

# FORMULACIONES VAGINALES PARA LA PREVENCIÓN DEL SIDA



Autor: Carla Cepeda Jorge  
Facultad de Farmacia,  
Universidad Complutense de Madrid

## INTRODUCCIÓN

### EPIDEMIOLOGÍA

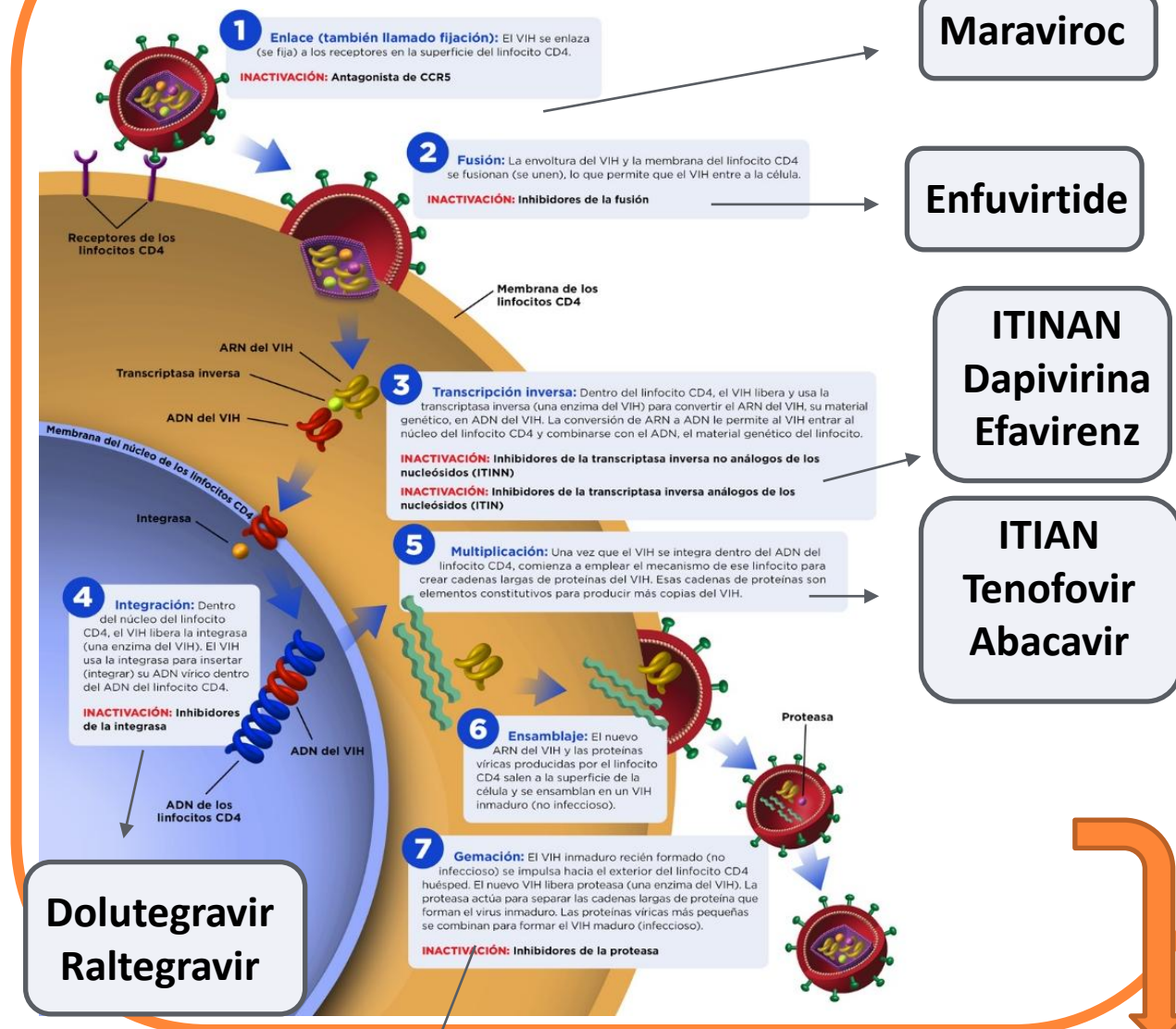
- Cada día más de un millón de personas contraen enfermedades de transmisión sexual (ETS).
- El *Virus de la Inmunodeficiencia humana* (VIH) infecta las células del sistema inmune y hace que éste pierda su capacidad de defender al cuerpo contra infecciones y enfermedades, dando lugar al *Síndrome de Inmunodeficiencia adquirida* (SIDA).
- Uno de los principales problemas de salud pública a nivel mundial.

36,7  
Millones de infectados por VIH

1'8  
Millones de nuevas infecciones

1  
Millón de muertes/año

### CICLO VIRAL VIH



**Tratamiento antirretroviral (TAR)**  
2 ITIAN + 1 INI o  
1 ITIAN o  
1 IP potenciado

### OBJETIVO ONUSIDA

- 90% de las personas que viven con VIH conocerán su estado serológico
- 90% de quienes conocen su estado serológico positivo recibirá terapia antirretroviral continuada
- 90% de las personas en tratamiento logrará suprimir la carga viral

**"Eliminar las desigualdades, el maltrato y la violencia de género y aumentar la capacidad de las mujeres y las adolescentes para protegerse del VIH"**  
Objetivo de la ONU para acabar con la epidemia de SIDA

### La mujer y el VIH

Cada minuto, una mujer joven se infecta con el VIH



Urgente necesidad de desarrollar métodos de prevención controlados por mujeres

Seguro y eficaz  
Aceptado por las mujeres  
Estable  
Bajo coste y fácil fabricación

**MICROBICIDA VAGINAL "Ideal"**

## METODOLOGÍA

- 1ª Revisión, documentación e investigación bibliográfica en bases de datos como PubMed, Google Scholar y Medline.
- 2ª Análisis de la evolución de las formas farmacéuticas microbicidas vaginales en los últimos años y el estado actual de su investigación. Así como la importancia de seguir estudiando estrategias de prevención para el SIDA y otras ETS.
- 3ª Recopilación de la información siguiendo un orden cronológico de aparición del tema.

## OBJETIVOS

- 1- Realizar una amplia revisión bibliográfica sobre formulaciones vaginales preventivas de VIH.
- 2- Analizar las formas farmacéuticas vaginales microbicidas que hoy en día se encuentran en investigación y los avances y modificaciones sufridas durante su desarrollo.

## RESULTADOS Y DISCUSIÓN

### GELES

**PRIMEROS FRACASOS: Surfactantes**  
- Nonoxonyl-9 → Descartado por provocar lesiones genitales.  
- SAVVY gel® (C31G al 1) → No demostró eficacia en los ensayos clínicos.



### BÚSQUEDA DE SUSTANCIAS ALTERNATIVAS:

- Acidificantes:  
- BufferGel® → Son seguros, pero no interfieren en la transmisión del virus.
- Polianiones:  
- Carraguard® → Seguro pero ineficaz. Actual uso como vehículo.  
- PRO2000® → Activo in vitro pero no demostró eficacia clínica.  
- VivaGel® (SPL7013) → Bien tolerado y seguro en humanos; Activo en animales. → EN ESTUDIO

**OTROS:**  
- Anticuerpos monoclonales como 2G12 y PRO-140 → Eficacia dosis-dependiente y alto coste  
- Cianovirina-N → L. jensenii productor de CV-N  
- Grifitsina → EN ESTUDIO

### GELES QUE INCLUYEN FÁRMACOS ANTIRRETROVIRALES:

- Inhibidores de entrada:**  
- Gel de Maraviroc e hidroxietilcelulosa → Descartado por poca permanencia → Alternativa en gel de silicona EN ESTUDIO
- Inhibidores de la transcriptasa inversa:**  
- Gel de Tenofovir → Eficacia probada en estudio CAPRISA 004 → ESTUDIOS de Adherencia

### ANILLOS VAGINALES

- Anillo de Tenofovir disoproxil fumarato (TDF): Seguro, bien tolerado y de liberación prolongada

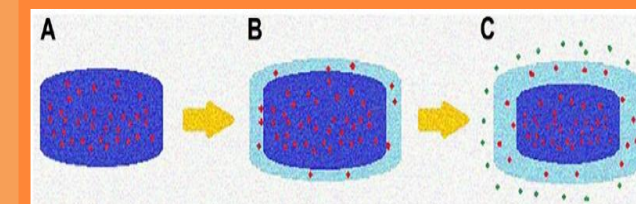
- Anillo de Dapivirina: Liberación controlada durante 28 días. Seguros y cómodos



Fase III

### COMPRIMIDOS VAGINALES

Tabletas hechas de polímeros capaces de gelificar en presencia de fluido vaginal



- Comprimidos vaginales de Tenofovir y diferentes polímeros mucoadhesivos.

### FILMS VAGINALES

- Film de HPMC con Abacavir

- Film de Dapivirina

ESTUDIOS de Efectividad



### NANOPARTÍCULAS

Pequeñas y recubiertas de polímeros biodegradables capaces de internalizarse en la células virales y soltar el p.a.

- 1) Nanogel de liberación sostenida
- 2) Nanopartículas en películas de polímero: NP de HPC con Tenofovir o Efavirenz

### FIBRAS ELECTROHILADAS

Creadas por electrospinning. Fibras poliméricas que sólo liberan el p.a. si el polímero se va erosionando.

- Nanofibra de PVA con Tenofovir o sobre una base de ácido hialurónico tiolado

### PROBIÓTICOS

Microorganismos de la flora vaginal genéticamente modificados capaces de expresar moléculas que inhiben el VIH

✓ Cápsulas blandas de *Lactobacillus jensenii*

## GELES

## ANILLOS

## COMPRIMIDOS y FILMS VAGINALES

## EL FUTURO DE LOS MICROBICIDAS

- × Rápido desarrollo de resistencias.
- × Uso profiláctico continuo. No elegido por las mujeres.

- ✓ Formulaciones de liberación sostenida.
- ✓ Mejoran la adherencia.
- × Necesidad de enseñar a la población.
- × Alto coste.

- ✓ Estables, económicos y fácil elaboración.
- ✓ Mayor tiempo de adherencia.
- ✓ Liberación sostenida.
- × Dificultad de encontrar polímero apropiado.

- ✓ Elevada flexibilidad, alta adhesión y liberación prolongada y sostenida.
- ✓ Comodidad.
- × Se requieren más estudios que garanticen la eficacia y seguridad.

## CONCLUSIONES

1ª

Los microbicidas suponen un método efectivo de prevención con alta aceptabilidad femenina demostrada

Aunque la mayoría de los candidatos a microbicidas se encuentran en investigación

2ª

La División sobre el SIDA del Instituto Nacional de Alergias y Enfermedades Infecciosas (DAIDS) ha interrumpido la financiación de los proyectos con microbicidas

3ª

El anillo de Dapivirina y el Gel de Tenofovir son las formulaciones microbicidas que se encuentran más avanzadas en investigación

Las formas de dosificación más novedosas están aún lejos de aplicación clínica

## BIBLIOGRAFÍA

1. Notario-Pérez F et al. Drug Des Devel Ther. 2017;11:1767-1787.
2. Thomson KA. Curr Opin HIV AIDS. 2016; 11(1): 18-26.
3. Montgomery CM. Anthropol Med. 2015;22(3):250-262.
4. Romero F, et al. Rev Argent Microbiol. 2014:256-268.
5. Fauci AS. Nat Immunol. 2013; 14(11): 1104-1107.