Тамоксифен



Код АТХ:

- L02BA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тамоксифен

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, плоские, со скошенными краями, с разделительной бороздкой с одной стороны.

	1 таб.
тамоксифена цитрат	15.46 мг,
что соответствует содержанию тамоксифена	10 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, кальция дигидрофосфат, повидон, кремния диоксид коллоидный, тальк, магния стеарат, натрия карбоксиметилкрахмал, натрия лаурилсульфат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки белого цвета, круглые, плоские, со скошенными краями, с разделительной бороздкой с одной стороны.

	1 таб.
тамоксифена цитрат	31 мг,
что соответствует содержанию тамоксифена	20 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, кальция дигидрофосфат, повидон, кремния диоксид коллоидный, тальк, магния стеарат, натрия карбоксиметилкрахмал, натрия лаурилсульфат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки белого цвета, круглые, плоские, со скошенными краями, с разделительной бороздкой с одной стороны.

	1 таб.
тамоксифена цитрат	46.5 мг,
что соответствует содержанию тамоксифена	30 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, кальция дигидрофосфат, повидон, кремния диоксид коллоидный, тальк, магния стеарат, натрия карбоксиметилкрахмал, натрия лаурилсульфат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Гормоны и их антагонисты
- Противоопухолевые средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Тамоксифен является нестероидным антиэстрогенным средством, обладающим также слабыми эстрогенными свойствами. Его действие основано на способности блокировать рецепторы эстрогенов. Тамоксифен, а также некоторые его метаболиты конкурируют с эстрадиолом за места связывания с цитоплазматическими рецепторами эстрогена в тканях молочной железы, матки, влагалища, передней доли гипофиза и опухолях с высоким содержанием рецепторов эстрогена. В противоположность рецепторному комплексу эстрогена рецепторный комплекс тамоксифена не стимулирует синтез ДНК в ядре, а угнетает деление клетки, что приводит к регрессии опухолевых клеток и их гибели.

Фармакокинетика

После приема внутрь тамоксифен хорошо всасывается. C_{max} в сыворотке достигается в пределах от 4 до 7 ч после приема однократной дозы. Равновесная концентрация тамоксифена в сыворотке крови обычно достигается после 3-4 недельного приема. Связь с белками плазмы - 99%.

Метаболизируется в печени с образованием метаболитов.

Выведение тамоксифена из организма имеет двухфазный характер с начальным $T_{1/2}$ от 7 до 14 ч и с последующим медленным терминальным $T_{1/2}$ в течение 7 дней. Выделяется главным образом в виде конъюгатов, в основном, с каловыми массами и лишь небольшие его количества выделяются с мочой.

Показания к применению:

— эстрогенозависимый рак молочных желез у женщин (особенно в менопаузе) и грудных желез у мужчин.

Препарат может быть применен для лечения рака яичников, рака эндометрия, рака почки, меланомы, сарком мягких тканей при наличии в опухоли эстрогенных рецепторов, а также для лечения рака предстательной железы при резистентности к другим лекарственным средствам.

Относится к болезням:

- Меланома
- Опухоли
- Рак
- Рак молочной железы
- Эндометрит

Противопоказания:

— беременность;

— период лактации;

— повышенная чувствительность к тамоксифену и/или любому другому ингредиенту препарата.

С *осторожностью*: почечная недостаточность, сахарный диабет, заболевания глаз (в т.ч. катаракта), тромбоз глубоких вен и тромбоэмболическая болезнь (в т.ч. в анамнезе), гиперлипидемия, лейкопения, тромбоцитопения, гиперкальциемия, сопутствующая терапия непрямыми антикоагулянтами.

Способ применения и дозы:

Режим дозирования обычно устанавливается индивидуально в зависимости от показаний. Суточная доза составляет 20-40 мг. В качестве стандартной дозы рекомендуется прием 20 мг тамоксифена внутрь ежедневно длительно. При появлении признаков прогрессирования заболевания прием препарата отменяют.

Таблетки следует принимать не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости, в один прием утром, или, разделяя необходимую дозу на два приема утром и вечером.

Побочное действие:

При лечении Тамоксифеном *наиболее часто* встречаются побочные реакции, связанные с его антиэстрогенным действием, проявляющиеся в виде приступообразных ощущений жара (приливов), влагалищных кровотечений или выделений, зуда в области гениталий, алопеции, болей в области очага поражения, оссалгии, увеличения массы тела.

Менее часто или редко наблюдались следующие побочные реакции: задержка жидкости, анорексия, тошнота, рвота, запор, повышенная утомляемость, депрессия, спутанность сознания, головная боль, головокружение, сонливость, повышение температуры тела, кожная сыпь, нарушение зрения, включая изменения роговицы, катаракту, ретинопатию и ретробульбарный неврит.

В начале лечения возможно местное обострение болезни - увеличение размера мягкотканных образований, иногда сопровождающееся выраженной эритемой пораженных участков и прилегающих областей - которое обычно проходит в течение 2-х недель. Может возрасти вероятность возникновения тромбофлебитов и тромбоэмболии. Иногда могут наблюдаться транзиторная лейкопения и тромбоцитопения, а также увеличение уровня печеночных ферментов, очень редко сопровождающееся более тяжелыми нарушениями функции печени, таких как жировая инфильтрация печени, холестаз и гепатит.

У некоторых пациентов с метастазами в кости в начале лечения наблюдалась гиперкальциемия.

Тамоксифен вызывает аменорею или нерегулярность наступления менструаций у женщин в предклимактерическом периоде, а также обратимое развитие кистозных опухолей яичников.

При длительном лечении Тамоксифеном могут наблюдаться изменения эндометрия, включающих гиперплазию, полипы и в единичных случаях - рак эндометрия, а также развитие фибромы матки.

Передозировка:

Острая передозировка тамоксифеном у человека не наблюдалась. Следует ожидать, что передозировка может вызвать усиление вышеописанных побочных реакций. Специфических антидотов не существует, лечение должно быть симптоматическим.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан.

Тамоксифен может вызывать овуляцию, что повышает риск беременности, в связи с чем женщинам, которые ведут активную половую жизнь, во время (и в течение примерно 3 месяцев после) лечения тамоксифеном рекомендуется применение механического или негормонального противозачаточного средства.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном назначении Тамоксифена и цитостатиков повышается риск тромбообразования.

Антациды, блокаторы гистаминовых H_2-рецепторов и другие препараты подобного действия, повышая значение pH в желудке, могут вызывать преждевременное растворение и потерю защитного эффекта кишечнорастворимой таблетки. Интервал между приемом тамоксифена и этих препаратов должен составлять 1-2 ч.

Имеются сообщения об усилении Тамоксифеном антикоагулянтного эффекта препаратов кумаринового ряда (например, варфарина).

Препараты, снижающие выведение кальция (например, диуретики тиазидового ряда), могут увеличивать риск развития гиперкальциемии.

Совместное применение тамоксифена и тегафура может способствовать развитию активного хронического гепатита и цирроза печени.

Одновременное применение Тамоксифена с другими гормональными препаратами (особенно, эстрогенсодержащими контрацептивами) приводит к ослаблению специфического действия обоих препаратов.

Особые указания и меры предосторожности:

Женщины, получающие Тамоксифен должны подвергаться регулярному гинекологическому обследованию. При

появлении кровянистых выделений из влагалища или влагалищных кровотечениях прием препарата следует прекратить.

У больных с метастазами в кости периодически во время начального периода лечения следует определять концентрацию кальция в сыворотке крови. В случае выраженных нарушений прием Тамоксифена следует временно прекратить.

При появлении признаков тромбоза вен нижних конечностей (боль в ногах или их отечность), эмболии легочной артерии (одышка) прием препарата следует прекратить.

В период терапии необходимо периодически контролировать показатели свертывания крови, содержание кальция в крови, картину крови (лейкоциты, тромбоциты), показатели функции печени, артериальное давление, проводить осмотр у окулиста.

У больных с гиперлипидемией в процессе лечения необходимо контролировать концентрацию холестерина и ТГ в сыворотке крови.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потениально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью*: почечная недостаточность.

Условия хранения:

Список Б. В сухом месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Tamoksifen