

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

SILDENAFILO CITRATO

Formula Molecular:	$C_{22}H_{30}N_6O_4S \cdot C_6H_8O_7$
Peso Molecular:	666,71
Datos Físico-Químicos:	Polvo cristalino blanco. Soluble en agua caliente, muy ligeramente soluble en etanol, prácticamente insoluble en cloroformo. Se disuelve en disoluciones diluidas de ácidos minerales.
Propiedades y usos:	<p>El sildenafil citrato es un inhibidor selectivo de la fosfodiesterasa tipo 5.</p> <p>Se absorbe rápidamente tras su administración oral, con una biodisponibilidad de aproximadamente un 40%. La concentración plasmática máxima se alcanza en 30-120 min; la tasa de absorción se reduce cuando se administra conjuntamente con alimentos. Se distribuye ampliamente en los tejidos y se une en aproximadamente un 96% a las proteínas plasmáticas. Se metaboliza mayoritariamente en hígado por la vía de los citocromos. El principal metabolito es el N-desmetilsildenafil, que también tiene cierta actividad, y se excreta por heces y en menor grado por orina. La semivida del sildenafil y de este metabolito es de unas 4 h.</p> <p>El sildenafil citrato se emplea de habitual en el tratamiento de la disfunción eréctil, y en formulación magistral se usa en el tratamiento de la hipertensión pulmonar persistente del recién nacido (HPPRN), ya que es un vasodilatador pulmonar relativamente selectivo.</p>
Dosificación:	Para el tratamiento de la hipertensión pulmonar persistente del recién nacido (HPPRN), dosificación sujeta a decisión médica. Dosis habituales en pediatría (hasta los 6 años): 2 – 10 mg/Kg/día.
Efectos secundarios:	Los efectos adversos descritos con mayor frecuencia para el sildenafil son cefalea, rubor y dispepsia. Pueden producirse alteraciones visuales, mareo y congestión nasal. Otros efectos adversos consisten en diarrea, dolor muscular, exantemas e infecciones de las vías urinarias o respiratorias. También se ha presentado priapismo. Existen asimismo informes de accidentes cardiovasculares graves, incluida muerte cardíaca repentina, relacionadas con la utilización de sildenafil.
Precauciones:	<p>Se requiere precaución en pacientes con alteraciones hepáticas o disfunción renal grave, y puede ser necesario reducir la dosificación. También hay que adoptar precauciones en pacientes con trastornos anatómicos o hematológicos que le predispongan al priapismo. Pacientes que experimentan mareos o alteraciones visuales no deben conducir ni manejar maquinaria peligrosa.</p> <p>La seguridad del sildenafil es incierta en pacientes con alteraciones hepáticas graves, trastornos hemorrágicos, úlcera</p>

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

péptica activa, hipotensión, antecedentes recientes de accidente vascular cerebral, infarto de miocardio o arritmias potencialmente mortales, angina inestable, insuficiencia cardíaca o trastornos retinianos, como retinitis pigmentosa.

Interacciones:

El sildenafil puede potenciar los efectos hipotensores de los nitratos orgánicos y, por consiguiente, está contraindicado en pacientes tratados con estos fármacos. La administración simultánea de sildenafil con fármacos que inhiben la isoenzima CYP3A4 del citocromo P450, como la cimetidina, la eritromicina, el itraconazol, el ketoconazol y los inhibidores de la proteasa del VIH pueden reducir el aclaramiento del sildenafil y requerir una reducción en la dosificación. Sin embargo, las concentraciones plasmáticas del sildenafil aumentan significativamente por ritonavir, requiriendo incluso una reducción mayor de la dosificación, por lo que se recomienda firmemente no administrar estos 2 fármacos al mismo tiempo.

Incompatibilidades:

El sildenafil citrato tiene un sabor amargo y este sabor es difícil de enmascarar, porque no admite edulcoración con sacarina sódica, ya que interacciona y precipita.

Conservación:

En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Suspensiones orales de sildenafil 2 mg/ml

Sildenafil	0,200 g
Solución de metilcelulosa 1%	50 ml
Nipagín	0,050 g
Nipasol	0,022 g
Acesulfamo potásico	0,500 g
Esencia para uso oral	0,050 g
Jarabe simple	c.s.p 100 ml

Sildenafil	0,200 g
Excipiente Acofar suspensión oral	50 %
Excipiente Acofar jarabe c.s.p.	100 ml

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *Formulas magistrales en pediatría*, Joaquín Callabed (2011).
- *Formulación en farmacia pediátrica*, Atienza Fernández M., Martínez Atienza J., Marín Gil R.; 4ª ed., 2011