

RELUGOLIX (GnRH ANTAGONISTA ORALE) APPROVATO DA FDA PER IL TRATTAMENTO DEL K PROSTATICO

Coordinatore
 Vincenzo Toscano
Editors
 Marco Caputo & Renato Cozzi

Relugolix è un antagonista recettoriale selettivo del GnRH, alla cui famiglia appartengono anche cetrorelix e degarelix (già in commercio in Italia), elagolix e abarelix.

È stato recentemente approvato da FDA per il trattamento del cancro della prostata.

Il suo grande vantaggio consiste nella **somministrazione orale**, possibilmente a stomaco vuoto (1).

Efficacia: nello studio di fase III (2) la soppressione dei valori di testosterone (< 0.5 ng/mL) è stata ottenuta nel 96.7% dei soggetti trattati con relugolix (120 mg in mono-somministrazione giornaliera) vs l'88.8% di quelli trattati con agonisti recettoriali del GnRH (leuprolide). Con relugolix sono stati raggiunti valori di testosterone da castrazione già in 4° giornata, con un maggior numero di soggetti che arrivava a valori < 0.2 ng/mL in 15° giornata. Il profilo di sicurezza cardio-vascolare è stato migliore nella popolazione trattata con relugolix.

Eventi avversi: bradicardia, allungamento del QTc, *flushing*, ipertransaminasemia, cefalea, stipsi, diarrea, artralgie.

Possibili utilizzi: oltre al tumore prostatico, relugolix potrebbe essere impiegato in altre patologie estrogeno/androgeno-dipendenti già trattate con questo tipo di farmaci, come endometriosi, fibromatosi uterina, pubertà precoce, disforia di genere (3).

Bibliografia

1. MacLean DB, Shi H, Faessel HM, Saad F. Medical castration using the investigational oral GnRH antagonist TAK-385 (Relugolix): phase 1 study in healthy males. J Clin Endocrinol Metab [2015, 100: 4579–87](#).
2. Shore ND, Saad F, Cookson MS, et al. Oral relugolix for androgen-deprivation therapy in advanced prostate cancer. N Engl J Med [2020, 382: 2187–96](#).
3. Imai A, et al. Relugolix: new oral gonadotropin-releasing hormone (GnRH) antagonist. Biomed J Sci Techn Res [2019, 18: 13675-6](#).

