

**Antagonistas del correceptor CCR5 e inhibidores de la entrada.**  
(parámetros farmacocinéticos en población adulta)

Grupo terapéutico	Antagonistas correceptor CCR5	Inhibidores de la fusión
Nombre genérico	Maraviroc (MVC)	Enfuvirtida (T-20)
<b>Nombre comercial</b>	<i>Celsentri</i> ®	<i>Fuzeon</i> ®
<b>Fecha de autorización por la AEMPS</b>	27/09/2007	05/06/2003
<b>Peso molecular y equivalencias</b>	PM 513,67 <sup>Ω</sup> μM x 0,514 = μg/mL	PM 4.492 <sup>Ω</sup> μM x 4,492 = μg/mL
<b>Efecto de los alimentos</b>	Un desayuno rico en grasa redujo el AUC un 33%. Sin embargo, dado que no hubo restricciones alimentarias en los estudios de eficacia, puede administrarse con o sin alimentos. <sup>Ω</sup>	--
<b>Biodisponibilidad Oral</b>	23 - 33% <sup>ω</sup> 23% (dosis única 100 mg) <sup>ω</sup> 33% (estimada 300 mg) <sup>ω</sup>	84,3 ± 15,5% <sup>a</sup> (vía s.c.) <sup>ω</sup>
<b>Tmax</b>	2 horas (0,5 - 4) <sup>b,ω</sup>	8 horas (3 - 12) <sup>b,Ω</sup>
<b>Semivida plasmática</b>	13,2 horas <sup>ω</sup>	3,8 ± 0,6 horas <sup>a,ω</sup>
<b>Cmax</b>	0,618 μg/mL (VIH+ asintomáticos con 300 mg/12h) <sup>Ω</sup>	4,59 ± 1,5 μg/mL (VIH+) <sup>a,ω</sup>
<b>Cmin</b>	0,034 μg/mL (VIH+ asintomáticos con 300 mg/12h) <sup>Ω</sup>	2,6 - 3,4 μg/mL (VIH+) <sup>b,Ω</sup>
<b>Niveles de Cmin sugeridos como mínimo a alcanzar</b>	0,05 μg/mL <sup>‡</sup>	No hay datos

Grupo terapéutico	Antagonistas correceptor CCR5	Inhibidores de la fusión
Nombre genérico	Maraviroc (MVC)	Enfuvirtida (T-20)
<b>AUC</b>	AUC <sub>0-12h</sub> : 2.550 µg.h/mL (VIH+ asintomáticos con 300 mg/12h) <sup>Ω</sup>	55,8 ± 12,1 µg.h/mL (VIH+) <sup>α,ω</sup>
<b>UPP</b>	76% <sup>ω</sup>	92% <sup>ω</sup>
<b>Vd aparente</b>	194 L <sup>ω</sup>	5,5 ± 1,1 L <sup>ω</sup>
<b>Penetración en LCR (LCR:plasma)</b>	Grado 3 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) ( <i>Letendre S Poster 430. Croi 2010</i> ).	Valores inferiores a los niveles cuantificables (<0,025 µg/mL) <sup>Ω</sup> Penetración insignificante. <sup>ω</sup> Grado 1 de penetración en LCR según la clasificación del estudio CHARTER (de 1 a 4, menor a mayor) ( <i>Letendre S Poster 430. Croi 2010</i> ).
<b>Aclaramiento total</b>	44,0 L/h <sup>ω</sup>	1,4 ± 0,28 L/h <sup>Ω</sup>
<b>Aclaramiento renal</b>	10,17 L/h <sup>ω</sup> 8% inalterado por orina <sup>ω</sup>	Se cataboliza a sus correspondientes aminoácidos que se reciclan en el organismo. <sup>Ω</sup> No se ha determinado la eliminación renal, aunque probablemente sea escasa.
<b>Farmacocinética: efecto de edad, raza y sexo</b>	No se han observado diferencias relevantes en la farmacocinética en función del sexo, la raza o la edad (pacientes de 16 a 65 años). La experiencia en pacientes >65 años de edad es limitada. <sup>ω</sup>	La farmacocinética no se ha investigado en personas de 65 o más años. No se han observado diferencias relevantes en la farmacocinética en función de la raza. El aclaramiento es un 20% inferior en el sexo femenino con independencia del peso, y aumenta según lo hace el peso corporal, con independencia del sexo (20% superior para personas de 100 kg y 20% inferior para personas de 40 kg, en relación con un paciente prototipo de 70 kg). Sin embargo, estas variaciones carecen de significado clínico y no se precisa ningún ajuste posológico. <sup>ω</sup>
<b>Actividad</b>	VIH-1 con tropismo R5 <sup>ω</sup>	VIH-1 <sup>Ω</sup>
<b>Sustrato</b>	CYP3A4 <sup>ω</sup> Glicoproteína P <sup>ω</sup> OATP1B1 <sup>ω</sup> MRP2 <sup>Ω</sup>	Péptido que se cataboliza a aminoácidos

Grupo terapéutico	Antagonistas correceptor CCR5	Inhibidores de la fusión
Nombre genérico	Maraviroc (MVC)	Enfuvirtida (T-20)
<b>Inductor</b>	--	--
<b>Inhibidor</b>	Glicoproteína P (in vitro) <sup>ω</sup>	--

<sup>a</sup> Expresado como media  $\pm$  DE si no se indica lo contrario

<sup>b</sup> Expresado como rango

<sup>ω</sup> 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=](http://www.ema.europa.eu/ema/index.jsp?curl=pages/includes/medicines/medicines_landing_page.jsp&murl=menus/medicines/medicines.jsp&mid=) Con acceso [05/02/2020].

<sup>Ω</sup> Información procedente de la ficha técnica americana (fuentes: FDA and First Data Bank, Inc). Disponible en: [http://www.rxlist.com/drugs/alpha\\_a.htm](http://www.rxlist.com/drugs/alpha_a.htm) .Con acceso [05/02/2020].

<sup>¥</sup> Tuset M, Moltó J, Manzardo C, Molas G, García C, Codina C, Miró JM. Interacciones de los fármacos antirretrovirales. En: Gatell JM, Clotet B, Podzamczar D, Miró JM, Mallolas J. (Eds). Guía Práctica del Sida. 13ª Edición. Barcelona: Ediciones Masson. 2015:527-578.