

From:

To:

Date: 6/14/2022 12:50:43 AM

Subject:

Attachments: .thmx

®
(ASTIN)

1 : ; 10 20 , 40 , 80 ;
 (Ac-Di-Sol); (Avicel PH 101); ; (Super tab 11 SD);
 HPMC 2910/ (Klucel EXF); 80 (Tween 80); (VG-EP); Opadry white (YS-1-7040):
 , /PEG, (171), .

-	:								
10	:							« »	«90»
9,70		5,10							
20	:							« »	«91»
12,00		6,50							
40	:							« »	«92»
15,30		8,00							
80	:							« »	«93»
19,00		10,40							

C10A A05.

-3-

A

()

(« »).

(C_{max})

(30 %.

25 % 9 %

®

C_{max}

(«

381 98 %
0,25,

(« » «

70 %

in vitro

P450 3A4 (CYP 3A4),

(«

»).

/

14

2 %

20 30

(40 % C_{max} 30 % AUC)

(65),

(« »).

#, ‡ / 15	400 2 400 2	, 40 1 4	3,93	4,31
# / 9	50 1 200 1	, 13 10	1,94	4,34
# 4	150 1	, 10 40	2,12	1,70
# / 9	500 2 , 9	80 1 8	4,54	5,38
# / 9	300 2 100 2	, 10 1 4	3,45	2,25
# 4	200 1	, 40	3,32	1,20
#	480 1	, 10 20	3,29	2,17
# / , 14	700 2 100 2	10 1 4	2,53	2,84
# , 14	1400 2	10 1 4	2,30	4,04
# 14	1250 2	, 10 1 28	1,74	2,22
# *	240 1	40 1	1,37	1,16
28	240 1	, 40 1	1,51	1,00
7	500 4	, 10 1	1,33	1,38

		/ ()	AUC	C _{max}	
80	1 15	600	1,03	0,89	
80	1 10	# 0,25 1 20	1,15	1,20	
40	1 22	,2 : 1 ; 35	1,28 1,19	1,23 1,30	
10	1	500 2 / 200 2 , 7	1,08	0,96	
10	1 4	1400 2 ,14	0,73	0,82	
10	1 4	700 2 / 100 2 ,14	0,99	0,94	

#

«

».

®

®

CYP 3A4

(. 1 ,

).

CYP 3A4.

CYP 3A4 (, , ,

HCV (, /)

CYP 3A4 (, , ,

(. 3).

(. 1).

CYP 3A4,

CYP 3 4

CYP 3A4

(1,2).

AUC

(500 2)

(. « »).

80

»).

® 20 (. « » «

AUC

(. « »).

®

+

+

®

+

+

®

®

®

40

20

+

+

(. «

» «

»).

AUC

40

200 (. « »).

®

20 (. « » « »).

OATP1B1.

OATP1B1 (,)

AUC

10

5,2 / /

®

(. «

(.

« »).

»).

20

480

(AUC: 3,29) (. « 20 »).

P-gp, BCRP, MRP2, OAT2
 CYP3A OATP1B1/1B3

20

OATP1B1/1 3,

»).

BCRP, OATP1B1/1 3 CYP3A

®

8,3

BCRP, OATP1B1/1 3 CYP3A

®

20

1,9

»).

(. «

», «

», «

», «

», «

»).

3 (.

«

3

+	+
+	20
	40
+	

*

®

(. «

»).

®

(. «

»).

® (. «

»).

P450 3A4.

P450 3A4 (

®

(40)

(240)

35 %.

(

0,74)

(10 1)

(500 1)

(. 1).

(. 1).

((

)

)

(. « »).

(. « »).

(. «

»).

AUC

30

0,2 %, 0,2 %, 0,6 % 0,7 % 2,3 % 10, 20, 40 80 () .18

« »).

HbA1c

« - - »

post-hoc

SPARCL (Stroke Prevention by Aggressive Reduction in Cholesterol Levels/ 80 4731)

%; (17 18); : 1,68, 95 % : 1,09, 2,59; =0,0168). (38, 1,6 %), (16, 0,7 %).

(. « »).

39828

75

, 15813 (40 %)

65 , 2800 (7 %)

(65)

®

(. « » « »).

() :

-
-
-
-
-

(70)

»)

(. « »),

(5),

5), 5 7

(5),

(10)

(,).

CYP 3A4

CYP 3A4

7

(

)

«

»).

7

®

()

(

)

(

,

).

®

(I V

).

®

,
(. « »).

®

®

2-4 % 15-20 %

100

3 4-

89 %

®

®

(. « »).

(10 80 45 %),

®

10 20 1

40 1

®

®

®

2 4

(10 17)

®

10 / ,

10 20

1

®

10 80

®

(,)

®

(. «

- - ()

» « »).

; , »).

(. « » «

C

+

®

+

+

®

+

+

+

+

20

®

®

40

®

» «

»).

10 17

:

³ 190 / (4,91 /)

³ 160 / (4,14 /)

o
o

6

10

187

20

10

17

163

10 15

130 / (3,36 /).

10

80 / 8 1

®

®

(0,7 %), (0,5 %), (0,4 %), (9,7 % 9,5 %), (0,4 %), (N=8755),
 : (8,3 %), (6,9 %), (6,8 %), (6,0 %) (5,7 %).
 2 % (%).

*	- N=8755	10 N=3908	20 N=188	40 N=604	80 N=4055	N=7311
	8,3	12,9	5,3	7	4,2	8,2
	6,9	8,9	11,7	10,6	4,3	6,5
	6,8	7,3	6,4	14,1	5,2	6,3
	6	8,5	3,7	9,3	3,1	5,9

),
2,5 %
(3) 0,8 %
3 0,4 %
10

26-

(10 17)

10 20

« »); (3)
() (3)
;

()

10

.2

25 °

3

/MICRO LABS LIMITED.

. S.155 - S.159 N1, IV, INDUSTRIAL ESTATE, PHASE III & PHASE IV, VERNA SALCETTE, IN-403 722, India.

, In-403 722, /PLOT NO. S.155 TO S.159 & N1, VERNA