



Viagra

Sildenafil (wl. cytrynian sildenafilu, ang. i INN sildenafil citrate, ATC: G 04 BE 03, oryginalna nazwa handlowa: **Viagra**) - lek stosowany w leczeniu zaburzen erekcji oraz w pierwotnym nadciśnieniu płucnym (w tym wskazaniu pod nazwa Revatio). Został on opatentowany w 1996 roku przez firme Pfizer i wprowadzony po raz pierwszy na rynek w 1998 roku.

Po znalezieniu metody na obejście patentu Pfizera na ten związek, zaczęło go produkować wiele firm na świecie. M.in. firmy **Cialis** (Tadalafil), Levitra (Vardenafil) i polska Polpharma (**Maxigra**). Tabletki sildenafilu zawierają od 25 do 100 miligramów tego związku chemicznego. Mechanizm działania sildenafilu polega na hamowaniu enzymu fosfodiesterazy typu 5 (PDE5) (powinowactwo do innych fosfodiesteraz jest znacznie mniejsze: PDE3 – ponad 4000 razy, PDE 2, 3, 4, 7, 8, 9, 10, 11 – ponad 700 razy, PDE1 – 80 razy, PDE 6 – 10 razy). Cząsteczka sildenafilu zawiera motyw strukturalny piperazyny oraz analogu nukleozydowej zasady heterocyklicznej, guaniny - 1H-pirazolo[4,3-d]pirymidyny. Centralny układ fenolowy jest strukturalnym odpowiednikiem rybozy, natomiast reszta sulfonowa odpowiada grupie fosforanowej nukleotydu.

W momencie pobudzenia seksualnego mózg wysyła sygnał do komórek nerwowych u rdzenia prącia, sterujących działaniem mięśni gładkich, które normalnie ograniczają dopływ krwi przez tętnice do ciał jamistych prącia. Komórki nerwowe, po otrzymaniu sygnału z mózgu, zaczynają wytwarzać tlenek azotu. W mięśniu gładkim występuje stale stężenie związku chemicznego - trójfosforanu guanozyny (GTP), oraz enzym - cyklaza guanozynowa. Enzym ten jest uaktywniany przez tlenek azotu produkowany przez komórki nerwowe. Po uaktywnieniu enzym ten przekształca GTP w cGMP (cykliczny monofosforan guanozyny). cGMP uruchamia ciąg przemian doprowadzających do rozluźnienia mięśni gładkich, a co za tym idzie zwiększenia napływu krwi do ciał jamistych członka i jego wzwodu. Dopóki stężenie cGMP utrzymuje się na odpowiednio wysokim poziomie, mięsień gładki jest rozluźniony, a członek wzwiedziony.

cGMP jest jednak w normalnych warunkach stale przekształcane przez inny enzym - fosfodiesterazę - w nieaktywny GMP (zwykły monofosforan guanozyny). Stąd utrzymywanie się wzwodu prącia jest warunkowane stałym wytwarzaniem cGMP, a co za tym idzie stałym dostarczeniem tlenu azotu przez komórki nerwowe, które muszą być stymulowane przez mózg. U wielu mężczyzn jednak na skutek nerwicy, napięcia psychicznego, nierównowagi hormonalnej, czy zaburzeń nerwowego układu współczulnego, wytwarzanie tlenu azotu przez komórki nerwowe jest zbyt słabe lub krótkotrwałe, co prowadzi do słabych i zbyt krótkotrwałych wzwodów.

Sildenafil działa przez hamowanie enzymu fosfodiesterazy. Sildenafil ma podobny kształt geometryczny do cGMP i dobrze mieści się w centrum aktywnym fosfodiesterazy, jednak wiąże się z fosfodiesterazą na dłużej, blokując możliwość katalizowania reakcji przejścia cGMP w zwykłe GMP. W rezultacie nawet mała "produkcja" NO przez komórki nerwowe wystarcza do osiągnięcia odpowiedniego stężenia cGMP i może się ono utrzymywać nawet bez dalszej produkcji tlenu azotu przez te komórki. Jednak, dzięki temu, że sildenafil działa na "koncowym" etapie całego procesu, nie powoduje on automatycznie wzwodu, lecz nadal potrzebna jest do tego "normalna" stymulacja erotyczna.

W momencie pobudzenia seksualnego mózg wysyła sygnał do komórek nerwowych u rdzenia prącia, sterujących działaniem mięśni gładkich, które normalnie ograniczają dopływ krwi przez tętnice do ciał jamistych prącia. Komórki nerwowe, po otrzymaniu sygnału z mózgu, zaczynają wytwarzać tlenek azotu. W mięśniu gładkim występuje stale stężenie związku chemicznego - trójfosforanu guanozyny (GTP), oraz enzym - cyklaza guanozynowa. Enzym ten jest uaktywniany przez tlenek azotu produkowany przez komórki nerwowe. Po uaktywnieniu enzym ten przekształca GTP w cGMP (cykliczny monofosforan guanozyny). cGMP uruchamia ciąg przemian doprowadzających do rozluźnienia mięśni gładkich, a co za tym idzie zwiększenia napływu krwi do ciał jamistych członka i jego wzwodu. Dopóki stężenie cGMP utrzymuje się na odpowiednio wysokim poziomie, mięsień gładki jest rozluźniony, a członek wzwiedziony.

cGMP jest jednak w normalnych warunkach stale przekształcane przez inny enzym - fosfodiesterazę - w nieaktywny GMP (zwykły monofosforan guanozyny). Stąd utrzymywanie się wzwodu prącia jest warunkowane stałym wytwarzaniem cGMP, a co za tym idzie stałym dostarczeniem tlenu azotu przez komórki nerwowe, które muszą być stymulowane przez mózg. U wielu mężczyzn jednak na skutek nerwicy, napięcia psychicznego, nierównowagi hormonalnej, czy zaburzeń nerwowego układu współczulnego, wytwarzanie tlenu azotu przez komórki nerwowe jest zbyt słabe lub krótkotrwałe, co prowadzi do słabych i zbyt krótkotrwałych wzwodów.

Sildenafil działa przez hamowanie enzymu fosfodiesterazy. Sildenafil ma podobny kształt geometryczny do cGMP i dobrze mieści się w centrum aktywnym fosfodiesterazy, jednak wiąże się z fosfodiesterazą na dłużej, blokując możliwość katalizowania reakcji przejścia cGMP w zwykłe GMP. W rezultacie nawet mała "produkcja" NO przez komórki nerwowe wystarcza do osiągnięcia odpowiedniego stężenia cGMP i może się ono utrzymywać nawet bez dalszej produkcji tlenu azotu przez te komórki. Jednak, dzięki temu, że sildenafil działa na "koncowym" etapie całego procesu, nie powoduje on automatycznie wzwodu, lecz nadal potrzebna jest do tego "normalna" stymulacja erotyczna.

[Viagra](#), [maxigra](#), [cialis](#).