



ABSORCIÓN ORAL DE GLUCOSAMINA Y CONDROITÍN SULFATO

Esther Alonso Bernardo.

Facultad de Farmacia, Universidad Complutense de Madrid.

1. INTRODUCCIÓN Y ANTECEDENTES

La Glucosamina (GlcN) y el Condroitín sulfato (CS) son **fármacos de acción sintomática lenta** (SYSADOA) que mejoran los síntomas de la artrosis y se postulan como condroprotectores.

SER, EULAR y OARSÍ establecen un alto grado de recomendación (A) y nivel de evidencia (1A), pero su efectividad es frecuentemente cuestionada.

La **artrosis** es una patología crónico-degenerativa que se manifiesta en dolor intermitente, rigidez y baja movilidad articular. Se trata del motivo de incapacidad más frecuente en personas de edad avanzada.

2 : 1



2. OBJETIVOS

- Evaluación crítica de la eficacia de Glucosamina y Condroitín sulfato en artrosis tras su administración oral, tanto individual como combinada.
- Comprobar si se produce absorción y si la biodisponibilidad es suficientemente significativa como para producir efecto.
- Determinar si estos fármacos son útiles o si, por el contrario, no demuestran efectividad frente al placebo.

3. MATERIAL Y MÉTODOS

Revisión bibliográfica en inglés y en castellano de libros, manuales y artículos científicos recopilados en bases de datos:



4. RESULTADOS Y DISCUSIÓN

- Tienen baja variabilidad farmacocinética y alta seguridad al no ser metabolizados por el citocromo P450 y al no fijarse a proteínas.
- Es fundamental utilizar fármacos de calidad, con un proceso de fabricación estandarizado y considerando la fuente de origen del material biológico.



- Se absorben en el intestino delgado con una biodisponibilidad (Bd) de 5 – 45% y se acumulan en tejidos articulares.
- El mecanismo de acción depende del tamaño de la molécula.
- Ventajas:
 - Modifican el curso de la enfermedad además de paliar los síntomas.
 - ↓ riesgo de efectos adversos.
 - Innovación terapéutica.

⚠️ Uso no recomendado en: población pediátrica, embarazo, lactancia e insuficiencia renal y/o hepática.

GLUCOSAMINA: GLUCOSAMINA HIDROCLORURO (GH) Y GLUCOSAMINA SULFATO (GS)

Presente en el organismo en su forma acetilada.

Se extrae del caparazón de crustáceos marinos.

Absorción gastrointestinal: t_{max} = 3 h y Bd = 44%.

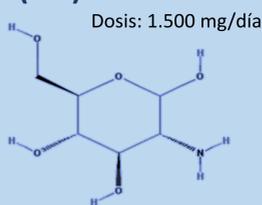
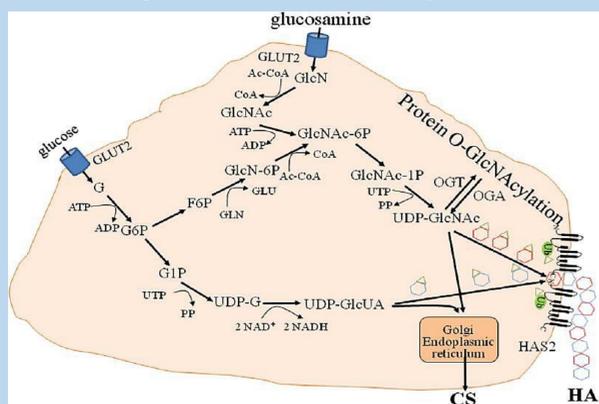


Figura 1. Ruta biosintética de hexosaminas.

Ac-CoA, acetil-coenzima A; ADP, adenosin difosfato; ATP, adenosin trifosfato; F6P, fructosa-6-fosfato; G6P, glucosa-6-fosfato; GlcNAc, N-acetilglucosamina; GlcUA, ácido glucurónico; GLN, glutamina; GLU, glutamato; HA, ácido hialurónico; NADH, nicotinamida adenina dinucleótido; OGA, O-GlcNAc hidrolasa; OGT, O-GlcNAc transferasa; P, fosfato; PP, pirofosfato; Ub, ubiquitina; UDP, uridín difosfato; UTP, uridín trifosfato.



Penetra en las células óseas mediante transportadores de glucosa y se acumula en el líquido sinovial de las articulaciones.

⦿ Más eficaz en fases más avanzadas de artrosis.

CONDROITÍN SULFATO

Dosis: 800 – 1.200 mg/día

Extraído de tejidos bovino, porcino, aviar, peces cartilaginosos o sintetizado.

Respecto a CS bovino:

- CS íctico: mayor masa molecular y densidad de carga.
- CS sódico (CSS): mayor absorción sin reacción adversa.

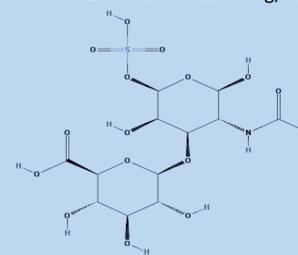


Figura 2. Área bajo la curva (AUC) plasmático (µg h/mL) vs. perfiles de tiempo tras administración de CS y CSS en sujetos humanos.

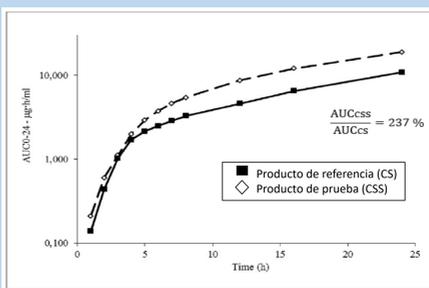
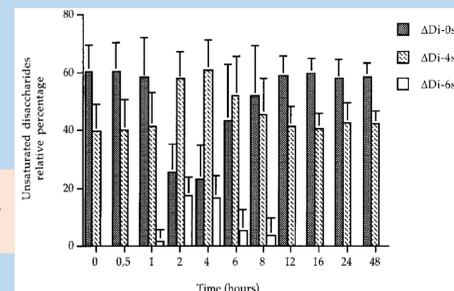


Figura 3. Porcentaje relativo de disacáridos insaturados de Condroitín sulfato determinados por HPLC en 20 voluntarios humanos sanos.



Absorción en segmentos proximales intestino delgado: t_{max} = 2 – 3 h y Bd = 12%. El 90% se despolimeriza.

No penetra en las células del hueso.

⦿ Más eficaz en fases iniciales de artrosis.

ASOCIACIÓN GLUCOSAMINA + CONDROITÍN SULFATO

No hay estudios farmacocinéticos pero las características de sus mecanismos de acción respaldan su uso combinado.

No se produce variación en concentraciones de CS, pero los valores de C_{max} y AUC de GlcN disminuyen.

Principios activos	Dosis	Medicamento comercializado	Forma farmacéutica (oral)	Indicación
Glucosamina	GlcN 625 mg	Duartron	Cápsulas duras	Artrosis de rodilla leve-moderada
	GH 1.250 mg	Acenam, Arafisio	Comprimidos	
	625 mg	Glufan, Arafisio	efervescentes	
GS 1.500 mg	Hespercorbin, Cartisorb, Coderol, Xicil, Cinfa, Normon, Pensa, Kern Pharma, Korhispana, Mabo, Genove, Gluniro	Polvo para solución		
Condroitín sulfato	400 mg CSS	Condrosan, Condrosulf	Cápsulas vía Granulado para solución	Artrosis
GlcN + CS	200 mg GH 250 mg CSS	Droglican	Cápsulas duras	Artrosis de rodilla moderada-grave

5. CONCLUSIONES

- Tienen un inicio de respuesta lento, permiten una reducción de la dependencia a analgésicos y se asocian a mejoras de calidad de vida. Los resultados de las investigaciones existentes son muy dispares por fallos en su diseño al no tener en cuenta: el curso natural de la enfermedad, el efecto placebo, la medicación de rescate, la duración del ensayo o la estandarización y calidad del producto.
- Al observar su efecto, se confirma que estas moléculas de alta masa molecular y densidad de carga se absorben vía oral, siendo capaces de traspasar las mucosas.
- Los resultados de los estudios analizados son esperanzadores con efectos favorables frente al placebo. La investigación no debe detenerse aquí, sino que es necesario realizar más estudios para seguir ampliando los conocimientos farmacológicos.

6. BIBLIOGRAFÍA

- du Souich P. Absorption, distribution and mechanism of action of SYSADOAS. *Pharmacology & Therapeutics*. 2014;142(3):362-74.
- Miraglia N, Bianchi D, Trentin A, Volpi N, Soni M. Safety assessment of non-animal chondroitin sulfate sodium: Subchronic study in rats, genotoxicity tests and human bioavailability. *Food and Chemical Toxicology*. 2016;93:89-101.
- Volpi N. Oral bioavailability of chondroitin sulfate (Condrosulf®) and its constituents in healthy male volunteers. *Osteoarthritis and Cartilage*. 2002;10(10):768-77.
- Bernad Pineda M. Situación actual de los SYSADOA en España. *Reumatología Clínica*. 1 de julio de 2016;12(4):181-83.
- Calvo R. Sulfato de glucosamina y condroitín sulfato, fármacos para el tratamiento de la artrosis, acusados de no presentar eficacia clínica. ¿Culpables?. *Gaceta Médica de Bilbao*. 2012;109(4):158-64.
- Rainsford K.D. Importance of pharmaceutical composition and evidence from clinical trials and pharmacological studies in determining effectiveness of chondroitin sulphate and other glycosaminoglycans: a critique. *Journal of Pharmacy and Pharmacology*. 2009;61(10):1263-70.