

(R SUVASTATINANANTA)

1 : ;
1 , ; 10,40 , 10 , 20,80
20 ;
(31 84972) (; (171); ; (321); ;
(172)). ;

i - i i i :
10 : , , , ;
20 : , , ,

10 07.

i i .

()
(),

().

(-),

(-),
(-)

- (1).

- / - , ()/ - ,

- / - / - .

1.

IIa I b (

)

	-	-		-		-		A-I
	13	-7	-5	3	-3	-7	-3	0
5	17	-45	-33	13	-35	-44	-38	4
10	17	-52	-36	14	-10	-48	-42	4
20	17	-55	-40	8	-23	-51	-46	5
40	18	-63	-46	10	-28	-60	-54	0

4 1 , 90 % - 2 .

4,8 /) , 10 , EAS (< 3 /). 80 % , 40 (12) - 53 % . 33 % 20-40 - EAS (< 3 /). 22 %

45-70 (. « »). (< 10 % 10) , - 4 / (154,5 /), (- 0,0145 / . 2 ,)

40 1 2 . 45 % (p < 0,001) > 20 % (= 0,028), 8,8 1000 - .

SCORE (= 0,193). 5 %

(= 0,076). 65) (= 0,0003), 1000

10-17 (II-IV 12 1) 40

38,3 %, 44,6 % 50,0 % 5, 10 20

0,7 % 40- (20) 40,5 %

52 2,8 / . () (> 1)

»).

20 %.

134 . 90 % , , - . ,

(10 %).

2C19, 3A4 2D6. N- 450. *in vitro* N- CYP2C9, 90 %

50% , , - - .

90 % () ,

5 % . 50 / (19 - 21,7 %).

OATP-C,

(. . . « »).

C_{max} , ; (, AUC , C_{max} , , 1,3) AUC

3 , N- - , 9 50% , (N- - < 30 /)

- ' . , 8 9 - ' , 9 - ' , 7

SLCO1B1 (OATPIB1) / ABCG2 (BCRP) 1 1 BCRP.
SLCO1B1 .521 ABCG2 .421 (AUC) SLCO1B1 .521 ABCG2

.421

10 17

10 (I b) (,) () ()

2). (300 / 100), 10, AUC, C_{max},
3 7, (« 2). », « », 2 (« AUC C_{max} »).
», « », « », 2). (« AUC C_{max} »).
»).

(³ 1 /) () 40
- , (« » « »).

5 .

1,2 (2). 10 10 AUC
(« »).

50 %.

AUC 20 %, C_{max} – 30 %.

450
in vitro in vivo, 450,
(CYP2C9 CYP3A4) (CYP2A6 CYP3A4).
5 1 (AUC) 2,
40 / ,
; , / –10 (3,1), 20 (1,9),
). –5 (7,1

2.

(AUC;)

, ,

		AUC*
, 75 2 200 2 ,6	10 1 ,10	7,1
300 / 100 1 ,8	10 ,	3,1
150 1 ,7	10 ,	2,8
400 / 100 2 ,17	20 1 ,7	2,1
600 2 ,7	80 ,	1,9
75 1 ,5	10 ,	1,6
600 / 100 2 ,7	10 1 ,7	1,5
500 / 200 2 ,11	10 ,	1,4
400 2		1,4
200 1 ,5	10 ,	**1,4
10 1 ,14	10 1 ,14	**1,2
700 / 100 2 ,8	10 ,	
0,3 7	40 7	
140 3 ,5	10 ,	
67 3 ,7	10 7	
450 1 ,7	20 ,	
200 2 ,7	80 ,	
200 1 ,11	80 ,	
500 4 ,7	80 ,	20 %
50 3 ,14	20 ,	47 %
* , , (%)		(%),
** « » , « » - , « » - .		

- - , () ,

() .

/ ()

34 %

AUC

26 %

/
100),

(400 /
AUC₍₀₋₂₄₎)

m

40 ,
(. « »).

40 .

20 .

(. «

»),

40 .

(> 5

()),

5-7

5

-

;

/

- ;

-

-

- ;

- > 70 ;

- ,

- » « »);

-

, .

(> 5),

(> 5 ×)

,

,

,

(5 ×).

- -

()

,

- -

,

,

,

,

,

- .

40

(.

«

»

« 40 »).

(

).

-

-

,

,

/

.

3

,

(

)

40

,

,

« .. »).

(.. « .. » « .. »).

20 ..

(.. « .. » « .. »).

« .. »).

(..)

/ 2, ..) (.. 5,6 – 6,0 / , > 30

JUPITER

5,6 6,9 / .

2,8 %

2,3 %

HbA1c

(), , ()
1 . 52
(. « »).
(> 1)

52 , > 10

(. “

”).

(. « »).

5 10 1

4 (. « »).

40

40

20

(. « »).

« »). - 20 (.

> 70 5 (. « »).

(< 60 /) 5 . 40

- (. « » « »).

, 7 - ' , (. « »).

8 9 - ' (. « »).

9 « »). - ' . (.

« »). (. « 40 » , « »

5 ; 40

(. « »).

40 (. « ») 5 (. « »).

(1 1 BCRP). ()

/ ; . « » « » , »).

(. «

»).

10 17 (, 1) . 5 20 1 . (« ») . 20 40 10 10 (8 10) 10 . 4 % : (1/100 < 1/10), (1/1000 < 1/100), (1/10000 < 1/1000), (< 1 /10 000), (

3.

-					
			-		
			- ,		

	1				
	- ,			- ,	, ()
,					,
-	, - ,				
				,	
		, ,			-
			(,)		, -

1



(5,6 / , > 30 / 2,

).

- , .

, - , < 1% ,

20 10 20 3% - 40 ++ . +

, - , ; .

, (), > 20 .

, (> 5), (. « »).

; HbA1c. , , ,

(. « »).

40 , ()

, , - ' , , ' , , , , ' , , ' ,

), (; 1 ,

> 10 , (. « »).

.2

25°

10

,3

/ Bafna Pharmaceuticals Ltd., India.

. 147,

IN 600052, / 147, Madhavaram Red Hills Road Grantlyon Village Vadakarai Chennai Tamil Nadu IN 600052, India.

/ SCAN BIOTECH LTD, India.

-4/300, ,462016, ,(. .) / E-4/300, Arera Colony Extension, 462016, Bhopal, (M.P.) India.