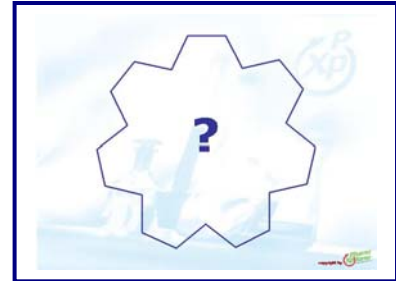


## Selektive Estrogen-Rezeptor-Modulatoren

Selektive Estrogenrezeptor-Modulatoren werden mit SERM abgekürzt. Sie lösen nur einen Teil der Estrogenwirkungen aus und unterdrücken andere Wirkungen der Estrogene. Je nach Zielgewebe besitzen sie **Estrogen-agonistische-** oder **Estrogen-antagonistische Eigenschaften**. Daher werden diese Arzneistoffe als Estrogenrezeptor-Modulatoren bezeichnet.



### NE01B000

Da die einzelnen SERMs spezifische Wirkprofile besitzen, haben sie auch unterschiedliche Indikationsgebiete. Strukturmäßig handelt es sich bei den SERMs ausschließlich um nichtsteroidale Moleküle.

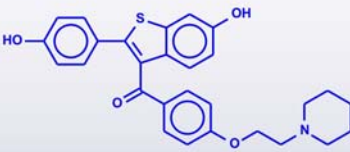
## Wirkmechanismus

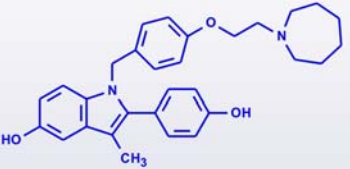
Natürliche Estrogene und ihre Derivate aktivieren alle Estrogen-regulierenden Gene gleichermaßen, Estrogen-Rezeptor-Antagonisten inhibieren diese. Die SERM stimulieren jedoch nur einen Teil dieser Gene, da sie unterschiedliche Affinitäten zu den Estrogenrezeptor-Subtypen  $\alpha$  +  $\beta$  aufweisen und der Ligand-Rezeptorkomplex eine unterschiedliche Struktur aufweist.

SERM-Estrogenrezeptorkomplexe binden dann in weiterer Folge nicht an die gleichen DNA-Sequenzen wie die Estrogenrezeptorkomplexe im Kern.

Zu den SERM zählen ***Clomifen, Raloxifen, Tamoxifen, Toremifen, Bazedoxifen*** und ***Lasofoxifen***

*Clomifen, Tamoxifen* und *Toremifen* werden bei den Antiestrogenen besprochen.

<div style="text-align: center;"> <h3>Raloxifen</h3> <p>EVISTA - Filmtabletten®</p>  <p><math>C_{28}H_{27}NO_4S</math> CAS 84449-90-1</p> </div>	
<b>Wirkstoffgruppe</b>	SERM
<b>Wirkmechanismus</b>	Estrogenrezeptor-Agonist im Knochengewebe (Verminderung der Knochenresorption und Senkung des Spiegels biochemischer Marker des Knochenumbaus)
<b>Indikation</b>	Osteoporoseprophylaxe in der Postmenopause
<b>Nebenwirkungen</b>	Hitzewallungen, Venenthrombosen, Wadenkrämpfe, Periphere Ödeme
<b>Interaktionen</b>	<b>Warfarin:</b> Leichte Verkürzungen der Prothrombinzeit <b>Cholestyramin:</b> Signifikante Verminderung von Resorption und enterohepatischem Kreislauf von Raloxifen
<b>Kontraindikationen</b>	Thromboembolische Ereignisse in der Patientenvorgeschichte, Gebärfähige Frauen, Leber- und Nierenschäden, Ungeklärte Uterusblutungen
<b>Halbwertszeit</b>	

<div style="text-align: center;"> <h3>Bazedoxifen</h3> <p>Conbriza®</p>  <p>1-(4-[2-(azepin-1-yl)ethoxy]phenylmethyl)-2-(4-hydroxyphenyl)-3-methylindol-5-ol <math>C_{30}H_{34}N_2O_3</math> CAS 198481-32-2</p> </div>	
<b>Wirkstoffgruppe</b>	SERM
<b>Wirkmechanismus</b>	Estrogenrezeptor-Agonist im Knochengewebe (Verminderung der Knochenresorption und Senkung des Spiegels biochemischer Marker des Knochenumbaus); Estrogenrezeptor-Antagonist im Uterus- und Brustgewebe
<b>Indikation</b>	postmenopausale Osteoporose bei Frauen mit einem erhöhten Frakturrisiko
<b>Nebenwirkungen</b>	Hitzewallungen, Muskelkrämpfe; Schläfrigkeit, Mundtrockenheit, Urtikaria, peripheres Ödem

<b>Interaktionen</b>	keine bekannt
<b>Kontraindikationen</b>	bestehende oder frühere venöse Erkrankungen (einschließlich tiefer Venenthrombose, Lungenembolie und Retina-Venenthrombose), gebärfähiges Alter, Schwangerschaft, Stillzeit
<b>Halbwertszeit</b>	

<p><b>Lasofoxifen</b> Fablyn® <chem>Oc1ccc2c(c1)CCc3ccccc3C2C4=CC=C(C=C4)OCCN5CCCC5</chem> (5R,6S)-6-phenyl-5-[4-(2-pyrrolidin-1-ylethoxy)phenyl]-5,6,7,8-tetrahydronaphthalin-2-ol C<sub>28</sub>H<sub>31</sub>NO<sub>2</sub> CAS 180916-16-9</p>	
<b>Wirkstoffgruppe</b>	SERM
<b>Wirkmechanismus</b>	Bindung an Östrogenrezeptoren; Induktion von gewebe- und zellspezifischen Wirkungen in östrogenempfindlichen Geweben (agonistische Wirkung auf Knochen und antagonistische Wirkung auf die Brust);
<b>Indikation</b>	Osteoporose bei postmenopausalen Frauen mit erhöhtem Frakturrisiko
<b>Nebenwirkungen</b>	Hitzewallungen, Muskelkrämpfe, venöse thromboembolische Ereignisse, Gliederschmerzen, Scheidenausfluss, endometriale Störungen, Magen/Darm (Verstopfung, Hyperhidrose, Brustbeschwerden)
<b>Interaktionen</b>	gleichzeitige Anwendung mit synthetischen Östrogenen wird nicht empfohlen
<b>Kontraindikationen</b>	bestehende oder frühere venöse Erkrankungen (einschließlich tiefer Venenthrombose, Lungenembolie und Retina-Venenthrombose), Schwangerschaft, Stillzeit, gebärfähiges Alter, ungeklärte Uterusblutungen
<b>Halbwertszeit</b>	