

西立伐他汀 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文  
[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/312/2021\\_2022\\_\\_E8\\_A5\\_BF\\_E7\\_AB\\_8B\\_E4\\_BC\\_90\\_E4\\_c22\\_312215.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/312/2021_2022__E8_A5_BF_E7_AB_8B_E4_BC_90_E4_c22_312215.htm) 药品名称西立伐他汀 药物别名拜斯亭 英文名称Cerivastatin 类别调节血脂药及抗动脉粥样硬化药制剂0.3mg/片 分子式成分西立伐他汀钠，交联聚乙烯吡咯烷酮，硬脂酸镁，甘露醇等。 药理毒理西立伐他汀是一种合成的纯映像体羟甲基戊二酸辅酶A还原酶抑制剂，是胆固醇合成的竞争性抑制剂，特异地抑制HMG-CoA（羟甲基戊二酸辅酶A）还原酶。在胆固醇合成中，该酶催化由HMG-CoA转变为二羟甲基戊酸这一限速步骤的反应，西立伐他汀作用的主要部位是肝脏。通过降低细胞内胆固醇含量，HMG-CoA还原酶抑制剂继发性引起肝细胞表面低密度脂蛋白（LDL）受体上调，伴随低密度脂蛋白胆固醇清除增加。从而导致血清中总胆固醇及低密度脂蛋白胆固醇降低。本药的显著疗效可见于服药后2周内，最佳的治疗反应在4周内出现，并维持于持续用药期间。德国医药和化工巨头拜耳公司于2001年8月8日发出紧急通知，要求其在世界各地的拜斯亭销售店立即停止出售此药，并速将尚未出售的拜斯亭全部退回拜耳公司 药动学本药轻易且几乎全部从胃肠道吸收，在口服后2~3小时达到血浆峰浓度。在0.05-0.4mg剂量范围内，最大药物浓度及血浆浓度时间下面积随剂量成比例地增加。一天一次或两次多剂用药后无药物蓄积。本药的绝对生物利用度约为60%，其片剂和口服液的生物利用度相似（即相对生物利用度等于100%），无论曲线下面积、血药峰浓度、还是T<sub>max</sub>均呈等量。本药与蛋白质高度结合（99.1~99.5%），主要为血清白蛋白。稳态时分布容积约0.3L/kg体重，提

示该药仅中度穿透入组织，与肝组织（作用靶部位）亲和力高。在动物体内，放射性标记的药物很少穿透血脑屏障。在大鼠体内进行的研究发现，本药也透过胎盘屏障，并从哺乳大鼠的乳汁中分泌出来。本药在人体主要有2种生物转化反应：醚基团的脱甲基作用（代谢物M1）和异丙基团的羟化（M23），结合两种转化反应即形成代谢物M24，后者仅少量存在于尿和粪便中，且不能从血浆中检测出来。上述3种主要代谢产物均为有活性HMG-CoA还原酶的抑制剂，具有母体药相似的ED50，与其母体药一同组成药物的全部活性。本药的总清除率约13L/hr，其血浆清除半衰期约2~3小时，剂量的30%以代谢产物从尿液排出，70%通过粪便排出。尿液中未发现原形药物，在粪便中原形药不足2%。适应症饮食控制效果不满足的原发性高胆固醇血症（a型）；混合高脂血症、高胆固醇血症及高甘油三脂血症（b型）。不良反应发生率lt.2%的不良反应有：腹痛、无力、头痛、便秘、腹泻、消化不良、腹胀、恶心、肌酸磷酸激酶升高、肌痛。发生率lt.1%的不良反应有：胃肠道不适，肌无力，嗜睡，白内障。偶有过敏、血管神经性水肿，个别有肝炎和横纹肌溶解。像其它他汀类药物一样，有新的晶体混浊和核混浊的报道，但是与使用本药的关系没有确定。相互作用胆汁酸分离剂：在给予树脂（如消胆胺）几小时（至少一小时）之后才能给予拜斯亭，以避免由于拜斯亭与树脂结合而产生的相互作用（使用拜斯亭的生物利用度降低）。与华法令、地高辛、抗酸药（氢氧化镁铝）、西咪替丁、红霉素、伊曲康唑、硝苯地平及奥美拉唑罕有明显的临床相互作用。西立伐他汀对这些患者环孢菌素稳态血药浓度没有影响。由于拜斯亭暴露的

增加，合用环孢菌素治疗的患者的初始剂量应从剂量范围的低限开始。其后应谨慎应用序贯法并密切监测。用法用量治疗开始前，应当排除继发性高胆固醇血症。治疗期间患者应当保持标准的低胆固醇饮食。成人：每晚服一次（晚饭时或睡前）。与食物一起服用不影响西立伐他汀的效果。其显著疗效可见于服药后两周内，最佳的治疗反应在四面内出现，并维持于持续用药期间。老年患者：没有临床证据表明老年患者的剂量应有所不同。与其它治疗一样，治疗的初始剂量应从剂量范围的低限开始。儿童：由于缺乏临床经验，不建议应用于儿童，肾脏损伤：根据药代动力学资料，肾脏损伤的患得不必调整剂量。由于治疗这些患者的临床资料还很有限，中度到重度肾脏疾病菌的患者，治疗应当从推荐剂量范围的低限开始并需密切监测。如必要，其后应慎重调整剂量。注重事项已知对其中的任何成份过敏者。活动性肝病或原因不明的持续血清转氨酶升高禁用。与其它降脂药一样，建议治疗前查肝功能，并在治疗中定期检查。对有过量饮酒史和肝病史（活动性肝病或不明原因的转氨酶升高忌用）的患者应慎用拜斯亭。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)