



VIAGRA: ¿LA PANACEA PARA LA DISFUNCIÓN ERÉCTIL?

La disfunción eréctil es un trastorno que trae consigo una serie de desajustes en la vida de pareja y en la autoestima del hombre. Por este motivo siempre se seguirá profundizando en el conocimiento de nuevos fármacos que permitan mejorar la actividad sexual y por ende la calidad de vida del paciente.

En este momento se lanza al mercado un producto nuevo: el Sildenafil. Pero, ¿hasta qué punto es seguro, como para permitir asumir el costo-beneficio?

El citrato de sildenafil, es un inhibidor selectivo del monofosfato de guanosina cíclico (GMPc) en los cuerpos cavernosos. De tal manera que, cuando ocurre la estimulación sexual se produce un incremento del óxido nítrico, por la inhibición que ejerce el sildenafil sobre la fosfodiesterasa tipo 5 impidiendo la degradación del GMPc, permitiendo la relajación del músculo liso y facilitando por lo tanto el llenado sanguíneo de los cuerpos cavernosos.

Se absorbe por vía oral, logrando una biodisponibilidad del 40%. Las concentraciones máximas se logran en un tiempo que oscila entre los 30 y los 120 minutos con un promedio de 60 minutos. Se metaboliza a nivel hepático por el citocromo p-450 originando un metabolito activo (N-desmetil sildenafil). La vida media de la molécula parental y su metabolito es de cuatro horas para cada uno. Se unen a las proteínas plasmáticas en un 96% y se eliminan ambos por heces.

En pacientes geriátricos, se incremen-

tan las concentraciones plasmáticas hasta en un 40% en relación a los pacientes jóvenes (18- 45 años). Igualmente en pacientes con insuficiencia renal o hepática el aclaramiento se disminuye en forma notoria.

Entre las reacciones adversas que se presentan con una frecuencia mayor al 2% se han reportado: alteración de la visión (borrosa, o alteración en la percepción de los colores), cefalea, rubor facial, dispepsia -siendo este efecto común cuando se utilizaron dosis bajas-, congestión nasal, diarrea y debilidad.

Los efectos adversos que se presentaron con una frecuencia menor al 2% incluyen: edema facial, hipotensión ortostática, taquicardia, síncope, angor pectoris, mialgias, tenosinovitis, tos, asma, midriasis, tinnitus, cistitis y nicturia. No se reportó priapismo.

La seguridad y eficacia del sildenafil fue evaluado en un estudio de dosis - respuesta durante 24 semanas, manteniéndose dosis de 25, 50 y 100 mg-. En otra fase del estudio se inició con una dosis de 50 mg y se incrementó a 100 mg observándose una mejoría en el 100% de los pacientes con disfunción eréctil.

En la totalidad del grupo estudiado se administró el fármaco una hora antes de la actividad sexual de acuerdo a su farmacocinética y no más de una vez al día (*N Engl J Med* 1998; 338: 20).

MARÍA LUISA CÁRDENAS MUÑOZ, MD,
*Msc Farmacología. Unidad de Farmacología,
Departamento de Ciencias Fisiológicas,
Universidad Nacional de Colombia.*

FENOLFTALEÍNA: ¿UN MEDICAMENTO DEL PASADO?

La FDA, a través de HHS News, ha informado sobre la reclasificación de la fenolftaleína como un producto inseguro con base en estudios sobre carcinogenicidad en animales y, aunque no hay reportes de cáncer en humanos relacionados con el uso de este producto, los estudios en animales indican la posibilidad de un riesgo potencial para los pacientes que usen fenolftaleína. Dado que existen alternativas terapéuticas, la FDA considera que su utilidad no es superior a los posibles riesgos que implica su uso. Por lo tanto, no pertenece más al grupo considerado seguro y efectivo.

Algunos fabricantes ya han reformulado sus productos con otros principios activos con actividad de laxantes (HHS News. U.S. Department of Health and Human Services Food and Drug Administration).

CARLOS MALDONADO, MD Msc
*Farmacología. Facultad de Ciencias,
Departamento de Farmacia. Universidad
Nacional de Colombia.*

TAMOXIFENO Y RALOXIFENO: ¿QUÉ SABEMOS Y QUÉ ESPERAMOS?

Estos moduladores de los receptores de estrógenos, han demostrado utilidad en el manejo y prevención del cáncer de seno.

El tamoxifeno, que ya lleva dos décadas en el mercado, es una de las opciones de tratamiento en el cáncer de seno, además de haberse comprobado en un estudio multicéntrico en mujeres de alto riesgo (determinado por historia

familiar de cáncer de seno, paridad, edad de la menarquia, antecedentes de biopsia con resultados de hiperplasia atípica, antecedente de cáncer de seno no invasivo), con edades entre 35 y 60 años, realizado en Estados Unidos y Canadá durante los años de 1992-1997, que reduce en un 45% la incidencia de cáncer de seno.

Igualmente entre las reacciones adversas reportadas en este estudio se encontraron cáncer de endometrio, tromboembolismo pulmonar y trombosis venosa (<http://www.pslgroup.com/dg/6A632.htm>).

Teniendo en cuenta que el tamoxifeno es un inductor de ovulación, la mujer que reciba esta medicación debe ser prevenida del riesgo de embarazo, ya que es un fármaco que se ha

relacionado con abortos espontáneos y muerte fetal. Además, por los efectos estrogénicos del tamoxifeno, existe la posibilidad de desarrollar un síndrome semejante al ocasionado por el dietilestilbestrol (DES). A nivel experimental se comprobaron cambios en el tracto reproductivo, como la adenosis vaginal que es compatible con los cambios ocasionados por el (DES).

En 1997 se reportó un caso de ambigüedad genital probablemente causada por la exposición a tamoxifeno en la hija de una paciente con cáncer de seno que recibió el fármaco hasta las 20 semanas de gestación. La niña nació a las 29 semanas encontrándose un aumento en el tamaño del clítoris semejando el pene, y un orificio en periné compartido para vagina y uretra (<http://www.pslgroup.com/dg/>

308ca.htm).

El raloxifeno ha sido estudiado por un grupo de investigadores de la Universidad de California, el cual observó una disminución de la incidencia de cáncer de seno en un 70% en la mujer postmenopáusica y, a diferencia del tamoxifeno, tiene efecto estrogénico a nivel de huesos y en los niveles de colesterol, lo cual permitiría una reducción en la incidencia de osteoporosis y de enfermedad cardíaca. Fue aprobado por la FDA en diciembre de 1997 para la prevención de la osteoporosis (<http://www.pslgroup.com/dg/7cc12.htm>).

MARÍA LUISA CÁRDENAS MUÑOZ, MD,
*Msc Farmacología. Unidad de Farmacología.
Departamento de Ciencias Fisiológicas.
Universidad Nacional de Colombia.*