

From:

To:

Date: 3/24/2022 6:53:28 AM

Subject:

Attachments: .thmx

®
(AIGLIP)

1 : ; 50 ;

-4. A10B H02.

-4 (DPP-4). DPP-4. -1

(DPP-4 1) ()

II 50 100 HOMA- (-),

), -1 -

-1,

(C_{max}) 1,7 .

C_{max} - 2,5 , (AUC).

C_{max} (19 %).

®

85 %.

(9,3 %);

(V_{ss}) 71

69 %

, LAY151,
57 %

(BQS867)

(4 %

in vitro

, LAY151. DPP-4
in vivo

DPP-4.

450

CY 450,

in vitro

450.

CYP 1A2, CYP 2C8, CYP 2C9, CYP 2C19, CYP 2D6, CYP 2E1

CYP 3A4

[¹⁴ C]-

85 %

15 %

23 %

41

13

2

3

C_{max}

AUC

() .

DPP-4

®

- ' (6

12

)

(20 % 8 %

22 %.
%,

()

30

(50

)

50 < 80 / ,
< 30 /),

30 < 50 /

AUC

LAY151 BQS867 1,5, 3 7 AUC ,
() ,

LAY151 2-3 , (3 % 3-4-
, 4).
(70) (100
) 32 %, C_{max} - 18 %
(18 40). DPP-4

II.

- ,
- ,
- ;
- , ;
- , ;
- , ;
- , ;
(),

450 (CYP)

CYP 450,

(Pgp), (CYP2C9)

(. «).

®

I

®

®

3

()

®

3

®

®

NYHA

NYHA

V

NYHA

65

18

®

®

18

®

10

400

600

() ,

(LAY 151)

100

50 ()

100 (50

3

50

0,2 % , 0,3 %

0,2 %

50

/10),

(1/100, < 1/10),

(1/1000, < 1/100),

(> 10000, 1/1000),

:

(1 /10000),

()

100

100

0,4 %
0,2 %

100

2

100

100

100

+

+

100

(0,4 %).

(1 %)

100

2

50

50

0,6 %

50

0 %

+

50

, 1,2 % 0,6 % + .

50

100

∴ - ; -
∴ - ∴ -

100

+ 100 ,
+ (0,6 %), + (1,9 %).

100

1,4 2,7
100 (45)

7,0 % 2,5 %

50

∴ - ∴ -
∴ - ∴ -
∴ - ∴ -

0,6 %

+ + + + 0,6 %
+ + 1,9 % +
+)

100

()

∴ - ∴ -
∴ - ∴ - ; -
∴ - ∴ -

50

0,3 %

_____.

- : - ((

),).

: - , ,

, .

3

. , .

. .

10

. 3 6 .

. .

. « » (in bulk - ,).

,04080, . , . ,74.