

### HMG-CoA 還元酵素阻害薬(スタチン)の種類と特徴

Statin Intensity <sup>1)2)</sup>	%LDL-C Reduction	ロスバスタチン <sup>※1</sup>	アトルバスタチン	ピタバスタチン	シンバスタチン	プラバスタチン	フルバスタチン	ロバスタチン							
		クレストール	リピトール	リバロ	リポバス	メバロチン	ローコール	本邦未承認							
High-Intensity (≥50%)	62	40mg 882.4円 (194.8円)	80mg 705.6円 (195.2円)												
	60														
	58														
	56	20mg 441.2円 (97.4円)	40mg 352.8円 (97.6円)						80mg 1378.0円 (382.4円)						
	54														
	52	5mg 110.3円 (41.4円)	10mg 88.2円 (24.4円)						2mg 99.7円 (35.9円)	40mg 689.0円 (191.2円)	80mg 564.0円 (144.8円)	80mg 226.0円 (123.7円)			
50															
48	10mg 220.6円 (48.7円)			20mg 176.4円 (48.8円)	4mg 185.7円 (71.8円)	20mg 344.5円 (95.6円)	40mg 282.0円 (72.4円)								
46															
Moderate-Intensity (30%-49%)	44	5mg 110.3円 (41.4円)	10mg 88.2円 (24.4円)	2mg 99.7円 (35.9円)	40mg 689.0円 (191.2円)	80mg 564.0円 (144.8円)	80mg 226.0円 (123.7円)								
	42														
	40														
	38														
	36														
	34														
Low-Intensity (<30%)	32	5mg 110.3円 (41.4円)	10mg 88.2円 (24.4円)	2mg 99.7円 (35.9円)	40mg 689.0円 (191.2円)	80mg 564.0円 (144.8円)	80mg 226.0円 (123.7円)								
	30														
	28							1mg 52.8円 (15.5円)	10mg 181.5円 (47.8円)	20mg 141.0円 (36.2円)	40mg 113.0円 (63.4円)				
	26														
	24														
	22														
20															
18															
用法・用量	1日用量(mg)	2.5-5	10	1-2	5	10	20-30	-							
	制限量(mg)	20	20(HL)/40(FH)	4	20	20	60	-							
	1日投与回数(回)	1	1	1	1	1-2	1	-							
吸収	BA(%)	20	14	43-51	<5	17	24	<5							
	T <sub>max</sub> (h)	3-5	1-2	1	4	1-1.5	<1	2-4							
分布	蛋白結合(%)	88	≥98	99	95	50	98	>95							
	溶解性(log p)	-0.3	4.1	1.5	4.7	-0.2	3.2	4.3							
代謝	チトクロム P450	2C9	3A4	2C9	3A4	3A4	2C9	3A4							
	CYP 寄与率	極めて軽度	中等度	不明	極めて高度	軽度	中等度	-							
	CR	0.17	0.68	不明	1.00	0.35	0.61	-							
	プロドラッグ	×	×	×	○	×	×	○							
	活性代謝物	ごく少量	○	×	○	×	×	○							
排泄	腎排泄(%)	10	<2	15	13	20	5	10							
	T <sub>1/2</sub> (h)	19	14	12	2	1.8	3	2-3							
相互作用 <sup>※2</sup>		添付文書	AUC 上昇比	添付文書	AUC 上昇比	添付文書	AUC 上昇比	添付文書	AUC 上昇比	添付文書	AUC 上昇比	添付文書	AUC 上昇比	添付文書	AUC 上昇比
	ポリコナゾール	注意	(1.1倍)	注意	(3.0倍)	(注意)	(不明)	(注意)	(>20倍)	(注意)	(1.5倍)	(注意)	(2.2倍)	-	-
	イトラコナゾール	注意	1.4倍	注意	2.5-3.2倍	-	(不明)	禁忌	19倍	-	1.5倍	-	1.3倍	-	-
	ミコナゾール	注意	(1.2倍)	-	(2.5倍)	-	(不明)	禁忌	(約9倍)	-	(1.5倍)	-	(>2倍)	-	-
	フルコナゾール	注意	1.2倍	注意	(2.2倍)	-	(不明)	(注意)	(4.8倍)	-	1.4倍	注意	1.8倍	-	-
	クラリスロマイシン	-	(1.0倍)	注意	1.8-4.4倍	-	不明	注意	11.9倍	-	(1.4倍)	-	(1.3倍)	-	-
	エリスロマイシン	注意	0.8倍	注意	1.3倍	注意	2.8倍	注意	6.2倍	-	(1.4倍)	注意	(1.2倍)	-	-
	ロキシスロマイシン	-	(1.0倍)	-	(1.3倍)	-	(不明)	-	(1.5倍)	-	(1.1倍)	-	(1.1倍)	-	-
	アジスロマイシン	-	(1.0倍)	-	1.0倍	-	(不明)	-	(1.1倍)	-	(1.0倍)	-	(1.0倍)	-	-
	ジルチアゼム	-	(1.0倍)	-	(2.2倍)	-	(不明)	注意	4.8倍	-	(1.4倍)	-	(1.2倍)	-	-
	ペラパミル	-	(1.0倍)	-	(1.9倍)	-	(不明)	注意	4.1-4.7倍	-	(1.3倍)	-	(1.2倍)	-	-
シクロスポリン	禁忌	7.1倍	注意	8.7-15倍	禁忌	4.6倍	注意	2.5倍	注意	5-23倍	注意	1.9-3倍	-	-	
								AUC7倍以上		AUC2-7倍		AUC2倍未満			

※1 薬物輸送タンパク(SLC01B1、ABCG2)遺伝子多型により、欧米人(白人)と比較しアジア人ではロスバスタチンの Cmax および AUC が 2 倍程度上昇することが報告されている。<sup>3)4)</sup>  
 ※2 「-」は添付文書に記載なし。「添付文書」欄の括弧内は阻害薬の添付文書にのみ記載。「AUC 上昇比」欄の括弧内は PISCS による予測値。<sup>5)</sup>

[参考]  
 1) Grundy SM, et al. 2018 AHA/ACC/AACVPR/AAPA/ABC/ACPM/ADA/AGS/APHA/ASPC/NLA/PCNA Guideline on the Management of Blood Cholesterol. Circulation. 2018 Nov 10;CIR0000000000000625. PMID: 30586774  
 2) Catapano AL, et al. 2016 ESC/EAS Guidelines for the Management of Dyslipidaemias. Eur Heart J. 2016 Oct 14;37(39):2999-3058. PMID: 27567407  
 3) Lee E, et al. Rosuvastatin pharmacokinetics and pharmacogenetics in white and Asian subjects residing in the same environment. Clin Pharmacol Ther. 2005 Oct;78(4):330-41. PMID: 16198652  
 4) Birmingham BK, et al. Rosuvastatin pharmacokinetics and pharmacogenetics in Caucasian and Asian subjects residing in the United States. Eur J Clin Pharmacol. 2015 Mar;71(3):329-40. PMID: 25630984  
 5) 鈴木 洋史, ら. これからの薬物相互作用マネジメント 臨床を変える PISCS の基本と実践. じほう. 2014.  
 6) 各社 添付文書、インタビューフォーム