

에제티미브(ezetimibe)

요약

에제티미브는 고지혈증 치료제이다. 음식으로 섭취한 콜레스테롤이 소장에서 체내로 다시 흡수되는 것을 막아주어 혈액 중 지질관련 수치들을 낮춰준다. 고지혈증 환자의 콜레스테롤 감소를 위한 식이요법의 보조제로 사용된다.

| | |
|----------|--|
| 외국어 표기 | ezetimibe(영어) |
| CAS 등록번호 | 163222-33-1 |
| ATC 코드 | C10AX09 |
| 분자식 | C ₂₄ H ₂₁ F ₂ NO ₃ |
| 분자량 | 409.433 g/mol |

유의어·관련어: 고지혈증 치료제, 高脂血症 治療劑, 고지혈약, 高脂血藥, hyperlipidemia treatment, 고콜레스테롤혈증 치료제, 이상지질혈증 치료제, 이상지질혈증약, anti-dyslipidemia agent, dyslipidemia treatment, 이지트롤, Ezetrol, 바이토린, Vytorin

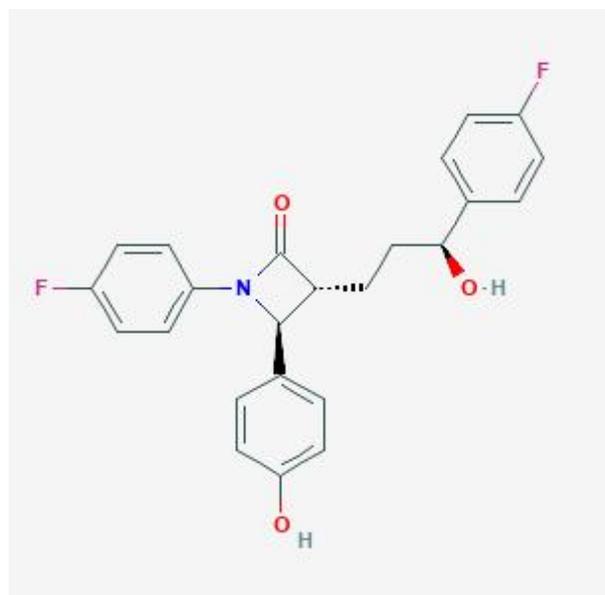


그림 1. 에제티미브의 구조식

고지혈증 개요

고지혈증은 혈액 내 지질 성분 중 콜레스테롤과 중성지방이 증가된 상태를 의미한다. 혈중 지질의 종류로는 콜레스테롤, 중성지방(트리글리세리드), 인지질 등이 있으며 혈액 내에서는 단백질과 결합한 지질단백의 형태로 존재한다. 지질단백은 각 지질 성분의 비율에 따라 초저밀도지질단백(very-low-density-lipoprotein, VLDL), 저밀도지질단백(low-density-lipoprotein, LDL), 고밀도지질단백(high-density-lipoprotein, HDL) 등으로 구분된다. LDL-콜레스테롤은 VLDL-콜레스테롤에서 유래하며, 흔히 '나쁜 콜레스테롤'로 알려져 있다. LDL-콜레스테롤 수치가 높을수록 동맥경화증과 각종 심혈관질환의 위험이 높아지므로 고지혈증 치료 시 기준이 된다. HDL-콜레스테롤은 '좋은 콜레스테롤'로 알려져 있고, 혈액 중에 있는 콜레스테롤을 제거하는 역할을 한다.

고지혈증과 흔하게 혼용되는 이상지질혈증은 콜레스테롤과 중성지방 등의 지질 상승과 함께 좋은 콜레스테롤인 HDL-콜레스테롤이 감소한 상태까지 포함하는 의미이다.

약리작용

에제티미브는 음식으로 섭취한 콜레스테롤이 소장에서 체내로 다시 흡수되는 것을 막아주어 혈액 중 지질관련 수치들을 낮춰주며 고지혈증 환자의 콜레스테롤 감소를 위한 식이요법의 보조제로 사용된다.

음식물이나 담즙산의 형태로 장으로 분비되는 내인성 콜레스테롤은 소장의 솔가장자리*에 존재하는 콜레스테롤을 운반하는 단백질 통로(Niemann Pick Cell 1 Like 1, NPC1L1)를 통해 간으로 이동, 저장된다. 에제티미브는 이 과정을 저해하여 콜레스테롤의 간 저장량을 감소시키고, 체외로 빠져나가는 것을 돕는다.

* 솔가장자리(brush border): 척추동물의 장관내 상피세포에 잘 발달되어 있으며, 표면적을 크게 증대시켜 음식물의 흡수를 돕는다. 광학현미경으로 관찰 시 솔(brush)처럼 보여 솔가장자리라고 이름 지어졌다.

효능·효과

고지혈증 및 이상지질혈증 환자의 콜레스테롤 감소를 위한 식이요법의 보조제로 사용되며, 이지트롤® 등의 제품이 있다. 단독 사용되거나 또는 고지혈증 치료 효과를 높이기 위해 상호작용을 일으키지 않는 다른 고지혈증 치료제(HMG-CoA 환원효소 저해제* 또는 페노피브레이트†) 와 함께 사용된다.

Table 1. 에제티미브 단일제와 복합제의 종류 및 제품 예

| 구분 | 약물 | | 제품 예 |
|-----|------------------------|---------|-------|
| 단일제 | 에제티미브 | | 이지트롤® |
| 복합제 | 에제티미브 + 다른 고지혈증 치료제 | 심바스타틴 | 바이토린® |
| | | 로수바스타틴 | 로수젯® |
| | | 아토르바스타틴 | 아토젯® |

* HMG-CoA 환원효소 저해제: 콜레스테롤의 전단계 물질인 메발론산(mevalonic acid)이 생성되는 과정에서 필요한 효소(HMG-CoA reductase)를 차단하여 콜레스테롤 합성을 저해한다. 성분명이 '~스타틴'으로 끝나기 때문에 '스타틴계 약물'이라고도 불리며 심바스타틴, 로수바스타틴, 아토르바스타틴 등이 있다.

† 페노피브레이트: 혈액 중의 지질단백질을 분해하는 효소의 작용을 도와 중성지방과 콜레스테롤을 감소시켜 준다.

그 외 자세한 사항은 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다.

용법

에제티미브 단일제는 1일 1회 10 mg을 음식과 상관없이 복용한다.

그 외 상세한 정보 및 복합제에 대한 정보는 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다.

금기

에제티미브 단일제에 대한 금기사항은 다음과 같다. 복합제의 경우 복합되는 성분에 따라 금기사항의 차이가 있으며, 상세한 정보는 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다.

- 활동성 간질환 환자 또는 혈청 아미노전달효소치(ALT, AST)*가 지속적으로 증가되어 있는 환자에게는 에제티미브와 HMG-CoA 환원효소 억제제를 함께 투여하지 않는다.
- 임신 또는 임신하고 있을 가능성이 있는 여성과 수유부에게는 에제티미브와 HMG-CoA 환원효소 억제제 또는 페노피브레이트를 함께 투여하지 않는다.
- 중증 간기능 또는 신기능 저하 환자에게는 에제티미브와 페노피브레이트를 함께 투여하지 않는다.

* 혈청 아미노전달효소치(ALT, AST): 알라닌 아미노전이효소(alanine aminotransferase, ALT), 아스파테이트 아미노전이효소(aspartate aminotransferase, AST)는 간세포 내에 존재하는 효소로 간세포가 손상되었을 때 혈액으로 유입되어 증가되므로 이들 효소의 혈청 수치는 간기능 검사에 이용된다.

주의사항

에제티미브 단일제에 대한 주의사항은 다음과 같다. 복합제의 경우 복합되는 성분에 따라 주의사항의 차이가 있으며, 상세한 정보는 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다.

- 중등도 혹은 중증의 간기능 장애 환자에서는 에제티미브가 몸 밖으로 잘 빠져나가지 못해 효과가 증가되고 부작용이 나타날 수 있으므로 투여가 권장되지 않는다.
- 에제티미브와 HMG-CoA 환원효소 억제제를 함께 투여할 때 투여시작 전과 그 이후 지속적으로 추가적인 간기능 검사가 필요하다. HMG-CoA 환원효소 억제제 사용 시에 간부전 사례들이 드물게 보고되었으므로 복용 중 간 손상 또는 황달이 발생하면 즉시 사용을 멈춘다.

• 횡문근융해증*이 드물게 보고되었고 때때로 근육병증†이 발생할 수 있으므로, 무기력, 열을 동반한 설명되지 않는 근육통, 근육약화 등의 증상이 나타나면 즉시 의사에게 알리도록 해야 하며, 크레아틴키나제‡ 수치를 측정하여 현저히 상승된 경우에는 투여를 중단해야 한다.

* 횡문근융해증: 외상, 운동, 수술, 약물 등으로 인해 근육의 에너지 공급이 충분하지 않을 때 괴사가 일어나고 그로 인해 생긴 독성의 세포 성분이 혈액으로 유입되어 신부전 같은 신장 손상을 일으키는 질환으로 근육통, 근무력감, 적색이나 갈색의 소변 등이 대표적인 증상이다.

† 근육병증: 근육통, 근무력감, 갈색뇨와 함께 CK 수치가 정상치의 10배 이상 증가되는 경우에 근육병증으로 진단된다. 횡문근융해증은 드물게 발생하지만 치명적인 근육병증이다.

‡ 크레아틴키나제(creatine kinase, CK): 우리 몸의 심근, 골격근, 평활근, 뇌 등에 분포하는 효소로 그 부분이 손상을 받으면 혈액 중에 유출된다. 혈액 중 CK는 골격근(근육)이나 심장세포가 손상될 때 증가되므로 근육의 질환이나 심근경색의 조기 진단에 사용된다.

부작용

에제티미브 단일제를 복용 시 발생 가능한 주요 부작용은 다음과 같다. 그 외 상세한 정보는 제품설명서 또는 제품별 허가정보에서 확인할 수 있다. 부작용이 발생하면 의사, 약사 등 전문가에게 알려 적절한 조치를 취할 수 있도록 한다.

일반적 부작용(사용자의 1~10%에서 보고)

두통, 피로, 복통, 설사, 혈청 아미노전달효소치 상승, 바이러스 감염, 상기도 감염, 부비동염, 관절통 등

드문 부작용(사용자의 1% 미만에서 보고)

혈관부종, 담낭염, 간염, 우울, 어지러움, 구토, 발진 등

상호작용

에제티미브 단일제와 함께 투여 시 상호작용을 일으킬 수 있는 약물은 다음과 같다.

| 상호작용 | 약물 |
|-----------------------------------|---|
| 에제티미브의 효과를 증가시켜 부작용 위험성을 증가시키는 약물 | 다른 고지혈증 치료제(젬피브로질, 페노피브레이트), 면역억제제(사이클로스포린) 등 |
| 에제티미브의 효과를 감소시키는 약물 | 다른 고지혈증 치료제(콜레스티라민) 등 |
| 에제티미브에 의해 부작용이 증가되는 약물 | 면역억제제(사이클로스포린), 항응고제(와파린) 등 |

소아, 청소년 사용

6세 미만의 소아에게는 투여가 권장되지 않는다.

고령자 사용

65세 이상 고령자에서의 유효성과 안전성은 보통 성인 환자의 경우와 유사하였으며, 용량 조절이 필요하지 않다.

임부·수유부 사용

- 임부에게 사용한 임상 자료는 없으나, 에제티미브 사용의 잠재적 유익성이 유아에 대한 잠재적 위험성보다 높을 때에 한하여 임부에게 사용한다.
- 사람의 모유로 분비되는지는 알려지지 않았다. 따라서 에제티미브 사용의 잠재적 유익성이 유아에 대한 잠재적 위험성보다 높지 않는 한 수유부에게 투여해서는 안 된다.