

NUOVA FORMULAZIONE ORO-DISPERSIBILE DI SILDENAFIL: BIOEQUIVALENZA E VANTAGGI

Responsabile Editoriale
Renato Cozzi

Gli inibitori della PDE5 approvati per la terapia della disfunzione erettile e attualmente in commercio (Sildenafil, Tadalafil, Vardenafil e Avanafil), pur con il medesimo meccanismo di azione, si differenziano per uno specifico profilo farmacocinetico, che ne condiziona la scelta rispetto a ogni tipologia di esigenza del paziente (tabella).

Confronto PDE5-inibitori		
Molecola	Minuti per raggiungere la concentrazione plasmatica massima	Tempo di dimezzamento della concentrazione plasmatica (ore)
Sildenafil (Viagra-Rabestrom)	30-120 (media 60)	3-5
Tadalafil (Cialis)	120 (media)	17.5 (media)
Vardenafil (Levitra)	30-120 (mediana 60)	4-5
Avanafil (Spedra)	30-45	6-17

Tuttavia, il 40-50% degli utilizzatori (1) indica che il loro utilizzo rimane inadeguato a ripristinare una vita sessuale normale, con un tasso di interruzione che va dal 30 all'80%, dipendente non solo da questioni economiche ma da percezione intrusiva del farmaco, necessità di attenderne l'inizio d'azione, comodità di assunzione, effetti collaterali, ecc. L'uso al bisogno appare come il più adatto alle necessità di coppia.

È imminente l'immissione in commercio di una **nuova formulazione di sildenafil**, che potrebbe meglio soddisfare queste esigenze: **applicata sotto la lingua**, si scioglie rapidamente, rilasciando nella saliva il farmaco, che poi **passa rapidamente nel circolo sistemico**. La caratteristica più importante di questa nuova formulazione di sildenafil è insita nella "discrezionalità d'uso", che permette al paziente di assumere il farmaco senza che questo gesto venga percepito dalla coppia come atto artificioso o medicale, conferendo la "naturale spontaneità" alla sessualità. Nell'aprile 2017 è stato pubblicato uno studio (2) di bioequivalenza tra le due formulazioni di sildenafil, oro-dispersibile e compresse tradizionali, in cui la farmacocinetica è stata confrontata in 53 maschi volontari sani, tra 15 e 51 anni: il test di bioequivalenza è stato completamente soddisfatto, come concentrazione plasmatica e area sotto la curva.

Le confezioni che verranno messe in commercio conterranno 2-4 e 8 film, in **dosaggi** da 25-50-75 e 100 mg, con **prezzi sovrapponibili a quelli del sildenafil generico**; ai fini della rimborsabilità, tutte le formulazioni sono collocate in **fascia "C"**, dispensabili con presentazione di **ricetta medica ripetibile** (3).

I film oro-dispersibili, con cui la sostanza attiva viene assorbita attraverso la mucosa orale, oltre a non richiedere acqua, presentano contemporaneamente i vantaggi delle formulazioni in compresse (dosaggio preciso e facilità di somministrazione) e di quelle liquide (facilità di deglutizione e rapida biodisponibilità dovuta al *by-pass* epatico) (4,5).

Bibliografia

1. Corona G, Rastrelli G, Burri A, et al. First-generation phosphodiesterase type 5 inhibitors dropout: a comprehensive review and meta-analysis. *Andrology* [2016, 4: 1002-9](#).
2. Radicioni M, Castiglioni C, Giori A, et al. Bioequivalence study of a new sildenafil 100 mg orodispersible film compared to the conventional film-coated 100 mg tablet administered to healthy male volunteers. *Drug Drug Des Devel Ther* [2017, 11: 1183-92](#).
3. Autorizzazione all'immissione in commercio del medicinale per uso umano "Sildenafil Ibsa" (16A07618). Determina AIFA n. 1358/2016 del 29 settembre 2016, pubblicato in Gazzetta Ufficiale Serie Generale [n. 251 del 26-10-2016](#).
4. Irfan M, Rabel S, Bukhtar Q, et al. Orally disintegrating films: a modern expansion in drug delivery system. *Saudi Pharm J* [2016, 24: 537-46](#).
5. Bala R, Pawar P, Khanna S, Arora S. Orally dissolving strips: a new approach to oral drug delivery system. *Int J Pharm Investig* [2013, 3: 67-76](#).



Agostino Specchio (agostinospecchio@libero.it) & Commissione Farmaci AME

Agostino Paoletta (Coordinatore) (scandiffio@libero.it)

Enrica Ciccarelli, Alfonso Massimiliano Ferrara, Angelo Gasparre, Vincenzo Novizio, Barbara Pirali