



# INHIBIDORES DE LA UNIÓN Y DE LA FUSIÓN

**NOTA:** varias otras hojas informativas también describen medicamentos antirretrovirales (ARVs) que están en estudio. Para mayor información, vea la hoja:

- 410 sobre los inhibidores análogos de los nucleósidos de transcriptasa reversa (INTR)
- 430 sobre los inhibidores no análogos de los nucleósidos de transcriptasa reversa (INNTR)
- 440 sobre los inhibidores de la proteasa (IP)
- 470 sobre otros ARVs
- 480 sobre los estimuladores del sistema inmune.

*Estos medicamentos no han sido autorizados para su uso contra el VIH por la Administración de Alimentos y Fármacos (FDA).*

## INHIBIDORES DE LA UNIÓN Y DE LA FUSIÓN

Esta es una nueva clase de medicamentos anti VIH. Su intención es proteger a las células de la infección con el VIH, al prevenir que el virus se acople a una célula nueva y penetre por su membrana. Los investigadores esperan que estos medicamentos prevengan la infección de una célula por virus libre (en la sangre) o por contacto con una célula infectada.

Debido a que los ácidos digestivos los inactivan, la mayoría de estos medicamentos se aplican en inyecciones o infusiones intravenosas.

**AK602** bloquea los receptores CCR5. Se desarrolla por Kumamoto University en Japón. Se estudia en ensayos humanos tempranos.

**AMD070** por AnorMed bloquea el receptor CXCR4 en las células CD4 para inhibir la fusión del VIH. Su desarrollo fue terminado debido a problemas del hígado en estudios en animales.

**BMS-378806** es un inhibidor de la unión que se ata a gp120, una parte del virus, no de la célula CD4. Se estudia en ensayos de Fase I.

**GSK 706769** de ViiV Healthcare es un nuevo bloqueador de CCR5. Se estudia en ensayos de Fase I.

**HGS004** de Human Genome Sciences, un anticuerpo monoclonal que bloquea el receptor CCR5, ha terminado un ensayo de Fase II con éxito.

**Ibalizumab (TNX-355)** es fabricado por Tanox, bloquea al receptor CD4. Es un medicamento de ingeniería genética, un "anticuerpo monoclonal". Se toma por infusión intravenosa (IV) cada dos o cuatro semanas. Se administra junto con medicamentos antirretrovirales. Todavía no se han observado efectos secundarios importantes. Está en estudios en fase II.

**INCB9471** de Incyte Corporation ha terminado ensayos de Fase II en personas no infectadas con VIH. Ha mostrado muy pocos problemas de tolerabilidad. Cumplió estudios de Fase II con éxito. Sin embargo, Incyte va a licenciar este medicamento a una otra firma. Dejará de trabajar en el VIH.

**PF232798** de ViiV Healthcare es un bloqueador de CCR5. Se estudia en ensayos de Fase II.

**PRO 140** de Progenics se estudia en ensayos de Fase II. Bloquea la fusión al unirse a una proteína que se encuentra en la parte exterior de las células CD4. PRO140 ha sido otorgado el estado de revisión rápida (Fast Track) por el FDA. Se estudian la administración de PRO140 por vía de infusiones intravenosas y por inyecciones subcutáneas.

**SCH532706** de Schering se estudia en Fase I. Funciona lo mejor como parte de un régimen incluyendo ritonavir porque puede tomarse una vez al día.

**SP01A** por Samaritan Pharmaceuticals es un inhibidor de la entrada de VIH. Se estudia en un ensayo de Fase II.

**TBR-652** de Tobira Therapeutics (antes TAK-652 de Takeda) es un bloqueador de CCR5. Se estudia en ensayos de Fase II.

**VCH-286** de ViroChem Pharma es un bloqueador de CCR5. Un ensayo de Fase II ha recibido la aprobación.

**Vicriviroc (SCH 417690, anteriormente llamada Schering D)** es fabricado por Schering Plough, Bloquea al receptor CCR5 en las células CD4+. No hay informes de ninguna toxicidad seria con Vicriviroc. Se estudia en ensayos de Fase III. A comienzos de 2010, Merck anunció que no pediría la aprobación de vicriviroc en pacientes experimentados en tratamiento. Sin embargo, continuarán desarrollar el producto para pacientes que empezarán su tratamiento.

## MEDICAMENTOS QUE YA NO ESTÁN EN DESARROLLO

Se abandonó el desarrollo de los siguientes medicamentos para su uso contra el VIH:

**AMD3100** (inhibidor de la fusión) de AnorMed.

**Aplaviroc (GW873140)** por GlaxoSmithKline. Su desarrollo fue terminado por toxicidad hepática.

**BMS488043 y BMS806** (inhibidores de la unión de Bristol-Myers Squibb, reemplazados por BMS378806)

**FP21399**, inhibidor de la fusión, por Fujii Pharmaceuticals

**PRO542** de Progenics no se desarrolla más. En su lugar Progenics se enfoca en PRO140.

**T-1249** (inhibidor de la fusión) por Roche y Trimeris. Su desarrollo se terminó temprano en 2004

**TAK-652** de Takeda se desarrolla actualmente por Tobira Therapeutics como TBR-652,

\*ViiV Healthcare es una nueva compañía especializada en VIH. Fue creada en 2009 por GlaxoSmithKline y Pfizer.

*Actualizada el 21 de enero de 2010*