



Purifarma



São Paulo (11) 2067.5600
Brasil 0800 10 50 08



www.purifarma.com.br



[grupopurifarma](#)



[Purifarma](#)

TACROLIMUS

IDENTIFICAÇÃO

FÓRMULA MOLECULAR: C₄₄H₆₉NO₁₂.H₂O

SINONÍMIA: Tacrolimo, tacrolimus

DESCRIÇÃO / ESPECIFICAÇÃO TÉCNICA:

Macrolídeo imunossupressor derivado de *Streptomyces tsukubaensis*. Tacrolimo monohidratado com teor entre 98 a 102 % em base anidra.

PROPRIEDADES:

- Imunossupressor usado topicamente para o tratamento das doenças inflamatórias cutâneas.
- Imunossupressor usado oralmente no controle a rejeição em transplantados e em doenças de caráter auto-imune.
- Inibidor tópico de calcineurina.

COMPOSIÇÃO: Substância isolada

APLICAÇÕES

INDICAÇÕES:

- Tratamento tópico de dermatite atópica em adultos e crianças;
- Tratamento tópico de psoríase;
- Tratamento tópico de vitiligo;
- Tratamento tópico de dermatite eczematosa.
- Controle de rejeição a transplantes;
- Tratamento de miastenia gravis;
- Tratamento de artrite reumatóide

POSOLOGIA / CONCENTRAÇÃO:

- Psoríase em placas leve a moderada 0,1% a 0,3%;
- Dermatite atópica 0,03% a 0,1%;
- Dermatite eczematosa ou seborreica 0,1%;
- Vitiligo 0,1 %;
- Transplantados: 75 a 200 mcg/kg em doses divididas, conforme o tipo de transplante;
- Em doenças reumatológicas e auto-imunes: 3 a 10 mg por via oral ao dia.

VIA DE ADMINISTRAÇÃO:

Oral e tópico.

SOLUÇÃO MAGISTRAL:

- Doses diferentes de acordo com a patologia e resposta do paciente.
- Escolha de veículo de acordo com a patologia, resposta individual, localização das lesões e concentração do ativo.
- Possibilidade de associações de fármacos para promover melhores resultados.
- Possibilidade de formas farmacêuticas diferenciadas para melhorar a biodisponibilidade e promover a adesão dos pacientes.



Purifarma



São Paulo (11) 2067.5600
Brasil 0800 10 50 08



www.purifarma.com.br



grupopurifarma



Purifarma

FORMULAÇÕES

Creme de tacrolimo, psoríase em placas
Tacrolimo.....0,5%
Fitalite™.....qsp 60 g

POSOLOGIA: Aplicação tópica, 2 vezes ao dia.

PROPRIEDADES

- Imunossupressor.
- Melhora dos sintomas de psoríase.

Creme de tacrolimo, DA em adultos
Tacrolimo.....0,1%
Versatile rich™qsp 60 g

POSOLOGIA: Aplicação tópica, 2 vezes ao dia.

PROPRIEDADES

- Imunossupressor.
- Redução da gravidade e sintomas da DA.

Creme de tacrolimo, DA em crianças
Tacrolimo.....0,03%
Versatile™qsp 60 g

POSOLOGIA: Aplicação tópica, 2 vezes ao dia.

PROPRIEDADES

- Imunossupressor.
- Redução da gravidade e sintomas da DA.

Creme de tacrolimo, vitiligo segmentar
Tacrolimo.....0,1%
Versatile™.....qsp 60 g

POSOLOGIA: Aplicação tópica, 2 vezes ao dia.

PROPRIEDADES

- Imunossupressor.
- Promove repigmentação das áreas acrômicas

Tacrolimo em baixa dose em Artrite Reumatóide (6)

Tacrolimo.....1,5 mg
Cáps.....1 un

Posologia: Tomar 1 cáps ao dia em tratamento associado ao metotrexate ou terapia única.

PROPRIEDADES

- Imunossupressor.
- Controle da atividade da doença.

REFERÊNCIAS CIENTÍFICAS

ESTUDOS CLÍNICOS / ESTUDOS PRÉ-CLÍNICOS:

DISTÚRBIOS DERMATOLÓGICOS

Resultados de um estudo realizado em portadores de psoríase em placas leve a moderada confirmaram que os tratamentos com gel de tacrolimo a 0,3%, creme de tacrolimo a 0,5% e pomada de calcipotriol a 0,005%, melhoram os sintomas dessa patologia. O gel de tacrolimo e a pomada de calcipotriol apresentaram efeitos comparáveis na proliferação epidermal, além de reduzir as células T.



Purifarma



São Paulo (11) 2067.5600
Brasil 0800 10 50 08



www.purifarma.com.br



grupopurifarma



Purifarma

Em um estudo foi avaliada pomada de tacrolimo a 0,03% em portadores da dermatite atópica com idade entre 2 e 12 anos. A resposta clínica foi melhorada em 9% dos pacientes na 4ª semana. A gravidade dos sintomas foi reduzida já na 1ª semana. Foi concluído que o tacrolimo tópico é eficaz e seguro nas DA pediátrica.

Tacrolimo também foi avaliado no tratamento de vitiligo em crianças (2-16 anos) VS. Pomada de propionato de clobetasol a 0,05%. No grupo de pacientes com lesões localizadas na região facial 58% respondeu ao tratamento com clobetasol vs. 58% tratados com tacrolimo a 0,1%. No grupo com lesões não-faciais 39% do grupo tratado com CP respondeu ao tratamento vs. 23% tratados com tacrolimo.

DISTÚRBIOS REUMATOLÓGICOS

Com o objetivo de investigar se tacrolimo em dose baixa é eficaz no tratamento de artrite reumatóide (AR) em associação com metotrexate, 32 pacientes receberam tacrolimo nas doses de 1 mg ao dia (5), 1,5 mg ao dia (24) e 3 mg ao dia (3) associado ao metotrexate. Os resultados sugerem que a adição de tacrolimo em doses de 1 a 2 mg/dia associado ao MTX em pacientes com AR moderadamente ativa é altamente eficaz.

Um estudo investigou a segurança e eficácia de tacrolimo associado à DMARDs em pacientes com artrite reumatóide (AR). Tacrolimo 3 mg ao dia ou placebo foi administrado por 52 semanas de forma duplo-cega randomizada em 123 pacientes.

Baseado nos resultados observados, o estudo concluiu que o uso de tacrolimo, especialmente em pacientes que não respondem adequadamente ao tratamento com outros DMARDs é útil e eficaz podendo ser considerada uma opção de tratamento em AR.

FARMACOLOGIA

ESTABILIDADE: Informação não disponível nas referências consultadas.

Mecanismo de ação: Tacrolimo liga-se a FKBP-12, uma proteína intracelular, formando um complexo com o cálcio, calmodulina e calcineurina, interferindo na produção e liberação de Interleucina-2 e inibindo a ativação de linfócitos-T, resultando em imunossupressão.

EFEITOS ADVERSOS: O uso de tacrolimo tópico pode causar irritação local e distúrbios cutâneos, incluindo aumento da incidência de infecções por herpes simplex e zoster.

Cefaleia e sintomas parecidos com rinite também foram reportados. Os efeitos adversos após uso sistêmico mais comuns incluem: tremor, cefaléia, parestesia, náusea, diarreia, hipertensão insônia e disfunção renal.

CONTRAINDICAÇÕES / PRECAUÇÕES: Os tratamentos das infecções cutâneas devem ser realizados antes do início de tratamento com tacrolimo tópico. Durante o tratamento, a exposição solar e UV deve ser mínima. Não pode ser aplicado nas condições malignas ou pré-malignas cutâneas. Deve ser evitado em crianças abaixo de 2 anos. Deve ser evitado em pacientes imunocomprometidos. Deve ser evitado em pacientes com neoplasias. O uso sistêmico demonstrou ser abortivo e teratogênico em modelos animais. Não existem informações suficientes que qualifiquem o uso tópico durante a gestação.

FARMACOTÉCNICA

Equivalência: Tacrolimo é usado na forma de Tacrolimo monohidratado, porém a dose é expressa na forma anidra. Portanto 1,02 mg de Tacrolimo monohidratado equivale a 1 mg de Tacrolimo anidro.

CONCENTRAÇÃO / DILUIÇÃO (FABRICANTE): Não aplicável.

Solubilidade: Solúvel em metanol, etanol, acetona, etil acetato. Insolúvel em água.



Purifarma



São Paulo (11) 2067.5600
Brasil 0800 10 50 08



www.purifarma.com.br



[grupopurifarma](#)



[Purifarma](#)

EXCIPIENTE SUGERIDO: Não foi determinada classificação biofarmacêutica (BCS) conforme as referências consultadas, porém em função da baixa hidrossolubilidade é recomendável adição de um agente molhante no excipiente para melhorar a característica de solubilidade.

pH ESTABILIDADE (PRODUTO FINAL): Informação não encontrada nas referências consultadas.

ORIENTAÇÕES FARMACOTÉCNICAS: Informação não encontrada nas referências consultadas.

INCOMPATIBILIDADES: Informação não encontrada nas referências consultadas.

CONSERVAÇÃO / ARMAZENAMENTO: Acondicionar em recipientes hermeticamente fechados, ao abrigo da luz, calor e umidade, temperatura até 40°.

REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

1. Martindale. The Complete Drug Reference. 36th Edition, 2009.
2. Alomar A, Corella F, García-Navarro X. Tacrolimus in diseases other than atopic dermatitis. *Actas Dermosifiliogr.* 2008 Feb;99 Suppl 2:26-35.
3. Vissers WH, van Vlijmen I, van Erp PE, de Jong EM, van de Kerkhof PC. Topical treatment of mild to moderate plaque psoriasis with 0.3% tacrolimus gel and 0.5% tacrolimus cream: the effect on SUM score, epidermal proliferation, keratinization, Tcell subsets and HLA-DR expression. *Br J Dermatol.* 2008 Apr; 158(4):705-12. Epub 2008 Feb 16.
4. Singalavanija S, Noppakun N, Limpongsanuruk W, Wisuthsarewong W, Aunhachoke K, Chunharas A, Wananukul S, Akaraphanth R. Efficacy and safety of tacrolimus ointment in pediatric patients with moderate to severe atopic dermatitis. *J Med Assoc Thai.* 2006 Nov; 89(11):1915-22.
5. Ho N, Pope E, Weinstein M, Greenberg S, Webster C, Krafchik BR. A double-blind, randomized, placebo-controlled trial of topical tacrolimus 0.1% vs. clobetasol propionate 0,05% in childhood vitiligo. *Br J Dermatol.* 2011 Sep; 165(3):626-32. Jun 30.
6. Morita Y, Sasae Y, Sakuta T - Efficacy of low-dose tacrolimus added to methotrexate in patients with rheumatoid arthritis in Japan: a retrospective study. *Mod Rheumatol.* 2008; 18(4):379-84.
7. Kawai S, Takeuchi T, Yamamoto K, Tanaka Y, Miyasaka N. - Efficacy and safety of additional use of tacrolimus in patients with early rheumatoid arthritis with inadequate response to DMARDs--a multicenter, double-blind, parallel-group trial. *Mod Rheumatol.* 2011 Oct; 21(5):458-68.