

Inhibidores de la transcriptasa inversa análogos de nucleósidos y de nucleótidos (parámetros farmacocinéticos en población adulta)

Nombre genérico	Zidovudina AZT	Didanosina ddI	Estavudina d4T	Lamivudina 3TC	Emtricitabina FTC	Abacavir ABC	Tenofovir TDF
Nombre comercial	Zidovudina EFG® Retrovir® *Combivir® *Trizivir®	Didanosina EFG® Videx®	Zerit®	Lamivudina EFG® Epivir® *Combivir® *Trizivir® *Kivexa®	Emtriva® *Truvada® *Atripla® *Eviplera® *Genvoya® *Stribild®	Ziagen® *Trizivir® *Kivexa® *Triumeq®	Viread® *Truvada® *Atripla® *Eviplera® *Genvoya® *Stribild®
Fecha de autorización por la AEMPS	01/07/1988	01/06/1993	01/09/1996	08/08/1996	02/12/2003	08/07/1999	05/02/2002
Peso molecular y equivalencias	PM 267,24 ^Ω microM x 0,267= mcg/ml	PM 236,2 ^Ω microM x 0,236= mcg/ml	PM 224,2 ^Ω microM x 0,224= mcg/ml	PM 229,3 ^Ω microM x 0,229= mcg/ml	PM 247,24 ^Ω microM x 0,247= mcg/ml	PM 670,76 ^Ω microM x 0,671= mcg/ml	PM 635,52 (Tenofovir disoproxil fumarato) ^Ω microM x 0,635= mcg/ml
Biodisponibilidad oral	60-70% ^ω	42 (±12)% ^{a,Ω}	86±18% ^{a,ω}	80-85% ^ω	93% (cápsulas) ^ω 75% (solución oral) ^ω	83% ^ω	25% en ayunas. ^ω
Efecto de los alimentos	Se puede administrar con y sin alimentos, el AUC se mantiene similar. ^Ω	Debe administrarse al menos 30 min antes de las comidas o 2 horas después de comer (los alimentos reducen un 50% su biodisponibilidad). ^ω	Puede administrarse con o sin alimentos.	Puede tomarse con o sin alimentos. La administración con alimentos disminuye un 47% la Cmáx. No obstante, el grado de absorción, según el AUC, no se ve afectado. ^ω	Puede tomarse con o sin alimentos. ^ω	Puede tomarse con o sin alimentos. ^ω	La administración con una comida ligera en grasa no modificó el AUC, mientras que una comida rica en grasa aumentó un 40% el AUC. ^ω
T max	0,5 horas ^ω 0,5 -1,5 horas ^Ω	0,25-1,5 horas ^Ω	1 hora ^Ω	1 horas ^ω	1,5 horas (comprimido) ^ω 1 hora (solución) ^ω	1,5 horas (comprimido) ^ω 1,0 h (solución) ^ω .	2,3 horas ^{&}
Semivida plasmática	1,1 horas (iv) ^ω	1,4 h (iv) ^ω 1,5 ± 0,4 horas ^{a,Ω}	1,3 a 2,3 horas ^ω	5-7 horas ^ω	10 horas ^ω	1,5 horas ^ω	12-18 horas ^ω
Semivida intracelular	3 horas ^{&}	25-40 horas ^{&}	3,5 horas (in vitro) ^ω	16-19 horas ^ω	39 horas ^ω	20,6 horas ^ω (carbovir trifosfato)	PBMCs: 10 horas (en células activadas); 50 horas (en células en reposo) ^ω

Nombre genérico	Zidovudina AZT	Didanosina ddl	Estavudina d4T	Lamivudina 3TC	Emtricitabina FTC	Abacavir ABC	Tenofovir TDF
Cmax	2,29 mcg/ml (300mg/12h) ^ω 1,9 mcg/ml (5mg/kg/4h en solución) ^ω 1,2 mcg/ml (200mg/4h) ^ω	1,475 ± 0,673 mcg/ml ^ω 0,9 mcg/ml (3,8 microM) & ^{a,ω}	536±146 nanog/ml (con 40 mg/12h)(VIH+) ^{a,ω}	1,2 mcg/ml (150mg/12h) ^ω 2,0 mcg/ml (300 mg/24h) ^ω	1,8 ± 0,7 mcg/ml ^ω	3,0 ± 0,89 mcg/ml (300mg/12h) ^{ω,Ω} 4,26 ± 1,19 microg/ml (600 mg/24h) ^{ω,Ω}	0,326 mcg/ml ^ω
Cmin	0,02 mcg/ml (300mg/12h) ^ω 0,1 mcg/ml (5mg/kg/4h en solución y 200mg/4h) ^ω	—	9 ± 8 nanog/ml (con 40 mg/12h) (VIH+) ^ω	0,09 mcg/ml (150mg/12h) ^ω 0,04 microg/ml (300 mg/24h) ^ω	0,09 ± 0,07mcg/ml ^ω	0,01 mcg/ml (300mg/12h) ^ω	0,064 mcg/ml ^ω
AUC	2,4 mcg·h/ml ^ω	2,516 ± 0,847 mcg·h/ml ^ω	AUC _{0-12h} : 1284± 227 nanog·h/ml (con 40 mg/12h) (VIH+) ^{a,ω}	AUC _{0-24h} : 4,7 mcg·h/ml (150 mg/12h) ^ω AUC _{0-24h} : 8,9 mcg·h/ml (300 mg/24h) ^ω	10 ± 3,1mcg·h/ml ^ω	AUC _{0-12h} : 6,02 ± 1,73 microg·h/ml (600 mg/24h) ^{ω,Ω} AUC _{0-24h} : 11,95 ± 2,51 microg·h/ml (600 mg/24h) ^{ω,Ω}	3,32 mcg·h/ml ^ω
UPP	34-38% ^ω	<5% ^Ω	Unión despreciable ^ω	<16 % - 36 % ^ω	< 4% ^ω	Aprox. 49% ^ω	<7.2% ^ω
Vd aparente	1,6 L/kg ^ω	54L ^ω 43.70 ± 8.90 L/m ^{2 a,Ω}	46 ± 21L ^ω	1,3 L/kg ^ω	1,4 ± 0,3 L/kg (i.v.) ^ω	0,8 L/kg ^ω	800 mL/kg ^ω
Penetración en LCR (LCR:plasma)	0,5 (a las 2-4h de la dosis) ^ω Grado 4 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) (Letendre S Poster 430. Croi 2010)	21 (±0,03)% ^a (tras admin. IV). ^{ω,Ω} Grado 2 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) (Letendre S Poster 430. Croi 2010)	0,39 ± 0,06 (4h post dosis).No se observó acumulación significativa. ^ω Grado 2 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) (Letendre S Poster 430. Croi 2010)	0,12 (2-4h post dosis) ^ω Grado 2 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) (Letendre S Poster 430. Croi 2010)	No se dispone de datos ^ω Grado 3 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) (Letendre S Poster 430. Croi 2010)	30-44% ^ω Grado 3 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) (Letendre S Poster 430. Croi 2010)	Grado 1 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) (Letendre S Poster 430. Croi 2010)
Aclaramiento total	27,1 ml/min/kg ^ω	1252 ± 154 ml·min/m ^{2 a,Ω} 2164 ± 638 ml/min ^{a,Ω}	594±164 ml/min ^ω	0,32 L/h/kg ^ω	307 ml/min (4,03 ml/min/kg) ^ω	0,80 ± 0,24 L/hr/kg ^{a,Ω}	230 ml/h/kg (aprox. 300 ml/min) ^ω
Aclaramiento renal	0,34 L/h/kg ^ω	223 ± 85 ml·min/m ^{2 a,Ω} 458 ± 164 ml/min ^{a,Ω}	237±98 ml/min ^ω	280,4 ± 75,2 mL/min ^{a,Ω} (71% ± 16% ^a del aclaramiento total) ^Ω	86% ^Ω	1,2% inalterado ^Ω	160 ml/h/kg (aprox. 210 ml/min) ^ω

Nombre genérico	Zidovudina AZT	Didanosina ddI	Estavudina d4T	Lamivudina 3TC	Emtricitabina FTC	Abacavir ABC	Tenofovir TDF
Farmacocinética: efecto de edad, raza y sexo.	No se han investigado los posibles cambios en la farmacocinética relacionados con la edad o la raza. No se han observado diferencias en ambos sexos. ^Ω	No se han investigado los posibles cambios en la farmacocinética relacionados con la edad, raza o sexo. ^Ω	No se han investigado los posibles cambios en la farmacocinética relacionados con la edad. No se han observado variaciones relacionadas con la edad o el sexo. ^Ω	No se han investigado los posibles cambios en la farmacocinética relacionados con la edad. No se han observado variaciones relacionadas con la edad o el sexo. ^Ω	No se dispone de datos en pacientes de edad avanzada (>65años). No se han observado variaciones relacionadas con la edad, sexo o raza. ^ω	No se han investigado los posibles cambios en la farmacocinética relacionados con la edad. No se han observado variaciones relacionadas con la edad o el sexo. ^Ω	No se han investigado los posibles cambios en la farmacocinética relacionados con la edad o la raza. No se han observado variaciones relacionadas con el sexo. ^ω
Actividad	VIH-1,2 ^ω	VIH-1,2 ^ω	VIH-1,2 ^{&}	VIH-1,2 ^ω VHB ^ω	VIH-1,2 ^ω VHB ^ω	VIH-1,2 ^ω	VIH-1,2 ^ω VHB ^ω
Sustrato	Glucuronidación ^ω	--	--	Bajo grado de metabolismo hepático (5-10%) ^ω	Glucuronidación ^ω	Glucuronidación ^ω	--

^a Expresado como media ± DE si no se indica lo contrario

^b Expresado como mediana ± rango intercuartil

^c Expresado como rango

^ω Información procedente de la ficha técnica europea. EPARS: European Public Assessment Reports. Disponible en:

http://www.ema.europa.eu/ema/index.jsp?curl=pages/includes/medicines/medicines_landing_page.jsp&murl=menus/medicines/medicines.jsp&mid=. Con acceso [05/03/2016].

^Ω Información procedente de la ficha técnica americana (fuentes: FDA and First Data Bank, Inc). Disponible en: http://www.rxlist.com/drugs/alpha_a.htm .Con acceso [05/03/2016].

[&]Guardiola JM, Soriano V (Eds). Tratamiento de la infección por VIH-SIDA. Fármacos y combinaciones. Décima Edición. Barcelona: Publicaciones Permanyer 2007.

* En combinación con otros fármacos