

(ZOLAFREN)

: :1 5 10 ; ( ) , ( ) 400, Yellow No.6 Al-Lake ( 110), ( 171), ( 172),

7 ; 10 : 5 : 7 .

N05A H03.

5 2 /2 , 5 3, 5 6, D1, D2, D3, D4, D5, a1 1- 5, D2, in vitro, in vivo. ( 10) ( 9)

10 5 2 , D2. ( ) D2- ( ) ,

1484 (16,6) ( = 0,001),

(- 6,0) (-3,1).

3

2 6 6 12 10

12-

12-

18- ( 30 %, 38,3 %; = 0,055).

( )

( 13 17 ) 200 2,5 (6

20 /

, C<sub>max</sub> 5-8

93 % 7 / 1000 /

a<sub>1</sub>-

P450-CYP1A2 P450-CYP2D6 10-N- N- 2-

*in vivo*,

\_\_\_\_\_:

(51,8 33,8 ), ( 65 ) (17,5 18,2 / ).  
 , 44 > 65 , 5 20 / ,  
 / ). (5-20 ) (36,7 32,3 ), (18,9 27,3  
 (N = 467) (N = 869).

\_\_\_\_\_:

(37,7 32,4 ) < 10 / ) (21,2 25,0 / ). , 57 %

\_\_\_\_\_:

(18,0 / ) , , (39,3 ),  
 (18,6 27,7 / ). ( ) (48,8 14,1 / ) .  
 (38,6 30,4 ),

\_\_\_\_\_:

27 %

CYP1A2, CYP1A2, CYP1A2, CYP1A2, AUC, 52 %<sup>max</sup> 108 %

54 % 77 % CYP1A2, CYP1A2.

50-60 % — 2 2

( CYP2D6), CYP 450 ( 1A2, 2D6, 2C9, 2C19, 3A4) *in vitro*, ( CYP2D6), (CYP2C9), (CYP 1A2) (CYP

3 4 2 19).

QT . CYP 2D6. (60 60 8 ) QT .

16 % 16 %.

( 6 – 12 )

( 78 ) ,

2

65

3

0,4 %).

15 /

( ) –

(3,5 %

1,5 %

4,4 )

(1,3 %

75

2,5 /

( )

12

(

12

4

8

( )

( ),

/

(

)

/

-

/

( 0,01 % — < 0,1 %)

QT-

QT

QT

QT

QT,

( 0,1 % — < 1 %).

*in vitro*

( 52 )

).

HbA1

(

9-12-

6

5

12

12

( )

(

( )

( 48 )

4-6

12-

I

13

2,6

0,3

6 ; 22,2 %

%  
15 % 3 % 0,3 % 8 ; 4,2 % 12 . 0,2 %  
( )  
N = 2021). 48 0 % 5,6 ( 573 ;  
64 %, 32 % 12 % 7 %, 15 % 25 % , 0,4 %  
48 .  
*in vitro*  
(n = 1184), 5 -  
2 %, (13 % 7 %).  
D<sub>2</sub>, GnRH,  
( . « » ),



10 / ( 17

/ 2 ),  
10 / ,

/  
10 / ( 1 10  
/ 2 ) 3  
22,5 / ( 11  
/ 2 ) 3 16 / ( 8  
/ 2 ) 6 12

, 5 10 , - Yellow No.6 Al-Lake ( 110),

1,8 %

( / ).

III

( / )

10 1 15 10 10  
(  
5 20 24

65 (5 )  
/ ( , — ’ ) (5 ) 5 ,

( , ) ,  
(5 ) 10 20

13-17 :  
( > 10 %): / ,

( < 2 % )  
450 , 2

( , 50–60 % ).

( 1 % ),

1 : ( 1/10), ( 1/100 < 1/10), ( 1/1000 < 1/100), ( 1/10000 < 1/1000), (< 1/10000), (

1.

	10 10		11
		11	
1	2,3 4 2,5, ,	,	12
		, 11	

	6, 6, 6,	( 11, )11, 11, 9,	12, 7,12
,			
		9	
		QT ,	/ , 11
10		( )	
-			
	,	9	11
	( ),		( , )11

		,	(DRESS)
- ,	9		11
		,	
		,	
		11	
,			
			:
	,	;	12
		;	
		;	/
	,		
	,		
	, ' 10		
8	10, 1, - - 10	10,	



7 % 39,9 %

( 13-17 ) ,

( 7 % )

( 24 )

( 1/10), ( 1/100 — < 1/10).

13,

14,

15.

\_\_\_\_\_

:

13,

14,

15.

:

(

,

,

).

-

\_\_\_\_\_

:

.

\_\_\_\_\_

:

(

).

\_\_\_\_\_

:

13

(

22 )

7 %

(40,6 %

), 15 %

(7,1 %

) 25 %

55,3 % - 15 %

29,1 % -

25 %.

(2,5 %

).

(

24

) 89,4 %

7 %,

14

(< 1,016 / ),

( 1,467 / ).

( 1,016 - < 1,467 / )

( 1,467 / ).

15

(< 4,39 / )

( 5,17 / ).

( 4,39 — < 5,17 / )

( 5,17 / ).

16

47,4 %

16.

( 0,1 % ) -

(

,

,

).

(< 0,01%) -

(< 0,1% > 0,01%) -

(< 0,01 % ) -

(< 0,01 % ),

(> 10 %).

(> 1 % <10 %).

( ) , ' ,

(> 10 %).

(> 10 %).

.3 .

25° ,

. 30

; 1

« » ,

5, 95-200,