

Condroxamín® 400/500

Comprimidos Sobres

DESCRIPCIÓN

Comprimidos

Cada comprimido contiene condroitín sulfato sódico de origen bovino 400 mg, glucosamina sulfato 500 mg, Excipientes c.s.

Sobres

Cada sobre contiene granulado de condroitín sulfato sódico de origen bovino 400 mg, glucosamina sulfato 500 mg.

Excipientes c.s.

Cada comprimido y cada sobre contienen menos de 100 mg de sodio.

FARMACOLOGÍA

Los principales constituyentes del cartilago son el condroitín sulfato A y el condroitín sulfato C y en menor grado el keratan sulfato y el ácido hialurónico.

El **condroitín sulfato** se caracteriza por su extraordinaria capacidad para fijar agua. Gracias a estas características, permite asegurar las propiedades funcionales mecánico-elásticas del cartilago.

El condroitín sulfato A se halla en el cartilago, en el hueso y en la córnea. El condroitín sulfato C, en el cartilago, los tendones y los discos intervertebrales y en la sustancia metacromática de los basófilos.

Se ha sugerido que el suplemento de glicosaminoglicanos en la artrosis podría permitir a los condrocitos reemplazar a los proteoglicanos. Los glicosaminoglicanos son capaces generalmente de inhibir ciertas enzimas presentes en el líquido sinovial que pueden dañar al cartilago articular (elastasa, hialuronidasa). Aseguraría también el mantenimiento de la correcta viscosidad del líquido sinovial. Además los glicosaminoglicanos han demostrado actuar, asimismo, como una droga antiinflamatoria, ya que tienen un efecto inhibitorio sobre el complemento. Por tanto en teoría, los glicosaminoglicanos podrían tener un efecto condroprotector en pacientes con artrosis.

La absorción de sulfato de condroitín por vía oral es menor a un 10%. La principal vía de excreción es la renal. En estudios experimentales se ha visto como diferentes moléculas de glicosaminoglicanos y proteoglicanos formadores de proteínas agregadas, añadidos al medio de cultivo, pueden prevenir el daño y la reducción de glicosaminoglicanos y la producción fibrilar en los condrocitos cultivados con AINES y corticoides.

Se demostró que el condroitín sulfato inhibe la inflamación experimental inducida por la carragenina y la histamina. En modelos animales de artrosis la administración local o general reduce la actividad de la proteinasa, el nivel de ácido urónico en el líquido sinovial y el número de células inflamatorias en la sinovial. Los condroitín sulfato también estimulan las células sinoviales para producir un ácido hialurónico altamente polimerizado, con mejoría de la viscosidad y restauración del líquido sinovial a niveles normales. El mecanismo de la acción antiinflamatoria es hasta el momento desconocido, pero difiere sustancialmente del de los AINES.

En los estudios clínicos comparados contra placebo el hallazgo más destacable fue la mejoría significativa de los síntomas inflamatorios de los pacientes con osteoartritis (artrosis) y la disminución significativa de la ingesta de los AINES. Cuando se comparó contra AINES, la acción antiinflamatoria fue más lenta pero la persistencia del efecto sintomático fue más prolongada en los pacientes que habían discontinuado el condroitín sulfato en relación a aquellos que habían discontinuado los AINES.

La **glucosamina** es un aminomonosacárido, que es un componente de casi todos los tejidos humanos, incluyendo el cartilago. Es el principal componente de los glicosaminoglicanos con enlaces de O y N, que forman la matriz de todos los tejidos conectivos. La glucosamina es producida en el cuerpo por la adición de un grupo amino a la glucosa; esta molécula es subsecuentemente acetilada a acetil-glucosamina. Hialuronan, keratan y heparan sulfatos están compuestos, en parte, por unidades repetidas de acetil-glucosamina. En keratan y heparan sulfato, el sulfato se agrega a la posición 4 ó 6 de la glucosamina.

El sulfato de glucosamina (peso molecular de 456,41g/nol) es la sal sulfatada de este aminomonosacárido natural. La glucosamina "per se" tiene un peso molecular de 179.17g/nol. Más del 50% está no-ionizada al pH del intestino delgado, lo que permite su rápida absorción (a pH 7.4, 75% está en la forma no-ionizada).

Luego de su administración oral, por lo menos 90% de la sal es absorbida, con 10% que aparece en las heces; aproximadamente 20 a 30% aparece en la orina y hasta un 70% es exhalado como CO₂, siendo retenido aproximadamente en los tejidos entre el 8 al 12%.

En estudios en ratas, las autorradiografías muestran que la glucosamina marcada con ¹⁴C aparece en el cartilago a las 4 horas luego de su ingestión. La glucosamina tiene un especial tropismo por el cartilago y es incorporada por los condrocitos a los proteoglicanos, que son secretados dentro de la matriz extracelular. La porción sulfato juega un importante rol en la síntesis de los proteoglicanos, a causa de que los constituyentes de los glicosaminoglicanos están altamente sulfatados. La depleción de sulfato inorgánico conduce a una disminución de la síntesis de glicosaminoglicanos "in vivo" y la administración exógena de sulfatos es capaz de contrarrestar la acción deletérea de la eventual depleción.

La farmacocinética del sulfato de glucosamina marcada con ¹⁴C ha sido investigada luego de la administración intravenosa, intramuscular u oral en perros, ratas y humanos. Su vida media plasmática es de 0.28 horas. Luego de 1-2 horas, la glucosamina desaparece del plasma y aparece incorporada a las proteínas plasmáticas con un pico a las 8 ó 10 horas luego de la inyección, declinando más tarde con una vida media de alrededor de 70 horas. 28% de sulfato de glucosamina intravenoso puede ser recuperado en la orina a las 120 horas, con una excreción fecal de alrededor de 1%. Los resultados obtenidos de la administración de glucosamina sulfato no marcada a voluntarios humanos muestra que la farmacocinética no difiere sustancialmente de lo que se observa en los perros. La farmacocinética luego de la administración oral es similar a la vía intravenosa, pero las concentraciones son 5 veces más bajas, probablemente debido al "efecto del primer paso hepático", donde se metaboliza la glucosamina a CO₂, agua y urea.

Se ha sugerido que el sulfato de glucosamina tiene un efecto condroprotector que no ha sido demostrado "in vivo", pero existe evidencia experimental "in vitro" que sugiere un rol benéfico en las respuestas metabólicas del cartilago.

Se ha reconocido que el sulfato de glucosamina tiene una actividad antiinflamatoria por un mecanismo aún desconocido pero sustancialmente diferente al de los AINES, que actúan fundamentalmente a través de la inhibición de las ciclo-oxigenasas. La glucosamina es inefectiva como inhibidor de esta enzima y sus efectos

son independientes de las prostaglandinas. Alguno de los mecanismos de acción de la glucosamina han sido relacionados con la estimulación de la síntesis de los proteoglicanos. Aparentemente, estos proteoglicanos nuevamente sintetizados serían capaces de estabilizar las membranas, lo que resultaría en un efecto antiinflamatorio.

La glucosamina también reduce la generación de radicales superóxidos por los macrófagos e inhibe las enzimas lisosomales. En los estudios en que se administró la glucosamina junto con AINEs (diclofenac, indometacina, piroxicam) se mostró que la combinación permite una disminución 2.7 veces menor en la dosis de AINEs requeridos para suprimir la inflamación inducida por carragenina.

Existen más de 20 estudios clínicos en pacientes con osteoartritis (artrosis) en los cuales se incluyen aproximadamente 3.000 pacientes que han recibido glucosamina o placebo. La mayor parte de estos estudios son de corta duración y muestran que existe una respuesta favorable y significativa a la glucosamina en relación al placebo. Estos constituyen la base para considerar a la glucosamina entre los agentes útiles en el tratamiento sintomático de la osteoartritis (artrosis). La glucosamina tiene un comienzo de acción más lento que los AINEs pero su administración permite disminuir el consumo de AINEs y en algunos estudios, la mejoría sintomática se mantuvo de modo significativamente más prolongado luego de la suspensión del tratamiento.

INDICACIONES Y USOS

Condroxamin® 400/500 está indicado para el tratamiento sintomático de la artrosis de rodilla en pacientes con dolor moderado a grave en los que esté indicado el tratamiento combinado con condroitín sulfato y glucosamina.

CONTRAINDICACIONES, PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS

Hipersensibilidad conocida a las drogas.

En portadores de fenilcetonuria se indica el comprimido pues el sobre contiene aspartamo en su fórmula.

El contenido de sodio es bajo y, por lo tanto, **no está contraindicado** su uso en hipertensos que hacen régimen hiposódico.

Embarazo: No existen datos suficientes sobre la utilización de condroitín sulfato y glucosamina en mujeres embarazadas. Los estudios en animales son insuficientes para determinar las reacciones en el embarazo y/o desarrollo embrional, fetal o postnatal. Por tanto, este medicamento no debe utilizarse durante el embarazo.

Lactancia: No existe información disponible sobre la excreción de condroitín sulfato y glucosamina a través de la leche materna. Por ello, y debido a la falta de información de seguridad para el recién nacido, no se recomienda la utilización de este medicamento durante la lactancia.

REACCIONES ADVERSAS

Los estudios de posibles reacciones adversas por su uso a largo plazo son limitados.

Se han informado algunos casos de leves trastornos gastrointestinales (náuseas, diarreas, constipación), que no hacen necesario suspender el tratamiento.

Hay comunicaciones de casos esporádicos de reacciones alérgicas.

Se han observado excepcionalmente casos de retención de agua en pacientes con insuficiencia renal, lo que puede atribuirse a un efecto osmótico del condroitín sulfato.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

La administración oral del sulfato de glucosamina puede favorecer la absorción de tetraciclinas y reducir las de penicilina y cloramfenicol. La glucosamina puede incrementar la acción de la warfarina y por tanto el riesgo de hemorragia cuando se administran de forma concomitante. No se han descrito interacciones con los AINEs y esteroides, por lo que se pueden dar administrar conjuntamente.

POSOLOGÍA Y ADMINISTRACIÓN

Aunque las dosis pueden variar, se recomienda:

Tratamiento de ataque (3 semanas): 1 comprimido o 1 sobre de Condroxamin® 400/500 (equivalente a 400 mg de condroitín sulfato sódico + 500 mg de glucosamina sulfato) cada 8 horas.

Tratamiento de mantenimiento: 1 comprimido o 1 sobre de Condroxamin® 400/500 (equivalente a 400 mg de condroitín sulfato sódico + 500 mg de glucosamina sulfato) cada 12 horas.

Forma de administración del sobre: se puede ingerir el granulado antes o después de las comidas previamente disuelto en agua.

Los comprimidos pueden fraccionarse para facilitar su deglución, pero no para modificar la dosis a administrar.

En los pacientes con trastornos del tracto digestivo se recomienda que tomen la medicación después de las comidas.

PRESENTACIONES

Envases conteniendo 10 y 20 comprimidos.

Envases conteniendo 20 sobres.

No deje ningún medicamento al alcance de los niños.

En caso de intoxicación llamar al C.I.A.T. (Centro de Información y Asesoramiento Toxicológico), Hospital de Clínicas, Avda. Italia s/n Tel.: 1722



Gramón Bagó de Uruguay S.A.
Av. J. Suárez 3359 - Montevideo

www.gramonbago.com.uy
E-mail: info@gramonbago.com.uy
Servicio de atención al consumidor:
 0800 1856