

MELoxicAM GLUCOSAMINA SULFATO

Venta Bajo Receta - Industria Argentina

Fórmula

Cada sobre contiene:
Meloxicam 15 mg; glucosamina sulfato 1500 mg (como glucosamina sulfato cloruro potásico); Excipientes: ácido cítrico anhídrido 165 mg; sacarosa 25 mg; sabor limón polvo 100 mg; povidona K30 100 mg; dióxido de silicio coloidal 20 mg; azúcar 1578 mg

Acción Terapéutica

Antiartrosico. Código ATC: M01 AX05
Antiinflamatorio. Código ATC: M01 AC06

Indicaciones

Tratamiento sintomático a corto plazo de la artrosis y reumatismos extraarticulares.

Acción Farmacológica

Glucosamina: glucosamina sulfato es una molécula naturalmente presente en el organismo humano; es utilizada para la biosíntesis de los proteoglicanos de la sustancia fundamental del cartilago articular y del ácido hialurónico del líquido sinovial. Esta biosíntesis se halla alterada en la artrosis, proceso degenerativo que compromete al cartilago articular.

En la artrosis se ha verificado una ausencia local de glucosamina, por disminución de la permeabilidad de la cápsula articular y por alteraciones enzimáticas en las células de la membrana sinovial del cartilago. DOLO MOVUM efectúa un aporte exógeno de glucosamina sulfato para atenuar la deficiencia endógena de la misma, estimular la síntesis de proteoglicanos, desarrollar una acción trófica en las superficies articulares; aportar azufre para la síntesis del ácido condroitin sulfúrico y calcio para el tejido óseo.

Meloxicam: el meloxicam es un antiinflamatorio no esteroide perteneciente al grupo de las enolcarboxamidas; inhibe las prostaglandinas (mediadores de la inflamación) en forma más selectiva en el sitio de la inflamación que sobre la mucosa gastroduodenal o sobre el riñón. Este mecanismo de acción se basa en una inhibición preferencial de la enzima ciclooxigenasa-2 sobre la zona inflamada con respecto a la ciclooxigenasa-1, responsable de los efectos adversos.

Farmacocinética

Glucosamina: en el organismo, el sulfato de glucosamina se disocia en ion sulfato y D-glucosamina (peso molecular = 179.17), que es el principio activo. A 37° C la glucosamina tiene un pKa de 6,91 que favorece su absorción intestinal y, en general, el paso de todas las barreras biológicas.

Tras administración por vía oral en perros, de glucosamina radiomarcada la radiactividad aparece rápidamente (15 minutos) en el plasma y se debe a glucosamina no modificada, como se demuestra por cromatografía de intercambio iónico. Los picos en plasma de glucosamina libre se alcanzan a los 60 minutos y luego disminuyen lentamente. Cuando se comparan las AUC después de la administración I.V. y oral, la biodisponibilidad absoluta de la glucosamina ingerida es de un 72 %. De hecho, según estudios de la excreción fecal de radiactividad en perros, la absorción intestinal es el 87 % de la dosis administrada.

La radiactividad de la glucosamina libre en plasma se difunde con rapidez a distintos órganos y tejidos que tienen la capacidad de concentrar la glucosamina del plasma. La incorporación al cartilago articular se ve rápidamente después de la administración tanto I.V. como oral y persiste en cantidades notables a lo largo del tiempo. Este comportamiento probablemente representa la base farmacocinética para la actividad farmacológica y terapéutica de la glucosamina.

1

hematológicas y los problemas de coagulación, requieren supervisión constante; lo mismo, en pacientes que padecen de insuficiencia cardíaca o renal.

Eventos cardiovasculares trombóticos: estudios clínicos con diversos AINEs COX – 2 – selectivos y no selectivos de hasta 3 años de duración han evidenciado un riesgo incrementado de serios eventos cardiovasculares trombóticos serios, infarto de miocardio, ictus, que pueden ser fatales. Todos los AINEs, tanto COX – 2 selectivos como no selectivos, pueden tener un riesgo similar. Pacientes con enfermedad CV conocida o factores de riesgo para enfermedad CV pueden encontrarse ante un riesgo mayor. Para minimizar el riesgo potencial de un evento CV adverso en pacientes tratados con AINEs, la dosis efectiva más baja debe utilizarse, por el menor tiempo posible. Médicos y pacientes deben permanecer alertas por el desarrollo de tales eventos, aún en ausencia de síntomas CV previos. Los pacientes deben ser informados sobre los signos y/o síntomas de eventos CV serios y los pasos a dar si ello ocurre.

No existe evidencia consistente que el uso concomitante de aspirina disminuya el riesgo incrementado de eventos CV serios asociados al uso de AINEs. El uso concurrente de aspirina y AINEs incrementa el riesgo de eventos gastrointestinales (GI) serios.

Dos estudios clínicos controlados de un AINE COX – 2 selectivo para el tratamiento del dolor en los primeros 10 – 14 días siguiendo a cirugía de bypass coronario, hallaron una incidencia aumentada de infarto de miocardio e ictus.

Hipertensión: los AINEs, incluyendo meloxicam, pueden conducir al comienzo de una nueva hipertensión o al agravamiento de una hipertensión pre-existente, la que puede contribuir a la incidencia aumentada de eventos CV. Los pacientes que reciban tiazidas o diuréticos de asa pueden tener una respuesta alterada a estas terapias cuando están tomando AINEs.

Los AINEs, incluyendo meloxicam, deben ser usados con precaución en pacientes con hipertensión. La tensión arterial debe ser monitorizada exhaustivamente durante la iniciación del tratamiento con AINEs y durante el curso de esta terapia.

Insuficiencia cardíaca congestiva y edema: edemas han sido observados en algunos pacientes que recibían AINEs. Meloxicam debe ser utilizado con precaución en pacientes con retención de líquidos, hipertensión o insuficiencia cardíaca.

Controlar hemograma periódicamente en tratamientos prolongados.

En general, la enfermedad ulcerosa tiene consecuencias más graves en las personas de edad avanzadas. Las mismas pueden ocurrir en cualquier momento durante el tratamiento, con o sin síntomas indicativos o una historia previa. En los casos raros en que se produzcan hemorragias intestinales o ulceraciones en pacientes que reciben la medicación, la droga deberá suspenderse. Ante la acción del meloxicam sobre el flujo renal, debe tenerse especial precaución en los pacientes con insuficiencia renal, cardíaca, hipovolemia y en aquellos tratados con diuréticos.

En los pacientes de edad avanzada, delicados o muy adelgazados, se recomienda utilizar la dosis mínima efectiva.

Con meloxicam al igual que con otros antiinflamatorios no esteroideos, puede presentarse una elevación de enzimas hepáticas. Por lo tanto, durante el tratamiento prolongado con la droga debe indicarse, como medida precautoria el control de la función hepática.

Si las pruebas funcionales hepáticas anormales persisten o empeoran, o si se desarrollan signos o síntomas clínicos compatibles con enfermedad hepática, o si ocurren otras manifestaciones (ej. eosinofilia, erupción, etc.), meloxicam debe interrumpirse.

Se recomienda cautela cuando se utiliza meloxicam en pacientes con porfiria hepática, dado que la droga puede desencadenar un ataque una crisis.

Durante la terapia prolongada con meloxicam - al igual que con otros antiinflamatorios - se recomiendan recuentos hemáticos. Como con otros antiinflamatorios no esteroideos, pueden ocurrir reacciones alérgicas, incluyendo reacciones anafilácticas/anafilactoides, incluso sin una exposición previa a la droga.

La dosis de meloxicam en pacientes con insuficiencia renal terminal en hemodiálisis no debe ser superior a 7,5 mg.

En pacientes con insuficiencia renal leve no debe disminuirse la dosis, al igual que en pacientes afectados de cirrosis hepática clínicamente evolutiva.

3

nal oculto o macroscópico.

Sistema nervioso central

En ocasiones, cefaleas, mareos o vértigo.

Raras veces somnolencia, zumbidos.

Piel

En ocasiones, erupciones cutáneas (exantema, prurito)

Raras veces, urticaria, estomatitis.

En casos aislados, reacciones de fotosensibilización.

Genitourinario

Anormalidades urinarias tales como hematuria, proteinuria, ocasionalmente aumento de los niveles plasmáticos de creatinina y urea.

Hígado

En ocasiones, elevación de las aminotransferasas séricas (GOT y GPT).

Sangre

En casos aislados, anemia.

Otras reacciones adversas ocurrieron en < 2% de los pacientes que han recibido meloxicam en estudios clínicos.

- Reacciones alérgicas, reacciones anafilactoides incluyendo shock, edema facial, fatiga, fiebre, tuforadas, decaimiento, síncope, disminución de peso, aumento de peso.

- Angina de pecho, insuficiencia cardíaca, hipertensión arterial, hipotensión arterial, infarto de miocardio, vasculitis.

- Convulsiones, parestesias, temblor, vértigo.

- Colitis, boca seca, úlcera duodenal, esofagitis, úlcera gástrica, gastritis, reflujo gatroesofágico, hemorragia gastrointestinal, hematemesis, úlcera duodenal hemorrágica, perforación intestinal, melena, pancreatitis, úlcera duodenal perforada, estomatitis ulcerativa.

- Arritmia, palpitación, taquicardia.

- Agranulocitosis, leucopenia, púrpura, trombocitopenia.

- Incremento de transaminasas, bilirubina, GGT, hepatitis, ictericia, falla hepática.

- Deshidratación.

- Trastornos del sueño, ansiedad, aumento del apetito, confusión, depresión, nerviosismo, somnolencia.

- Asma, broncoespasmo, disnea.

- Alopecia, angioedema, erupción bullosa, eritema multiforme, reacción de fotosensibilidad, prurito, dermatitis exfoliativa, síndrome de Stevens-Johnson, aumento de sudoración, necrólisis epidérmica tóxica, urticaria.

- Visión anormal, conjuntivitis, trastornos del gusto, tinnitus.

- Albuminuria, aumento de la creatinina, nefritis intestinal, falla renal.

Sobredosificación

Glucosamina

No se han documentado casos de sobredosis con glucosamina.

Meloxicam

No se ha descrito el cuadro clínico típico por sobredosis con meloxicam. En caso de presentarse se debe realizar lavado gástrico y medidas de protección general.

La colestiramina puede aumentar la eliminación del meloxicam.

No existe antídoto específico para meloxicam.

Síntomas que siguen a la sobredosis de antiinflamatorios están usualmente limitados a letargia, mareos, náuseas, vómitos y dolor epigástrico, que son generalmente revertidos con terapia de sostén. Sangrado gastrointestinal puede ocurrir.

Severa sobredosis puede resultar en hipertensión, falla renal aguda, distensión hepática, depresión respiratoria, coma, convulsiones, colapso cardiovascular, paro cardíaco. Reacciones anafilactoides han sido comunicados con la ingestión de AINEs.

Los pacientes deben ser manejados con cuidados sintomáticos y de sostén. En casos de sobredosis aguda, el lavado gástrico seguido de carbón activado es recomendado.

El lavado realizado después de más de una hora de la sobredosis tiene escasos beneficios.

La administración de carbón activado está recomendada en pacientes que se presentan 1-2 horas después de la sobredosis.

Para sobredosis importantes o síntomas severos, el carbón activado debe ser administrado

5

Los resultados en humanos son semejantes a los obtenidos previamente en animales de experimentación. En particular, se consiguió demostrar una buena biodisponibilidad absoluta tanto por vía I.M. como oral. Por vía oral, la radiactividad recuperada en las heces fue sólo un 11,3

% de la dosis administrada, lo que demuestra que al menos un 89 % de la glucosamina administrada por vía oral se absorbe en el aparato digestivo.

Meloxicam: meloxicam se absorbe rápidamente por vía oral con una biodisponibilidad del 89 % luego de una dosis única de 30 mg y 7,5 mg alcanzando concentración de 2 mcg/ml con 15 mg y de 1 mcg/ml con 7,5 mg. Los picos de concentración plasmática se alcanzan entre las 5 y 6 horas en ayunas o con una comida liviana y son más tardíos con el estómago lleno. El comienzo de acción es de 80 a 90 minutos en la forma oral y de 30 minutos con la forma I.V. La absorción luego de la administración rectal es similar a la vía oral y la inyectable I.M. es mayor que la oral con una concentración máxima entre 1 a 1,5 hora.

La absorción es independiente de la dosis, llevando a aumentos lineales en las concentraciones plasmáticas según la dosis en el rango de 7,5 a 30 mg.

Meloxicam circula ligado a la albúmina en un 90%. El volumen de distribución es del orden de 10 a 15 litros, aproximadamente igual al espacio extracelular. Penetra en los tejidos y la concentración en el líquido sinovial es la mitad de la del plasma.

Meloxicam es metabolizado extensamente y menos del 1 % de la droga original aparece en la orina. Se han aislado 4 metabolitos principales formados por la oxidación del grupo metilo de la molécula tiazinol, seguido de un desdoblamiento oxidativo del anillo benzotiazina. El metabolismo de meloxicam es mediado a través del citocromo P450 2C.

Posología y Modo de administración

Sobre diluido en un vaso de agua una vez al día con el desayuno. El tratamiento es de corto plazo y la duración del mismo consistente con las metas individuales para cada paciente.

Contraindicaciones

- Hipersensibilidad a cualquiera de los componentes de la fórmula.

- Embarazo y lactancia.

- Fenilcetonuria.

- Úlcera gastrointestinal o duodenal activa.

Precauciones y Advertencias

Riesgo cardiovascular: los AINEs pueden causar un incremento de serios eventos trombóticos cardiovasculares, infarto de miocardio, e ictus, que pueden ser fatales. Este riesgo puede incrementarse con la duración de su uso. Pacientes con enfermedad cardiovascular o factores de riesgo de enfermedad cardiovascular pueden hallarse en riesgo mayor.

Meloxicam está contraindicado para el tratamiento de dolor perioperatorio en pacientes sometidos a bypass coronario.

Riesgo Gastrointestinal: los AINEs pueden causar eventos gastrointestinales adversos serios incluyendo hemorragias, úlceras y perforación de estómago o intestino, que puede ser fatal. Estos eventos pueden ocurrir en cualquier momento durante su uso y sin síntomas previos. Los pacientes ancianos tienen mayor riesgo de padecer eventos gastrointestinales serios.

Meloxicam no sustituye la acción de corticosteroides para tratar la insuficiencia esteroide.

La discontinuación abrupta de corticosteroides puede producir una exacerbación de la enfermedad. Los pacientes con terapia prolongada de corticosteroides deben disminuir lentamente las dosis de los mismos si la decisión es discontinuarlos.

La actividad antiinflamatoria y febrífuga del meloxicam puede disminuir la utilidad de estos signos diagnósticos para detectar complicaciones en cuadros dolorosos presumiblemente no infecciosos.

Glucosamina

Embarazo y lactancia: aunque se observaron efectos desfavorables sobre la función reproductora y en el período de lactancia en estudios realizados sobre animales, la administración del producto en el hombre en estos casos debe ser limitada a los casos de gran necesidad y siempre bajo control médico.

Meloxicam

Antecedentes de úlcera gastroduodenal, colitis ulcerosa o enfermedad de Crohn. Las afecciones

2

Carcinogénesis, mutagénesis, teratogénesis y deterioro de la fertilidad

Glucosamina

La glucosamina es un componente natural del organismo humano; estudios de toxicidad crónica en dos especies de animales durante 52 semanas han demostrado la ausencia de efectos tóxicos hasta una dosis diaria de 2700 mg/kg.

Estudios de mutagénesis confirman la ausencia de una acción mutagénica del producto. No se realizan estudios de carcinogénesis, debido al tipo de producto, a la ausencia de una relación entre la estructura química y la de las sustancia cancerígenas, y al hecho de que no se han encontrado efectos tóxicos en los estudios de toxicidad aguda, subaguda y crónica, fertilidad y teratogénesis.

Meloxicam

Carcinogénesis

No se han observado efectos carcinogénicos en ratas tratadas con dosis de 0,8 mg/kg/día.

Mutagénesis

No se han demostrado efectos mutagénicos con el test de AMES.

Interacciones medicamentosas

Glucosamina

La administración oral de glucosamina sulfato puede favorecer la absorción gastrointestinal de las tetraciclinas y reducir las de la penicilina y del cloramfenicol, cuando son administradas conjuntamente por vía oral.

No existen inconvenientes con la administración simultánea de analgésicos o de antiinflamatorios esteroideos o no esteroideos.

Meloxicam

- No asociar meloxicam con ácido acetilsalicílico ni administrar simultáneamente con otros antiinflamatorios no esteroideos porque existe sinergismo entre ellos y aumenta la posibilidad de efectos adversos gastrointestinales.

- El uso simultáneo de terapia anticoagulante oral, ticlopidina, heparina, trombolíticos, aumenta el riesgo de hemorragia siendo necesario controlar los efectos de esta medicación.

- El meloxicam incrementa ligeramente la absorción de litio, por lo tanto, se recomienda controlar los niveles plasmáticos del mismo durante la administración de meloxicam.

- Se debe realizar un control hematológico riguroso en caso de asociación con metotrexato pues se potencia la toxicidad hematológica del último.

- Los pacientes tratados simultáneamente con meloxicam y diuréticos han de estar normohidratados y debe controlarse su funcionamiento renal antes de iniciar el tratamiento ya que la terapia con antiinflamatorios no esteroideos se asocia con riesgo potencial de insuficiencia renal aguda en pacientes deshidratados.

- Se ha informado de una menor acción de drogas antihipertensivas (betabloqueantes, vasodilatadores, inhibidores de la CEA, etc.) por inhibición de las prostaglandinas vasodilatadoras por acción de los antiinflamatorios no esteroideos.

- La colestiramina se une al meloxicam en el tracto gastrointestinal causando una eliminación más rápida del último.

- Meloxicam ocasionalmente puede producir reacciones de hipersensibilidad cruzada con ácido acetilsalicílico u otros antiinflamatorios no esteroideos.

Embarazo y Lactancia: no se debe administrar durante el embarazo y la lactancia ya que no está demostrada la seguridad clínica del meloxicam.

Reacciones adversas

Glucosamina

Eventualmente alteraciones gastrointestinales (epigastralgia, náuseas, diarrea).

Meloxicam

Tracto gastrointestinal

Puede presentarse, dolor abdominal y otras alteraciones gastrointestinales, tales como estados nauseosos, vómitos, diarrea, calambres abdominales, dispepsia, flatulencia, anorexia.

En muy raras ocasiones pueden producir aumento de las transaminasas u otras alteraciones hepáticas como hiperbilirrubinemia, esofagitis, úlcera gastroduodenal, sangrado gastrointesti-

4

repetidamente.

La retención acelerada de meloxicam por 4 gramos orales de colestieraimina administrados tres veces al día ha sido demostrada en estudios clínicos.

Diuresis forzadas, alcalinización de orina, hemodiálisis o hemoperfusión pueden no ser útiles debido a la elevada ligadura proteica.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

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

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

Opativamente otros Centros de Intoxicaciones.

Presentación: envases con 30 sobres.

Fecha de última revisión: diciembre de 2013.

Forma de conservación

- Conservar a temperatura ambiente hasta 30°C en lugar seco. Proteger de la luz y la humedad.

- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Luis M. Radici – Farmacéutico.

MEDICAMENTO AUTORIZADO POR EL MINISTERIO DE SALUD.

Certificado N° 56.753

Laboratorios CASASCO S.A.I.C.

Boyaçá 237 - C.A.B.A.

6

8