

# TIRZAGEN

GLP-1 / GIP  
receptor agonist

Ficha técnica — uso médico-profesional



Tirzepatide es el primer doble agonista GLP-1R/GIPR aprobado para el tratamiento de obesidad y diabetes mellitus tipo 2, con una reducción de peso corporal de hasta 22.5% documentada en ensayos clínicos Fase III (programa SURMOUNT). Su administración subcutánea semanal y su perfil de eficacia superior a semaglutida lo posicionan como la opción premium dentro de los agonistas de receptores de incretinas.

## 1 IDENTIFICACIÓN

Campo	Dato
Nombre comercial	TIRZAGEN
Principio activo	Tirzepatide (LY3298176)
Forma farmacéutica	Liofilizado para solución inyectable
Concentración	10 mg / vial — 5 mg/mL tras reconstitución con 2 mL
Vía de administración	Subcutánea (SC) — una vez por semana
Kit	Vial 1: Liofilizado 10 mg + Vial 2: NaCl 0.9% bacteriostático 2 mL

## 2 FÓRMULA — KIT DE 2 VIALES

Vial 1 — Liofilizado (polvo blanco estéril):

Componente	Cantidad / Función
Tirzepatide (acetato)	10 mg — Principio activo
Manitol	c.s. — Lioprotector / crioprotector
Fosfato sódico dibásico / monobásico	c.s. — Tamponante (pH 6.5–7.5)
Polisorbato 80	c.s. — Estabilizante peptídico

# TIRZAGEN — Tirzepatide 10 mg / mL

Ficha técnica — uso médico-profesional



## Vial 2 — Diluyente bacteriostático (incluido en el kit):

Componente	Cantidad / Función
Cloruro de sodio (NaCl) 0.9 %	— Solución isotónica
Alcohol bencílico	0.9 % v/v — Agente bacteriostático
Agua para inyección c.b.p.	2.0 mL — Vehículo estéril

*Reconstitución: agregar los 2 mL del diluyente al vial liofilizado y girar suavemente hasta disolver. No agitar. Concentración final: 5 mg/mL. Aspecto: solución clara, incolora a ligeramente amarilla, libre de partículas.*

## 3 MECANISMO DE ACCIÓN

Agonista simultáneo de dos receptores metabólicos, con efecto sinérgico superior al de los agonistas simples:

Receptor	Efecto metabólico	Beneficio clínico
GLP-1R	Suprime el apetito, potencia la insulinosecreción glucosa-dependiente y enlentece el vaciamiento gástrico	Control glucémico y reducción de peso
GIPR	Potencia el efecto incretínico y modula la lipogénesis central	Mayor pérdida de peso frente a GLP-1 solo

## 4 INDICACIONES

### Control de peso corporal:

Adultos con obesidad (IMC  $\geq 30$  kg/m<sup>2</sup>) o sobrepeso (IMC  $\geq 27$  kg/m<sup>2</sup>) con al menos una comorbilidad asociada al peso: diabetes mellitus tipo 2, hipertensión arterial, dislipidemia o apnea obstructiva del sueño. Coadyuvante a dieta hipocalórica y actividad física.

### Control glucémico en diabetes mellitus tipo 2:

Tratamiento adyuvante en adultos con DM2 con control insuficiente bajo metformina sola o en combinación con hipoglucemiantes orales.

## 5 EFICACIA CLÍNICA (FASE III — SURMOUNT-1, DOSIS 15 MG/SEMANA, 72 SEMANAS)

Parámetro	Resultado
Reducción de peso corporal	Hasta -22.5 % del peso inicial
Pacientes con $\geq 20$ % de pérdida de peso	~57 % de los pacientes a dosis máxima

# TIRZAGEN — Tirzepatide 10 mg / mL

Ficha técnica — uso médico-profesional



<b>Reducción de HbA1c (DM2)</b>	-2.0 a -2.3 %
<b>Glucosa en ayuno (DM2)</b>	-40 a -60 mg/dL
<b>Circunferencia abdominal</b>	-10 a -14 cm
<b>Comparativo indirecto</b>	Tirzepatida ~20% > Semaglutida ~14%

## 6 POSOLOGÍA Y MODO DE ADMINISTRACIÓN

Concentración tras reconstitución: 5 mg/mL (10 mg en 2 mL de NaCl 0.9 % bacteriostático).

Período	Dosis semanal SC	Volumen	Objetivo
<b>Sem. 1-4</b>	2.5 mg	0.5 mL	Inducción — tolerabilidad gastrointestinal
<b>Sem. 5-8</b>	5 mg	1.0 mL	Primera escalada
<b>Sem. 9 →</b>	7.5 mg	1.5 mL	Segunda escalada
<b>Sem. 13 →</b>	10 mg	2.0 mL	Mantenimiento (vial completo)
<b>Ajuste ↓</b>	5 - 7.5 mg	1.0 - 1.5 mL	Si a dosis de 10 mg no es tolerada

- Administrar el mismo día de la semana. Rotar el sitio de inyección: abdomen, muslo o parte posterior del brazo.
- Reconstituir con 2 mL de NaCl 0.9 % bacteriostático; girar suavemente hasta disolver. No agitar. Verificar que la solución sea clara antes de inyectar.
- Usar jeringa de insulina 31 G x 6 mm. Desechar en contenedor de punzocortantes.
- Dosis olvidada: aplicar dentro de los 3 días siguientes al día habitual; si ya transcurrieron más de 3 días, omitir y retomar el siguiente día programado.

## 7 CONTRAINDICACIONES

### ■ Advertencia:

Contraindicado en pacientes con antecedente personal o familiar de carcinoma medular de tiroides (CMT) o síndrome MEN-2, por riesgo de clase GLP-1R observado en modelos animales. La relevancia clínica en humanos está en evaluación.

- Hipersensibilidad a tirzepatide o a cualquier excipiente de la fórmula.
- Diabetes mellitus tipo 1 — no indicado como sustituto de insulina.
- Cetoacidosis diabética — no usar como tratamiento de esta condición.
- Uso concomitante con insulina — requiere ajuste de dosis y monitoreo glucémico estricto bajo supervisión médica.
- Enfermedad cardiovascular inestable — uso con precaución en pacientes con evento cardiovascular mayor reciente (infarto agudo al miocardio, ACV).
- Retinopatía diabética preexistente — monitorear progresión ante mejora acelerada del control glucémico.
- Embarazo y lactancia. Suspender al menos 2 meses antes de una gestación planificada.
- Pancreatitis aguda activa o pancreatitis crónica grave.
- Insuficiencia renal severa (CrCl <15 mL/min) o diálisis.
- Menores de 18 años.

# TIRZAGEN — Tirzepatide 10 mg / mL

Ficha técnica — uso médico-profesional



## 8 EFECTOS ADVERSOS MÁS FRECUENTES

Frecuencia	Efecto adverso
<b>Muy frecuentes (≥10 %)</b>	Náuseas (20–40 %), diarrea (10–22 %), vómito (10–24 %), constipación (5–11 %)
<b>Frecuentes (1–10 %)</b>	Dispepsia, dolor abdominal, flatulencia, fatiga, mareo, eructos
<b>Poco frecuentes (&lt;1 %)</b>	Pancreatitis aguda, colelitiasis, taquicardia sinusal, empeoramiento retinopatía
<b>Raras (&lt;0.1 %)</b>	Hipersensibilidad grave: angioedema, anafilaxia
<b>Reacción SC local</b>	Eritema, dolor, hematoma (~1–2 %; leve y autolimitado)

## 9 INTERACCIONES PRINCIPALES

Fármaco / Grupo	Manejo recomendado
<b>Insulina / Sulfonilureas</b>	Reducir la dosis al iniciar TIRZAGEN. Riesgo de hipoglucemia aditiva.
<b>Warfarina / Anticoagulantes orales</b>	Monitorear el INR con mayor frecuencia durante las primeras semanas.
<b>Anticonceptivos orales</b>	Considerar un método anticonceptivo adicional; posible retraso en la absorción.

## 10 CONSERVACIÓN Y CADENA DE FRÍO

Condición	Especificación
<b>Vial liofilizado sin abrir</b>	2 °C – 8 °C. No congelar. Proteger de la luz.
<b>Diluyente bacteriostático</b>	Temperatura ambiente (≤25 °C). No congelar.
<b>Vial reconstituido</b>	2 °C – 8 °C. Máximo 28 días. No regresar al refrigerador tras el uso.
<b>Congelación accidental</b>	DESECHAR. La congelación inactiva el péptido sin alterar su apariencia visual.
<b>Transporte</b>	Cadena de frío activa 2–8 °C con registrador de temperatura (datalogger).

### ■ Crítico para distribución:

La pérdida de cadena de frío inactiva el péptido de forma irreversible sin producir cambios visuales en la solución. Todo lote expuesto a temperaturas inferiores a 0 °C o superiores a 30 °C durante más de 72 horas debe ser retirado del mercado y destruido.

# TIRZAGEN — Tirzepatide 10 mg / mL

Ficha técnica — uso médico-profesional



## 11 FARMACOCINÉTICA

Parámetro	Valor
Biodisponibilidad SC	~80 %
T <sub>max</sub> (SC)	8–72 horas post-inyección
Unión a proteínas	>99 % (albúmina sérica)
Vida media (t <sub>1/2</sub> )	~120 h (~5 días) — dosificación semanal
Estado estacionario	Semanas 4–6 con dosis repetida
Metabolismo	Proteólisis secuencial; beta-oxidación; sin isoenzimas CYP
Ajuste renal / hepático	No se requiere; AUC no modificada clínicamente

## 12 RESTRICCIÓN QUIRÚRGICA — AVISO IMPORTANTE

■ **PROHIBIDO:** El paciente **NO** puede someterse a ningún procedimiento quirúrgico mientras esté en tratamiento con tirzepatide.

Tirzepatide enlentece el vaciamiento gástrico, aumentando el riesgo de broncoaspiración bajo anestesia incluso con ayuno convencional. Aplica a toda cirugía electiva o urgente bajo anestesia general, sedación o anestesia regional.

■ **Conducta obligatoria:**

- Suspender tirzepatide **≥7 días antes** de cualquier cirugía programada.
- Urgencia: informar a anestesiología — asumir estómago lleno, intubación de secuencia rápida.
- No reiniciar hasta que la vía oral esté restablecida y el paciente dado de alta quirúrgica.