



藥訊

Ten-Chan Medical group

健康、真愛、天成心

出版單位：藥劑科
聯絡電話：
4629292-22525

期別 No.10304

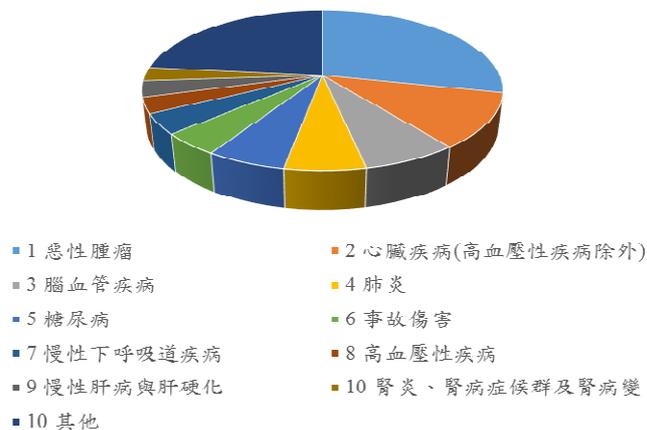
Statin 類降血脂類藥物簡介與比較

張欽喻藥師

一、前言

由於社會的富裕與國人的飲食習慣逐漸改變，導致近年來慢性三高疾病(糖尿病、高血壓、高血脂)病人逐年增加，也影響著國人的生活。在行政院主計處 2012 年統計指標中，國民前十大死亡原因(圖 1)包含了心臟疾病、腦血管疾病、糖尿病、高血壓性疾病等與三高直接或間接相關聯的疾病，故可想而知的是接下來如何治療與預防這些慢性疾病或者三高引起的緊急醫療情況，是醫療人員們發展的重要課題。

圖1. 2012年台灣十大死亡原因



Statin 類藥物為一種降低血脂的藥物，可以降低血液中的低密度膽固醇(LDL)和提高高密度膽固醇(HDL)的濃度，在治療高血脂症扮演重要的角色；依 2013 年 AHA/ACC 的治療指引¹，治療血脂主張正常人 LDL-C 大於 190mg/dL 以下或者有糖尿病或其他共病症者 LDL-C 70-189mg/Dl 者皆須治療以降低血管粥樣硬化心血管疾病風險；亦有報告指出不只 LDL-C 重要，HDL 也扮演相當重要的角色，HDL-C 男性>40mg/dl 女性>50mg/dl。

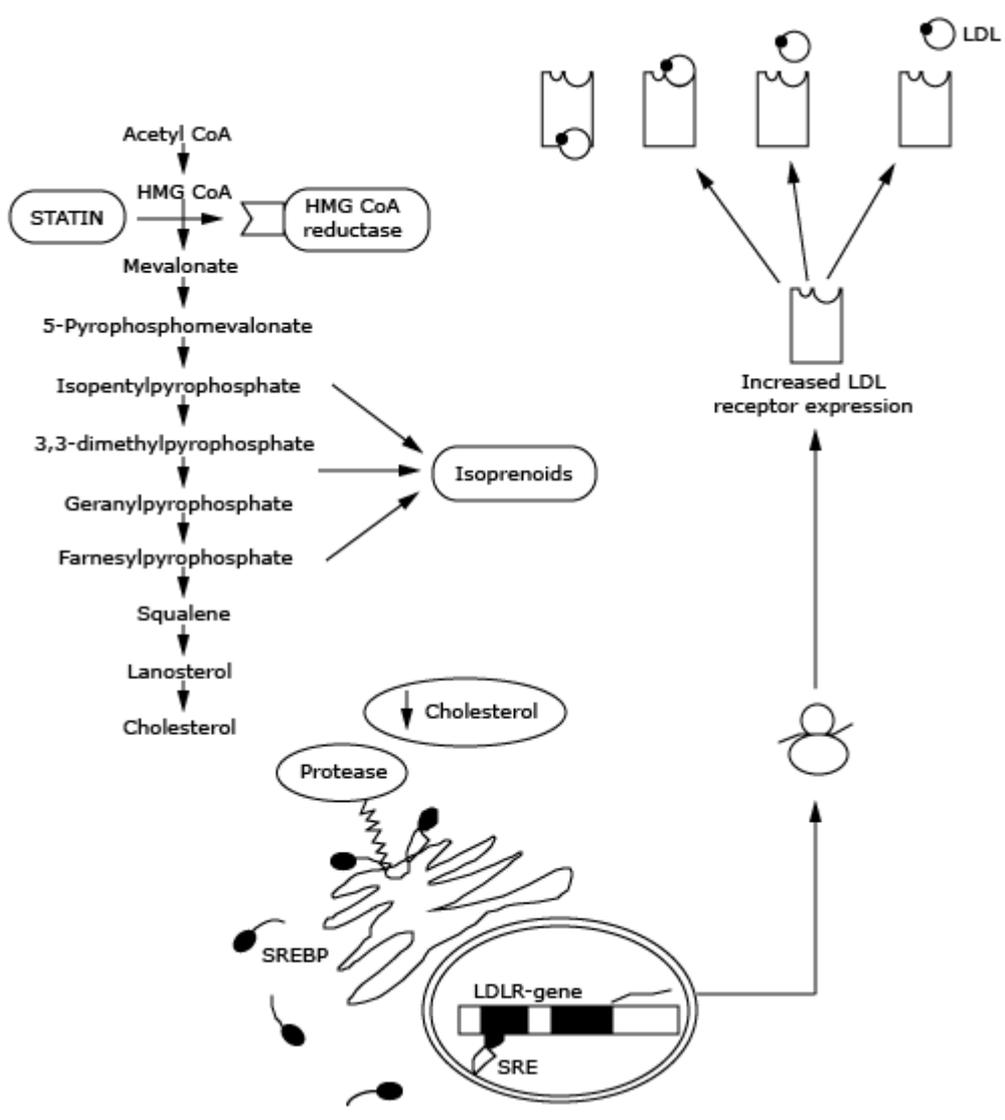
二、 STATIN 類藥物機轉

Statin 類藥物抑制 cholesterol 生合成中 Hydroxymethylglutaryl Coenzyme A(簡稱 HMG-CoA) reductase，使 HMG-CoA 無法轉化成 Mevalonate，肝臟內 cholesterol 減少導致 LDL 受體循環率增強而增加 LDL 受體的轉換。(圖 2)²

三、 STATIN 類藥物之間比較與差異

目前國內使用的 Statin 類藥物有七種，包含 Atorvastatin、Rosuvastatin、Pitavastatin、Simvastatin、Fluvastatin、Lovastatin 及 Pravastatin；雖說七種藥品皆為 statin 類藥物，其效果與特性卻不能含括而論，以下就幾個面向來討論 statin 類藥物之間的差異性：

圖 2. Statin 類藥物作用機轉圖



1. 效果

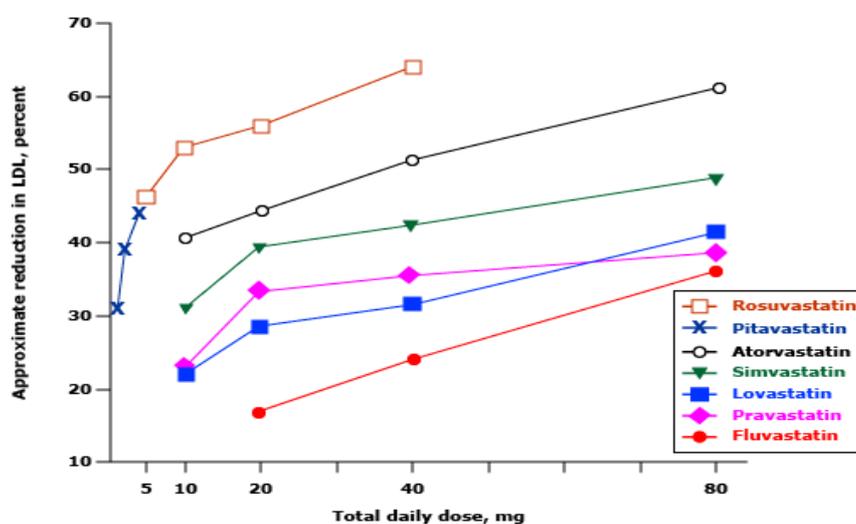
依 2013 年 AHA/ACC 的治療指引¹，我們將 statin 類藥物分為高效果 statin 類治療(High-Intensity Statin Therapy)、中效果 statin 類治療(Moderate-Intensity Statin Therapy)與低效果 statin 類治療(Low-Intensity Statin Therapy)(表 1)，其主要區分就是以每日劑量

能平均降低多少比率的 LDL-C 為主，每種藥物能降低的百分比都不盡相同(圖 3)³，效能強弱依序為 Rosuvastatin >Atorvastatin >Simvastatin >Lovastatin >Pravastatin >Fluvastatin。

表 1. High- Moderate- and Low-Intensity Statin Therapy

High-Intensity Statin Therapy	Moderate-Intensity Statin Therapy	Low-Intensity Statin Therapy
Daily dose lowers LDL-C on average, by approximately $\geq 50\%$	Daily dose lowers LDL-C on average, by approximately 30% to $< 50\%$	Daily dose lowers LDL-C on average, by $< 30\%$
Atorvastatin 40–80 mg Rosuvastatin 20 -40 mg	Atorvastatin 10 -20mg Rosuvastatin 5- 10 mg Simvastatin 20–40 mg Pravastatin 40 -80 mg Lovastatin 40 mg Fluvastatin XL 80 mg Fluvastatin 40 mg bid Pitavastatin 2-4mg	Simvastatin 10 mg Pravastatin 10–20 mg Lovastatin 20 mg Fluvastatin 20–40 mg Pitavastatin 1 mg

圖 3.各種 statin 類藥物每日使用劑量對應能降低 LDL 的百分比



2. 代謝與吸收

由於各藥品的半衰期不同，影響到藥物在體內作用的時間，故短半衰期的 Lovastatin、Fluvastatin 和 Simvastatin 需要配合身體的 cholesterol 生合成時間於夜晚服用，其他藥物或者 XL 劑型（長期釋放）的藥物則不需特別選擇於夜晚服用，每日擇一時間服用即可；Lovastatin 與其他 statin 不同的是，lovastatin 與食物併服可以增加吸收，其他 statin 則是減少吸收或者不影響吸收；其他種類 statin 亦有個別的特性(表 2)³，需事情況開立相對應的藥物。

表 2. 各個 statin 類藥物的特性

Variable	Atorvastatin	Fluvastatin	Lovastatin	Pitavastatin	Pravastatin	Rosuvastatin	Simvastatin
LDL cholesterol reductions (dose range, mg)	38 to 54 percent (10 to 80)	17 to 33 percent (20 to 80)	29 to 48 percent (20 to 80)	31 to 41 percent (1 to 4)	19 to 40 percent (10 to 40)	52 to 63 percent (10 to 40)	28 to 41 percent (10 to 40)
Elimination half-life, hours	15 to 30	0.5 to 2.3	2.9	12	1.3 to 2.8	19	2 to 3
Bioavailability, percent	12	19 to 29	5	51	18	20	5
Protein binding, percent	80 to 90	>99	>95	99	43 to 55	88	94 to 98
Solubility	Lipophilic	Lipophilic	Lipophilic	Lipophilic	Hydrophilic	Hydrophilic	Lipophilic
Cytochrome 450 metabolism and Isozyme	3A4	2C9	3A4	Limited 2C9, 2C8	-	Limited 2C9	3A4, 3A5
Active metabolites	Yes	No	Yes	Yes	No	No	Yes
Effect of food on absorption of drug	None	Negligible	Increased absorption	Decreases	Decreased absorption	None	None
Optimal time of administration	Anytime	IR: evening (or morning and evening if taken twice daily) XR: anytime	IR: with evening meal (or with morning and evening meal if taken twice daily) XR: anytime	Anytime	Anytime	Anytime	Evening
Renal excretion of absorbed dose, percent	2	<6	10	15	20	10	13

四、 資料來源

1. Stone NJ, Robinson J, Lichtenstein AH, et al. 2013 ACC/AHA Guideline on the Treatment of Blood Cholesterol to Reduce Atherosclerotic Cardiovascular Risk in Adults: A Report of the American College of Cardiology/American Heart Association Task Force on Practice Guidelines. *Journal of the American College of Cardiology* 2013.
2. Vaughan CJ, Gotto AM, Jr., Basson CT. The evolving role of statins in the management of atherosclerosis. *Journal of the American College of Cardiology* 2000;35:1-10.
3. Statins: Actions, side effects, and administration. 2014 UpToDate.