

FICHA TECNICA

HESPERCORBIN, polvo

Sulfato de glucosamina

1.- **NOMBRE DEL MEDICAMENTO**

HESPERCORBIN polvo, sulfato de glucosamina.

2.- **COMPOSICION CUANTITATIVA-CUALITATIVA**

Por sobre:

Sulfato de glucosamina cristalino 1.884 mg
(equivalente a 1.500 mg de sulfato de glucosamina)

3.- **FORMA FARMACEUTICA**

Polvo para solución oral, en sobres monodosis.

4.- **DATOS CLINICOS**

4.1. **Indicaciones terapéuticas.**

HESPERCORBIN, sulfato de glucosamina, está indicado en el tratamiento de la artrosis de columna y de grandes y pequeñas articulaciones.

4.2. **Posología y formas de administración.**

Se recomienda la administración de un sobre monodosis al día, conteniendo 1.500 mg de sulfato de glucosamina, durante un período de 4 a 12 semanas.

Para mantener la actividad terapéutica debe repetirse el tratamiento con intervalos de 2 meses.

Normas para la correcta administración.

Verter el contenido de un sobre en medio vaso de agua; agitar hasta obtener una solución y tomar inmediatamente.

Es aconsejable efectuar la toma del producto antes de las comidas.

4.3. **Contraindicaciones.**

HESPERCORBIN no debe ser administrado a pacientes con hipersensibilidad al sulfato de glucosamina o a cualquiera de sus componentes.

4.4. **Advertencias y precauciones especiales de empleo.**

El HESPERCORBIN contiene como excipiente aspartamo: en personas afectadas de fenilcetonuria, se tendrá en cuenta que cada sobre contiene 1.4 mg de fenilalanina.

4.5. Interacciones con otros medicamentos y otras formas de interacción.

En ensayos clínicos realizados con piroxicam, se ha observado que no existe interacción.

La administración concomitante de HESPERCORBIN con tetraciclinas aumenta la absorción de las mismas siempre que éstas se administren por vía oral.

Asimismo, en el caso de penicilinas y cloramfenicol, la administración de HESPERCORBIN reduce la absorción de éstos.

4.6. Embarazo y lactancia.

No existen estudios realizados en mujeres embarazadas o en período de lactancia, por tanto, debe evitarse la terapia durante estos períodos.

4.7. Efectos sobre la capacidad de conducir vehículos y utilizar maquinaria

HESPERCORBIN no produce efectos sobre el sistema nervioso central, que puedan influir sobre la capacidad de conducción o uso de maquinaria.

4.8. Reacciones adversas.

Los efectos secundarios de HESPERCORBIN son poco comunes y generalmente de naturaleza leve y transitoria.

En raras ocasiones se ha descrito la aparición de náuseas, pesadez, dolor abdominal, meteorismo, estreñimiento, diarrea, mareo, somnolencia y cefalea.

Reacción de hipersensibilidad.- La incidencia de eritema, prurito o asma bronquial es escasa. El tratamiento debe suspenderse ante la aparición de cualquier tipo de reacción alérgica.

4.9. Sobredosificación

No se han dado casos de sobredosificación accidental o intencionada. Basándonos en los resultados obtenidos de toxicidad aguda y crónica no son de esperar síntomas tóxicos incluso tras una dosificación elevada.

5. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

5.1. Propiedades farmacodinámicas.

El principio activo de HESPERCORBIN es el sulfato de glucosamina. La glucosamina es un amino-monosácarido natural y es el sustrato preferido para la biosíntesis de los proteoglicanos del cartílago. Experimentos in vitro mostraron que el sulfato de glucosamina puede estimular la síntesis de proteoglicanos por el condrocito, y que estos tienen una estructura polimérica y uniones macromoleculares con el ácido hialurónico normales en el contexto de la matriz cartilaginosa.

La glucosamina inhibe algunos enzimas destructores del cartílago tal como colagenasas y fosfolipasa A₂ o la formación de otras sustancias que dañan los tejidos, como radicales superóxido de los macrófagos. La glucosamina es también capaz de proteger al cartílago articular de las lesiones derivadas de algunos antiinflamatorios no esteroideos así como de proteger a los condrocitos de la acción lesiva de la dexametasona.

Todas estas actividades pueden explicar los efectos favorables del sulfato de glucosamina en modelos experimentales de osteoartritis.

El sulfato de glucosamina inhibe las reacciones inflamatorias agudas y subagudas, sin inhibir la síntesis de prostaglandinas, probablemente por la vía, ya mencionada, de la inhibición de la formación de radicales superóxido y también de la inhibición de la actividad de los enzimas lisosomiales. Estas acciones pueden explicarse por una actividad estabilizadora de membrana, posiblemente conectada con las propiedades metabólicas anteriormente reportadas del producto.

Todas estas propiedades farmacológicas del sulfato de glucosamina explican su actividad beneficiosa en los procesos de osteoartritis y en particular sobre los síntomas de la enfermedad en diferentes localizaciones.

La glucosamina no muestra efectos sobre el sistema cardiocirculatorio, sobre la función respiratoria y sobre el SNC o vegetativo.

5.2. Propiedades farmacocinéticas

El sulfato de glucosamina en medio acuoso se disocia en glucosamina y en ion sulfato. Estudios in vitro e in vivo han mostrado que la glucosamina no se une a proteínas plasmáticas de la rata, perro u hombre y que difunde libremente desde el compartimento central a los compartimentos periféricos.

La farmacocinética del sulfato de glucosamina se estudió ampliamente en la rata y en el perro empleando ¹⁴C-glucosamina marcada uniformemente.

Absorción Tras la administración oral, alrededor del 90% del sulfato de glucosamina

administrado es absorbido en el tracto gastrointestinal.

Distribución La ^{14}C -glucosamina libre desaparece rápidamente del plasma y concomitantemente la radioactividad aparece incorporada en las globulinas del plasma, en el hígado y en el riñón, y también en los tejidos articulares donde se encuentra en concentraciones mayores que en sangre.

Eliminación La glucosamina se excreta en la orina durante las 48 horas siguientes a la administración oral en una proporción de alrededor del 5% de la dosis administrada. La principal cantidad de la glucosamina administrada oralmente se metaboliza en los tejidos y se elimina como CO_2 en el aire expirado.

Administración repetida La administración repetida diariamente del sulfato de ^{14}C -glucosamina marcado muestra que el estado estacionario en sangre se alcanza durante el tercer día de administración y que no se acumula después de este período.

Estudios en humanos La farmacocinética del sulfato de ^{14}C -glucosamina se estudió en hombres voluntarios sanos, con una dosis única administrada vía intravenosa, intramuscular u oral. Tras la administración oral una proporción próxima al 90% del sulfato de glucosamina fue absorbido. La glucosamina libre no fue detectable en plasma. La radioactividad incorporada en las proteínas plasmáticas siguió pautas farmacocinéticas similares a las obtenidas tras administración i.v. o i.m., pero las concentraciones plasmáticas fueron menores que aquellas obtenidas tras la administración parenteral probablemente debido a un efecto de primer paso hepático.

5.3. Datos preclínicos de seguridad

Los ensayos efectuados en distintas especies animales (rata, conejo y perro) administrando dosis por vía oral de sulfato de glucosamina de hasta 2700 mg/kg (135 veces la dosis terapéutica humana) no han mostrado diferencias significativas con los grupos control.

La dosis letal 50 (DL50) calculada para rata y ratón por vía oral es superior a 5.000 mg/kg (250 veces la dosis terapéutica humana).

Embriotoxicidad (teratogénesis)

Las dosis de sulfato de glucosamina administrada por vía oral, tanto en rata SD como a conejo hembra NZ, comprendidas entre 5 y 125 veces la dosis terapéutica humana, no han provocado efectos teratogénicos.

Fertilidad

En la rata las dosis orales de sulfato de glucosamina, hasta 135 veces la dosis terapéutica humana, administradas a los machos durante 10 semanas antes del acoplamiento y durante el

acoplamiento o a las hembras durante 2 semanas antes del acoplamiento, durante el acoplamiento, la gravidez y la lactancia no han provocado diferencias significativas respecto a los controles.

Los test de mutagénesis son negativos con o sin activación metabólica, sobre varias cepas de Salmonella (test de Ames) y sobre Saccharomyces Cerevisiae D4.

También ha resultado negativo el "Host-mediated assay" administrando el fármaco a dosis orales de 1, 3, 9 g/kg ó subcutáneas de 60, 180 y 540 mg/kg y Salmonella typhimurium por vía i.p..

In vivo (test del micronúcleo en el ratón) la administración de sulfato de glucosamina a dosis orales de 1,3 y 9 g/kg y a dosis subcutáneas de 60, 180 y 540 mg/kg no ha aumentado los eritrocitos con micronúcleo.

6.- DATOS FARMACEUTICOS

6.1. Lista de excipientes

Por sobre:

Aspartamo 2,5 mg

Sorbitol

Carbowax 4000

Acido cítrico

6.2. Incompatibilidades

No se han observado incompatibilidades farmacéuticas.

6.3. Período de validez

El plazo de validez es de 4 años cuando el producto ha sido conservado correctamente.

6.4. Precauciones especiales de conservación

Los envases deben mantenerse en lugar fresco y seco, a temperatura ambiente.

6.5. Naturaleza y contenido del recipiente

Estuche conteniendo 20 ó 30 sobres monodosis.

6.6 Instrucciones de uso/manipulación

Verter el contenido de un sobre en medio vaso de agua; agitar hasta obtener una solución y tomar inmediatamente.

HESPERCORBIN debe conservarse en el envase original cerrado hasta el momento de su utilización.

6.7. Nombre o razón social y domicilio permanente o sede social del titular de la autorización

ROTTAPHARM, Ltd.

Damastown, Industrial Park

Mulhuddart, Dublín 15. Irlanda