

## FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

### TACROLIMUS

<b>Sinónimos:</b>	Tacrolimus monohidrato.
<b>Formula Molecular:</b>	$C_{44}H_{69}NO_{12} \cdot H_2O$
<b>Peso Molecular:</b>	822,02
<b>Datos Físico-Químicos:</b>	Polvo blanco o casi blanco. Insoluble en agua y soluble en etanol. Punto de fusión: 127 – 129 °C. Rotación óptica: -84,4° (c=1, cloroformo).
<b>Propiedades y usos:</b>	<p>Se trata de un macrólido de acción inmunosupresora derivado de <i>Streptomyces tsukubaensis</i>.</p> <p>Su absorción tras la administración vía oral es variable, con una biodisponibilidad del 15 – 20 %. Cuando se administra por vía intravenosa, se distribuye ampliamente en todos los tejidos y uniéndose a proteína plasmáticas en un 99% así como a los eritrocitos. Se metaboliza mayoritariamente en el hígado y se excreta sobre todo por la bilis. La vida media en plasma está sobre las 12 – 16 h en pacientes trasplantados.</p> <p>Se usa para prevenir o combatir el rechazo en pacientes trasplantados.</p> <p>También se usa en trastornos inmunológicos o autoinmunológicos refractarios.</p> <p>Vía tópica se usa en el eczema atópico grave o moderado y en el vitíligo, teniendo una mejor absorción cutánea que la ciclosporina.</p> <p>Vía oftálmica se usa para el tratamiento del ojo seco.</p>
<b>Dosificación:</b>	<p>Por vía oral normalmente se usan dosis de 10 – 300 µg/Kg/día, según patología.</p> <p>Por vía tópica, al 0,03 – 0,1 % en ungüentos.</p> <p>Por vía oftálmica, al 0,02 – 0,1 % en pomadas o colirios.</p>
<b>Efectos secundarios:</b>	<p>El tacrolimus puede causar nefrotoxicidad y neurotoxicidad.</p> <p>Los efectos adversos más comunes que aparecen tras la administración sistémica son temblores, náuseas y diarreas, hipertensión, leucocitosis, y disfunción renal.</p> <p>Con frecuencia provoca alteraciones electrolíticas serias, sobre todo hiperpotasemia.</p> <p>Otros efectos son cambio del estado de ánimo, trastornos del sueño, confusión, mareo, acúfenos, trastornos de la visión y convulsiones, trastornos del metabolismo de los hidratos de carbono o diabetes franca, alteraciones del ECG y taquicardia, así como miocardiopatía hipertrófica (especialmente en los niños), estreñimiento, dispepsia y hemorragia digestiva, disnea, asma, derrames pleurales, alopecia, hirsutismo, erupción cutánea y prurito; artralgia o mialgia, espasmos, calambres en las piernas, edema periférico, disfunción hepática y trastornos de la coagulación.</p>

## FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

También se han descrito cefaleas y síntomas similares a los de la gripe.

Como con otros inmunopresores, los pacientes tratados con tacrolimus tienen un aumento del riesgo de contraer infecciones y otras enfermedades malignas.

La aplicación tópica del tacrolimus se asocia a irritación local y trastornos cutáneos, incluido el aumento de la incidencia de infecciones por herpes simple y herpes zoster.

**Contraindicaciones:** No se debe administrar tacrolimus a personas con hipersensibilidad a los macrólidos.

**Precauciones:** En los pacientes con disfunción hepática es necesaria una reducción de la dosificación. También hay que tener cuidado en los pacientes con disfunción renal preexistente, aconsejándose la reducción de la dosificación.

Se aconseja el control de las concentraciones sanguíneas del tacrolimus en todos los pacientes, así como el de las funciones renales y hepáticas, presión arterial, glucosa y electrolitos de suero y las funciones hematológicas y cardíacas; también debe controlarse regularmente la visión.

El tacrolimus puede afectar a la función visual y neurológica, por lo que es preferible que los pacientes tratados no conduzcan ni manejen maquinaria peligrosa.

**Interacciones:** Su uso conjunto con ciclosporina u otros fármacos nefrotóxicos aumenta el riesgo de nefrotoxicidad.

También se evitará la administración de diuréticos ahorradores de potasio.

Los fármacos que inhiben el metabolismo pueden provocar un aumento de las concentraciones sanguíneas de tacrolimus, p. ej. antifúngicos azólicos, bromocriptina, calcioantagonistas, cimetidina, algunos corticosteroides, ciclosporina, danazol, inhibidores de la proteasa del VIH, antibióticos macrólidos, y metoclopramida.

Los inductores del metabolismo como carbamazepina, fenobarbital, fenitoína, y rifampicina reducen las concentraciones sanguíneas del tacrolimus.

**Observaciones:** Es termolábil.

**Conservación:** En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ. NEVERA (2 – 8 °C) hasta el lote **141415** (incluido). A partir del lote **160462** (incluido) el producto cumple USP por lo que no es necesaria la conservación en nevera.

**Ejemplos de formulación:** **Ungüento o emulsión con tacrolimus**

Tacrolimus..... 0,03 %

Unguento hidrófilo o Emulsión O/W c.s.p. .... 50 g

**Tacrolimus en colirio oleoso para la queratoconjuntivitis seca**

## FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Tacrolimus ..... 0,03 %  
Aceite de oliva c.s.p. .... 5 ml

### **Bibliografía:**

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Formulario básico de medicamentos magistrales*, M.ª José Llopis Clavijo y Vicent Baixauli Comes (2007).
- *Formulario médico farmacéutico*, PharmaBooks, 2010.