Тамоксифен ГЕКСАЛ



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, покрытые оболочкой белого или слегка желтоватого цвета, круглые, двояковыпуклые, с однородной гладкой поверхностью.

	1 таб.
тамоксифена цитрат	15.2 мг,
что соответствует содержанию тамоксифена	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 71.3 мг, натрия крахмала гликолат - 10 мг, повидон - 2.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 24.8 мг, магния стеарат - 1.2 мг.

Состав оболочки: краситель белый опадрай - 2.5 мг (лактоза - 0.9 мг, титана диоксид - 0.65 мг, гипромеллоза - 0.7 мг, полиэтиленгликоль 4000 - 0.25 мг).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой белого или слегка желтоватого цвета, круглые, двояковыпуклые, с насечкой на одной стороне, с однородной гладкой поверхностью.

	1 таб.
тамоксифена цитрата	30.4 мг,
что соответствует содержанию тамоксифена	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 142.6 мг, натрия крахмала гликолат - 20 мг, повидон - 5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 49.6 мг, магния стеарат - 2.4 мг.

Состав оболочки: краситель белый опадрай - 5 мг (лактоза - 1.8 мг, титана диоксид - 1.3 мг, гипромеллоза - 1.4 мг, полиэтиленгликоль 4000 - 0.5 мг).

10 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (10) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой белого или слегка желтоватого цвета, круглые, двояковыпуклые, с однородной гладкой поверхностью.

	1 таб.
тамоксифена цитрат	45.6 мг,

что соответствует содержанию тамоксифена	30 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 213.9 мг, натрия крахмала гликолат - 30 мг, повидон - 7.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 74.4 мг, магния стеарат - 3.6 мг.

Состав оболочки: краситель белый опадрай - 7.5 мг (лактоза - 2.7 мг, титана диоксид - 1.95 мг, гипромеллоза - 2.1 мг, полиэтиленгликоль 4000 - 0.75 мг).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой белого или слегка желтоватого цвета, круглые, двояковыпуклые, с насечкой на одной стороне, с однородной гладкой поверхностью.

	1 таб.
тамоксифена цитрат	60.8 мг,
что соответствует содержанию тамоксифена	40 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 285.2 мг, натрия крахмала гликолат - 40 мг, повидон - 10 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 99.2 мг, магния стеарат - 4.8 мг.

Состав оболочки: краситель белый опадрай - 10 мг (лактоза - 3.6 мг, титана диоксид - 2.6 мг, гипромеллоза - 2.8 мг, полиэтиленгликоль 4000 - 1 мг).

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - 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

Всасывание и распределение

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%.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени с образованием нескольких 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 (грудного вскармливания);

— 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, тромбоцитоиения, 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 1 прием утром, или, разделив необходимую дозу на 2 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 тромбоэмболий.

Иногда могут наблюдаться транзиторная лейкопения и тромбоцитопепия, 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:

Противопоказано применение препарата при беременности.

Нет достаточных данных о том, проникает ли тамоксифен в грудное молоко, поэтому в период лактации не следует применять препарат или необходимо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

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 антикоагуляционного 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.

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

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

С осторожностью: почечная недостаточность.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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