馨藥訊

Shin-Huey-Shin Hospital Drug Bulletin

心與心的守護 Sing Wish 馨蕙馨醫療體系

2026 11

發行人：尤瑜文 總院長｜編輯組：藥劑科編委會｜期別：115 年 11 月

出版處：馨蕙馨醫院 高雄市左營區明誠二路541號 電話：07-5586080轉1113

本期重點

子宮肌瘤相關經血過多的新治療選擇



新藥介紹 Yselty®

(linzagolix choline)

林語謙 藥師



一. 前言

子宮肌瘤（uterine fibroids，又稱uterine leiomyomas）是育齡女性常見的良性子宮腫瘤，可能引起經血過多、經期延長、骨盆腔疼痛、腹部壓迫感及貧血等症狀。其中，經血過多可能進一步造成缺鐵性貧血、疲倦及生活品質下降。子宮肌瘤的發生與遺傳及荷爾蒙調控等因素相關，雌激素與黃體素在肌瘤的生長與維持中扮演重要的角色，因此抑制卵巢性荷爾蒙分泌是藥物治療的重要策略之一。

現行的治療方式包括藥物與手術治療。藥物治療可依患者症狀、肌瘤大小與位置、生育規劃及共病情形選擇，例如tranexamic acid可減少經血量；口服避孕藥與黃體素可協助控制出血；促性腺激素釋放激素促效劑（GnRH agonist）如Leuplin®（leuprorelin）可以減少雌激素分泌並縮小肌瘤，但治療期間須考量低雌激素可能引起的熱潮紅及骨質密度下降等不良反應。手術治療適用於症狀嚴重、藥物治療效果不佳或有其他臨床需求者。綜上所述，如何兼顧症狀控制、肌瘤體積改善及治療安全性，仍是子宮肌瘤藥物治療的重要課題。



二. 藥物作用機轉

Yselty®（linzagolix choline）是一種新型口服促性腺激素釋放激素受體拮抗劑（GnRH antagonist），透過競爭性結合腦下垂體中的GnRH receptor，抑制內源性GnRH訊號傳導，降低黃體生成素（luteinizing hormone, LH）及濾泡刺激素（follicle-stimulating hormone, FSH)分泌，進而減少卵巢分泌雌二醇（estradiol）及黃體素（progesterone），減少子宮內膜增生與週期性出血，達到控制經血過多的效果。值得注意的是，不同於傳統GnRH agonist需經歷初期刺激後才逐漸抑制激素分泌，linzagolix可直接阻斷GnRH receptor，因此不會產生GnRH agonist使用初期可能出現的荷爾蒙反彈效應（flare effect）。此外linzagolix可透過不同劑量調整荷爾蒙的抑制程度，並可依治療需求合併荷爾蒙補充療法（add-back therapy, ABT），以減輕低雌激素相關不良反應。

三. 臨床試驗結果

Linzagolix治療子宮肌瘤相關經血過多的療效，主要來自兩項第三期隨機分派、雙盲、安慰劑對照試驗：PRIMROSE 1與PRIMROSE 2。兩項試驗共納入1,012名受試者（PRIMROSE 1為511人，PRIMROSE 2為501人），治療期間最長為52週。研究對象為有經血過多且經超音波確認子宮肌瘤的女性。受試者每日接受linzagolix 100 mg或200 mg，並依試驗組別合併或不合併ABT；主要療效指標為治療第24週時，月經失血量（menstrual blood loss, MBL）降至每週期80 mL以下，且相較基準值減少至少50%的受試者比例。兩項試驗均顯示linzagolix各治療組的主要療效反應率皆高於安慰劑組，其中以200 mg合併ABT組的反應率最高。此外治療組亦可達到改善貧血、疼痛症狀及健康相關生活品質。

表一、PRIMROSE 1與PRIMROSE 2於第24週的治療反應率

治療組別	PRIMROSE 1	PRIMROSE 2
安慰劑	35.0%	29.4%
Linzagolix 100 mg	56.4%	56.7%
Linzagolix 100 mg + ABT	66.4%	77.2%
Linzagolix 200 mg	71.4%	77.7%
Linzagolix 200 mg + ABT	75.5%	93.9%

註：治療反應定義為月經失血量 ≤80 mL／週期，且相較基準值減少至少50%ABT為每日 estradiol 1 mg 與 norethisterone acetate 0.5 mg

四. 劑量與用法

Yselty®為口服藥品，可與食物併服，200 mg劑量可由兩顆100 mg錠劑達成。開始治療前須排除懷孕，並建議於月經週期第一週開始使用，每日服用一次。依臺灣核准仿單，建議劑量如下：

●100 mg併用ABT或200 mg併用ABT：一般建議每日使用100 mg併用ABT，若有必要，可增加至200 mg併用ABT。

●100 mg單獨使用：適用於不建議併用ABT的女性（不可單用超過12個月）。

●200 mg單獨使用：適用於臨床上需要縮小子宮肌瘤體積時（不可單用超過6個月）。停藥後肌瘤體積可能再次增加。

由於linzagolix可能造成劑量及時間依賴性的骨質密度（bone mineral density, BMD）下降，長期使用時應特別注意骨質流失風險。若有必要延長療程或再次給藥，應評估骨質密度並審慎衡量治療效益與風險。

五. 不良反應與注意事項

在第三期臨床試驗中，linzagolix最常見的不良反應為熱潮紅及頭痛，且發生率與使用劑量有關；合併ABT可降低此類不良反應的發生率。此外，治療期間亦須留意骨質密度下降、情緒變化及肝臟酵素升高等問題。臨床使用前應排除懷孕，並評估患者的骨骼健康及相關禁忌症。

六. 結論

Yselty®（linzagolix choline）為口服GnRH受體拮抗劑，可藉由抑制腦下垂體GnRH訊號、降低卵巢性荷爾蒙濃度，進而改善子宮肌瘤相關經血過多。PRIMROSE 1與PRIMROSE 2第三期臨床試驗顯示，linzagolix可顯著提高月經失血量改善的反應率，並有助於改善貧血相關指標、疼痛及生活品質。其治療特色在於可依臨床治療目標及患者狀況選擇不同劑量，並在適當情況下合併ABT，以兼顧症狀控制並減少低雌激素相關不良反應及骨質密度流失的風險。然而，臨床使用前仍應評估患者的骨骼健康、肝腎功能、懷孕可能性與避孕需求、情緒變化及潛在藥物交互作用，並依核准仿單進行個別化治療與必要監測。





表二、院內現有藥品與Yselty® 之比較

	Yselty®	Leuplin®	口服避孕藥	Mirena®	Tranexamic acid
成分	linzagolix	leuprorelin	雌激素／黃體素複方	levonorgestrel	tranexamic acid
規格含量	100 mg/tab	3.75 mg/vial 11.25 mg/vial	依院內實際品項及成分含量而異	52 mg IUS	250 mg/cap
核准適應症	停經前女性因子宮肌瘤所引起的經血過多	1. 前列腺癌緩和治療 2. 子宮內膜異位 3. 中樞性性早熟 4. 因子宮肌瘤引起之經血過多而預計進行手術切除者 5. 停經前乳癌	1. 避孕 2. 月經相關症狀控制	1. 避孕 2. 月經經血過多 3. 預防雌激素補充治療引起的子宮內膜增生	全身及局部出血或出血性疾病
作用機轉	競爭性拮抗GnRH 受體，降低LH、FSH及卵巢性荷爾蒙分泌	GnRH 受體致效劑，持續刺激後抑制性腺激素分泌，降低卵巢性荷爾蒙濃度	透過荷爾蒙調控月經週期及子宮內膜增生	持續釋放levonorgestrel (黃體素)，主要作用於子宮內膜，使內膜變薄並減少出血	競爭性抑制Plasminogen，阻斷其活化為Plasmin，從而抑制纖維蛋白溶解反應以達到止血作用
給藥途徑	口服	皮下注射	口服	由醫師置入子宮腔內	口服
劑量與用法	每日口服一次 (ABT合併方式及療程依患者狀況而定)	每4週皮下注射3.75 mg 或每 12 週注射11.25 mg	每日口服一次 (依各產品服用方式使用)	初次使用者：月經開始後的 7 天內置入子宮腔內 (更換設備者不在此限，原則上每五年更換一次)	依適應症與醫囑服用

參考文獻

1. Bulun, S. E., Yin, P., Wei, J., Zuberi, A., Iizuka, T., Suzuki, T., Saini, P., Goad, J., Parker, J. B., Adli, M., Boyer, T., Chakravarti, D., & Rajkovic, A. (2025). UTERINE FIBROIDS. Physiological reviews, 105(4), 1947–1988. https://doi.org/10.1152/physrev.00010.2024

2. Kocaoz, S., Cirpan, R., & Degirmencioglu, A. Z. (2019). The prevalence and impacts heavy menstrual bleeding on anemia, fatigue and quality of life in women of reproductive age. Pakistan journal of medical sciences, 35(2), 365–370. https://doi.org/10.12669/pjms.35.2.644

3. Amendola, I. L. S., Spann, M., Segars, J., & Singh, B. (2024). The Mediator Complex Subunit 12 (MED-12) Gene and Uterine Fibroids: a Systematic Review. Reproductive sciences (Thousand Oaks, Calif.), 31(2), 291–308. https://doi.org/10.1007/s43032-023-01297-7

4. Wang, S., You, W., Ding, D., Liu, F., Han, F., & Tang, L. (2026). The estrogen-progestogen-oxidative stress network in uterine fibroids: mechanistic insights and therapeutic opportunities. Redox report : communications in free radical research, 31(1), 2622747. https://-doi.org/10.1080/13510002.2026.2622747

5. Diaz, I., Lumsden, M. A., & Zeppernick, M. (2025). Medical treatment of fibroids: FIGO best practice guidance. International journal of gynaecology and obstetrics: the official organ of the International Federation of Gynaecology and Obstetrics, 171(2), 507–512. https://doi.org/10.1002/ijgo.70497

6. Sparić, R., Hatirnaz, S., & Tinelli, A. (2025). Editorial: Uterine fibroid surgery in gynecology and obstetrics and reproduction: lights and shadows. Frontiers in surgery, 12, 1698612. https://doi.org/10.3389/fsurg.2025.1698612

7. Donnez, J., Petraglia, F., Taylor, H., Becker, C. M., Becker, S., Herrera, F. C., Bestel, E., Hori, S., & Dolmans, M. M. (2025). Linzagolix with and without hormonal add-back therapy for symptomatic uterine fibroids: PRIMROSE 1 & 2 long-term extension and withdrawal study. Fertility and sterility, 124(4), 737–748. https://doi.org/10.1016/j.fertnstert.2025.06.016