

Rx: Thuốc bán theo đơn

LETROZSUN

(Viên bao phim Letrozol 2,5 mg)

THÀNH PHẦN:

Mỗi viên bao phim có chứa:

- Hoạt chất:

Letrozol.....2,5 mg

- Tá dược:

Lactose monohydrat, cellulose vi tinh thể, tinh bột ngô, povidon (K30), Opadry II yellow 31G52301, natri starch glycolat, colloidal silica khan, magnesi stearat.

ĐƯỢC LỰC HỌC

Letrozol là chất ức chế aromatase chọn lọc không steroid. Letrozol ức chế enzym aromatase bằng cách gắn kết với nhân hem của tiểu đơn vị CYP450 của enzym này, dẫn đến làm giảm quá trình sinh tổng hợp estrogen trong tất cả các mô.

Letrozol có hiệu lực chống ung thư bằng cách lấy đi các tế bào ung thư vú phụ thuộc estrogen của tác nhân kích thích phát triển khối u. Ở phụ nữ sau mãn kinh, estrogen chủ yếu được tổng hợp nhờ hoạt động của enzym aromatase, có tác dụng chuyển các androgen thượng thận (chủ yếu là androstenedion và testosterone) thành estron (E1) và estradiol (E2). Quá trình ức chế sự tổng hợp estrogen ở các mô ngoại biên và tại bản thân khối u có thể đạt được nhờ sự ức chế đặc hiệu enzym aromatase.

Ở phụ nữ sau mãn kinh khỏe mạnh, liều đơn 0,1; 0,5 và 2,5mg letrozol ức chế nồng độ estron và estradiol huyết tương lần lượt là 75-78% và 78%. Ức chế tối đa đạt được sau 48-78 giờ.

Ở những bệnh nhân sau mãn kinh bị ung thư vú tiến triển, liều dùng hàng ngày 0,1 đến 5mg giúp ức chế làm giảm nồng độ oestradiol, oestron, và oestron sulphat trong huyết tương đến 78-95%.

Letrozol không có tác động trên nồng độ androgen huyết thanh (androstenedion và testosterone) ở người phụ nữ sau mãn kinh khỏe mạnh sau khi dùng liều đơn 0,1; 0,5 và 2,5 mg, là những liều có tác dụng ức chế sinh tổng hợp estrogen, không gây tích lũy các tiền thân của androgen. Không ảnh hưởng đến tổng hợp steroid tuyến thượng thận.

ĐƯỢC ĐỘNG HỌC

Letrozol được hấp thu nhanh và hoàn toàn qua đường tiêu hóa (sinh khả dụng tuyệt đối khoảng 99,9%). Thức ăn làm giảm nhẹ tỉ lệ hấp thu nhưng mức hấp thu thì không đổi. Thay đổi nhỏ của tỉ lệ hấp thu không ảnh hưởng đến hiệu quả lâm sàng, do đó letrozol có thể dùng trước, trong hoặc sau bữa ăn.

Letrozol gắn kết protein huyết tương khoảng 60%, chủ yếu là với albumin (55%). Nồng độ letrozol trong hồng cầu bằng khoảng 80% nồng độ letrozol trong huyết tương.

Chuyển hóa thành chất chuyển hóa không có hoạt tính dược lý carbinol là con đường bài tiết chủ yếu của letrozol nhưng tương đối chậm khi so với tốc độ máu qua gan. Các isoenzym 3A4 và 2A6 của CYP450 có khả năng chuyển hóa letrozol trên *in vitro* nhưng sự chuyển hóa letrozol của các yếu tố này chưa được thiết lập trên *in vivo*.

Thời gian bán thải biểu kiến là 2 ngày. Sau khi uống liều hàng ngày 2,5mg, nồng độ ổn định đạt được trong vòng 2 – 6 tuần.

CHỈ ĐỊNH

Letrozsun là trị liệu đầu tay trong ung thư vú di căn/tiến triển ở phụ nữ mãn kinh (thụ thể hormon dương tính hoặc chưa rõ thụ thể).

LIỀU DÙNG VÀ CÁCH SỬ DỤNG

Liều dùng khuyến cáo với Letrozsun là 2,5 mg/lần/ngày. Điều trị với Letrozsun cần được tiếp tục khi khối u vẫn đáp ứng. Ngưng thuốc nếu khối u ngưng phát triển.

Không cần điều chỉnh liều đối với người già.

Không cần điều chỉnh liều cho bệnh nhân suy gan hoặc suy thận ở mức độ từ nhẹ đến trung bình nếu độ thanh thải creatinin ≥ 10 ml/phút.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

- Mẫn cảm hay nghi ngờ mẫn cảm với letrozol, các chất ức chế enzym aromatase khác hay với bất kỳ thành phần nào của thuốc.
- Phụ nữ có thai hay cho con bú, phụ nữ tiền mãn kinh.
- Suy gan nặng.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

- Các tác dụng phụ có liên quan đến letrozol thường ở mức nhẹ đến trung bình và hiếm có trường hợp nghiêm trọng phải ngừng điều trị. Nhiều tác dụng phụ có thể liên quan đến bản thân bệnh tật hoặc các hậu quả dược lý bình thường của việc thiếu estrogen (như đỏ bừng, thưa tóc).



- Các phản ứng phụ thường xảy ra như: đau cơ xương, đau khớp, nhức đầu, mệt mỏi, buồn nôn, khó thở, phù mạch ngoại vi, ho, táo bón, nôn, đau ngực, nhiễm virus, tiêu chảy, phát ban, đau bụng, khó tiêu, biếng ăn.
- Ít gặp: chóng mặt, tăng cân, ngứa.

Thông báo cho bác sĩ các tác dụng phụ gặp phải khi dùng thuốc.

THẬN TRỌNG

- Ở bệnh nhân ung thư vú bị rối loạn chức năng gan ở mức trung bình, không cần phải điều chỉnh liều lượng. Tuy nhiên, cần thận trọng vì letrozol được đào thải chủ yếu qua các chất chuyển hoá.
- Suy thận (hệ số thanh thải creatinin từ 20-50ml/phút): không ảnh hưởng đến nồng độ letrozol ở trạng thái ổn định trong huyết tương khi dùng liều 2,5mg hoặc 5mg. Vì vậy, không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy giảm chức năng thận. Letrozol có thể bị loại bỏ bằng quá trình thẩm tách máu vì letrozol gắn kết yếu với protein huyết tương. Nên cân nhắc kỹ giữa nguy cơ có thể xảy ra và lợi ích đạt được trước khi điều trị bằng letrozol.

TƯƠNG TÁC THUỐC

- Các nghiên cứu lâm sàng với cimetidin và warfarin cho thấy khi dùng đồng thời với letrozol không gây ra tương tác nào đáng kể mặc dù cimetidin ức chế một isoenzyme của CYP450 tham gia chuyển hoá letrozol trên *in-vitro*.

PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ

- Chưa có nghiên cứu đầy đủ và được kiểm soát tốt về việc sử dụng letrozol ở phụ nữ có thai. Không dùng letrozol cho phụ nữ có thai.
- Vẫn chưa biết letrozol có bài tiết qua sữa mẹ không nhưng nhiều thuốc có khả năng bài tiết qua sữa mẹ, do đó, không nên dùng letrozol cho phụ nữ cho con bú.

TÁC DỤNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE & VẬN HÀNH MÁY MÓC

Khi điều trị bằng letrozol, một số trường hợp có thể mệt mỏi, chóng mặt. Vì thế bệnh nhân cần được thông báo về khả năng ảnh hưởng đến thể lực và tinh thần khi vận hành máy móc hay lái xe.

QUÁ LIỀU

Hiếm có trường hợp quá liều nào của letrozol được báo cáo. Trong trường hợp đặc biệt, liều đơn cao nhất dùng là 62,5 mg hay sử dụng 25 viên, không có tác dụng phụ nguy hiểm nào được báo cáo trong những trường hợp này (do số liệu giới hạn), chưa có hướng dẫn chắc chắn nào cho việc điều trị quá liều, tuy nhiên có thể kích thích để bệnh nhân nôn. Cần phải chăm sóc và theo dõi thường xuyên các dấu hiệu sống. Trong thử nghiệm đơn liều thì liều cao nhất dùng là 30 mg, trong thử nghiệm đa liều thì liều cao nhất có thể dùng là 10 mg.

BẢO QUẢN: Bảo quản nơi khô mát dưới 30°C, tránh ánh sáng.

HẠN DÙNG: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

TRÌNH BÀY: Hộp 2 vỉ x 14 viên

- Để xa tầm tay trẻ em.
- Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.
- Nếu cần thêm thông tin, xin hỏi ý kiến bác sĩ.
- Thuốc này chỉ dùng theo sự kê đơn của thầy thuốc

Sản xuất bởi



**SUN PHARMACEUTICAL
INDUSTRIES LTD.**

Halol - Baroda Highway, Halol – 389 350,
Gujarat, Ấn Độ.

