



# FORMULACIONES VAGINALES PARA LA PREVENCIÓN DEL SIDA III



Autor: Sara Álvarez Atienza

Facultad de Farmacia, Universidad Complutense de Madrid

## INTRODUCCIÓN

El **SIDA** es uno de los principales problemas de salud pública a nivel mundial, fundamentalmente en los países más desfavorecidos.

Es importante subrayar la situación de las mujeres en estos países ya que es muy habitual la **violencia sexual** contra ellas y las medidas que tienen a su alcance para su protección y prevención es muy escasa.

Debido a esto, se hace imprescindible disponer de diferentes métodos de prevención que puedan ser controlados por ellas mismas, un ejemplo de ello, los microbicidas.

En este trabajo se han recogido y analizado los artículos más notables sobre los diferentes estudios de formulaciones microbicidas para prevenir la transmisión sexual del VIH.

## MATERIAL Y MÉTODOS

Se llevó a cabo una búsqueda bibliográfica rigurosa, utilizando las bases de datos y otras publicaciones existentes como PubMed, Elsevier, libros científicos o webs institucionales.

El método fue analizar diferentes fórmulas microbicidas vaginales observando los distintos resultados obtenidos en los estudios preclínicos y clínicos.

## RESULTADOS Y DISCUSIÓN

### GELES

**Gel de HidroxiEtilCelulosa (HEC) con Maraviroc** en  $\neq$  concentraciones. Protección máxima

→ gel al 3,3%.

La concentración necesaria se alcanza en el intervalo de 30 minutos a 2 horas tras la administración.

**Gel de liberación prolongada con Maraviroc:** el estudio se realizó en macacos con un gel de silicona → se

consiguieron concentraciones mayores y más sostenidas en el tiempo en el fluido vaginal.



### ANILLOS

**Anillo de Dapivirina:** Estudio en fase III en mujeres africanas. Estudio aleatorio vs placebo.

- ↓ 27% la adquisición del VIH
- ↓ 37% en mujeres con una adherencia al tratamiento aceptable
- ↓ 56% en mujeres con > de 21 años.



**Anillo de liberación prolongada de Dapivirina + Levonorgestrel:**

- Anillo tipo matriz → 60 días de liberación de ambos fármacos
- Anillo tipo reservorio → 90 días de liberación de ambos fármacos

In vitro vs VIH

### COMPRIMIDOS Y CÁPSULAS

**Comprimidos vaginales con Tenofovir y  $\neq$  polímeros:**

- HidroxiPropilMetilCelulosa (HPMC)
- Quitosan (CH)
- Goma Guar (GG)
- Eudragit RS® (ERS)

Liberación controlada del fármaco. (Mayor en HPMC y CH).

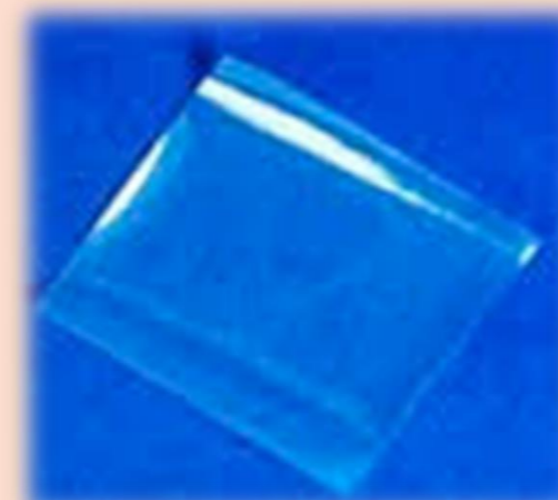


**Cápsulas blandas con Lactobacillus:** modificaciones para expresar moléculas inhibitorias del VIH.

Polímero	Tiempo Mucoadhesión (h)
CH	48
HPMC	180
ERS	140
GG	160

### FILMS VAGINALES

**Film con 5-Cloro-3-[fenilSulfonil]Indol-2-Carboxamida (CSIC):** El CSIC es un potente ITINAN muy hidrófobo → se preformuló con PEG 400, propilenglicol y glicerina en proporciones 5:2:1.



**Film con Abacavir:** ha demostrado tener actividad *in vitro* como *in vivo* vs VIH-1 y VIH-2. El film se formuló a partir de diferentes combinaciones de HPMC y alginato sódico. Presentaron mínima citotoxicidad tanto *in vitro* como *in vivo*. Los films resultantes eran finos, flexibles, transparentes y fáciles de manipular.

## CONCLUSIÓN

Desde la última década se ha avanzado considerablemente en la lucha contra el SIDA y los resultados son verdaderamente prometedores pero todavía seguimos esperando el desarrollo definitivo de una formulación vaginal con un microbicida como principio activo la cual resultaría ideal para otorgar a las mujeres de una defensa añadida en la prevención total contra esta enfermedad.

Es necesario encontrar las propiedades físicas, químicas y farmacocinéticas adecuadas para una buena penetración y distribución por el tejido vaginal, y que sea capaz de mantener la liberación del fármaco de manera prolongada para lograr una menor frecuencia en la administración.

A pesar de que la mayoría se encuentran en estudio, existen altas expectativas y además siguen surgiendo nuevas formulaciones vaginales muy esperanzadoras.

## BIBLIOGRAFÍA

Campuzano RV. Virus de la Inmunodeficiencia Humana (VIH). Universidad nacional autónoma de México. 2016. [Consulta Feb 2017]. Disponible en: <http://www.facmed.unam.mx/deptos/microbiologia/virologia/sida-vih.html>

On the Fast-Track to end AIDS (UNAIDS, 2016-2021 Strategy). [Citado Abril 2017]. Disponible en: [www.unaids.org/sites/default/files/media\\_asset/20151027\\_UNAIDS\\_PCB37\\_15-18\\_EN\\_rev1.pdf](http://www.unaids.org/sites/default/files/media_asset/20151027_UNAIDS_PCB37_15-18_EN_rev1.pdf)

Forbes CJ, Lowry D, Geer L, et al. Non-aqueous silicone elastomer gels as a vaginal microbicide delivery system for the HIV-1 entry inhibitor maraviroc. J Control Release 2011;156(2):161-169.

Montgomery ET, van der Straten A, Chitukuta M et al. Acceptability and use of a dapivirine vaginal ring in a phase III trial. AIDS. 2017;31(8):1159-1167

Notario-Perez F, Martín-Illana A, Cazorla-Luna R, Ruiz-Caro R, et al. Influence of Chitosan Swelling Behaviour on Controlled Release of Tenofovir from Mucoadhesive Vaginal Systems for Prevention of Sexual Transmission of VIH. Marine Drugs. 2017;15(2):1-16

Gong T, Zang W, Parniak MA, et al. Preformulation and Vaginal Film Formulation Development of Microbicide Drug Candidate CSIC for HIV Prevention. J Pharm Innov. 2017;2(2):142-154

