

(72)

60031 6957
 60091 , 1011
 60076 . 8335
 60048, , 2343

(74)

:

(54)

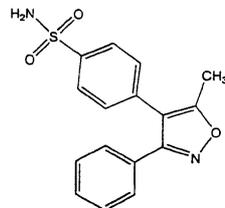
1mg 100mg 2 - 1

가 , -2

(valdecoxib) 4 - (5 - - 3 - - 4 -)
 (Talley) 5,633,272

I :

I



-2(COX - 2) 5,633,272 가 , - 1(COX - 1)
 . , 5,633,272 가

0 863 134

-) - 3 - (4 -)) - 2 - - 1 - - 2 가 , 2 - (3,5

WO 00/32189

- 2 가

[, Dionne(1999), " COX - 2 inhibitors - IBC Conference, 12 - 13 April 1999, Coronado, CA, U.S.A."IDrugs, 2(7), 664 - 666].

가

가

- 2

가 가 가

- 2

, 1 1 mg 100 mg 1 가

가 , 가

:

(a) 0.5 ;

(b) 3 (T_{max}) ;

(c) 100 ng/Mℓ (C_{max})

" " , 가 20 ng/Mℓ , 25 75 ng/Mℓ .

1 , , , 가 , , ,

가 , , 가

가

1 1 4 , - 2

가

1 ,
 2 ,
 3 (犬) ,
 4 .

- 2 1 mg 가 100 mg , ,
 , 가 ,
 가 . 가 - 2
 , 가 가

- (a) 0.5 (, 20 ng/Mℓ) ;
- (b) 3 (T_{max}) ;
- (c) 100 ng/Mℓ (C_{max})

(a) (c) 가 (,) , 1 mg 100
 mg 가 (,) (a) (c)
 5 mg 40 mg 1

- (a) 20 ng/Mℓ, 50 ng/Mℓ 가 0.5 ;
- (b) T_{max} 가 3 ;

, HIV

()

(stent)

;

;

(),

(Barrett)

(FAP)

FAP

가

(,) ,

(, ,)

COX - 2

COX - 2 가

1 1 2 2

가

(,) , P -

1 , e-

(), S-
 (), , 3- -4- , 2- -4
 , p- , 5-
 , p-
 , 5'- -2'- , 1-
 0-

[The Merck Index, 12, Therapeutic Category and Biological Activity Index, S. Budaviri (1996), pp. Ther - 2 Ther - 3 Ther - 12 (Analgesic(Dental), Analgesic(Narcotic), Analgesic(Non-narcotic), Anti-inflammatory(Nonsteroidal)] 1 .

2 COX-2
 가 2 ,
 2 , - ,
 1mg 100mg
 2mg 60mg, 1/10
 5mg 40mg , 5mg, 1

0mg, 20mg 40mg . 가 (, ,)
1mg 100mg, 5mg 60mg,
10mg 50mg, , 10mg, 20mg 40mg .

5,633,272

가 1

1

가

가

1

1

가

가

1

(

)

가

1

/

가 , 가
 2 가 , 가
 (Pouring) 0.6 0.9g/Mℓ (tapping) 0.3 1.0g/Mℓ
 N) . 가 (: 1 50k
 4 kP, ; 5 kP, 6 kP
 18kP, 15kP, 12kP
 1.0% , 0.8% , 0.5%
 25 , 20 , 15 30
 . 2가 ,
 1 1 , ()
 1 () , 가 ,
 (Comil) , 가 ,
 가 . ,
 2 , 2 1 , ,
 1 , 가 ,
 2 2 , 2 , (Fitz mill)

가 , , , .

COX - 2 / .

1: 10mg

1 :

[1]

		(mg)
		10
NF, #310		105
NF(Avicel™ PH - 101)	2	60
NF(1500)		20
NF(Ac - Di - Sol™)		4
		1
		200

, , 20
 , (Hobart)
 가 , 10
 12 - 15
 (Gruenberg) (가 60 ± 5) 2.0 ± 1.0%(
)
 (Quadro) 14
 Patterson Kelley V - V -
 5 3
 가 7.5mm Manesty DB16
 가 10 ± 4 200 ± 10mg

2: 10mg

2 :

[2]

		(mg)
		10
NF, #310		103
NF(Avicel™ PH - 101)	2	603030
NF(1500)		20
NF(Ac - Di - Sol™)		633
		1
		200

가 45 (Watson Marlow) (Baker Perkins) 3
 2.0 ± 1.0% () (60 ± 5)
 800rpm 가 20 Patters 1
 on Kelley V - 5 3 7.5 mm
 Korsch PH - 230 200 ± 10mg
 6,8,10 12kP
 3: 5, 10, 20 40mg
 2 3 15%
 3% Opardry Yellow YS - 1 - 12525A Opardry White YS - 1 - 18027A

[3]

	/ (mg)			
	5	10	20	40
NF	108	103	206	186
NF	60	20	120	120
NF	20	20	40	40
NF	6	6	12	12
NF	1	1	2	2
()	200	200	400	400
Opardry Yellow YS - 1 - 12525A	6			12
Opardry White YS - 1 - 18027A		6	12	

3 4
 가 6 37 ± 2 가
 . 1000Mℓ
 가 2.5cm 2.5cm
 가

[4]

	5mg	10mg	20mg	40mg
				7
(mm)	3.6 ± 0.2	3.6 ± 0.2	4.8 ± 0.4	4.2 ± 0.3
(kP)	9 ± 3	9 ± 3	13 ± 5	13 ± 5
(%)	< 0.8	< 0.8	< 0.8	< 0.8
	12	12	12	12

4:

23 20mg(2) 2 0.5, 1, 1.5, 2, 2.
 5, 3, 4, 6, 8, 12 24 3000G HPLC 가 3
 - 20

5:

24 20mg(2) 2 0.5, 1,
 1.5, 2, 2.5, 3, 4, 6, 8, 12, 16 24 3000G HPLC
 - 20
 4

C_{max} () = 303 ± 93ng/Mℓ. T_{max} () = 2.97 ± 0.73h

(57)

1.

1 1mg 100mg 가 1
 :

(a) 0.5 ;

(b) 3 (T_{max}) ;

(c) 100 ng/Mℓ (C_{max})

2.

1 , 20ng/Mℓ .

3.

2 , 가
:

(a) 0.5 (, 20 ng/Mℓ) ;

(b) 3 (T_{max}) ;

(c) 100 ng/Mℓ (C_{max})

4.

1 , 1 5mg 40mg .

5.

1 4 , 5 % 99 % 1 ,
0.2 % 30 % 1 , 0.5 % 25 % 1 , 0.1% ,
10 % .

6.

5 , .

7.

1 4 , , ,
, .

8.

1 , 1 .

9.

1 8 , D₉₀ 75μm .

10.

1 8 , 1μm 10μm .

11.

1 8 , 10nm 1000nm .

12.

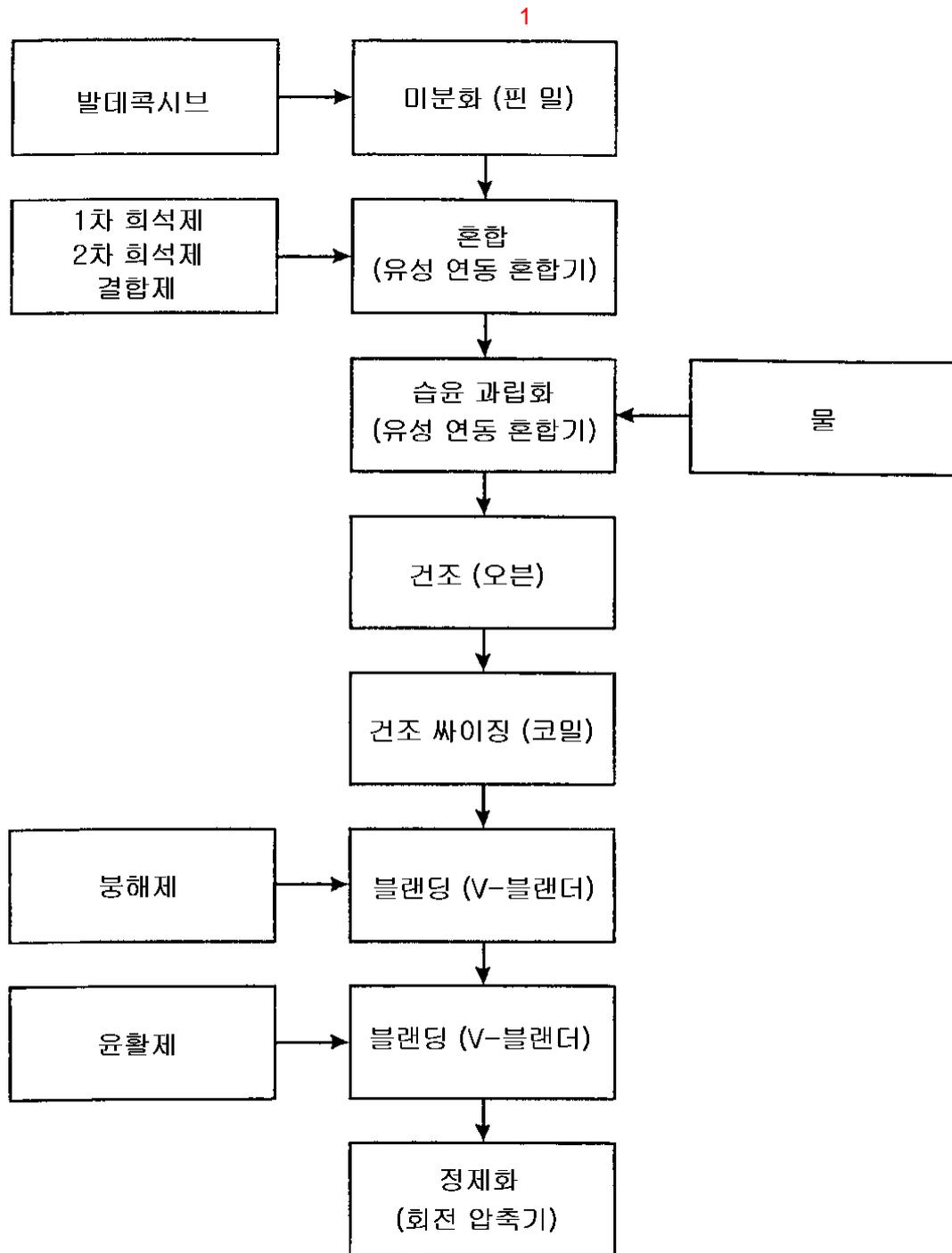
1 5 7 , , .

13.

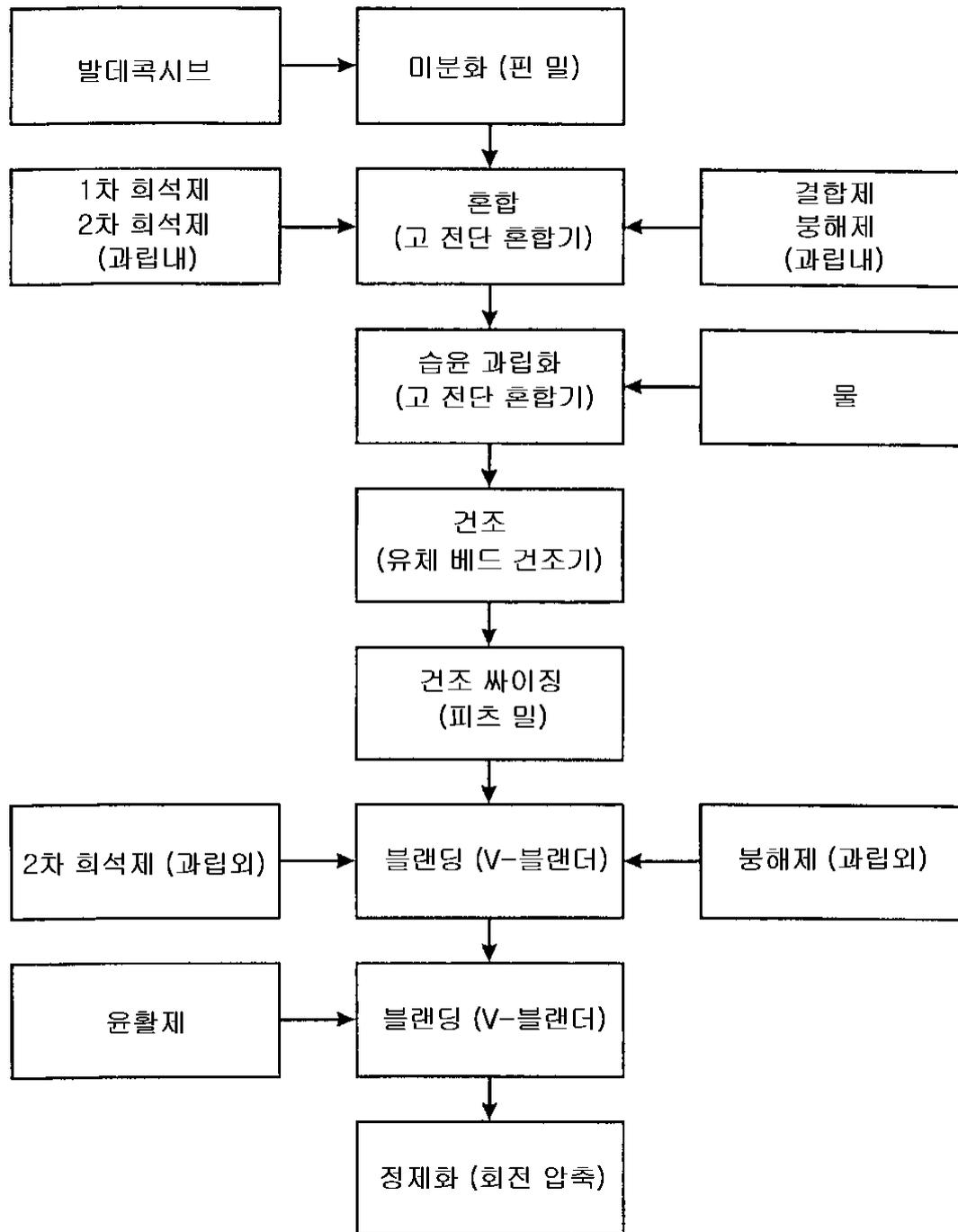
1 12 1 2 -
2- 가 .

14.

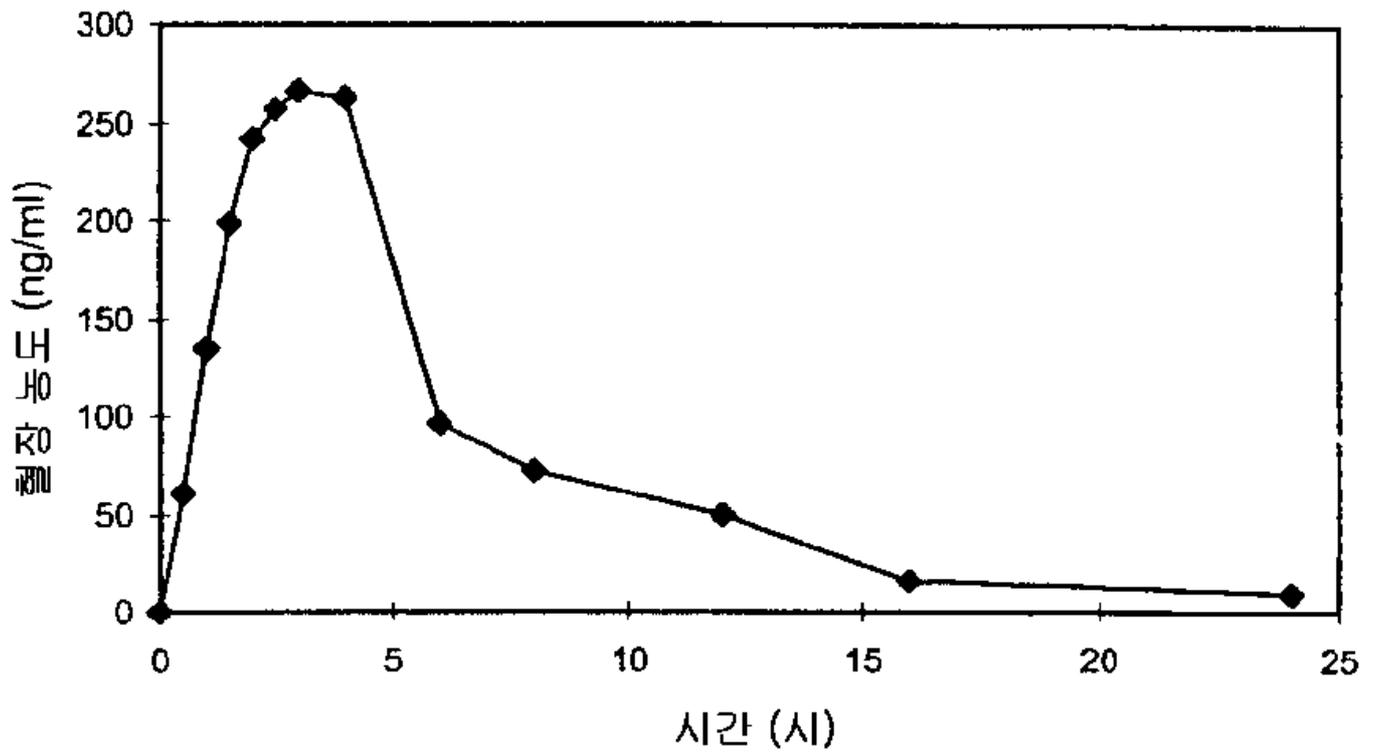
1 12 -2- 가 ,



2



3



4

