

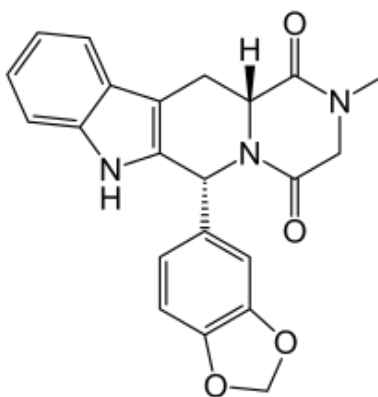
## MONOGRAFÍA FARMACOLÓGICA PLUSEX® 5mg TABLETAS RECUBIERTAS

Tadalafil

### CATEGORIA TERAPÉUTICA CÓDIGO ATC

G	Sistema genitourinario y hormonas sexuales
G04	Urológicos
G04BE	Medicamentos usados en la disfunción eréctil
G04BE08	Tadalafilo

### ESTRUCTURA QUÍMICA DEL PRINCIPIO ACTIVO



(6R-trans)-6-(1,3-benzodioxol-5-yl)- 2,3,6,7,12,12a-hexahydro-2-methyl-pyrazino [1', 2':1,6] pyrido[3,4-b]indole-1,4-dione  
 $C_{22}H_{19}N_3O_4$

### INFORMACIÓN FARMACOLÓGICA

*Urológico.*

#### **FÓRMULA:**

Cada Tableta Recubierta Contiene:

Tadalafil ..... 5 mg

Excipientes c.s.p. .... 1 Tableta recubierta

#### **INDICACIONES TERAPÉUTICAS:**

Tratamiento de la disfunción eréctil en hombres adultos e Hiperplasia prostática benigna.

El uso de tadalafilo no está indicado en mujeres.

#### **MECANISMO DE ACCIÓN:**

PLUSEX® es un inhibidor potente de la fosfodiesterasa tipo 5, enzima responsable de la degradación cíclica de Guanosin Monofosfato cíclico (GMPc). Cuando la estimulación sexual produce la liberación local de óxido nítrico, la inhibición de la PDE5 por tadalafilo ocasiona un aumento de los niveles de GMPc en los cuerpos cavernosos. El resultado es una relajación del músculo liso, permitiendo la afluencia de sangre a los tejidos del pene, produciendo por tanto una erección. Tadalafilo no produce efecto en el tratamiento de la disfunción eréctil en ausencia de estimulación sexual.

El efecto de la inhibición de la PDE5 sobre la concentración de GMPc en el cuerpo cavernoso, también se observa en el músculo liso de la próstata, la vejiga y su vascularización. La relajación vascular que se produce, aumenta la perfusión sanguínea, el cual podría ser el mecanismo por el que se reducen los síntomas de la hiperplasia benigna de próstata. Estos efectos vasculares pueden estar complementados por la inhibición de la actividad del nervio aferente de la vejiga y la relajación del músculo liso de la próstata y de la vejiga.

#### **FARMACOCINÉTICA:**

Tadalafilo se absorbe inmediatamente tras la administración por vía oral y la concentración plasmática máxima media (Cmax) se alcanza en un tiempo medio de 2 horas después de la dosificación. No se ha determinado la biodisponibilidad absoluta de tadalafilo después de la administración oral. Ni la velocidad ni la magnitud de absorción de tadalafilo se ven influidos por la ingesta, por lo que tadalafilo se puede tomar con o sin alimentos.

El volumen medio de distribución es aproximadamente 63.1, indicando que tadalafilo se distribuye en los tejidos. A concentraciones terapéuticas, el 94 % de tadalafilo en plasma se encuentra unido a proteínas plasmáticas. La unión a proteínas no se ve afectada por la función renal alterada.

Tadalafilo se metaboliza principalmente por la isoforma 3A4 del citocromo CYP450. El metabolito principal circulante es el metilcatecol glucurónido. Este metabolito es al menos 13.000 veces menos selectivo que tadalafilo para la PDE5.

El aclaramiento medio de tadalafilo es de 2,5 l/h y la semivida plasmática es 17,5 horas en individuos sanos. Tadalafilo se excreta predominantemente en forma de metabolitos inactivos, principalmente en heces (aproximadamente el 61 % de la dosis administrada) y en menor medida en la orina (aproximadamente el 36 % de la dosis).

#### **CONTRAINDICACIONES:**

Pacientes con hipersensibilidad al medicamento o alguno de los excipientes.

Tadalafilo no se debe utilizar en hombres con enfermedades cardíacas en los que la actividad sexual está desaconsejada. El médico debe considerar el riesgo cardíaco potencial de la actividad sexual en pacientes con antecedentes de enfermedad cardiovascular.

En los estudios clínicos no se incluyeron los siguientes grupos de pacientes con enfermedades cardiovasculares, y por tanto el uso de tadalafilo está contraindicado en:

- pacientes que hubieran sufrido infarto de miocardio en los últimos 90 días,
- pacientes con angina inestable o angina producida durante la actividad sexual,
- pacientes con insuficiencia cardíaca correspondiente a clase 2 o superior de la clasificación New York Heart Association en los últimos 6 meses,
- pacientes con arritmias incontroladas, hipotensión (< 90/50 mm Hg) o hipertensión no controlada,
- pacientes que hayan sufrido un accidente cerebrovascular en los últimos 6 meses.

Tadalafilo está contraindicado en pacientes que han perdido la visión en un ojo a consecuencia de una neuropatía óptica isquémica anterior no arterítica (NAION), independientemente de si el episodio tuvo lugar o no coincidiendo con una exposición previa a un inhibidor de la PDE5.

En personas que estén tomando cualquier forma de nitrato orgánico. Pacientes con úlcera péptica, anomalías anatómicas del pene (Deformidad), fibrosis cavernosa, hipospadía severa.

**ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES:**

Antes de considerar cualquier tratamiento farmacológico es necesario realizar una historia clínica y un examen físico para diagnosticar la disfunción eréctil o la hiperplasia benigna de próstata y determinar las potenciales causas subyacentes.

Antes de comenzar el tratamiento de la hiperplasia benigna de próstata con tadalafilo, los pacientes deben ser examinados para descartar la presencia de un carcinoma de próstata y evaluados cuidadosamente en cuanto a enfermedades cardiovasculares.

En pacientes con diabetes y/o hipertensión con cardiopatía su uso debe ser bajo estricta vigilancia médica.

Evaluar riesgo beneficio en insuficiencia hepática, no recomendado en insuficiencia renal grave y con enfermedad pulmonar venosa oclusiva.

**NO APTO PARA HOMBRES QUE NO PADEZCAN DE DISFUNCIÓN ERÉCTIL Y/O HIPERPLASIA PROSTÁTICA BENIGNA.**

Consulte a su médico si experimenta pérdida repentina de la visión mientras toma PLUSEX®.

NO tome más dosis de PLUSEX® o medicamentos similares sin indicación médica.

Riesgo de priapismo (acudir al médico si se experimentan erecciones de 4 h o más).

Evitar consumo excesivo de alcohol. No recomendado en menores de 18 años. Si aparecen síntomas cardiovasculares al iniciar la actividad sexual, se recomienda no continuar e informar al especialista.

**REACCIONES SECUNDARIAS:**

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Cefalea.

Poco Frecuente: Mareo.

Raros: Accidente cerebrovascular (incluyendo acontecimientos hemorrágicos) síncope, accidentes isquémicos transitorios, migraña, convulsiones, amnesia transitoria.

Trastornos oculares

Poco Frecuentes: Visión borrosa, Sensación descrita como dolor de ojos.

Raros: Defectos del campo de visión, Edema palpebral, Hiperemia conjuntival, Neuropatía óptica isquémica anterior no arterítica (NAION), Obstrucción vascular retiniana.

Trastornos cardiacos

Poco Frecuentes: Taquicardia, Palpitaciones.

Raros: Infarto de miocardio, Angina de pecho inestable, Arritmia ventricular.

Trastornos vasculares

Frecuentes: Rubor.

Poco Frecuente: Hipotensión, Hipertensión.

Trastornos gastrointestinales

Frecuente: Dispepsia.

Poco Frecuente: Dolor abdominal, vómitos, náuseas, reflujo gastroesofágico.

**INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO GÉNERO:**

No recomendado en combinación con alfabloqueantes (Doxazosina), ni con otros inhibidores de la PDE5 u otros tratamientos para disfunción eréctil ni en pacientes que estén tomando de forma crónica inductores potentes (Rifampicina) o inhibidores potentes del CYP3A4 (Ketoconazol o Ritonavir).

Tadalafilo se metaboliza principalmente por el citocromo CYP3A4. Cuando se administraron 200 mg diarios de ketoconazol, se produjo un aumento de cuatro veces en la exposición (AUC) a tadalafilo 20 mg, y de un 22 % en la Cmax.

Tadalafil ha presentado un incremento en el efecto hipotensor de los nitratos. Por ello, está contraindicada la administración de tadalafilo a pacientes que están tomando cualquier forma de nitrato orgánico.

La administración concomitante de doxazosina (4 y 8 mg diarios) y tadalafilo (dosis diaria de 5 mg, y dosis única de 20 mg) aumenta de forma significativa el efecto hipotensor de este alfa bloqueante. Dicho efecto dura al menos 12 horas y puede ser sintomático, incluyendo la aparición de síncope. Por tanto, no se recomienda la administración de esta combinación.

Se ha observado que tadalafilo produce un aumento en la biodisponibilidad de etinilestradiol oral; un incremento similar se debe esperar con la administración oral de terbutalina, aunque las consecuencias clínicas son inciertas.

La concentración de alcohol (nivel medio máximo de alcohol en sangre de 0,08 %) no se vio afectada por la administración concomitante de tadalafilo (dosis de 10 ó 20 mg). Además, no se produjeron variaciones en las concentraciones de tadalafilo tres horas después de la coadministración con alcohol. El alcohol se administró de manera que se maximizase la velocidad de absorción del alcohol (ayuno durante la noche y sin tomar alimentos hasta dos horas después de la ingesta de alcohol).

**VÍA DE ADMINISTRACIÓN:** Oral.

**DOSIS:**

Tomar 1 Tableta recubierta al día. Puede tomarse independiente de las comidas, 30 minutos antes de la actividad sexual.

**Disfunción eréctil en hombres adultos**

En general, la dosis recomendada es de 10 mg tomados antes de la actividad sexual prevista, con o sin alimentos. En aquellos pacientes en los que tadalafilo 10 mg no produzca el efecto adecuado, se puede probar con la dosis de 20 mg. Se puede tomar desde al menos 30 minutos antes de la actividad sexual.

No se requiere ajuste de la dosis en pacientes de edad avanzada

No se requiere ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal de leve a moderada. En pacientes con insuficiencia renal grave, la dosis máxima recomendada para el tratamiento a demanda es de 10 mg.

**Hiperplasia benigna de próstata en hombres adultos**

La dosis recomendada es de 5 mg tomados una vez al día, aproximadamente a la misma hora, con o sin alimentos. La dosis recomendada para hombres adultos que estén siendo tratados tanto para la hiperplasia benigna de próstata como para la disfunción eréctil es también de 5 mg tomados una vez al día, aproximadamente a la misma hora.

**Información por Sobredosis:**

Se administraron dosis únicas de hasta 500 mg a voluntarios sanos, y dosis diarias múltiples de hasta 100 mg a pacientes. Los acontecimientos adversos fueron similares a los observados con dosis más bajas. En caso de sobredosis, se deben adoptar las medidas de soporte habituales. La hemodiálisis contribuye de manera insignificante a la eliminación de tadalafilo.

**CONDICIONES DE ALMACENAMIENTO:**

Almacenar a una temperatura no mayor a 30°C.

**Venta Bajo Prescripción Médica.  
Manténgase fuera del alcance de los Niños.**

**PRESENTACIÓN:**

Carterita con 2 tabletas, caja con 14 tabletas.

**DESCRIPCIÓN DEL MATERIAL DE ENVASE Y EMPAQUE:**

Blíster PVC-PVDC Aluminio Transparente en caja/carterita de cartón con barniz.

**CARACTERÍSTICAS ORGANOLÉPTICAS:**

Tableta redonda de caras planas, ranurada de 6 mm blanca y color recubrimiento amarillo.

**FECHA DE REVISIÓN:**

20 de Noviembre de 2023.

**BIBLIOGRAFÍA:**

1. Drug Información for the health Care Professional. Volumen I. Edición 22. 2002. pp. 2626-2629
2. Asociación Española de Medicamentos y Productos Sanitarios -AEMPS- (2021) Tadalafilo Sandoz Comprimidos Recubiertos con Película. CIMA. España. Recuperado de: [https://cima.aemps.es/cima/pdfs/es/ft/81952/81952\\_ft.pdf](https://cima.aemps.es/cima/pdfs/es/ft/81952/81952_ft.pdf)
3. Asociación Española de Medicamentos y Productos Sanitarios -AEMPS- (2021) Tadalafilo Accord 20 mg Comprimidos Recubiertos con Película. CIMA. España. Recuperado de: [https://cima.aemps.es/cima/dohtml/ft/81509/FT\\_81509.html](https://cima.aemps.es/cima/dohtml/ft/81509/FT_81509.html)