

# 甲苯磺酸依仑司群片 (择叙®)

中国首个且唯一精准靶向ESR1突变\*

1类新药，弥补中国ESR1突变患者治疗短板

拮抗&降解双重机制，可穿透血脑屏障

## 基本医保目录外新通用名药品申报：

- 单药用于既往接受过内分泌治疗的ER阳性、HER2阴性、ESR1突变的局部晚期或转移性乳腺癌成人患者
- **【全球首批】** 联合阿贝西利用于既往接受过内分泌治疗的ER阳性、HER2阴性、ESR1突变的局部晚期或转移性乳腺癌成人患者

# 目录

## 01 基本信息

- **1类新药<sup>1</sup>**，中国首个且唯一精准靶向ESR1突变\*
- 建议**空白参照**，“**突破**”创新评级

## 02 创新性

- “拮抗和降解”**双重作用机制<sup>2,3</sup>**，突破ESR1突变耐药
- 可**穿透血脑屏障<sup>2,3</sup>**，安全性良好<sup>4</sup>，口服便捷<sup>5</sup>，填补空白

## 03 有效性

- 依仑司群中位**OS获益延长11.4个月**，**中国患者**疗效获益趋势一致<sup>6-8</sup>
- 联合阿贝西利进一步获益，中位**PFS达11.1个月**，ORR达到39%<sup>6,7,9</sup>

## 04 安全性

- 无黑框警告，安全性良好，**中国患者安全性特征与整体人群一致<sup>5-8</sup>**
- 不良反应临床可管可控，**特殊人群**无需调整剂量<sup>5#</sup>

## 05 公平性

- 填补**ESR1突变**晚期乳腺癌患者**精准靶向治疗的空白**
- **靶点明确**，需精准基因检测诊断，纳入医保后预估适用患者**不足4000**

\*根据依仑司群在中国获批时间，依仑司群是中国首个且唯一精准靶向ESR1突变ER+/HER2-晚期乳腺癌患者的药物

#特殊人群包括老年患者，轻度肝功能损伤患者，轻度或中度肾功能损伤患者

1. <https://www.cde.org.cn/main/xxgk/listpage/9f9c74c73e0f8f56a8bfb646055026d> 2. Bhagwat SV, et al. Cancer Res. 2025;85(4):777-790. 3. Brett JO, et al. Breast Cancer Res. 2021;23(1):85. 4. Jhaveri KL, et al. Ann Oncol. 2026;37(4):532-543. 5. 甲苯磺酸依仑司群片说明书. 6. Jhaveri KL, et al. Ann Oncol. 2026;37(4):532-543. 7. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med. 2025;392(12):1189-1202. 8. Qingyuan Zhang, et al 2026 ESMO BC 571eP. 9. Komal L. Jhaveri, et al. 2025 SABCS Abstract.

# ESR1突变是ER+/HER2-晚期乳腺癌患者内分泌耐药的重要临床挑战；亟需有效、精准的靶向药物纳入医保

ESR1突变是内分泌耐药与疾病进展的关键驱动因素之一，亟需突破性治疗



## 关键突变，引发耐药

- 内分泌治疗耐药患者中，**ESR1突变率约25.8%**<sup>1</sup>
- ESR1突变是**内分泌治疗失败**的重要原因之一<sup>2</sup>



## 预后更差，生存期更短

- 接受内分泌治疗的**ESR1突变患者**的中位**PFS不足3个月**，中位**OS仅约20个月**<sup>3</sup>
- ESR1突变可能是脑转移过程的关键驱动事件<sup>4</sup>



## 传统治疗机制受限且入脑不足

- ESR1突变导致传统药物\*与受体的结合亲和力降至原来的**1/40**，疗效不佳<sup>2</sup>
- 传统药物**难以穿透血脑屏障**<sup>5</sup>，ESR1突变伴脑转移患者亟需有效的新治疗手段

## 权威指南关注ESR1突变，亟需精准靶向治疗实现获益最大化

- ESR1突变是国内外权威指南**广泛认可**且**明确推荐检测**的关键靶点<sup>6-10</sup>
- **针对ESR1突变开展精准靶向治疗**，已成为提升ER+/HER2-晚期乳腺癌患者临床获益的重要手段<sup>6,9,10</sup>



高证据 强推荐

ASCO<sup>®</sup> AMERICAN SOCIETY OF CLINICAL ONCOLOGY

NCCN National Comprehensive Cancer Network<sup>®</sup>

ESMO

GOOD SCIENCE  
BETTER MEDICINE  
BEST PRACTICE

(IA级)



备注：\*传统治疗药物指氟维司群。缩写：ESR1，雌激素受体1；OS，总生存期；PFS，无进展生存期；HR+/HER2-，激素受体阳性/人表皮生长因子受体2阴性

1. Zhu W, et al. *Onco Targets Ther*. 2020;13:615-621. 2. Brett JO, et al. *Breast Cancer Res*. 2021;23(1):85. 3. Chandarlapaty S, et al. *JAMA Oncol*. 2016;2(10):1310-1315. 4. Nguyen TT, et al. *Cancers (Basel)*. 2023;15(6):1728. Published 2023 Mar 12. 5. Bhagwat SV, et al. *Cancer Res*. 2025;85(4):777-790. 6. 中国抗癌协会肿瘤病理专业委员会等. *中华肿瘤杂志*, 2025, 47(10): 929-945. 7. 中华医学会病理学分会等. *中华病理学杂志*, 2025, 54(10): 1039-1049. 8. Burstein HJ, et al. 2023 Jun 20;41(18):3423-3425. 9. NCCN Clinical Practice Guidelines in Oncology: Breast Cancer, Version 4. 2025. 10. ESMO Metastatic Breast Cancer Living Guideline v1.2. 2025

# 依仑司群是中国首个且唯一精准靶向ESR1突变晚期乳腺癌患者的药物； 1类新药，填补ESR1突变精准靶向治疗空白，建议空白参照

通用名：甲苯磺酸依仑司群片

申报目录类别：基本医保目录

适应症<sup>1</sup>：（1）本品单药用于既往接受过内分泌治疗的ER阳性、HER2阴性、ESR1突变的局部晚期或转移性乳腺癌成人患者；（2）本品联合阿贝西利用于既往接受过内分泌治疗的ER阳性、HER2阴性、ESR1突变的局部晚期或转移性乳腺癌成人患者

注册分类<sup>4</sup>：1类新药

注册规格：200mg，片剂

用法用量<sup>1</sup>：400mg 口服，每日一次

首次上市时间及国家<sup>2</sup>：2025年9月，美国

中国大陆首次上市时间：预计2026年6月

专利到期时间：2039年7月

是否是独家：是

## 参照药建议：空白参照

- 中国**唯一精准靶向ESR1突变人群**的药物\*
- **无适应症相同**的药物纳入医保目录<sup>3</sup>
- 填补内分泌治疗后**ESR1突变的精准靶向治疗**的临床和目录空白

## 价格锚点建议

**需要基因检测的小靶点晚期乳腺癌药物**

## 创新分级建议：突破

- **1类新药**<sup>4</sup>
- 联合适应症**全球首批**
- 突破耐药，**显著获益**<sup>6,7#</sup>
- 结构优化，**强效入脑**<sup>5</sup>

缩写：ER：雌激素受体；HER2：人表皮生长因子受体2；ESR1：雌激素受体1

\*根据依仑司群在中国获批时间，依仑司群是中国首个且唯一精准靶向ESR1突变ER+/HER2-晚期乳腺癌患者的药物；#依仑司群单药在ESR1突变人群或联合阿贝西利在全人群的中位PFS相较于标准治疗均有显著获益

1. 甲苯磺酸依仑司群片中国说明书. 2. <https://www.fda.gov/drugs/resources-information-approved-drugs/fda-approves-implunestrant-er-positive-her2-negative-esr1-mutated-advanced-or-metastatic-breast>. 3. 国家基本医疗保险、工伤保险和生育保险药品目录（2025年）. 4. CDE官网. 5. Bhagwat SV, et al. Cancer Res. 2025;85(4):777-790. 6. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med. 2025;392(12):1189-1202. 7. Jhaveri KL, et al. Ann Oncol. 2026;37(4):532-543.

# 依仑司群具备“拮抗和降解”双重作用机制，突破ESR1突变耐药；可穿透血脑屏障，安全良好，口服便捷，填补空白

## 机制创新：拮抗&降解双重作用<sup>1</sup>

雌激素受体ERα高亲和力高选择性拮抗剂

**持续抑制：**阻断受体信号，持续抑制ERα依赖型基因转录，强效抑制ER+乳腺癌细胞增殖

持续抑制：抑制基因转录



诱导降解：促进泛素-蛋白酶体识别降解

**诱导降解：**诱导受体构象改变，使其更易被泛素-蛋白酶体系统识别并降解，清除功能性ERα (包括ESR1突变体)

## 填补空白，突破ESR1突变耐药

对ESR1野生型和突变型均能产生强效且持久的应答，阻断ER介导的信号通路，**从机制上克服ESR1突变耐药<sup>2</sup>**

## 结构优化，血脑屏障穿透性高

具有优化的分子结构设计和**优异的血脑屏障穿透能力**，脑内药物暴露量显著高于传统药物\*(464 nmol/L vs. 11nmol/L)<sup>1</sup>

## 安全良好，无黑框警告

依仑司群组≥3级不良反应及严重不良反应发生率均**低于对照组**，因AE导致的停药率为5%<sup>3</sup>

## 给药便捷，口服依从性更优

**每日口服1次**，无需依赖注射给药即可实现强效获益，大幅提升患者用药依从性，减轻患者治疗负担<sup>4</sup>

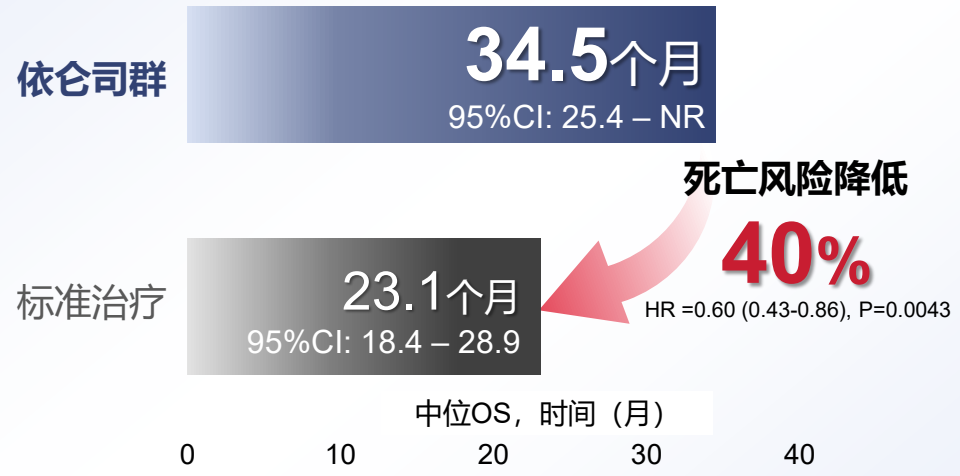
备注：\*传统药物指氟维司群。缩写：Era：雌激素受体α；ESR1突变：雌激素受体1突变

1. Bhagwat SV, et al. Cancer Res. 2025;85(4):777-790. 2. Jhaveri KL, et al. J Clin Oncol. 2024;42(35):4173-4186. 3. Jhaveri KL, et al. Ann Oncol. 2026;37(4):532-543. 4. 甲苯磺酸依仑司群片说明书

# 依仑司群单药中位OS获益延长11.4个月，中国患者疗效获益趋势一致； 脑转移事件复发或进展累积风险降低82%

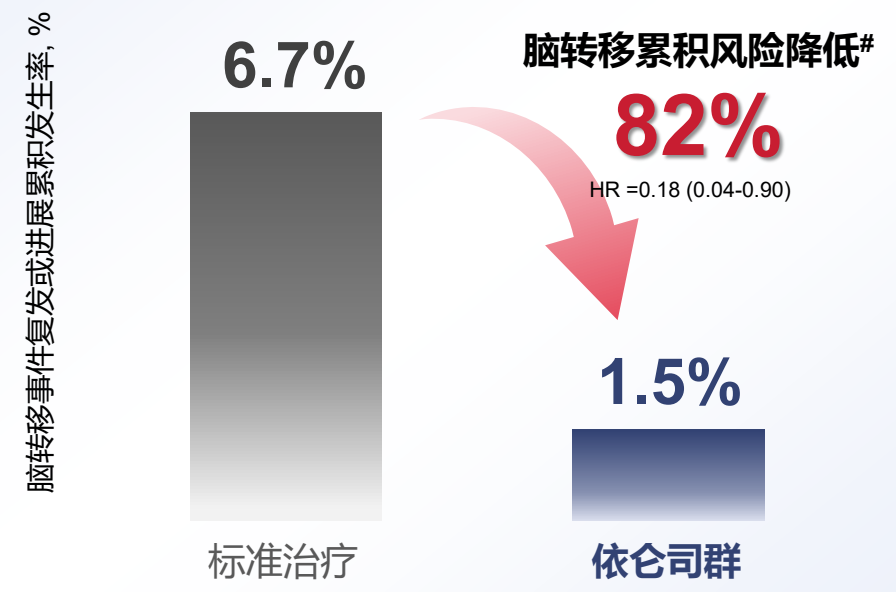
The NEW ENGLAND JOURNAL of MEDICINE 依仑司群3期临床研究 (EMBER-3) 发表于《新英格兰医学杂志》 (IF值: 74.699)

**中位OS延长11.4个月, 达34.5个月<sup>1,2\*</sup>**  
肿瘤疗效“金标准”，最高级别终点指标



**依仑司群在中国人群的OS疗效趋势与全球人群获益一致 (HR = 0.54)<sup>3\*\*</sup>**

**脑转移事件复发或进展累积风险降低82%<sup>1,2#</sup>**  
影响患者生存与生活质量的关键预后指标



\*相较于依仑司群，依仑司群联合阿贝西利在24个月时观察到OS曲线开始分离 (HR=0.82 (0.59-1.16))，依仑司群联合阿贝西利的中位OS尚未达到；\*\* HR = 0.54, 95%CI: 0.14, 2.18. #Post-hoc分析显示，依仑司群具有更低的脑转移事件复发或进展的趋势，考虑到事件发生率低，HR估计值应谨慎解读  
备注：标准治疗组为内分泌治疗。缩写：CDK4/6i：细胞周期蛋白依赖性激酶4/6抑制剂；OS，总生存期；NR，未达到；HR，风险比；95%CI，95%置信区间  
1. Jhaveri KL, et al. Ann Oncol. 2026;37(4):532-543. 2. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med. 2025;392(12):1189-1202. 3. Qingyuan Zhang, et al 2026 ESMO BC 571eP

# 依仑司群联合阿贝西利有进一步获益，中位PFS达到11.1个月，ORR达39%，临床疗效更优



The NEW ENGLAND  
JOURNAL of MEDICINE

依仑司群3期临床研究 (EMBER-3) 发表于《新英格兰医学杂志》 (IF值: 74.699)

## 联合阿贝西利中位PFS达11.1个月<sup>1,2</sup>

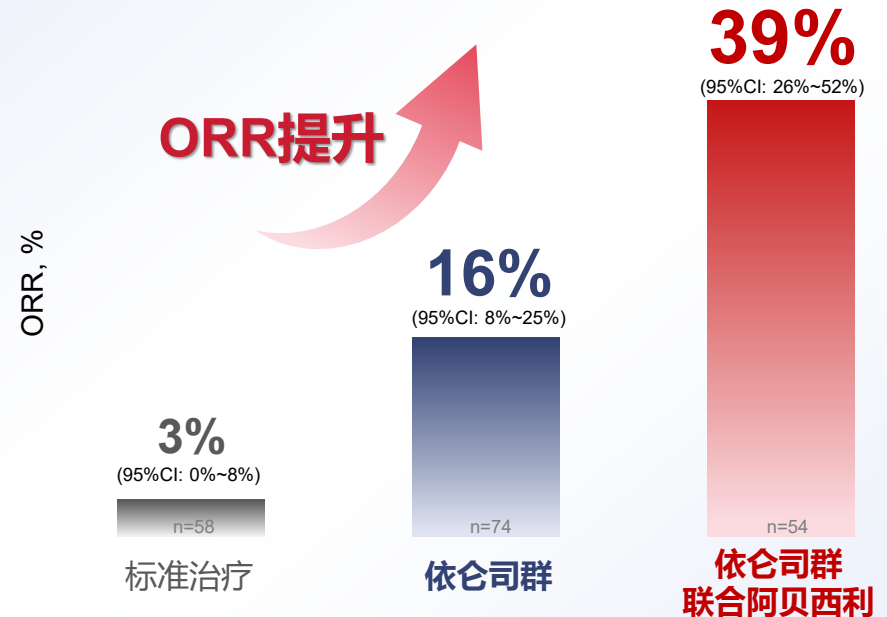
肿瘤疗效评价指标



EMBER-3研究以下主要研究终点达到显著性差异: ESR1突变人群 依仑司群 vs. 标准治疗, HR = 0.62 (0.47-0.82), p=0.0007; 依仑司群联合阿贝西利 vs. 依仑司群, HR = 0.57(0.44-0.73), P < 0.001

## 联合阿贝西利ORR提升至39%<sup>3</sup>

短期抗肿瘤活性的核心指标



备注: 标准治疗组为内分泌治疗。ORR为针对具有可测量病灶患者。缩写: PFS, 无进展生存期; ORR, 总体缓解率; HR, 风险比; 95%CI, 95%置信区间

\* 该分析是针对EMBER-3三期临床研究探索性终点(依仑司群联合阿贝西利 vs. 标准治疗)的ESR1突变亚组分析, data on file in Lilly. 该探索性分析未进行α控制, 相关结果主要用于描述性解读。考虑到样本量较小及基线特征可能存在差异, 疗效结果可能存在一定不确定性, 需在解读时予以谨慎考虑。

1. Jhaveri, et al.; SABCS 2025. 2. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med. 2025;392(12):1189-1202. 3. Komal L. Jhaveri, et al. 2025 SABCS Abstract

# 多个国内外权威指南/共识均推荐依仑司群用于ESR1突变晚期乳腺癌

## 《CSCO 乳腺癌指南 2026版》<sup>1</sup>



对于**携带ESR1突变**的激素受体阳性晚期乳腺癌患者，**依仑司群单药治疗相比标准内分泌治疗可显著延长PFS**，而联合CDK4/6抑制剂可进一步提高疗效。

## 《中国抗癌协会乳腺癌诊治指南与规范 (2026年版)》<sup>2</sup>



**依仑司群单药在ESR1突变**，联合阿贝西利在CDK4/6i经治HR阳性/HER2阴性晚期乳腺癌患者的**PFS优于**医师选择的**氟维司群或依西美坦单药**。

## 《NCCN 乳腺癌指南 (2026.v1)》<sup>3</sup>



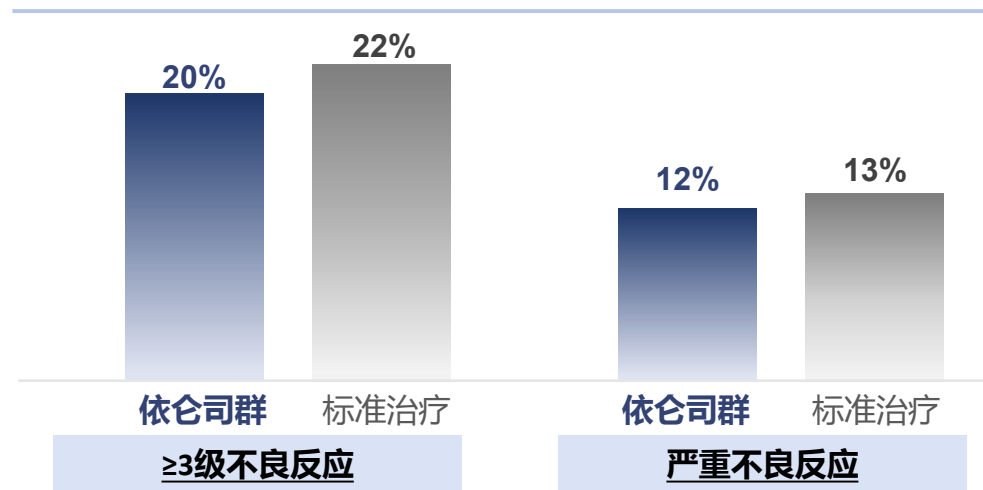
针对ER阳性/HER2阴性的复发性不可切除或IV期的乳腺癌患者，推荐依仑司群联合阿贝西利方案在二线及以上治疗中的特定情况下使用。**依仑司群联合阿贝西利方案在携带ESR1突变且既往未接受CDK4/6抑制剂治疗的患者中可能疗效最佳。**

# 依仑司群说明书无黑框警告，安全性良好，中国患者安全性特征一致；不良反应临床可管可控，特殊人群无需调整剂量

说明书及临床试验显示安全性整体良好，可管可控<sup>1-4</sup>

- **中国患者**耐受性良好，安全性可控，与全球人群一致
- FDA 说明书**无黑框警告**
- 与阿贝西利联用**无新的安全性信号**
- 常见不良反应多为轻中度（1-2级），以乏力，腹泻，恶心为主，可通过常用药物进行管理，整体安全性可控
- 因不良反应\*导致的**剂量调整**和**永久停药**比例较低，分别为**3%**和**5%**

≥3级不良反应及严重不良反应发生率**较对照组更低**



特殊人群  
无需调整剂量<sup>4</sup>

- **老年患者 (≥75岁)** 安全性特征与整体人群一致，无需调整量
- **轻度肝功能损伤**患者无需调整剂量
- **轻度或中度肾功能损伤**患者无需调整剂量

\*备注：不良反应指 TEAE, treatment-emergent adverse event

1. Qingyuan Zhang, et al 2026 ESMO BC 571eP. 2. Jhaveri KL, et al. Ann Oncol. 2026;37(4):532-543. 3. Jhaveri KL, et al. N Engl J Med. 2025;392(12):1189-1202. 4. 甲苯磺酸依仑司群片中国说明书

# 依仑司群填补ESR1突变晚期乳腺癌患者精准靶向治疗的空白， 实现高生存获益，用药便捷，易于临床和医保管理

## “补短板”

- 中国首个且唯一精准靶向ESR1突变晚期乳腺癌患者的1类新药，弥补临床治疗和目录短板
- 针对ESR1突变ER+/HER2-晚期乳腺癌脑转移这一治疗困境，依仑司群可穿透血脑屏障，降低脑转移事件复发或进展累积风险82%\*，弥补目录保障短板

## “人群小”

- 获批适应症明确，患者人群精准，纳入医保后经内分泌治疗的ER+/HER2-且伴有ESR1突变的晚期乳腺癌患者预估不足4000人
- 考虑依仑司群市场份额后，适用人数进一步缩小，医保基金影响可控

## “保基本”

- 当前我国临床唯一精准靶向ESR1突变、经内分泌治疗的ER+/HER2-晚期乳腺癌患者的创新药，开启ESR1突变乳腺癌患者精准靶向治疗新时代
- 中位OS延长11.4个月，助力“健康中国2030”总体癌症5年生存目标达成，帮助女性更好地回归社会和家庭

## “易管理”

- 靶点明确，需依据精准基因检测诊断，诊疗路径便于医保经办机构审核执行
- 口服给药，每日一次，减少频繁注射就医，便于临床管理