

**USO:** Externo

**CAS:** 09581-93-3

**Fator de Correção:** Não se aplica

**FM:** C44H69NO12.H2O

**Fator de Equivalência:** 1,022

**PM:** 822,0

## TACROLIMUS IMUNOSSUPRESSOR

**Tacrolimus** é uma lactona macrolídea isolada de culturas da bactéria *Streptomyces tsukubaensis*. O tratamento com **Tacrolimus** se mostra eficaz para doenças inflamatórias da pele, tais como a dermatite atópica, atuando no sistema imunológico e diretamente nas células da pele. A dermatite atópica, assim como as doenças relacionadas à imunidade, tornam-se cada vez mais frequente entre os *pets*. Desta forma, o tratamento com **Tacrolimus** representa uma maneira moderna de tratar o eczema. Atua de forma específica, diferentemente dos corticóides. Além disso, há relatos de que o tratamento com corticóides ocasiona o afinamento da pele, o que não é verificado com **Tacrolimus**, podendo ser aplicado em área de pele mais delicada. Na maioria dos casos, ocorrem alívio dos sintomas do eczema na primeira semana de tratamento com **Tacrolimus**.

Importante ressaltar que os animais domésticos estão vivendo mais e as doenças associadas ao envelhecimento tornam-se cada vez mais comuns, como por exemplo deficiência em lubrificação ocular. Assim, o **Tacrolimus** juntamente com outros lacrimoestimulantes também são empregados para esta finalidade.

### Mecanismo de ação

**Tacrolimus** pertence a um grupo de fármacos chamados lactonas macrolídeas ou inibidores da calcineurina. Possui atividade imunossupressora semelhante à da Ciclosporina. **Tacrolimus** se liga a receptores na célula chamados proteínas conectoras FK. O complexo fármaco-protéico resultante inibe a calcineurina (transmissor de fosfatase dependente de cálcio) que por sua vez, reduz a atividade dos linfócitos T do sistema imunológico. Como consequência disso, as células T não liberam suas citocinas (que ocasionam a inflamação, vermelhidão e o prurido).

Adicionalmente, o Tacrolimus possui efeito direto nas células da pele (queratinócitos). Aparentemente, ele reduz o número de receptores IL-8 no queratinócito, reduzindo assim, a inflamação.

### Indicações

- Dermatite atópica;
- Pênfigo;
- Tratamento de fístulas perianais;
- Lacrimo estimulante;
- Prevenção de transplante de córnea.

### Dose recomendada

Usualmente utilizado em preparações semi-sólidas na concentração de 0,1%. Utilizado uma a duas vezes por dia, conforme a orientação do veterinário.

### Farmacotécnica

As preparações contendo **Tacrolimus** devem ser dosificadas em relação à forma anidra. Portanto, em caso de utilização da forma hidratada é necessário aplicar o fator de equivalência.

Preparações líquidas e semi sólidas devem ser conservadas entre 5 a 25°C.

pH de estabilidade: em altos valores de pH ocorre um substancial aumento da velocidade de decomposição do Tacrolimus, apresentando maior estabilidade na faixa de pH entre 2 a 6.

### Contra-indicações

O uso é contra-indicado nos casos de hipersensibilidade conhecida a **Tacrolimus**, bem como nos casos de gravidez e amamentação, nos casos de infecções de pele confirmadas ou mesmo suspeita de infecções



(bacterianas ou virais). Deve-se evitar a exposição à luz solar natural ou artificial, durante o uso de **Tacrolimus**.

#### **Referências Bibliográficas**

- 1) The Merck Index – 12a Edição – Tacrolimus – Monograph Number - 9200 – The Merck & Co. Inc;
- 2) DermNet NZ – Tacrolimus – Treatments (<http://dermnetnz.org/treatments/tacrolimus.html>);
- 3) Medicine.net.com – Tacrolimus – Crohn’s Disease (<http://www.medicinenet.com/tacrolimus/article.htm>) and Tacrolimus ointment ([http://www.medicinenet.com/tacrolimus\\_oointment/article.htm](http://www.medicinenet.com/tacrolimus_oointment/article.htm));
- 9) Misseggers BS, Binnington AG, Mathews KA. Clinical observations of the treatment of canine perianal fistulas with topical tacrolimus in 10 dogs. Can Vet J. 2000 Aug;41(8):623-7.
- 10) Marsella R, Nicklin CF, Saglio S, Lopez J. Investigation on the effects of topical therapy with 0.1% tacrolimus ointment (Protopic) on intradermal skin test reactivity in atopic dogs. Vet Dermatol. 2004 Aug;15(4):218-24.
- 11) Rosenkrantz WS. Pemphigus: current therapy. Vet Dermatol. 2004 Apr;15(2):90-8.
- 12) Grahn BH, Storey ES. Lacrimostimulants and lacrimomimetics. Vet Clin North Am Small Anim Pract. 2004 May;34(3):739-53.
- 14) Martindale. Cguía Completa de Consulta Farmaco-Terapéutica . 1a edición. Barcelona: Pharma Editores, 2003.

Última atualização: 15/01/2021 VS