

phát ban đầu tiên trên da.

### Liều lượng và cách dùng

#### Cách dùng

Viên nén và dung dịch uống: Uống ngày 2 lần vào bữa sáng và tối.  
Viên nang giải phóng kéo dài: Uống 1 lần/ngày vào bữa sáng.

#### Liều dùng

##### Người lớn

**Viên nén và dung dịch uống:** Liều khởi đầu: 4 mg/lần, ngày 2 lần trong 4 tuần, nếu dung nạp, tăng liều lên 8 mg/lần, ngày 2 lần, duy trì trong ít nhất 4 tuần. Sau đó tùy theo đáp ứng và sự dung nạp thuốc của người bệnh mà tăng liều lên 12 mg/lần, ngày 2 lần. Liều duy trì 8 - 12 mg/lần, ngày 2 lần.

**Viên nang giải phóng kéo dài:** Liều khởi đầu 8 mg, ngày 1 lần trong 4 tuần, nếu dung nạp tăng liều lên 16 mg, ngày 1 lần trong ít nhất 4 tuần. Sau đó tùy theo đáp ứng và sự dung nạp thuốc của người bệnh mà tăng liều lên 24 mg, ngày 1 lần. Liều duy trì 16 - 24 mg, ngày 1 lần.

Nếu quá trình điều trị bị gián đoạn từ 3 ngày trở lên thì cần bắt đầu điều trị lại với mức liều thấp nhất rồi tăng dần đến mức liều hiện tại.

**Chuyển từ viên nén hoặc dung dịch uống sang viên giải phóng kéo dài:** Người bệnh nên uống liều cuối cùng viên nén hoặc dung dịch uống vào buổi tối và bắt đầu liều giải phóng kéo dài vào sáng hôm sau, với tổng liều trong ngày như nhau.

**Chuyển từ các thuốc ức chế cholinesterase khác sang galantamin:** Trên người bệnh kém dung nạp với donepezil hoặc rivastigmin, đợi đến khi ADR hết hoàn toàn hoặc đợi 7 ngày để loại bỏ hoàn toàn thuốc cũ trước khi bắt đầu điều trị với galantamin. Với người bệnh dung nạp tốt với donepezil hoặc rivastigmin có thể bắt đầu điều trị với galantamin vào ngày ngay sau khi ngừng điều trị với các liệu pháp trước.

**Người bệnh suy thận:** Không cần hiệu chỉnh liều trên người bệnh suy thận nhẹ. Trên người bệnh suy thận trung bình ( $Cl_{cr}$ : 9 - 59 ml/phút) liều tối đa 16 mg/ngày. Không khuyến cáo sử dụng thuốc trên người bệnh suy thận nặng ( $Cl_{cr}$  < 9 ml/phút).

**Người bệnh suy gan:** Không cần hiệu chỉnh liều trên người bệnh suy gan nhẹ. Trên người bệnh suy gan trung bình (điểm child - Pugh loại B) liều tối đa 16 mg/ngày. Không khuyến cáo sử dụng thuốc trên người bệnh suy gan nặng (điểm child - Pugh loại C).

**Trẻ em:** Không nên dùng cho trẻ em vì chưa xác định được liều an toàn có hiệu quả.

### Tương tác thuốc

#### Tương tác dược lực học

Thuốc kích thích hệ cholinergic khác như ambenonium, donepezil, neostigmin, pyridostigmin, rivastigmin hoặc pilocarpin dùng toàn thân: Tránh phối hợp đồng thời với galantamin do cùng cơ chế tác dụng.

Các thuốc kháng cholinergic: Galantamin đối kháng tác dụng của các thuốc kháng cholinergic. Ngừng đột ngột các thuốc kháng cholinergic như atropin có thể làm tăng tác dụng của galantamin.

Các thuốc làm chậm nhịp tim như digoxin và các chất ức chế beta, thuốc chẹn kênh calci và amiodaron: Có khả năng xảy ra tương tác dược lực với galantamin.

Các thuốc gây xoắn đỉnh: Thận trọng khi phối hợp với galantamin. Galantamin hiệp đồng tác dụng với các thuốc giãn cơ kiểu succinylcholin dùng trong phẫu thuật đặc biệt trong các trường hợp thiếu hụt pseudocholinesterase.

#### Tương tác dược động học

Các thuốc ức chế mạnh CYP2D6 như paroxetin làm tăng sinh khả dụng của galantamin 40%, thuốc ức chế CYP3A4 (erythromycin, ketoconazol) làm tăng sinh khả dụng của galantamin lần lượt 30 và 12%.

Khởi đầu điều trị với các thuốc ức chế mạnh CYP2D6 như quinidin, paroxetin hoặc fluoxetin hoặc các thuốc ức chế CYP3A4 như ketoconazol hoặc ritonavir có thể tăng nguy cơ ADR trên hệ cholinergic.

Amitriptylin, fluoxetin, fluvoxamin và quinidin làm giảm thanh thải galantamin.

### Quá liều và xử trí

**Triệu chứng:** Biểu hiện quá liều galantamin tương tự như biểu hiện quá liều các thuốc kích thích cholinergic khác. Thuốc tác động trên TKTW, hệ phó giao cảm và thần kinh - cơ với các triệu chứng như: Buồn nôn, nôn, co thắt đường tiêu hóa, tăng tiết nước bọt, chảy nước mắt, tiểu tiện, đại tiện, tiết mồ hôi, chậm nhịp tim, tụt huyết áp, trụy mạch và co giật. Ngoài ra, thuốc gây yếu cơ hoặc co cứng cơ cục bộ. Tăng yếu cơ cùng với tăng tiết dịch khí quản và co thắt phế quản có thể dẫn đến tắc nghẽn đường thông khí, nguy hiểm đến tính mạng. Xoắn đỉnh, kéo dài khoảng QT, nhịp nhanh, chậm trên thất và mất ý thức tạm thời đã được ghi nhận trong các báo cáo hậu marketing trên một trường hợp quá liều galantamin (tổng liều 32 mg/ngày).

**Xử trí:** Giải độc đặc hiệu bằng thuốc kháng cholinergic như dùng atropin tiêm tĩnh mạch bắt đầu từ 0,5 - 1,0 mg, cho đến khi có đáp ứng. Đồng thời sử dụng các biện pháp điều trị hỗ trợ ngộ độc chung.

*Cập nhật lần cuối: 2021.*

## GANCICLOVIR

**Tên chung quốc tế:** Ganciclovir.

**Mã ATC:** J05AB06 (dạng dùng toàn thân), S01AD09 (dạng thuốc nhỏ mắt).

**Loại thuốc:** Thuốc kháng virus.

### Dạng thuốc và hàm lượng

Bột pha dung dịch tiêm truyền tĩnh mạch: 500 mg.

Gel nhỏ mắt: 0,15% (kl/kl).

### Dược lực học

#### Cơ chế tác dụng

Ganciclovir là một dẫn chất của 2'-deoxyguanosin, có tác dụng ức chế quá trình sao chép của *Cytomegalovirus* (CMV). Trong tế bào, đầu tiên, ganciclovir được phosphoryl hóa bởi protein kinase tạo ganciclovir monophosphat. Do quá trình này được xúc tác bởi enzym của virus nên quá trình phosphoryl hóa ganciclovir xảy ra chọn lọc trong các tế bào nhiễm CMV. Sau đó, quá trình phosphoryl hóa được thực hiện thông qua các enzym kinase của tế bào để tạo thành ganciclovir triphosphat. Chất này ức chế enzym ADN polymerase thông qua cơ chế đối kháng cạnh tranh với deoxyguanosin, từ đó ức chế quá trình sao chép của virus. So với aciclovir, nồng độ dạng triphosphat của ganciclovir cao hơn khoảng 10 lần và thải trừ chậm hơn ra khỏi tế bào.

#### Phổ tác dụng

Các chủng virus nhạy cảm bao gồm: CMV, virus *Herpes simplex* typ 1 và 2 (HSV-1 và HSV-2), virus *Herpes* trên người các typ 6, 7, 8 (HHV-6, HHV-7 và HHV-8), virus *Epstein-Barr* (EBV), virus *Varicella-zoster* (VZV) và virus viêm gan B. Tuy nhiên mới chỉ có tác dụng trên CMV của thuốc được đánh giá thông qua các nghiên cứu lâm sàng.

#### Kháng thuốc

Đã ghi nhận hiện tượng đề kháng của CMV với ganciclovir khi sử dụng thuốc dài ngày. Các dữ liệu trên lâm sàng chưa đủ để đánh giá đầy đủ các cơ chế phát sinh đề kháng. Một số bằng chứng cho thấy



virus kháng thuốc mang đột biến trên các gen chịu trách nhiệm cho quá trình tổng hợp enzym kinase và ADN polymerase.

#### Dược động học

**Hấp thu:** Thuốc hấp thu kém qua đường tiêu hóa. Sinh khả dụng đường uống đạt khoảng 5% lúc đói và khoảng 6 - 9% sau khi ăn. Sau khi sử dụng liều 1 000 mg mỗi 8 giờ, nồng độ đỉnh và nồng độ đáy lần lượt là 0,5 - 1,2 và 0,2 - 0,5 microgam/ml. Khi truyền tĩnh mạch với liều 5 mg/kg trong 1 giờ, nồng độ đỉnh và nồng độ đáy trong huyết tương lần lượt là 8 - 11 và 0,6 - 1,2 microgam/ml.

**Phân bố:** Thể tích phân bố của ganciclovir theo đường truyền tĩnh mạch tại trạng thái ổn định là 0,54 - 0,87 lít/kg. Tỷ lệ liên kết với protein huyết tương khoảng 1 - 2%. Thuốc qua được nhau thai và hàng rào máu - não. Nồng độ thuốc trong dịch não tủy đạt khoảng 24 - 67% nồng độ trong huyết tương. Nồng độ trong dịch kính khoảng 1 microgam/ml, tương tự hoặc cao hơn một ít so với nồng độ trong huyết tương.

**Thải trừ:** Thuốc được thải trừ nguyên dạng với tỷ lệ trên 90%, với hai cơ chế chính là lọc ở cầu thận và bài tiết ở ống thận. Quá trình thải trừ thuốc từ huyết tương xảy ra theo 2 pha. Khi sử dụng qua đường tĩnh mạch, ở pha đầu tiên, nửa đời của thuốc khoảng 0,23 - 0,76 giờ và ở pha cuối là khoảng 2,53 - 3,6 giờ trên bệnh nhân có chức năng thận bình thường. Nửa đời của thuốc khi dùng qua đường uống là 4,8 giờ. Nửa đời của thuốc có thể kéo dài tới 4,4 - 30 giờ trên bệnh nhân suy thận. Thuốc có thể được thải trừ thông qua thẩm phân máu, sau 4 giờ tiến hành nồng độ thuốc có thể giảm từ 40 - 50%.

#### Chỉ định

##### Dùng toàn thân

Điều trị CMV trên bệnh nhân suy giảm miễn dịch.

Dự phòng nhiễm CMV trên bệnh nhân sử dụng thuốc ức chế miễn dịch trong ghép tạng.

##### Dùng tại mắt

Điều trị viêm giác mạc do virus Herpes (loét giác mạc hình cành cây).

#### Chống chỉ định

Mẫn cảm với thuốc, valganciclovir.

Phụ nữ cho con bú.

#### Thận trọng

**Phản ứng dị ứng chéo:** Do có cấu trúc hóa học tương đồng, phản ứng dị ứng chéo giữa ganciclovir với aciclovir và penciclovir có thể xảy ra. Thận trọng khi sử dụng ganciclovir trên bệnh nhân có tiền sử quá mẫn với aciclovir, penciclovir hoặc tiền thuốc của chúng (valaciclovir, famciclovir).

**Ảnh hưởng trên thai nhi và hệ sinh sản của bệnh nhân:** Các nghiên cứu trên động vật cho thấy ganciclovir có khả năng gây đột biến, dị tật thai nhi cũng như có nguy cơ gây ung thư và gây vô sinh. Các nghiên cứu lâm sàng và tiền lâm sàng cho thấy thuốc dường như gây ức chế tạm thời hoặc vĩnh viễn quá trình sinh tinh trùng. Do đó, phụ nữ trong độ tuổi sinh sản cần sử dụng một biện pháp tránh thai có hiệu quả trong suốt liệu trình và duy trì tối thiểu 30 ngày sau khi ngừng thuốc. Với nam giới, cần sử dụng biện pháp tránh thai trong suốt liệu trình và duy trì tối thiểu 90 ngày sau khi ngừng thuốc, trừ trường hợp bạn tình không có nguy cơ mang thai.

Thận trọng khi sử dụng thuốc trên trẻ em.

**Ảnh hưởng trên tủy xương:** Đã ghi nhận triệu chứng giảm bạch cầu, hồng cầu, tiểu cầu và suy tủy nặng trên bệnh nhân sử dụng ganciclovir. Cần thận trọng khi sử dụng thuốc trên bệnh nhân đang có triệu chứng giảm tế bào máu hoặc có tiền sử giảm tế bào máu do thuốc và bệnh nhân đang xạ trị. Không sử dụng thuốc khi số lượng bạch cầu trung tính giảm dưới  $0,5 \times 10^9/\text{microlit}$ , số lượng tiểu cầu

giảm dưới  $25 \times 10^9/\text{lít}$  hoặc hemoglobin dưới 80 g/lít.

Trong quá trình sử dụng thuốc, cần giám sát công thức máu của bệnh nhân, đặc biệt trên bệnh nhân suy thận, trẻ sơ sinh và trẻ nhỏ. Trong 14 ngày đầu tiên của liệu trình điều trị, khuyến cáo xét nghiệm công thức bạch cầu 2 ngày/lần; trên bệnh nhân có số lượng bạch cầu trung tính thấp ( $< 1,0 \times 10^9/\text{lít}$ ), bệnh nhân có tiền sử giảm bạch cầu do thuốc và bệnh nhân suy thận, cần xét nghiệm hàng ngày.

Trên bệnh nhân giảm bạch cầu, giảm hồng cầu và giảm tiểu cầu nặng, xem xét ngừng ganciclovir và/hoặc sử dụng các thuốc kích thích tạo máu.

**Bệnh nhân suy thận:** Bệnh nhân suy thận có nguy cơ gặp ADR cao hơn. Cần hiệu chỉnh liều khi sử dụng thuốc trên đối tượng này.

#### Thời kỳ mang thai

Tính an toàn của ganciclovir trên phụ nữ mang thai chưa được đánh giá đầy đủ. Các bằng chứng cho thấy thuốc có khả năng qua nhau thai. Trên động vật, ganciclovir gây độc tính trên hệ sinh sản và gây dị tật thai nhi. Do đó, không sử dụng ganciclovir trên phụ nữ mang thai trừ khi nhu cầu điều trị của người mẹ vượt trội hơn nguy cơ gây dị tật thai nhi của thuốc.

#### Thời kỳ cho con bú

Khả năng bài xuất của ganciclovir vào sữa mẹ chưa được đánh giá đầy đủ. Dữ liệu trên động vật cho thấy thuốc có khả năng bài xuất qua sữa. Do đó, cần ngừng cho con bú khi sử dụng ganciclovir.

#### Tác dụng không mong muốn (ADR)

##### Thường gặp

Nhiễm trùng: nhiễm nấm *Candida*, nhiễm khuẩn hô hấp trên, nhiễm khuẩn huyết, cúm, nhiễm khuẩn tiết niệu, viêm mô tế bào.

Huyết học: giảm bạch cầu, giảm hồng cầu, giảm tiểu cầu, giảm toàn bộ tế bào máu ngoại vi, suy tủy xương.

Miễn dịch: phản ứng quá mẫn.

Chuyển hóa: chán ăn, giảm cân.

Tâm thần: trầm cảm, lo âu, lú lẫn.

Thần kinh: đau đầu, mất ngủ, bệnh thần kinh ngoại vi, chóng mặt, dị cảm, giảm cảm giác, co giật, rối loạn vị giác.

Thị giác: giảm thị lực, bong võng mạc, đục dịch kính, đau mắt, viêm kết mạc, phù hoàng điểm.

Thính giác: đau tai.

Tim mạch: hạ huyết áp.

Hô hấp: ho, khó thở.

Tiêu hóa: tiêu chảy, buồn nôn, nôn, đau bụng, đầy hơi, khó tiêu, táo bón, loét miệng, khó nuốt, trướng bụng, viêm tụy cấp.

Gan mật: rối loạn chức năng gan, tăng phosphatase kiềm, tăng transaminase.

Da và mô mềm: viêm da, vẩy mồ hôi, ngứa, ban đỏ, rụng tóc.

Cơ - xương - khớp: đau lưng, đau cơ, đau khớp, co thắt cơ.

Thận - tiết niệu: suy giảm chức năng thận, tăng creatinin huyết thanh.

Toàn thân: sốt, mệt mỏi, phản ứng tại chỗ tiêm, đau, ớn lạnh, khó chịu, suy nhược.

##### Ít gặp

Suy tủy xương, kích động, ảo giác, run, mất thính giác, loạn nhịp tim, mày đay, khô da, suy thận, tiểu máu, gây vô sinh ở nam giới, đau ngực.

##### Hiếm gặp

Thiếu máu bất sản, giảm/mất bạch cầu hạt, sốc phản vệ.

#### Hướng dẫn cách xử trí ADR

Trên bệnh nhân giảm bạch cầu, giảm hồng cầu và giảm tiểu cầu nặng, xem xét ngừng ganciclovir và/hoặc sử dụng các thuốc kích thích tạo máu.



**Liều lượng và cách dùng****Liều dùng toàn thân**

*Người lớn và trẻ em từ 13 tuổi trở lên*

Điều trị CMV trên bệnh nhân suy giảm miễn dịch

Giai đoạn tấn công: 5 mg/kg, truyền tĩnh mạch tối thiểu trong 1 giờ, mỗi 12 giờ. Thời gian điều trị từ 14 - 21 ngày.

Giai đoạn duy trì: 5 mg/kg/ngày, ngày 1 lần truyền tĩnh mạch trong tối thiểu 1 giờ, 7 lần/tuần, hoặc 6 mg/kg/ngày, ngày 1 lần, 5 lần/tuần. Thời gian điều trị cần được cá thể hóa theo tình trạng của bệnh nhân. Trong trường hợp tái phát, sử dụng liều như giai đoạn tấn công.

Dự phòng CMV trên bệnh nhân sử dụng thuốc ức chế miễn dịch

Giai đoạn tấn công: 5 mg/kg truyền tĩnh mạch tối thiểu trong 1 giờ, mỗi 12 giờ. Thời gian điều trị từ 14 - 21 ngày.

Giai đoạn duy trì: 5 mg/kg/ngày, ngày 1 lần, truyền tĩnh mạch trong tối thiểu 1 giờ, 7 lần/tuần, hoặc, 6 mg/kg/ngày, ngày 1 lần, 5 lần/tuần. Thời gian điều trị cần được cá thể hóa theo nguy cơ nhiễm CMV của bệnh nhân. Với bệnh nhân ghép tạng, cần sử dụng thuốc tới 100 - 120 ngày sau ghép.

*Bệnh nhân suy thận*

Cần hiệu chỉnh liều theo bảng sau.

Độ thanh thải creatinin (Cl <sub>cr</sub> )	Liều khởi đầu	Liều duy trì
> 70 ml/phút	5 mg/kg mỗi 12 giờ	5 mg/kg/ngày
50 - 69 ml/phút	2,5 mg/kg mỗi 12 giờ	2,5 mg/kg/ngày
25 - 49 ml/phút	2,5 mg/kg/ngày	1,25 mg/kg/ngày
10 - 24 ml/phút	1,25 mg/kg/ngày	0,625 mg/kg/ngày
< 10 ml/phút	1,25 mg/kg × 3 lần/tuần sau lọc máu	0,625 mg/kg × 3 lần/tuần sau lọc máu

*Bệnh nhân suy gan:* Chưa có khuyến cáo liều dùng cho đối tượng này.

*Người cao tuổi:* Lưu ý hiệu chỉnh liều theo chức năng thận của bệnh nhân.

*Trẻ em dưới 13 tuổi:* Chưa có khuyến cáo liều dùng cho đối tượng này.

**Cách dùng**

Sử dụng thuốc qua đường truyền tĩnh mạch. Thời gian truyền tối thiểu 1 giờ và nồng độ thuốc không vượt quá 10 mg/ml. Không tiêm tĩnh mạch nhanh vì có thể tạo nồng độ thuốc trong huyết tương cao, làm tăng độc tính trên thận của thuốc. Không tiêm bắp hay tiêm dưới da vì có thể gây kích ứng vị trí tiêm do dung dịch ganciclovir có pH cao (~11).

Hoàn nguyên bột ganciclovir trong nước cất pha tiêm (nồng độ khoảng 50 mg/ml). Pha loãng bằng dung dịch tiêm truyền natri clorid 0,9%, glucose 5%, dung dịch Ringer hoặc Ringer lactat để có dung dịch chứa không quá 10 mg/ml. Không được dùng nước pha tiêm có chất bảo quản paraben vì có thể gây tủa. Dung dịch tiêm truyền phải dùng trong vòng 24 giờ để tránh nhiễm khuẩn.

**Liều dùng tại mắt**

Điều trị viêm giác mạc do virus *Herpes*

*Người lớn và trẻ em từ 18 tuổi trở lên*

Nhỏ mắt 1 giọt gel nồng độ 0,15%/lần, 5 lần/ngày cho tới khi hết triệu chứng. Tiếp tục sử dụng 3 lần/ngày, trong 7 ngày sau đó. Không sử dụng vượt quá 21 ngày.

*Trẻ em dưới 18 tuổi*

Chưa có khuyến cáo liều dùng cho đối tượng này.

**Tương tác thuốc**

*Probenecid:* Probenecid làm giảm thanh thải qua thận của ganciclovir, tăng nguy cơ xuất hiện độc tính. Bệnh nhân sử dụng đồng thời này cần được giám sát chặt chẽ các dấu hiệu độc tính của ganciclovir.

*Didanosin:* Phối hợp 2 thuốc làm tăng nồng độ didanosin trong huyết thanh. Bệnh nhân sử dụng đồng thời hai thuốc này cần được giám sát chặt chẽ các dấu hiệu độc tính của didanosin.

*Imipenem-cilastatin:* Phối hợp imipenem-cilastatin với ganciclovir có thể xuất hiện phản ứng co giật. Không sử dụng 2 thuốc đồng thời, trừ khi lợi ích vượt trội so với nguy cơ.

*Zidovudin:* Phối hợp hai thuốc làm tăng nguy cơ độc tính trên huyết học. Không nên sử dụng hai thuốc đồng thời.

Một số thuốc khác: Ganciclovir có thể hiệp đồng tăng độc tính của các thuốc có độc tính trên tủy xương và trên thận, bao gồm: Dapson, pentamidin, flucytosin, amphotericin B, sulfamethoxazol/trimethoprim, ciclosporin, tacrolimus, mycophenolat mofetil, vincristin, vinblastin, doxorubicin, hydroxyurê, zidovudin, stavudin, didanosin, tenofovir, adefovir. Khuyến cáo không dùng đồng thời với các thuốc này trừ khi lợi ích vượt trội so với nguy cơ.

**Tương kỵ**

Ngoại trừ các dung dịch được liệt kê trong phần *Cách dùng* (Natri clorid, glucose 5%, Ringer và Ringer lactat), không trộn lẫn ganciclovir với bất kỳ dung dịch nào khác. Không sử dụng nước cất vô khuẩn có chứa paraben để hoàn nguyên.

**Quá liều và xử trí**

*Triệu chứng:*

Huyết học: suy tủy xương, giảm toàn bộ tế bào máu ngoại vi, giảm bạch cầu, giảm bạch cầu trung tính, bạch cầu hạt.

Gan mật: viêm gan, rối loạn chức năng gan.

Thận - tiết niệu: tiểu máu, suy thận cấp, tăng creatinin.

Tiêu hóa: đau bụng, tiêu chảy, buồn nôn.

Thần kinh: run toàn thân, co giật.

*Xử trí:* Có thể sử dụng thăm phân máu trong điều trị quá liều ganciclovir. Bù nước và điện giải, điều trị triệu chứng, cân nhắc sử dụng các thuốc kích thích tăng sinh tế bào máu ở bệnh nhân có triệu chứng trên huyết học.

*Cập nhật lần cuối:* 2018.

**GEFITINIB**

**Tên chung quốc tế:** Gefitinib.

**Mã ATC:** L01XE02.

**Loại thuốc:** Chống ung thư, ức chế tyrosin kinase, ức chế EGFR.

**Dạng thuốc và hàm lượng**

Viên nén bao phim: 250 mg.

**Dược lực học**

Gefitinib là một anilinoquinazolin tổng hợp có tác dụng ức chế sự phosphoryl nội bào của một số tyrosin kinase kết hợp với thụ thể bề mặt xuyên màng như tyrosin kinase của thụ thể tăng trưởng biểu bì (EGFR). EGFR được biểu hiện trên bề mặt của cả tế bào thường và tế bào ung thư và đóng một vai trò trong quá trình tăng trưởng và tăng sinh tế bào. Một số đột biến của EGFR (đột biến mất đoạn exon 19 hoặc đột biến điểm L858R trên exon 21) trong tế bào ung thư phổi không tế bào nhỏ (NSCLC: Non-small Cell Lung Cancer) góp phần thúc đẩy sự phát triển của tế bào khối u, ngăn chặn sự tự chết theo chương trình, tăng sản xuất các yếu tố hình thành mạch máu và tạo thuận lợi cho các quá trình di căn. Gefitinib ức chế thuận nghịch hoạt tính kinase của các kiểu hình đột biến EGFR, ngăn chặn sự tự phosphoryl hóa của các gốc (residues) tyrosin gắn với EGFR, do đó ức chế các tín hiệu phát sinh và ngăn chặn sự sản sinh tế bào. Gefitinib có ái lực với EGFR bị đột biến mất đoạn exon 19 hoặc đột biến điểm L858R trên exon 21 cao hơn ái lực