

độ ăn, vận động, bỏ thuốc lá, hạn chế uống đồ uống có cồn.

Khi bị tăng cholesterol huyết có thể điều trị thuốc giảm lipid huyết.

#### Liều lượng và cách dùng

Liều uống ở phụ nữ người lớn: 2,5 mg/ngày, uống một lần trong ngày. Thời gian điều trị tối ưu chưa rõ. Ngừng điều trị khi không đáp ứng hoặc bệnh tiến triển nặng lên.

Do sự hấp thu thuốc không bị ảnh hưởng bởi thức ăn, nên có thể uống thuốc trước hoặc sau bữa ăn. Để dự phòng biến chứng loãng xương ở bệnh nhân điều trị bằng letrozol, cần bổ sung vitamin D và calci hàng ngày.

Bệnh nhân suy gan nhẹ hoặc trung bình không cần hiệu chỉnh liều, nhưng bệnh nhân xơ gan hoặc suy gan nặng cần giảm 50% liều, thường dùng liều 2,5 mg/ngày dùng cách ngày.

Không cần hiệu chỉnh liều ở bệnh nhân suy thận có  $Cl_{cr} \geq 10$  ml/phút.

#### Tương tác thuốc

Tamoxifen điều trị đồng thời với letrozol làm giảm nồng độ letrozol trong máu 38%. Nhưng kinh nghiệm lâm sàng chỉ ra rằng nếu dùng letrozol ngay sau tamoxifen thì tác dụng điều trị của letrozol không bị ảnh hưởng. Không dùng đồng thời letrozol với các thuốc điều hòa chọn lọc thụ thể estrogen khác như raloxifen vì làm giảm nồng độ letrozol trong huyết tương. Nếu cần chống loãng xương, nên dùng biphosphonat uống hơn dùng raloxifen.

Các estrogen làm giảm tác dụng dược lý của các thuốc ức chế aromatase, do đó tránh phối hợp letrozol với estrogen.

Letrozol chuyển hóa qua các isoenzym 3A4 và 2A6 của CYP450. Do đó, khi phối hợp với các thuốc gây cảm ứng hoặc ức chế các isoenzym này sẽ làm thay đổi chuyển hóa của letrozol. Tuy nhiên, cimetidin và diazepam không ảnh hưởng đến chuyển hóa letrozol. Mặt khác, letrozol ức chế mạnh CYP2A6 và ức chế yếu hơn CYP2C19. Do đó, dùng đồng thời letrozol có thể làm giảm chuyển hóa và làm tăng nồng độ trong huyết tương của các thuốc cũng chuyển hóa do các enzym này. Tuy nhiên, letrozol không ảnh hưởng đến chuyển hóa của warfarin và diazepam.

#### Quá liều và xử trí

Cho đến nay thông tin về quá liều ở người rất hạn chế. Điều trị triệu chứng và chăm sóc hỗ trợ, theo dõi các dấu hiệu sống là chủ yếu nếu có quá liều xảy ra. Có thể gây nôn nếu phát hiện sớm bệnh nhân mới uống thuốc quá liều.

Cập nhật lần cuối: 2018.

## LEUCOVORIN

(Acid folinic)

**Tên chung quốc tế:** Leucovorin, folinic acid.

**Mã ATC:** V03AF03 (folinat calci), V03AF06 (folinat natri).

**Loại thuốc:** Thuốc giải độc các chất đối kháng acid folic.

#### Dạng thuốc và hàm lượng

Thuốc thường dùng dưới các dạng muối calci hoặc natri, nhưng hàm lượng tính theo leucovorin (acid folinic).

Viên nén: 5 mg, 10 mg, 15 mg, 20 mg, 25 mg (dùng dạng leucovorin calci).

Dung dịch tiêm: 3 mg/ml, 7,5 mg/ml, 10 mg/ml (dùng dạng leucovorin calci).

Bột pha tiêm: 50 mg, 100 mg, 200 mg, 350 mg, 500 mg (dùng dạng leucovorin calci).

Dung dịch tiêm: 50 mg/ml (dùng dạng folinat dinatri).

#### Dược lực học

Leucovorin (acid folinic) là dẫn xuất 5-formyl của acid tetrahydrofolic (THF), dạng có hoạt tính của acid folic.

Acid folinic có vai trò như chất cộng tác của thymidylat synthase - là một enzym xúc tác tổng hợp thymidylat. Thymidylat là nucleotid cần thiết để tổng hợp DNA. Khác với acid folic, acid folinic không cần enzym dihydrofolat reductase để biến đổi thành dạng chất cộng tác của thymidylat synthase. Vì vậy acid folinic làm giảm tác dụng điều trị và độc tính của các thuốc đối kháng acid folic (ví dụ methotrexat) có cơ chế ức chế enzym dihydrofolat reductase.

Chất chuyển hóa của thuốc là 5,10-methenyltetrahydrofolat có tác dụng ổn định liên kết giữa acid fluorodeoxyridylic với thymidylat synthase nên làm tăng tác dụng chống ung thư của dẫn chất fluoropyrimidin (ví dụ fluorouracil).

Khi dùng với pyrimethamin để điều trị nhiễm trùng cơ hội, leucovorin làm giảm nguy cơ độc tính trên máu.

#### Dược động học

**Hấp thu:** Thuốc được hấp thu nhanh và tốt sau khi uống hoặc tiêm bắp. Sự hấp thu có thể đạt bão hòa sau khi uống liều trên 25 mg, sinh khả dụng đường uống khoảng 97% cho một liều 25 mg, 75% cho liều 50 mg và 37% cho liều 100 mg.  $C_{max}$  đạt được sau khi uống khoảng vài giờ, sau khi tiêm tĩnh mạch 10 phút (leucovorin và dạng khử folat chung) hoặc 1,3 giờ (5-methyl-THF) và sau khi tiêm bắp 28 phút (leucovorin), 2,8 giờ (5-methyl-THF) hoặc 52 phút (dạng khử folat chung). AUC của các dạng leucovorin, 5-methyl-THF và dạng khử folat chung tương tự nhau giữa đường tiêm bắp và tĩnh mạch. AUC của dạng khử folat chung khi uống một liều 25 mg bằng 92% so với đường tĩnh mạch. AUC đường tiêm bắp ở mông ít hơn 8% so với đường tiêm bắp ở cơ delta.

**Phân bố:** Sau khi uống, thuốc được phân bố đến toàn bộ các mô trong cơ thể, tập trung nhiều trong gan (chiếm khoảng một nửa tổng lượng folat trong cơ thể). Một lượng nhỏ của chất chuyển hóa có hoạt tính (5-methyl-THF) phân bố vào dịch não tủy. Thở tích phân bố chưa xác định. Leucovorin gắn với protein huyết tương khoảng 15%.

**Chuyển hóa:** Leucovorin (5-formyltetrahydrofolat) được chuyển hóa nhanh chóng và chủ yếu thành dạng có hoạt tính là 5-methyltetrahydrofolat (5-methyl-THF). 5-methyl-THF là dạng dự trữ và vận chuyển chính của folat trong cơ thể, chất này được sản xuất tại gan và niêm mạc ruột. Ngoài ra, leucovorin được chuyển hóa thành một folat khử khác là 5,10-methenyl-THF, có tác dụng ổn định liên kết của acid fluorodeoxyridylic với thymidylat synthase và do đó tăng cường ức chế enzym này.

**Thải trừ:** Leucovorin được đào thải chủ yếu qua nước tiểu dưới dạng không còn hoạt tính 10-formyl-THF và 5,10-methenyl-THF (80 - 90%) và 5 - 8% được đào thải qua phân. Nửa đời thải trừ qua đường uống là 3,5 - 5,7 giờ và qua đường tiêm bắp/tĩnh mạch khoảng 6,2 giờ.

#### Chỉ định

Phòng và giải độc khi dùng liều cao methotrexat trong điều trị ung thư xương (liệu pháp giải cứu folat).

Giải độc tính và tác dụng khi dùng quá liều hoặc do giảm thải trừ các chất đối kháng acid folic như methotrexat, pyrimethamin, trimethoprim...

Phối hợp với fluorouracil trong điều trị ung thư đại trực tràng di căn tiến triển.

Phòng và điều trị thiếu máu nguyên hồng cầu khổng lồ do thiếu acid folic.

#### Chống chỉ định

Quá mẫn với thuốc.

Thiếu máu ác tính hoặc thiếu máu nguyên hồng cầu khổng lồ thứ phát khác do thiếu vitamin B<sub>12</sub>, vì có thể che khuất triệu chứng huyết học trong khi các biến chứng thần kinh vẫn tiến triển.



**Thận trọng**

Khi dùng đồng thời với các chất kháng acid folic (methotrexat) hoặc 5-fluorouracil cần có sự giám sát trực tiếp của bác sĩ lâm sàng chuyên ngành ung thư.

Leucovorin có thể làm tăng độc tính, đặc biệt trên tiêu hóa của 5-fluorouracil (viêm ruột, ỉa chảy, mất nước), nhất là người già và suy nhược, do đó không nên dùng leucovorin trên bệnh nhân đang dùng 5-fluorouracil có độc tính trên tiêu hóa.

Nếu dùng đường tiêm, nên tiêm bắp hoặc tĩnh mạch, không tiêm nội tủy vì có thể gây tử vong.

Bệnh nhân có rối loạn hấp thu như không dung nạp galactose, thiếu enzym Lapp lactase hoặc kém hấp thu glucose-galactose thì không dùng leucovorin đường uống mà nên chuyển sang đường tiêm.

Thận trọng trên bệnh nhân suy thận vì thuốc đào thải qua thận.

Sử dụng đồng thời leucovorin với trimethoprim - sulfamethoxazol để điều trị viêm phổi cấp tính do *Pneumocystis carinii* ở bệnh nhân nhiễm HIV có liên quan đến tăng tỷ lệ thất bại điều trị và tử vong.

Thận trọng khi phối hợp leucovorin với fluoropyrimidin trên bệnh nhân ung thư di căn TKTW vì có thể gây co giật, ngất.

Thận trọng khi dùng đồng thời với các thuốc chống động kinh vì liều cao leucovorin có thể giảm hiệu quả thuốc chống động kinh và tăng tần suất co giật.

**Thời kỳ mang thai**

Leucovorin chưa có các bằng chứng nghiên cứu trên động vật sinh sản, vì vậy chưa rõ thuốc có gây hại cho thai nhi hoặc người mẹ hay không. Vì vậy chỉ sử dụng leucovorin cho phụ nữ mang thai khi thật cần thiết.

**Thời kỳ cho con bú**

Chưa có bằng chứng cho thấy leucovorin bài xuất qua sữa mẹ. Tuy nhiên cần thận trọng khi dùng leucovorin cho phụ nữ đang cho con bú.

**Tác dụng không mong muốn (ADR)**

ADR khi dùng leucovorin đơn độc thường ít gặp. Các ADR trong các liệu pháp điều trị nói chung bao gồm:

**Ít gặp**

Thần kinh, tâm thần: co giật, ngất xỉu, mất ngủ, kích động, trầm cảm.

Tiêu hóa: rối loạn tiêu hóa khi dùng liều cao.

**Hiếm gặp**

Phản ứng phản vệ, sốc phản vệ, dị ứng, mày đay, sốt.

**Các ADR khi phối hợp leucovorin với 5-fluorouracil, bao gồm****Rất thường gặp**

TKTW: mệt mỏi ( $\leq 13\%$ ), hôn mê ( $\leq 13\%$ ), khó chịu ( $\leq 13\%$ ).

Da liễu: rụng tóc (42 - 43%), viêm da (21 - 25%).

Tiêu hóa: viêm miệng (75 - 84%; mức độ  $\geq 3$ : 27 - 29%), buồn nôn (74 - 80%), tiêu chảy (66 - 67%), nôn (44 - 46%), biếng ăn (14 - 22%).

**Thường gặp**

Tiêu hóa: táo bón (3 - 4%).

Da: hội chứng bàn tay - chân.

Nhiễm trùng (3 - 8%).

**Ít gặp**

Sốc phản vệ, phản ứng phản vệ, quá mẫn, co giật, ngất xỉu.

**Chưa xác định được tần suất**

Độc tính trên tiêu hóa, phản ứng dị ứng, mày đay, tăng amoniac huyết.

**Hướng dẫn cách xử trí ADR**

Nếu tác dụng phụ nhẹ thường chỉ cần ngừng thuốc. Nếu dị ứng nặng cần tiến hành điều trị hỗ trợ (thông khí, thở oxygen, dùng kháng histamin, corticoid...).

**Liều lượng và cách dùng****Cách dùng**

Nên dùng càng sớm càng tốt khi quá liều chất kháng acid folic để giảm độc tính trên máu, nếu quá 4 giờ có thể việc giải độc không còn hiệu quả.

Leucovorin được dùng đường uống, tiêm bắp, tiêm hoặc truyền tĩnh mạch, không dùng tiêm nội tủy.

Tốc độ truyền tĩnh mạch tối đa được khuyến cáo là 160 mg/phút do dung dịch truyền có chứa calci.

Để tiêm truyền tĩnh mạch, có thể pha loãng leucovorin với dung dịch natri clorid 0,9% hoặc dung dịch glucose 5% trước khi sử dụng.

Nếu bệnh nhân có rối loạn tiêu hóa (buồn nôn, nôn...) và cần liều  $> 25$  mg thì nên dùng đường tiêm thay vì đường uống. Sự hấp thu leucovorin có thể đạt trạng thái bão hòa, do đó liều dùng đường uống được khuyến cáo không vượt quá 25 mg.

**Liều cho người lớn:****Giải độc methotrexat liều cao**

Liều khuyến cáo leucovorin dựa vào liều của methotrexat, khoảng 12 - 15 mg/m<sup>2</sup> truyền tĩnh mạch trên 4 giờ.

Liều leucovorin khởi đầu dùng đường uống, tiêm bắp, tĩnh mạch 15 mg (10 mg/m<sup>2</sup>) bắt đầu 24 giờ sau khi bắt đầu truyền methotrexat, tiếp tục 6 giờ/lần, dùng 10 liều cho đến khi nồng độ methotrexat dưới 0,05 micromol. Nếu có độc tính trên tiêu hóa như nôn, buồn nôn, leucovorin nên dùng đường tiêm tĩnh mạch hoặc tiêm bắp. Theo dõi bù dịch, điện giải và kiểm hóa nước tiểu (pH nước tiểu  $\geq 7$ ) liên tục. Điều chỉnh liều leucovorin tùy thuộc vào từng tình huống cụ thể như sau:

**Thải trừ methotrexat bình thường** (nồng độ methotrexat trong huyết thanh khoảng 10 micromol tại 24 giờ sau khi dùng thuốc, 1 micromol sau 48 giờ và dưới 0,2 micromol sau 72 giờ): uống, tiêm bắp, tiêm tĩnh mạch: 15 mg/lần, 6 giờ/lần, trong 60 giờ (10 liều), bắt đầu 24 giờ sau khi bắt đầu truyền methotrexat.

**Chậm thải trừ methotrexat muộn** (nồng độ methotrexat huyết thanh còn lại trên 0,2 micromol sau 72 giờ và trên 0,05 micromol ở thời điểm 96 giờ sau khi dùng): Tiếp tục dùng leucovorin 15 mg (uống, tiêm bắp hoặc tiêm tĩnh mạch) 6 giờ/lần cho đến khi mức methotrexat dưới 0,05 micromol.

**Chậm thải trừ methotrexat sớm và/hoặc tổn thương thận cấp tính** (nồng độ methotrexat huyết thanh  $\geq 50$  micromol sau 24 giờ, hoặc  $\geq 5$  micromol sau 48 giờ, hoặc nồng độ creatinin huyết thanh tăng gấp đôi ở thời điểm 24 giờ sau khi dùng methotrexat): Tiêm tĩnh mạch leucovorin 150 mg mỗi 3 giờ cho đến khi nồng độ methotrexat dưới 1 micromol, sau đó giảm liều đến 15 mg mỗi 3 giờ cho đến khi mức methotrexat dưới 0,05 micromol.

**Giảm thải trừ methotrexat hoặc quá liều do vô ý**

Dùng leucovorin càng sớm càng tốt trong vòng 24 giờ sau khi quá liều methotrexat nếu có chậm thải trừ. Dùng leucovorin 10 mg/m<sup>2</sup> đường uống, tiêm bắp hoặc tĩnh mạch mỗi 6 giờ tới khi nồng độ methotrexat dưới 0,01 micromol. Theo dõi nồng độ creatinin huyết thanh và methotrexat trong máu sau 24 giờ. Nếu nồng độ creatinin tăng lên 50% so với bình thường hoặc nồng độ methotrexat trên 5 micromol sau 24 giờ hoặc trên 0,9 micromol sau 48 giờ thì nên tăng liều leucovorin lên 100 mg/m<sup>2</sup> tiêm tĩnh mạch mỗi 3 giờ cho tới khi nồng độ methotrexat dưới 0,01 micromol.

Bù dịch (3 lít/ngày) và kiểm hóa nước tiểu với natri bicarbonat nên được dùng đồng thời, chỉnh liều bicarbonat để duy trì pH nước tiểu  $\geq 7$ .

**Giải độc các chất đối kháng acid folic khác**

**Phòng và điều trị độc tính của trimetrexat:** Để dự phòng, leucovorin được dùng hàng ngày trong quá trình điều trị bằng trimetrexat và



trong 72 giờ sau liều trimetrexat cuối cùng. Liều thường dùng là 20 mg/m<sup>2</sup>, mỗi 6 giờ, đường uống hoặc đường tĩnh mạch từ 5 đến 10 phút, tổng liều hàng ngày là 80 mg/m<sup>2</sup>. Liều hàng ngày được điều chỉnh tùy theo độc tính. Trong trường hợp điều trị quá liều trimetrexat, sau khi đã ngừng trimetrexat, có thể tiêm tĩnh mạch leucovorin với liều 40 mg/m<sup>2</sup>, mỗi 6 giờ một lần trong 3 ngày.

**Điều trị độc tính của trimethoprim:** Sau khi ngừng trimethoprim, tiêm tĩnh mạch hoặc tiêm bắp leucovorin liều 3 - 10 mg/ngày cho đến khi các số lượng tế bào máu phục hồi.

**Điều trị độc tính của pyrimethamin:** Trong trường hợp dùng pyrimethamin liều cao hoặc liều thấp nhưng kéo dài, trong thời gian điều trị dùng đồng thời leucovorin liều 5 - 50 mg/ngày, tùy thuộc số lượng tế bào máu ngoại vi.

#### **Thiếu máu hồng cầu không lồ do thiếu acid folic**

Liều uống 15 mg mỗi ngày. Nếu tiêm bắp hoặc tĩnh mạch, khuyến cáo dùng liều không quá 1 mg mỗi ngày vì liều cao hơn cũng không có hiệu quả hơn.

#### **Ung thư đại trực tràng tiến triển (phối hợp với 5-fluorouracil)**

Nên áp dụng một trong hai phác đồ sau:

1. Leucovorin liều 200 mg/m<sup>2</sup> tiêm tĩnh mạch chậm trong ít nhất 3 phút, sau đó là 5-fluorouracil liều 370 mg/m<sup>2</sup> tiêm tĩnh mạch.
2. Leucovorin liều 20 mg/m<sup>2</sup> tiêm tĩnh mạch tiếp theo là 5-fluorouracil liều 425 mg/m<sup>2</sup> tiêm tĩnh mạch.

5-fluorouracil và leucovorin nên dùng riêng bơm tiêm để tránh tạo thành kết tủa. Điều trị hàng ngày trong 5 ngày. Liệu trình thứ hai bắt đầu sau 4 tuần (28 ngày), sau đó lặp lại trong khoảng thời gian 4 - 5 tuần (28 - 35 ngày) với điều kiện là bệnh nhân đã hoàn toàn hồi phục các tác dụng không mong muốn sau liệu trình trước. Trong quá trình điều trị tiếp theo, liều lượng của 5-fluorouracil nên được điều chỉnh dựa trên sự dung nạp của bệnh nhân. Liều lượng leucovorin không cần điều chỉnh theo độc tính.

#### **Liều cho trẻ em:**

**Giải độc methotrexat:** Uống hoặc tiêm truyền tĩnh mạch với liều như người lớn.

**Quá liều methotrexat:** Tiêm truyền tĩnh mạch với liều như người lớn.

#### **Điều trị thiếu máu hồng cầu không lồ do thiếu acid folic**

Trẻ em < 12 tuổi: Uống 250 microgam/kg, 1 lần/ngày.

Trẻ em 12 - 17 tuổi: Uống 15 mg/lần, 1 lần/ngày.

#### **Điều trị rối loạn chuyển hóa dẫn đến thiếu folat**

Uống hoặc tiêm truyền tĩnh mạch 15 mg/lần, 1 lần/ngày.

#### **Dự phòng thiếu máu hồng cầu không lồ do điều trị nhiễm Toxoplasma bẩm sinh bằng pyrimethamin và sulfadiazin**

Trẻ sơ sinh: Uống 5 mg/lần, 3 lần/tuần, tăng lên đến 20 mg, 3 lần/tuần nếu giảm bạch cầu trung tính.

Trẻ 1 tháng - 1 tuổi: Uống 10 mg/lần, 3 lần/tuần.

#### **Tương tác thuốc**

Khi dùng leucovorin kết hợp với thuốc đối kháng acid folic (như co-trimoxazol, pyrimethamin, methotrexat), hiệu quả của chất đối kháng acid folic có thể bị giảm hoặc mất.

Leucovorin có thể làm giảm tác dụng của các thuốc chống động kinh: phenobarbital, primidon và phenytoin, succinimid và có thể làm tăng tần suất co giật (giảm nồng độ thuốc chống co giật trong huyết tương do hiện tượng cảm ứng enzym gây tăng chuyển hóa qua gan).

Cần thận trọng khi dùng đồng thời với fluoropyrimidin vì có thể gây ra co giật và ngất.

Dùng đồng thời leucovorin với 5-fluorouracil làm tăng cả hiệu quả và độc tính của 5-fluorouracil.

Glucarpidase là thuốc giải độc tính trên thận do methotrexat, có thể

làm giảm hiệu quả của leucovorin do đó không dùng leucovorin trong vòng 2 giờ trước hoặc sau khi dùng glucarpidase.

#### **Tương kỵ**

Không được trộn lẫn leucovorin với 5-fluorouracil vì gây kết tủa.

#### **Quá liều và xử trí**

**Triệu chứng:** Chưa có báo cáo nào về trường hợp quá liều leucovorin, tuy nhiên nếu dùng leucovorin với liều quá lớn có thể làm giảm hiệu quả điều trị của các chất đối kháng acid folic.

**Xử trí:** Không có thuốc giải độc đặc hiệu. Điều trị hỗ trợ. Nếu dùng quá liều khi phối hợp leucovorin với 5-FU thì tuân theo hướng dẫn xử trí như quá liều 5-FU.

*Cập nhật lần cuối: 2020.*

## **LEUPRORELIN (Leuprolid)**

**Tên chung quốc tế:** Leuporelin.

**Mã ATC:** L02AE02.

**Loại thuốc:** Thuốc tương tự hormon giải phóng gonadotropin.

#### **Dạng thuốc và hàm lượng**

Leuporelin thường được dùng dưới dạng muối leuporelin acetat (3,75 mg leuporelin acetat tương ứng 3,57 mg leuporelin base), hàm lượng leuporelin trong chế phẩm là hàm lượng tính theo leuporelin acetat.

Bột và dung môi pha hỗn dịch tiêm bắp, dạng giải phóng kéo dài, hàm lượng leuporelin trong mỗi ống: 3,75; 7,5; 11,25; 15; 22,5; 30; 45 mg.

Bột và dung môi pha hỗn dịch tiêm dưới da, dạng giải phóng kéo dài, hàm lượng leuporelin trong mỗi ống: 7,5; 22,5; 30; 45 mg.

Dung dịch leuporelin acetat tiêm dưới da: 5 mg/ml.

Que cấy có sẵn trong ống tiêm chuyên dụng để cấy dưới da: 11,25 mg leuporelin acetat.

#### **Được lực học**

Hormon giải phóng gonadotropin (GnRH) là một hormon decapeptid của vùng dưới đồi, có tác dụng điều hòa tổng hợp và tiết hormon kích thích nang trứng (FSH) và hormon tạo hoàng thể (LH). Các hormon này kích thích tổng hợp hormon steroid tuyến sinh dục. Leuporelin là một dạng tổng hợp của GnRH tự nhiên, tiềm lực mạnh hơn hormon tự nhiên. Khi bắt đầu dùng, leuporelin gây tăng tạm thời nồng độ gonadotropin, điều này dẫn đến tăng tạm thời các steroid như FSH, LH, testosterone và estradiol trong tuần hoàn. Khi điều trị liên tục và dài hạn, leuporelin có tác dụng ngăn chặn lâu dài việc tiết gonadotropin tuyến yên thông qua ức chế receptor GnRH tuyến yên, do đó làm giảm kéo dài LH, FSH và giảm đáng kể việc sản xuất hormon steroid của tinh hoàn và buồng trứng. Nồng độ testosterone trong huyết thanh ở nam giảm tới mức tương đương phẫu thuật cắt bỏ tinh hoàn trong vòng 2 - 4 tuần. Kết quả chức năng sinh lý và các mô phụ thuộc testosterone không hoạt động. Điều này giúp thoái triển ung thư tuyến tiền liệt và cải thiện triệu chứng trên phần lớn bệnh nhân. Các tác dụng này thường phục hồi sau khi ngừng điều trị. Ở nữ, nồng độ estradiol trong huyết thanh giảm tới mức tương tự ở người sau mãn kinh trong vòng 1 tháng sau khi bắt đầu dùng leuporelin ở phụ nữ tiền mãn kinh. Kết quả chức năng sinh lý và các mô phụ thuộc estrogen không hoạt động. Ở trẻ em dậy thì sớm thể trung ương (do hoạt hóa sớm trục dưới đồi - tuyến yên - tuyến sinh dục trước dậy thì), dùng kéo dài leuporelin ức chế giải phóng gonadotropin tuyến yên làm giảm nồng độ estradiol hoặc testosterone tới giá trị trong phạm