

甲苯磺酸依仑司群获批上市

文 / 国家癌症中心/国家肿瘤临床医学研究中心/中国医学科学院北京协和医学院肿瘤医院 贺飞

关键词: 甲苯磺酸依仑司群; 晚期乳腺癌; 选择性雌激素受体降解剂

2026年6月22日, 国家药品监督管理局正式批准甲苯磺酸依仑司群片上市。该药品可单药使用或与阿贝西利联合使用, 治疗既往接受过内分泌治疗的雌激素受体(ER)阳性、人表皮生长因子受体2(HER2)阴性、雌激素受体1(ESR1)突变的局部晚期或转移性乳腺癌成人患者。

一、晚期乳腺癌的治疗现状

乳腺癌是全球女性发病率最高的恶性肿瘤, 男性亦可罹患此病。每年新发乳腺癌患者中, 5%~10%初诊时即已发生远处转移, 另有20%~30%的早期患者后续会进展为晚期乳腺癌, 包括局部晚期、复发及转移性病变。

当前, 晚期乳腺癌虽尚无法根治, 但新型药物和优化治疗策略的不断涌现, 可以有效缓解临床症状, 改善患者生活质量, 使患者实现长期带瘤生存。其中, ER阳性、HER2阴性亚型患者的获益尤为显著, 中位总生存期(OS)已由过去的2~3年延长至约5年。然而, 该类患者在长期接受内分泌治疗后, 易出现ESR1获得性耐药突变, 进而导致内分泌治疗耐药及疾病进展。

二、ESR1突变型乳腺癌的药物治疗现状

化疗与内分泌治疗是ER阳性、HER2阴性晚期乳腺癌的传统治疗方法。随着抗体药物偶联物(ADC)、细胞周期蛋白依赖性激酶4/6(CDK4/6)抑制剂等新型抗肿瘤药物的不断涌现, 晚期乳腺癌的药物治疗格局也在不断演进。

针对内分泌治疗后出现ESR1突变的转移性乳腺癌, 研究者正在积极探索新的口服内分泌治疗药物或联合用药方案。

三、甲苯磺酸依仑司群的临床疗效及安全性

甲苯磺酸依仑司群是一种选择性雌激素受体降解剂(SERD)。该药可作用于ER, 在阻断雌激素作用的同时引起ER构象改变, 促使ER降解, 从而抑制肿瘤细胞增殖并诱导其凋亡。值得关注的是, 甲苯磺酸依仑司群对ESR1突变的ER同样有效, 而现有SERD类药物(如氟维司群)对此类突变的作用则明显偏弱。

该药的获批上市主要基于一项多中心、随机、开放标签的Ⅲ期临床试验。该临床试验共纳入874名受试者, 其按1:1:1随机分配至三组, 分别接受甲苯磺酸依仑司群单药治疗、标准内分泌治疗、甲苯磺酸依仑司群联合阿贝西利治疗。结果显示: 甲苯磺酸依仑司群单药组的中位无进展生存期(PFS)为5.5个月, 常规内分泌治疗组仅为3.8个月, 而甲苯磺酸依仑司群联合阿贝西利组为11.1个月。

安全性方面, 甲苯磺酸依仑司群的大多数不良事件为低级别(1~2级), 发生率超过10%的不良反应包含疲劳、腹泻、恶心、中性粒细胞减少等。

此前, 国内仅氟维司群一款SERD类药物可供临床使用, 且给药方式为肌肉注射。甲苯磺酸依仑司群作为国内首款获批的口服SERD制剂, 为晚期乳腺癌患者提供了新的治疗选择。

本文编辑: 李修坤