

FÓRMULA MOLECULAR: C₂₂H₁₉N₃O₄

PESO MOLECULAR: 389.40 g/mol

DCB/ DCI: 08253 - Tadalafila

CAS: 171596-29-5

INCI: Não aplicável

SINONÍMIA: Tadalafil 6S,12ar diastereomer;epi-tadafil; cis-tadalafil

Descrição/ especificação técnica: Tadalafila é um composto à base de carbonila (C=O), um potente e seletivo inibidor da enzima fosfodiesterase tipo 5 (PDE5). Possui um maior tempo de meia-vida (17.5 horas) quando comparado aos demais inibidores de PDE5, resultando em uma maior duração de ação e uma ereção peniana mais prolongada. Tadalafila é usado para tratar a disfunção erétil masculina, ou impotência.

PROPRIEDADES:

- Vasodilatador;
- Relaxante da musculatura lisa do corpo cavernoso;
- Inibidor seletivo da enzima fosfodiesterase tipo 5 (PED-5);
- Elevado tempo de meia vida.

Composição: Substância Isolada

APLICAÇÕES

INDICAÇÕES

- Disfunção erétil (DE);

POSOLOGIA / CONCENTRAÇÃO:

5 a 20mg

É recomendada a dose de 5 a 10mg para uso diário.

VIA DE ADMINISTRAÇÃO

Oral e Transdérmica.

SOLUÇÃO MAGISTRAL

Oportunidade exclusiva e promissora para terapia individualizada por via transdérmica, garantindo maior perfil de segurança e eficácia ao tratamento, além de menor incidência de efeitos adversos indesejáveis.

REFERÊNCIAS CIENTÍFICAS

ESTUDOS CLÍNICOS/ ESTUDOS PRÉ-CLÍNICOS

TADALAFILA USO DIÁRIO TRANSDÉRMICO

Em um estudo duplo-cego randomizado, placebo-controlado, 423 pacientes diagnosticados com DE receberam tadalafila 20 mg sob demanda ou tadalafila 5 mg diariamente ou placebo. Os resultados demonstraram que o tratamento com tadalafila diário foi o mais efetivo. Outro estudo conduzido para a avaliação da liberação transdérmica de tadalafila, que evita a metabolização pré-sistêmica, mostrou que essa via pode apresentar-se como uma alternativa promissora à administração por via oral da tadalafila.

TERAPIA DE REPOSIÇÃO DE TESTOSTERONA + INIBIDORES DE PDE-5

A adição de testosterona pode melhorar a ação dos inibidores de PDE-5 em pacientes que não respondem bem a terapia isolada. Vários estudos tem demonstrado esse fato. Em um estudo incluindo 173 homens nãorespondedores a terapia com tadalafila 10 mg ao dia por 4 semanas, receberam concomitantemente gel transdérmico de testosterona 1 % ou placebo. A melhora no resultado foi significativamente superior no grupo com testosterona, com máximo resultado após 12 semanas. Portanto, em homens hipogonadais, a administração de testosterona associada à tadalafila, apresentou melhor resposta.

Em outro estudo, 60 pacientes foram acompanhados durante 30 semanas. Metade recebeu 1,000mg de undecanoato de testosterona parenteral no dia 1, seguido por injeções adicionais nas semanas 6 e 18, com tadalafila 20mg sobre demanda durante 30 semanas (grupo I). Os outros 30 pacientes receberam a mesma dose e esquema de undecanoato de testosterona como o grupo I, porém utilizaram tadalafila 5mg diariamente, 1 vez ao dia, por 30 semanas (grupo II). A proporção de pacientes que relataram melhora na função erétil e nos sintomas físicos e mentais relacionados à idade foi significativamente maior no grupo II do que no grupo I, demonstrando que a associação de testosterona com tadalafila 5mg diariamente foi mais eficaz.

FARMACOLOGIA

ESTABILIDADE

Dado não encontrado nas referências consultadas.

MECANISMO DE AÇÃO

Tadalafila inibe seletivamente a enzima fosfodiesterase tipo 5 (PDE-5), responsável pela degradação de GMPc na musculatura lisa do corpo cavernoso e esponjoso do pênis. A ereção peniana durante a estimulação sexual é causada pelo aumento do fluxo sanguíneo no pênis, resultante do relaxamento das artérias penianas e da musculatura lisa do corpo cavernoso. Essa resposta é mediada pela liberação de óxido nítrico (NO), que ativa a enzima guanilatociclase, estimulando a síntese de guanosina monofosfato cíclico (GMPc) em células musculares lisas, responsável pelo relaxamento da musculatura lisa e pelo aumento do fluxo sanguíneo para o corpo cavernoso. A inibição dessa degradação pela tadalafila resulta em um aumento dos níveis de GMPc, promovendo um relaxamento muscular prolongado, vasodilatação e ingurgitamento vascular do corpo cavernoso, melhorando, assim, a função erétil.

EFEITOS ADVERSOS

Cefaléia, enxaqueca, tontura, rubor facial, priapismo e congestão nasal.

CONTRAINDICAÇÕES/ PRECAUÇÕES

A administração de Tadalafila a pacientes em uso de qualquer forma de nitrato orgânico é contraindicado, pois pode potencializar os efeitos hipotensivos dos nitratos.

A administração concomitante com antiácidos (p. ex hidróxido de magnésio e hidróxido de alumínio) diminui a absorção de tadalafila.

Não deve ser usado em pacientes com insuficiência hepática ou renal grave.

Tadalafila não é indicado para homens que não apresentam disfunção erétil.

FARMACOTÉCNICA

EQUIVALÊNCIA

Não aplicável.

CONCENTRAÇÃO/ DILUIÇÃO (FABRICANTE)

Aplicar fator de correção de acordo com o resultado de doseamento do Certificado de Análise do lote em questão, se necessário.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

1. <http://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/Tadalafil> - Acesso em 13/07/2015 as 11:00h
2. <http://www.molbase.com/en/index.html> - Acesso em 13/07/2015 as 10:30h
3. <http://www.drugbank.ca/drugs/DB00820> - Acesso em 16/07/2015 as 14:00h
4. Thomson.Micromedex. Drug Information for the Health Care Professional. 24th ed. Volume 1. Plus Updates. Content Reviewed by the United States Pharmacopeial Convention, Inc. Greenwood Village, CO. 2004.
5. Buvat J, et ; Hypogonadal men nonresponders to the PDE5 inhibitor tadalafil benefit from normalization of testosterone levels with a 1% hydroalcoholic testosterone gel in the treatment of erectile dysfunction (TADTEST study). J Sex Med. 2011 Jan;8(1):284-93.
6. Montorsi F., et al; Effects of tadalafil treatment on erectile function recovery following bilateral nerve-sparing radical prostatectomy: a randomised placebo-controlled study (REACTT); Eur Urol. 2014 Mar;65(3):587-96
7. Park MG1 , Yeo JK, Cho DY, Kim JW, Kim JW, Oh MM, Kim JJ, Moon du G, The efficacy of combination treatment with injectable testosterone undecanoate and daily tadalafil for erectile dysfunction with testosterone deficiency syndrome, J Sex Med. 2015 Apr;12(4):966-74.
8. Yassin AA, Saad F, Diede HE; Testosterone and erectile function in hypogonadal men unresponsive to tadalafila: results from an open-label uncontrolled study; Andrologia 2006 Apr; 38(2): 61-8.
9. Mehanna MM et al, Nanovesicular carrier-mediated transdermal delivery of tadalafila: i-formulation and physicochemical characterization; Drug Dev Ind Pharm. 2015 May; 41(5): 714-21
10. Mahmoud El-Badry, Nazrul Haq, Gihan Fetih, and Faiyaz Shakeel, Measurement and Correlation of Tadalafil Solubility in Five Pure Solvents at (298.15 to 333.15) K, J. Chem. Eng. Data, 2014, 59 (3), pp 839-843

Alcântara - Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130
Centro / Zé Garoto - Rua Coronel Serrado, 1630, lojas 102/103. Telefone (21) 2605-9480

 vendas@farmacam.com.br

 WhatsApp (21) 2604-7350

 Facebook.com.br/farmacam

 Instagram.com.br/farmacam