación de serotonina, antidepresivos tricíclicos, diuréticos tiazídicos, IECA, amlodipina y otros bloqueantes cálcicos.

La droga no potenció los efectos hipotensivos del alcohol. Dosis simples de antiácidos (hidróxido de magnesio e hidróxido de aluminio) no alteraron la biodisponibilidad del producto. El área bajo la curva del metabolito activo N-desmetil Sildenafil aumentó un 62% por efecto de diurético del asa y ahorradores de potasio y en un 102% por efecto de betabloqueantes no selectivos. Estos efectos sobre el metabolito de Sildenafil no produjeron consecuencias clínicas.

**Carcinogénesis, mutagénesis y trastorno de la fertilidad:** no se describieron efectos de este tipo en diversos estudios animales.

**Embarazo, lactancia y uso en pediatría:** no está indicado su uso en mujeres y niños.

**Reacciones adversas:** en los estudios realizados solo el 2.5% de los pacientes debió suspender el tratamiento antes reacciones adversas que fueron de carácter leve a moderado siendo este porcentaje similar al grupo placebo (2.3%).

Los efectos que con mayor frecuencia se observaron fueron cefalea, rubor facial, dispepsia, congestión nasal, infección urinaria, trastornos de la visión, diarrea, vértigo y rash cutáneo. Con menor frecuencia se observaron infecciones del tracto respiratorio, dorsalgia, síndromes gripales y artralgias.

En menos del 2% de los pacientes se comunicaron otros efectos adversos aunque no es clara su asociación con Sildenafil, entre ellos:

- Sistema Nervioso Central: ataxia, aumento del tono muscular, neuralgias, parestesias, temblor, depresión, insomnio, somnolencia, hiporeflexia e hipoestesia.
- Sistema Cardiovascular: angor, bloqueo auriculoventricular, síncope, hipotensión ortostática, taquicardia, palpitaciones, isquemia miocárdica, trombosis celular, migraña, alteraciones en el electrocardiograma, insuficiencia cardíaca, miocardiopatías y paro cardíaco.
- Sistema gastrointestinal: vómitos, glositis, colitis, disfagia, gastroenteritis, esofagitis, boca seca, gingivitis, alteraciones de los tests de función hepática, hemorragia rectal y estomatitis.
- Sistema hematológico: anemia y leucopenia.
- Sistema musculoesquelético: artritis, mialgias, tenosinovitis, dolor óseo, ruptura tendinosa, debilidad muscular.
- Sistema respiratorio: disnea, broncoespasmo, laringitis, faringitis, sinusitis, aumento de la tos y de la producción de esputo.

3