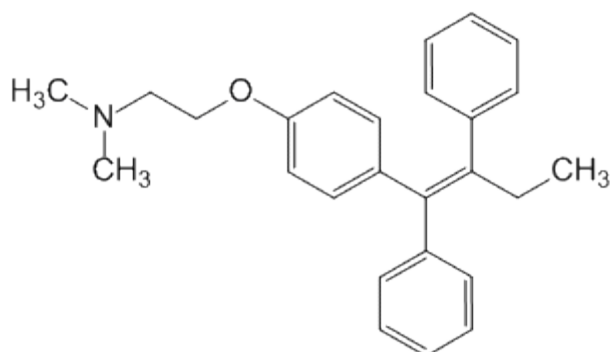


Тамоксифен (Tamoxifen): инструкция, применение и формула



- [Латинское название вещества Тамоксифен](#)
- [Фармакологическая группа вещества Тамоксифен](#)
- [Характеристика вещества Тамоксифен](#)
- [Фармакология](#)
- [Применение вещества Тамоксифен](#)
- [Противопоказания](#)
- [Ограничения к применению](#)
- [Применение при беременности и кормлении грудью](#)
- [Побочные действия вещества Тамоксифен](#)
- [Взаимодействие](#)
- [Способ применения и дозы](#)
- [Меры предосторожности вещества Тамоксифен](#)
- [Взаимодействия с другими действующими веществами](#)

Русское название

Тамоксифен

Латинское название вещества Тамоксифен

Tamoxifenum (*род.* Tamoxifeni)

Химическое название

(Z)-2-[4-(1,2-Дифенил-1-бутил)фенокси]-N,N-диметилэтанамин (в виде цитрата)

Брутто-формула

C₂₆H₂₉NO

Фармакологическая группа вещества Тамоксифен

[Эстрогены, гестагены, их гомологи и антагонисты](#)

[Противоопухолевые гормональные средства и антагонисты гормонов](#)

Нозологическая классификация (МКБ-10)

[C50 Злокачественные новообразования молочной железы](#)

[C54.1 Злокачественное новообразование эндометрия](#)

Код CAS

10540-29-1

Характеристика вещества Тамоксифен

Противоопухолевое средство (антиэстроген). Тамоксифена цитрат — белый кристаллический порошок без запаха. Очень мало растворим в воде (1:5000), легко — в горячей (1:2), растворим в этаноле, метаноле, ацетоне. Гигроскопичен при высокой влажности, чувствителен к ультрафиолету. Молекулярная масса 563,65.

Фармакология

Фармакологическое действие - антиэстрогенное, противоопухолевое.

Конкурентно связывается с эстрогенными рецепторами в органах-мишенях, подобно эстрогенам транслоцируется вместе с рецептором в ядро опухолевой клетки и блокирует таким образом действие эстрогенов.

Хорошо всасывается из ЖКТ, T_{max} — 4–7 ч, время достижения C_{ss} — 3–4 нед. Связывание с белками плазмы — 99%. Метаболизируется в печени путем гидроксилирования и деметилирования. Основным метаболит — N-десметил-тамоксифен — обладает активностью, сходной с таковой тамоксифена. Выведение носит двухфазный характер с начальным $T_{1/2}$ — 7–14 ч и последующим медленным терминальным $T_{1/2}$ — 7 дней. Выводится преимущественно через кишечник, в основном в виде метаболитов, незначительное количество — почками.

Применение вещества Тамоксифен

Рак молочной железы: особенно у женщин в менопаузе, у мужчин после кастрации, карцинома *in situ* протока молочной железы; адьювантная терапия рака молочной железы. Эстрогенчувствительные опухоли; рак эндометрия.

Противопоказания

Гиперчувствительность, беременность, кормление грудью.

Ограничения к применению

Тромбоз глубоких вен и тромбоемболия легочной артерии в анамнезе на фоне лечения непрямыми антикоагулянтами кумаринового ряда, тромбоцитопения, лейкопения, гиперкальциемия, гиперлипидемия, катаракта или нарушение зрения.

Применение при беременности и кормлении грудью

Противопоказано при беременности (перед началом лечения беременность должна быть исключена).

Категория действия на плод по FDA — D.

На время лечения следует прекратить грудное вскармливание (неизвестно, проникает ли тамоксифен в грудное молоко).

Побочные действия вещества Тамоксифен

Со стороны нервной системы и органов чувств: головная боль, головокружение, утомляемость, депрессия, спутанность сознания, нарушение зрения, изменения роговицы, катаракта и ретинопатия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы и крови (кроветворение, гемостаз): тромбофлебит, тромбоемболия, транзиторная лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны органов ЖКТ: боль в животе, тошнота, рвота, потеря аппетита, запор, увеличение уровня печеночных ферментов, тяжелые нарушения функции печени (холестаз, гепатит).

Со стороны мочеполовой системы: кровотечение или выделения из влагалища, аменорея или нерегулярность наступления менструаций у пациенток в предклимактерическом периоде, возникновение обратимой кистозной опухоли яичников, задержка жидкости, зуд в области гениталий.

Аллергические реакции: кожная сыпь.

Прочие: алопеция, боль в области очага поражения и/или в костях, увеличение размера мягкотканых образований (сопровождается выраженной эритемой пораженных участков и прилегающих областей), гиперкальциемия, приступообразное ощущение жара, повышение температуры тела; при длительном применении — случаи изменения эндометрия, включающие гиперплазию, полипы, внутриматочную фиброму и в единичных случаях — рак эндометрия.

Взаимодействие

При сочетании с цитостатиками повышается риск тромбообразования. Эстрогены могут снижать терапевтический эффект тамоксифена. Может использоваться в комбинации с прогестинами. Потенцирует эффект антикоагулянтов непрямого действия.

Тамоксифен + другие ЛС

Тамоксифен является субстратом изоферментов CYP3A, CYP2C9 и CYP2D6 цитохрома P450 и ингибитором P-гликопротеина.

Исследования *in vitro* показали, что эритромицин, циклоспорин, нифедипин и дилтиазем конкурентно ингибируют образование N-десметил-тамоксифена с константами ингибирования (K_i) 20, 1, 45 и 30 мкМ, соответственно. Клиническое значение этого взаимодействия неизвестно.

При одновременном применении с летрозолом тамоксифен снижает плазменную концентрацию летрозола на 37%. Рифампицин, индуктор изофермента CYP3A4 цитохрома P450, уменьшает AUC и C_{max} тамоксифена на 86 и 55% соответственно. Аминоглутетимид снижает концентрации в плазме тамоксифена и N-десметил-тамоксифена. Медроксипрогестерон снижает плазменную концентрацию N-десметил-тамоксифена, но не тамоксифена.

Показано, что при одновременной терапии бромокриптином повышается уровень тамоксифена и N-десметил-тамоксифена в крови.

[Обновлено 22.06.2015]

Взаимодействие с анастрозолом

В клинических исследованиях показано, что при совместном применении анастрозола и тамоксифена у больных раком молочной железы концентрация анастрозола в плазме снижается на 27% по сравнению с тем, когда анастрозол применяется один. Однако совместное применение не влияет на фармакокинетику тамоксифена или N-десметил-тамоксифена. Тамоксифен не следует применять сочетанно с анастрозолом.

Источник информации

[Обновлено 22.06.2015]

Способ применения и дозы

Внутрь. Режим дозирования устанавливается индивидуально в зависимости от показаний. При раке молочной железы — по 20–40 мг 1–2 раза в день, раке эндометрия — по 20–30 мг 1–2 раза в день. Высшая суточная доза — 40 мг. Лечение проводят длительно (до появления признаков регрессии процесса).

Меры предосторожности вещества Тамоксифен

До начала лечения женщины должны пройти тщательное гинекологическое обследование. Тамоксифен вызывает овуляцию, что повышает риск беременности, поэтому женщинам репродуктивного возраста необходимо использовать надежные методы контрацепции (негормональные) в период лечения и в течение 3 мес после окончания лечения.

Прием препарата следует прекратить при появлении кровянистых выделений из влагалища или влагалищных кровотечениях, появлении признаков тромбоза вен нижних конечностей (боль в ногах или их отечность), тромбоэмболии ветвей легочной артерии (одышка).

В процессе лечения необходим контроль показателей свертывания крови, картины крови (лейкоциты, тромбоциты), показателей функции печени. До начала и периодически во время лечения рекомендуется офтальмологическое исследование.

У больных с метастазами в кости периодически во время начального периода лечения следует определять концентрацию кальция в сыворотке крови (в случае выраженной гиперкальциемии прием тамоксифена следует временно прекратить). У больных с гиперлипидемией в процессе лечения необходимо контролировать концентрацию холестерина и ТГ в сыворотке крови.

Малоэффективен при лечении больных с метастазами (особенно в печень).

Год последней корректировки