

# super.o-Sildenafil

Comprimidos recubiertos 25 - 50 - 100 mg | Comprimidos masticables 50 mg

VENTA BAJO RECETA ARCHIVADA

INDUSTRIA ARGENTINA

## Fórmulas

### Super.O 25 mg

Cada comprimido recubierto contiene: Sildenafil (como citrato) 25 mg.

Excipientes autorizados: celulosa microcristalina, lactosa, croscarmelosa sódica, estearato de magnesio, fosfato de calcio dibásico anhidro, hidroxipropilmetilcelulosa, dióxido de titanio, PEG-6000, aceite de castor, azul brillante I.a., eritrosina I.a., talco, c.s.

### Super.O 50 mg

Cada comprimido recubierto contiene: Sildenafil (como citrato) 50 mg.

Excipientes autorizados: celulosa microcristalina, lactosa, croscarmelosa sódica, estearato de magnesio, fosfato de calcio dibásico anhidro, hidroxipropilmetilcelulosa, dióxido de titanio, PEG-6000, aceite de castor, azul brillante I.a., eritrosina I.a., talco, c.s.

### Super.O 100 mg

Cada comprimido recubierto contiene: Sildenafil (como citrato) 100 mg.

Excipientes autorizados: celulosa microcristalina, lactosa, croscarmelosa sódica, estearato de magnesio, fosfato de calcio dibásico anhidro, hidroxipropilmetilcelulosa, dióxido de titanio, PEG-6000, aceite de castor, azul brillante I.a., eritrosina I.a., talco, c.s.

### Super.O 50 mg Masticable

Cada comprimido masticable contiene: Sildenafil (como citrato) 50 mg. Excipientes autorizados: copolímero ácido metacrílico, trietilcitrateo, talco, dióxido de silicio coloidal, aceulfenato potásico, dicamato de sodio, esencia de mentol, estearato de magnesio, manitol, c.s.

“Este medicamento contiene eritrosina como colorante”

## Acción Terapéutica

Terapia oral para la disfunción eréctil.

## Indicaciones

SUPER.O está indicado para el tratamiento de la disfunción eréctil.

## Propiedades

- **Características farmacológicas:** SUPER.O, un tratamiento oral para la disfunción eréctil, es la sal citratada de sildenafil, un inhibidor selectivo de la fosfodiesterasa de tipo 5 (PDE5) específica del monofosfato cíclico de guanosina (cGMP).

- **Mecanismo de acción:** el mecanismo fisiológico de la erección peneana implica la liberación de óxido nítrico (NO) en el cuerpo cavernoso durante la estimulación sexual. El NO activa entonces la enzima guanilato ciclasa, lo cual conduce a niveles aumentados de monofosfato cíclico de guanosina (cGMP), produciendo la relajación del músculo liso en el cuerpo cavernoso, lo que permite el ingreso de sangre. El sildenafil no posee efecto relajante directo sobre el cuerpo cavernoso humano aislado, sino que incrementa el efecto del óxido nítrico (NO) por inhibición de la fosfodiesterasa de tipo 5 (PDE5), responsable de la degradación del cGMP en el cuerpo cavernoso. Cuando la estimulación sexual causa la liberación local de NO, la inhibición de la PDE5 por el sildenafil produce niveles aumentados de cGMP en el cuerpo cavernoso, lo que da lugar a la relajación del músculo liso y al ingreso de sangre en el cuerpo cavernoso. En las dosis recomendadas, el sildenafil no presenta efecto en ausencia de estimulación sexual.

- **Farmacocinética y metabolismo:** SUPER.O es rápidamente absorbido a continuación de su administración por vía oral, con una biodisponibilidad absoluta de aproximadamente 40%. Cuando SUPER.O se ingiere junto con una comida rica en grasas, el índice de absorción se reduce, con un retraso medio de T<sub>max</sub> de 60 minutos y una reducción media de C<sub>max</sub> del 29%.

- **Absorción y distribución:** SUPER.O es absorbido rápidamente. Las concentraciones plasmáticas máximas observadas se alcanzan en el término de 30 a 120 minutos (mediana: 60 minutos) de la administración oral en ayunas. El volumen de distribución medio en estado estable (V<sub>ss</sub>) del sildenafil es de 105 litros, lo cual indica distribución en los tejidos. El sildenafil y su principal metabolito circulante, N-desmetilado, se hallan unidos a proteínas plasmáticas en aproximadamente un 96%. La unión a proteínas es independiente de las concentraciones totales de la droga.

- **Metabolismo y excreción:** el sildenafil es excretado predominantemente mediante las isoenzimas microsomales hepáticas CYP3A4 (vía principal) y CYP2C9 (vía accesoria). El principal metabolito circulante es resultado de la N-desmetilación del sildenafil, y es metabolizado a su vez. Este metabolito posee un perfil de selectividad por las PDE similar al del sildenafil y una potencia in vitro respecto de la PDE5 aproximadamente equivalente al 50% de la correspondiente a la droga madre. Las concentraciones plasmáticas de este metabolito son de alrededor del 40% de las observadas respecto del sildenafil, de modo que el metabolito es responsable de aproximadamente el 20% de los efectos farmacológicos del sildenafil. A continuación de la administración por vía oral el sildenafil es excretado como metabolitos predominantemente por vía fecal (aproximadamente un 80% de la dosis oral administrada), y en

menor extensión, por la orina (aproximadamente un 13% de la dosis oral administrada).

## -Farmacocinética en poblaciones especiales

**Geriatría:** los voluntarios gerontes sanos (65 años de edad o más) presentaron una depuración reducida del sildenafil, siendo las concentraciones plasmáticas libres aproximadamente 40% mayores que las observadas en voluntarios sanos más jóvenes (18 a 45 años de edad).

- **Insuficiencia renal:** en voluntarios con deterioro renal leve (Cl<sub>cr</sub> = 50-80 ml/min) y moderado (Cl<sub>cr</sub> = 30-49 ml/min), la farmacocinética de una dosis oral única de SUPER.O (50 mg) no se modificó. En voluntarios con deterioro renal severo (Cl<sub>cr</sub> = < 30 ml/min), la depuración del sildenafil se redujo, siendo aproximadamente el doble de la AUC y la C<sub>max</sub>., en comparación con voluntarios equiparados por edad sin deterioro renal.

- **Insuficiencia hepática:** A edad mayor de 65 años, el deterioro hepático y el deterioro renal severo están asociados con niveles plasmáticos aumentados de sildenafil. En estos pacientes debe considerarse una dosis oral inicial de 25 mg (ver Posología y Forma de Administración).

## Posología

En la mayor parte de los pacientes, la dosis recomendada es de 50 mg según necesidad, aproximadamente 1 hora antes de la actividad sexual. Sin embargo, SUPER.O puede ser ingerido en cualquier momento entre 4 y 0.5 horas antes de ella. De acuerdo con su efectividad y tolerancia, la dosis puede ser aumentada hasta una dosis máxima recomendada de 100 mg o reducida a 25 mg. La frecuencia posológica máxima recomendada es de 1 vez por día. Los comprimidos masticables de SUPER.O pueden ser masticados o deglutidos enteros. Los siguientes factores se asocian con niveles plasmáticos aumentados de sildenafil: edad > 65 años (incremento de 40% de la AUC), alteración hepática (por ejemplo cirrosis, 80%), deterioro renal severo (depuración de creatinina < 30 ml/min, 100%) y uso concomitante de inhibidores potentes del citocromo P450 3A4 (eritromicina, ketoconazol, itraconazol (200%), saquinavir, 210%). Puesto que los niveles plasmáticos más elevados pueden incrementar tanto la eficacia como la incidencia de los fenómenos adversos, debe considerarse en estos pacientes una dosis inicial de 25 mg. Dada la extensión de la interacción en pacientes que reciben terapia concomitante con ritonavir se recomienda que no se exceda una dosis única máxima de 25 mg de SUPER.O en un período de 48 horas.

## Contraindicaciones

El uso de SUPER.O está contraindicado en los pacientes con hipersensibilidad conocida a cualquier componente del comprimido. Junto con sus efectos conocidos sobre la vía del óxido nítrico/cGMP, SUPER.O potencia los efectos hipotensivos de los nitratos, por lo que está contraindicada su administración a pacientes que estén usando nitratos orgánicos en cualquier forma, ya sea regular y/o intermitentemente. Se recomienda en especial en los siguientes casos: edad mayor 65 años, deterioro hepático (por ejemplo, cirrosis), deterioro renal severo (por ejemplo, depuración de creatinina < 30 ml/min), y uso concomitante de inhibidores potentes del citocromo P450 3A4 (eritromicina), pues el perfil farmacocinético y los niveles plasmáticos de sildenafil 24 horas después de la administración. Aunque los niveles plasmáticos de sildenafil 24 horas después de la administración son mucho menores que a la concentración máxima, no se sabe si es seguro coadministrar nitratos en ese momento.

## Advertencias

Existe un potencial de riesgo cardíaco debido a actividad sexual en pacientes con enfermedad cardiovascular preexistente. Por lo tanto, en general no deben utilizarse tratamientos para la disfunción eréctil, incluido SUPER.O, en hombres para los cuales no es recomendable la actividad sexual debido a su estado cardiovascular subyacente. SUPER.O posee propiedades vasodilatadoras sistémicas que resultan en descensos transitorios de la presión sanguínea supina en voluntarios sanos (descenso máximo medio de 8.4/5.5 mmHg) (ver Farmacología clínica: Farmacodinámica). Aunque esto no debería tener consecuencias en la mayoría de los pacientes, antes de prescribir SUPER.O, los médicos deberían considerar cuidadosamente si los pacientes con enfermedad cardíaca subyacente podrían ser afectados adversamente por tales efectos vasodilatadores, especialmente en combinación con la actividad sexual. Los pacientes con las siguientes afecciones subyacentes pueden ser especialmente sensibles a las acciones de los vasodilatadores incluyendo el SUPER.O, quienes poseen una obstrucción del flujo ventricular izquierdo (por ejemplo estenosis aórtica, estenosis subaórtica hipertrofia idiopática) y quienes poseen un control autonómico de la presión sanguínea seriamente deteriorado. No existen datos clínicos controlados sobre la seguridad o eficacia de SUPER.O en los grupos enumerados a continuación; si se prescribe, debe hacerse con precaución. Pacientes que han sufrido un infarto de miocardio, accidente cerebrovascular o arritmia con amenaza para la vida dentro de los últimos 6 meses; pacientes con hipertensión (TA < 90/50) o hipertensión (TA > 170/110) en reposo; pacientes con falla cardíaca o enfermedad arterial coronaria que causa angina inestable; pacientes con retinitis pigmentaria (la minoría de estos pacientes presenta trastornos genéticos de las fosfodiesterasas retinales). Se debe tener precaución al prescribir SUPER.O a pacientes en tratamiento con ritonavir. Existen pocos datos sobre individuos expuestos a niveles sistémicos elevados de sildenafil. Se ha observado muy raramente en pacientes que ingirieron medicamentos como el sildenafil (inhibidores de la fosfodiesterasa tipo 5- PDE 5) una disminución o pérdida de la visión causada por una neuropatía óptica isquémica anterior no arterérica (NOJA-NA). La mayoría de estos pacientes presentaban factores de riesgo tales como bajo índice excavación / disco (“disco apretado”, en el fondo de ojo), edad por encima de los 50 años, hipertensión arterial,

enfermedad coronaria, hiperlipemia y/o hábito de fumar. No se han podido aún establecer una relación causal entre el uso de inhibidores de la PDES y la NOIA-NA. El médico deberá informar a sus pacientes como factor de riesgo la posibilidad de padecer NOIA-NA y que, en caso de presentar pérdida repentina de la visión de uno o ambos ojos mientras están tomando sildenafil, deben suspender la medicación y consultar a un médico especialista.

#### Precauciones

- **Generales:** la evaluación de la disfunción eréctil debería incluir una determinación de causas subyacentes potenciales y la identificación de un tratamiento adecuado luego de un examen médico completo. Antes de prescribir SUPER.O, es importante notar lo siguiente: pacientes recibiendo medicación antihipertensiva múltiple fueron incluidos en estudios clínicos fundamentales con SUPER.O. La administración concomitante de SUPER.O a pacientes que tienen una terapia alfa bloqueante puede producir hipotensión sintomática en algunos pacientes. Por lo tanto, no deben ingerirse dosis de SUPER.O superiores a 25 mg dentro de las 4 horas luego de la ingesta de un alfa bloqueante. Se desconoce la seguridad de SUPER.O en pacientes con trastornos hemorrágicos y pacientes con úlcera péptica activa. SUPER.O debe ser utilizado con precaución en los pacientes con deformidades anatómicas peneanas (tales como angulación, fibrosis cavernosa o enfermedad de Peyronie) o en aquellos que presenten cuadros que puedan predisponerlos al priapismo (como anemia de células falciformes, mieloma múltiple o leucemia). En seres humanos, SUPER.O carece de efecto sobre el tiempo de sangría cuando se lo ingiere solo o con aspirina.

- **Embarazo, madres que amamantan y uso pediátrico:** SUPER.O no se encuentra indicado para su empleo en recién nacidos, niños o mujeres.

#### Información para los pacientes

Los médicos deben conversar con los pacientes acerca de la contraindicación de SUPER.O con la utilización regular y/ o intermitente de nitratos orgánicos. Los médicos deben discutir con los pacientes acerca del riesgo cardíaco potencial de la actividad sexual en pacientes con factores de riesgo cardíacos preexistentes. Se debe aconsejar a los pacientes que presenten síntomas (por ejemplo, angina de pecho, mareos, náuseas) al comenzar la actividad sexual que se abstengan de proseguir con la misma y que discutan el episodio con su médico. El uso de SUPER.O no ofrece protección contra las enfermedades de transmisión sexual. Se debe asesorar a los pacientes acerca de las medidas de protección necesarias para cuidarse de las enfermedades de transmisión sexual, incluyendo el virus de inmunodeficiencia humana (HIV).

#### Sobredosificación

En caso de sobredosis deben adoptarse medidas estandarizadas de sostén según sea necesario. No se espera que la diálisis renal acelere la depuración, ya que el sildenafil se halla fuertemente unido a proteínas plasmáticas y no es eliminado por orina. Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al hospital más cercano o comunicarse con los centros de toxicología:

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/4962-2247

Hospital Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777

#### Conservación

Debe ser conservado a temperatura ambiente, entre 15° y 30° C, en su estuche original y al abrigo de la luz. No utilizar después de la fecha de vencimiento.

**ESTE MEDICAMENTO DEBE SER USADO EXCLUSIVAMENTE BAJO PRESCRIPCIÓN MÉDICA Y VIGILANCIA MÉDICA Y NO PUEDE REPETIRSE SIN NUEVA RECETA MÉDICA.**

**MANTENER ESTE Y TODOS LOS MEDICAMENTOS FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.**

#### Presentaciones

SUPER.O 25 mg: envases conteniendo 1, 2, 3, 4, 6, 10, 20, 30, 40, 50, 100, 500\* y 1000\* comprimidos recubiertos.

SUPER.O 50 mg: envases conteniendo 1, 2, 3, 4, 6, 10, 20, 30, 40, 50, 100\*, 500\* y 1000\* comprimidos recubiertos.

SUPER.O 100 mg: envases conteniendo 1, 2, 3, 4, 6, 10, 20, 30, 40, 50, 100\*, 500\* y 1000\* comprimidos recubiertos.

SUPER.O 50 mg: envases conteniendo 1, 2, 3, 4, 6, 10, 20, 30, 40, 50, 100, 500\* y 1000\* comprimidos masticables.

\* Uso Hospitalario Exclusivo.



Especialidad Medicinal Autorizada por el  
Ministerio de Salud. Certificado N°: 53797  
Dirección Técnica: Silvia G. Balanian, Farmacéutica.  
BIOTENK S.A. Zúvira 5747, Capital Federal  
Fecha de última revisión: Octubre de 2010.