

※個々の用語・表現につき、イートモ検索で得られた対訳を 1 件のみ提示します。

※実際にはたくさんのイートモ対訳がヒットしますので、文脈に応じて対訳を選択して適当に改変して利用してください。

和文原稿

16 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

(1)線形性

健康成人男性(6~12 例)にロラタジン錠 10、20 注)、40mg 注)を空腹時に単回経口投与したとき、DCL の血漿中濃度について線形性が認められた 1)。

(2)レディタブ錠 10mg と錠 10mg の生物学的同等性

健康成人男性(23 例)に空腹時、口腔内速溶錠(レディタブ錠)10mg 又は錠 10mg を水とともに、若しくはレディタブ錠 10mg を水なしでそれぞれ単回経口投与したとき、DCL の薬物動態パラメータ及び血漿中濃度推移は以下のとおりであった。レディタブ錠 10mg は、水なし又は水とともに服用した場合のいずれにおいても、錠 10mg(水あり)と生物学的に同等であることが確認された 2)。

16.1.2 反復投与

健康成人男性(5 例)にロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数は 1.3 であった。健康成人男性(6 例)にロラタジン錠 20mg 注)を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数はともに 1.3 であった 3)。

16.2 吸収

16.2.1 食事の影響(錠 10mg)

健康成人男性(12 例)にロラタジン錠 10mg を食後又は空腹時に単回経口投与したときのロラタジン及び DCL の薬物動態パラメータは、以下のとおりであった。DCL の全身曝露に及ぼす食事の影響は認められなかった 4)※。

16.3 分布

16.3.1 血漿タンパク結合

ヒト血漿に添加したときのタンパク結合率は、ロラタジン 96.8~97.9%、DCL 73.3~75.6%であった(測定法:平衡透析法)5) (in vitro)。

16.3.2 組織中放射能濃度(ラット)

ラット(n=3)に 14C-ロラタジンを反復経口投与したとき、組織中放射能は大部分の組織で血漿より高く、特に下垂体、甲状腺、副腎、肝臓、涙腺、肺に高濃度の分布が認められた。また、脳内濃度は血漿より低かった。組織中放射能の生物学的半減期は、いずれの組織とも血漿より長かった。甲状腺では 14 日間反復投与でも定常状態に到達せず、蓄積性が示唆された 6)。

16.4 代謝

ロラタジンは、ヒトに経口投与したとき、消化管から速やかに吸収され、初回通過効果によって DCL へと代謝される 7)。ヒトの肝ミクロソームを用いた in vitro 試験から、ロラタジンから DCL への代謝には CYP3A4 及び CYP2D6 の関与が確認されている 8)。[10. 参照]

16.5 排泄

健康成人男性(6 例)に 14C-ロラタジン 40mg 注)(水溶液)を空腹時に単回経口投与したとき、投与 10 日後までに

総投与量の約 80%が代謝物として尿及び糞中へ等量ずつ排泄された。尿中にロラタジンは検出されず、DCL は尿中放射能の 2%未満であった 7) (外国人データ)。

授乳婦(6 例)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したとき、少量のロラタジン及び DCL が母乳中に検出された。投与後 48 時間までの移行率は 0.03%であった。AUC 母乳/AUC 血漿比は、ロラタジン及び DCL についてそれぞれ 1.2 及び 0.8 であった 9) (外国人データ)。[\[9.6 参照\]](#)

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

(1)薬物動態パラメータ

腎機能障害患者(12 例:クレアチニンクリアランス \leq 29mL/min)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度の C_{max} 及び AUC は、健康成人男性(6 例:クレアチニンクリアランス $>$ 80mL/min)との比較において、ロラタジンでは 1.5~1.7 倍、DCL では約 2 倍に上昇した。腎機能障害患者におけるロラタジン及び DCL の $t_{1/2}$ はそれぞれ平均 8 時間及び 20 時間であり、いずれも健康成人と明らかな差は認められなかった 10) (外国人データ)。[\[9.2 参照\]](#)

(2)血液透析患者

重症の腎機能障害患者(6 例:クレアチニンクリアランス $<$ 5mL/min)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与後 4~8 時間(計 4 時間)に血液透析を行ったとき、血液透析を行わない場合と比較して、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度に変動は認められず、ロラタジン及び DCL ともに透析液中へはほとんど排出されなかった 10) (外国人データ)。[\[13.2 参照\]](#)

16.6.2 肝機能障害患者

肝機能障害患者(7 例)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、健康成人男性(24 例)との比較において、ロラタジンでは C_{max} が 1.4~1.7 倍、AUC が 2.8~3.8 倍に上昇し、DCL では C_{max} 、AUC ともに健康成人と明らかな差は認められなかった。肝機能障害患者におけるロラタジン及び DCL の $t_{1/2}$ はそれぞれ平均 24.1 時間及び 37.1 時間であり、健康成人の 2~3 倍に延長していた 11) (外国人データ)。[\[9.3 参照\]](#)

16.6.3 小児

健康小児(13 例、8~12 歳)にロラタジンシロップ 10mg(非売品)を食後に単回経口投与したときのロラタジン及び DCL の薬物動態パラメータ及び血漿中濃度推移は、以下のとおりであった 12) (外国人データ)。

小児及び成人の通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした国内製造販売後臨床薬理試験において、小児患者(104 例、7~15 歳)及び成人患者(104 例、16~64 歳)にそれぞれロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 28 日間反復投与したときのロラタジン及び DCL による全身曝露は、互いに類似していた 13)。

16.6.4 高齢者

高齢者(12 例、66~78 歳)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、非高齢の成人男性(24 例、21~39 歳)との比較において、ロラタジンでは C_{max} が 1.6~1.9 倍、AUC が 1.5~2.0 倍に上昇した。DCL では C_{max} が約 1.7 倍であったが、AUC に明らかな差は認められなかった。高齢者でのロラタジン及び DCL の $t_{1/2}$ はそれぞれ平均 18.2 時間及び 17.4 時間であった 14) (外国人データ)。[\[9.8 参照\]](#)

16.7 薬物相互作用

健康成人男性にロラタジン錠 10mg 及びエリスロマイシン(CYP3A4 の阻害剤)又はシメチジン(CYP3A4 及び CYP2D6 の阻害剤)を空腹時に 10 日間経口投与したときの血漿中ロラタジン及び DCL 濃度の変化率は下表に示すとおりであったが、QTc 間隔を含め心電図への影響は認められなかった 15)、16)。健康成人男性にロラタジン錠 10mg 及びケトコナゾール(国内では外用剤のみ発売)を空腹時に 10 日間経口投与したとき、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度の変化率は下表に示すとおりであったが、QTc 間隔を含め心電図への影響は認められなかった 16)

(外国人データ)。[10.2 参照]

16.8 その他

DCL の効力比は未変化体(ロラタジン)の 7.9 倍であり、ヒトに経口投与したときの主たる薬効に寄与しているのは DCL である。

注)本剤の成人における承認用量は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。」である。

16 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

(1)線形性

健康成人男性(6~12 例)にロラタジン錠 10、20、40mg を空腹時に単回経口投与したとき、DCL の血漿中濃度について線形性が認められた 1)。

(2)レディタブ錠 10mg と錠 10mg の生物学的同等性

健康成人男性(23 例)に空腹時、口腔内速溶錠(レディタブ錠)10mg 又は錠 10mg を水とともに、若しくはレディタブ錠 10mg を水なしでそれぞれ単回経口投与したとき、DCL の薬物動態パラメータ及び血漿中濃度推移は以下のとおりであった。レディタブ錠 10mg は、水なし又は水とともに服用した場合のいずれにおいても、錠 10mg(水あり)と生物学的に同等であることが確認された 2)。

16.1.2 反復投与

健康成人男性(5 例)にロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数は 1.3 であった。健康成人男性(6 例)にロラタジン錠 20mg 注)を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数はともに 1.3 であった 3)。

16.1.2 反復投与

健康成人男性(5 例)にロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数は 1.3 であった。健康成人男性(6 例)にロラタジン錠 20mg 注)を 1 日 1 回 5 日間、空腹時に反復経口投与したとき、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度は連投開始後 4 日までに定常状態に到達し、AUC(0-24hr)について算出した累積係数はともに 1.3 であった 3)。

Japanese and non-Japanese healthy adults received single oral administration of Drug A (1 mg tablet) in a fasting state on Day 1.

日本人及び外国人の健康成人に薬剤 A(1mg 錠)を 1 日目の空腹時に単回経口投与した。

The pharmacokinetics of Drug A was linear over the dose range of 30 to 640 mg in healthy subjects.

薬剤 A の薬物動態は健康被験者において 30~640mg の用量範囲で線形性を示した。

Patients must be able to swallow the study drug whole with the aid of water.

患者は水とともに治験薬をまるごと《そのまま》飲み込むことができなければならない。

The specific objectives of the completed studies were as

終了済みのこれらの試験の具体的な目的は以下の

follows: ...	とおりであった。
This is seen most commonly when steroid medications (such as prednisone) are taken.	これはステロイド薬(プレドニゾンなど)を服用したときに最も多くみられる。
The to-be-marketed tablet formulation is bioequivalent to the clinical trial tablet formulation.	販売用錠剤は治験用錠剤と生物学的に同等である。
In the repeat study, it was found that the increase in chromosomal aberrations was influenced by the protein concentration because, as the protein concentration in the media increased, the level of chromosomal aberrations decreased.	この再試験において、培養液中のタンパク質濃度が高くなるにつれて染色体異常の程度が軽減したことから、染色体異常の増加はタンパク質濃度の影響を受けていることが確認された。
連投→連続投与	
Continuous therapy with 10 mg of Drug A per day is therefore the optimal dose for the treatment of Disease A.	したがって、薬剤 A 1 日 10mg の連続投与は疾患 A の治療における至適用量である。
After repeated oral dosing of Drug A, steady-state was slowly reached in agreement with the long elimination half-lives of Drug A and its metabolite.	薬剤 A の反復経口投与後、薬剤 A とその代謝物の消失半減期が長いことと一致して、定常状態にはゆっくりと到達した。
Drug A concentrations reached steady-state levels by the third infusion with mean peak and trough concentrations across studies ranging from 150 to 250 and 40 to 80 µg/mL, respectively.	薬剤 A の濃度は3回目の点滴静注までに定常状態レベルに到達し、諸試験の平均ピーク濃度及び平均トラフ濃度はそれぞれ 150～250µg/mL 及び 40～80µg/mL であった。
Odds ratios (ORs) of individual studies were pooled to calculate a more accurate point estimate for each predictor.	個々の試験のオッズ比(OR)をプールし、各予測因子についてより正確な点推定値を算出した。
The cumulative factor (mean) for Cmax and AUC of Drug A fell within a range from 1.1 to 1.3 for each dose level.	薬剤 A の Cmax 及び AUC の累積係数(平均値)は、各用量とも 1.1～1.3 の範囲内に入った。
Mean Cmax and AUC in Japanese patients treated with Drug A 500 mg were higher compared with those in non-Japanese patients treated with multiple oral doses of Drug A 1000 mg.	薬剤 A 500mg が投与された日本人患者における Cmax 及び AUC の平均値は、薬剤 A 1000mg が反復経口投与された外国人患者よりも高かった。

16.2 吸収

16.2.1 食事の影響(錠 10mg)

健康成人男性(12例)にロラタジン錠 10mg を食後又は空腹時に単回経口投与したときのロラタジン及び DCL の薬物動態パラメータは、以下のとおりであった。DCL の全身曝露に及ぼす食事の影響は認められなかった 4)。

16.3 分布

16.3.1 血漿タンパク結合

ヒト血漿に添加したときのタンパク結合率は、ロラタジン 96.8~97.9%、DCL73.3~75.6%であった(測定法:平衡透析法)5) (in vitro)。

16.3.2 組織中放射能濃度(ラット)

ラット(n=3)に 14C-ロラタジンを反復経口投与したとき、組織中放射能は大部分の組織で血漿より高く、特に下垂体、甲状腺、副腎、肝臓、涙腺、肺に高濃度の分布が認められた。また、脳内濃度は血漿より低かった。組織中放射能の生物学的半減期は、いずれの組織とも血漿より長かった。甲状腺では 14 日間反復投与でも定常状態に到達せず、蓄積性が示唆された 6)。

The adjusted geometric mean ratios of Cmax and AUC of Drug A administered in the fed state to those in the fasted state were 1.1 and 1.0, respectively.	薬剤 A を食後投与したときの空腹時投与に対する Cmax 及び AUC の補正幾何平均の比はそれぞれ 1.1 及び 1.0 であった。
---	--

Gender, smoking status, and baseline FEV ₁ had no apparent effect on systemic exposure.	性別、喫煙状況、ベースライン FEV ₁ は全身曝露量に明らかな影響を及ぼさなかった。
--	--

An open-label, two-way crossover study was conducted in 20 healthy adult male subjects at a single center in Japan to evaluate the food effect on the pharmacokinetics of Drug A.	薬剤 A の薬物動態に対する食事の影響を評価するため、健康成人男性被験者 20 例を対象に国内の 1 施設で非盲検 2 期クロスオーバー試験が行われた。
---	--

The favorable characteristics of the antibiotic are its high rate of binding to protein.	この抗生物質の好ましい特徴はタンパク結合率が高いことである。
--	--------------------------------

The outcome of the risk-benefit assessment will be influenced by whether the effect occurs in most patients or only in certain outliers.	リスク・ベネフィット評価の結果は、この影響が大部分の患者に起こっているのか、あるいはある特定の例外者にのみ起こっているのかによって影響される。
--	---

より高く→よりも高く	
The higher concentration of Drug A found in the blood vs. the plasma indicates that the drug is taken up by blood cells.	薬剤 A の血中濃度は血漿中濃度よりも高く、本剤は血球に取り込まれることを示している。

高濃度の分布が認められた→高濃度に	
AST is present in high concentrations in hepatic, renal, cardiac, and skeletal muscle cells, hence damage to any of these tissues may increase plasma AST levels	AST は肝臓、腎臓、心臓、骨格筋の細胞に高濃度に存在するので、これらの組織のいずれかに損傷により、血漿中 AST 値が上昇することがある。

より低かった→よりも低かった	
Drug A was present in dialysate at 1.25, 2, and 3 hours after the start of infusion at low concentrations compared to those observed in plasma.	薬剤 A は点滴静注の開始から 1.25、2、3 時間後の透析液中に存在したが、濃度は血漿中の濃度よりも低かった。

より長かった→よりも長かった	
Duration of disease was longer in the monotherapy group than in the combination therapy group.	罹病期間は単独投与群のほうが併用投与群よりも長かった。

In the bile duct cannulated rat, unchanged drug was the major component in bile and feces after intravenous administration, suggesting the possible presence of enterohepatic circulation.	胆管カニューレ挿入ラットでは、未変化体が静脈内投与後の胆汁中及び糞中における主要成分であったことから、腸肝循環の存在が示唆された。
--	---

16.4 代謝

ロラタジンは、ヒトに経口投与したとき、消化管から速やかに吸収され、初回通過効果によって DCL へと代謝される 7)。ヒトの肝ミクロソームを用いた in vitro 試験から、ロラタジンから DCL への代謝には CYP3A4 及び CYP2D6 の関与が確認されている 8)。[10. 参照]

16.5 排泄

健康成人男性(6 例)に 14C-ロラタジン 40mg 注(水溶液)を空腹時に単回経口投与したとき、投与 10 日後までに総投与量の約 80%が代謝物として尿及び糞中へ等量ずつ排泄された。尿中にロラタジンは検出されず、DCL は尿中放射能の 2%未満であった 7)(外国人データ)。

授乳婦(6 例)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したとき、少量のロラタジン及び DCL が母乳中に検出された。投与後 48 時間までの移行率は 0.03%であった。AUC 母乳/AUC 血漿比は、ロラタジン及び DCL についてそれぞれ 1.2 及び 0.8 であった 9)(外国人データ)。[9.6 参照]

速やかに→急速に	
This substance, as with other hemotoxic substances, may be rapidly taken up by red blood cells to undergo redox cycling to the nitroso species.	この物質は、他の血液毒性物質と同様、赤血球によって急速に取り込まれ、酸化還元を受けてニトロソ系物質になると考えられる。

The difference is explained by a higher degree of first-pass effect in these subjects.	この差はこれらの被験者における高度の初回通過効果によって説明可能である。
--	--------------------------------------

Studies of the relation between dietary intake and sympathetic nervous system activity and of the pathogenesis of obesity-related hypertension suggest the involvement of the sympathetic nervous system.	食事と交感神経系活動の関係についての試験並びに肥満高血圧症の病因についての試験から、交感神経系の関与が示唆されている。
---	---

An aqueous solution containing an alkali metal salt and Compound A is desalted by electrodialysis.	アルカリ金属塩及び化合物 A を含有する水溶液を電気透析によって脱塩する。
--	---------------------------------------

Chiral chromatography has demonstrated the presence of two isomers in approximately equal quantities.	キラルクロマトグラフィーにより、2 つの異性体がほぼ等量で存在することが証明されている。
---	--

A small amount of enterohepatic circulation (< 5% of the radioactivity excreted in bile) was observed.	少量の腸肝循環(胆汁中に排泄された放射能の5%未満)が認められた。
--	-----------------------------------

Drug A undergoes conjugation metabolism, resulting in the production of small amounts of glucuronide (plasma) and sulfate (feces) metabolites.	薬剤 A は抱合代謝を受け、その結果、少量のグルクロン酸代謝物(血漿中)と硫酸代謝物(糞便中)が生成されることになる。
--	---

母乳中へ→乳汁中に	
Following a single oral dose to lactating rats, Drug A was found in rat milk at concentrations similar to those in maternal plasma.	授乳期のラットに単回経口投与後、薬剤 A はラット乳汁中に母体血漿中濃度と同等の濃度で検出された。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

(1)薬物動態パラメータ

腎機能障害患者(12例:クレアチンクリアランス \leq 29mL/min)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度の C_{max} 及び AUC は、健康成人男性(6例:クレアチンクリアランス $>$ 80mL/min)との比較において、ロラタジンでは 1.5~1.7 倍、DCL では約 2 倍に上昇した。腎機能障害患者におけるロラタジン及び DCL の $t_{1/2}$ はそれぞれ平均 8 時間及び 20 時間であり、いずれも健康成人と明らかな差は認められなかった 10)(外国人データ)。^[9.2 参照]

(2)血液透析患者

重症の腎機能障害患者(6例:クレアチンクリアランス $<$ 5mL/min)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与後 4~8 時間(計 4 時間)に血液透析を行ったとき、血液透析を行わない場合と比較して、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度に変動は認められず、ロラタジン及び DCL とともに透析液中へはほとんど排出されなかった 10)(外国人データ)。^[13.2 参照]

Concomitant administration of fluconazole at 200 mg QD resulted in a two-fold increase in Drug A plasma concentration.	フルコナゾールを 200mg の 1 日 1 回で併用投与した結果、薬剤 A の血漿中濃度が 2 倍に上昇した。
--	--

There is no apparent difference in half-life between adult patients not on dialysis and adult patients maintained on dialysis.	透析を受けていない成人患者と透析による維持療法を受けている成人患者の間で半減期に明らかな差はない。
--	---

Patients with congestive heart failure or ischemic heart disease who are undergoing hemodialysis may have a high prevalence of depression.	血液透析を受けているうつ病性心不全又は虚血性心疾患の患者は、うつ病の有病率が高いと考えられる。
--	---

Treatment of Drug A in combination with Drug B did not result in increased toxicity when compared to treatment with the individual drugs alone, indicating that the toxicity of Drug A and Drug B was not additive or synergistic.	薬剤 A を薬剤 B と併用投与しても個々の薬剤を単独投与した場合と比較して毒性の増強がなかったことから、薬剤 A と薬剤 B の毒性は相加的又は相乗的のどちらでもないことが示された。
--	--

排出されなかった→排出されない	
Hydroxyurea is not actively effluxed by any of these transporters.	ヒドロキシ尿素はこれらのトランスポーターのいずれによっても能動的に排出されない。

16.6.2 肝機能障害患者

肝機能障害患者(7例)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、健康成人男性(24例)との比較において、ロラタジンでは C_{max} が 1.4~1.7 倍、AUC が 2.8~3.8 倍に上昇し、DCL では C_{max}、AUC ともに健康成人と明らかな差は認められなかった。肝機能障害患者におけるロラタジン及び DCL の t_{1/2} はそれぞれ平均 24.1 時間及び 37.1 時間であり、健康成人の 2~3 倍に延長していた 11) (外国人データ)。

[9.3 参照]

16.6.3 小児

健康小児(13例、8~12歳)にロラタジンシロップ 10mg(非売品)を食後に単回経口投与したときのロラタジン及び DCL の薬物動態パラメータ及び血漿中濃度推移は、以下のとおりであった 12) (外国人データ)。

小児及び成人の通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした国内製造販売後臨床薬理試験において、小児患者(104例、7~15歳)及び成人患者(104例、16~64歳)にそれぞれロラタジン錠 10mg を 1 日 1 回 28 日間反復投与したときのロラタジン及び DCL による全身曝露は、互いに類似していた 13)。

Sleep duration was increased by a factor of about 2 following doses of Drug A and Drug B.	睡眠時間は薬剤 A 及び薬剤 B の投与後に約 2 倍に延長した。
---	-----------------------------------

Among these patients, the outcome at one year was as follows: ...	これらの患者における 1 年後の転帰は以下のとおりであった。
---	--------------------------------

An MHW Ordinance was enacted to cover not only ordinary clinical studies but also post-marketing clinical studies.	一般的な臨床試験のみならず製造販売後臨床試験にも対応するため、厚生省令が制定された。
--	--

The steady-state pharmacokinetics of Drug A following 50 mg tid dosing was similar between hyperglycemic and normoglycemic obese subjects.	50mg を 1 日 3 回投与したときの薬剤 A の定常状態における薬物動態は、高血糖の肥満被験者と正常血糖の肥満被験者の間で類似していた。
--	---

16.6.4 高齢者

高齢者(12例、66~78歳)にロラタジンカプセル 40mg 注(非売品)を空腹時に単回経口投与したときの血漿中濃度は、非高齢の成人男性(24例、21~39歳)との比較において、ロラタジンでは C_{max} が 1.6~1.9 倍、AUC が 1.5~2.0 倍に上昇した。DCL では C_{max} が約 1.7 倍であったが、AUC に明らかな差は認められなかった。高齢者でのロラタジン及び DCL の t_{1/2} はそれぞれ平均 18.2 時間及び 17.4 時間であった 14) (外国人データ)。[9.8 参照]

16.7 薬物相互作用

健康成人男性にロラタジン錠 10mg 及びエリスロマイシン (CYP3A4 の阻害剤) 又はシメチジン (CYP3A4 及び CYP2D6 の阻害剤) を空腹時に 10 日間経口投与したときの血漿中ロラタジン及び DCL 濃度の**変化率**は下表に示すとおりであったが、QTc 間隔を含め心電図への**影響は認められなかった** 15),16)。健康成人男性にロラタジン錠 10mg 及びケトコナゾール (国内では**外用剤のみ発売**) を空腹時に 10 日間経口投与したとき、血漿中ロラタジン及び DCL 濃度の**変化率**は下表に示すとおりであったが、QTc 間隔を含め心電図への**影響は認められなかった** 16) (外国人データ)。[10.2 参照]

16.8 その他

DCL の**効力比**は未変化体 (ロラタジン) の 7.9 倍であり、ヒトに経口投与したときの主たる**薬効に寄与**しているのは DCL である。

注) 本剤の成人における**承認用量**は、「通常、ロラタジンとして 1 回 10mg を 1 日 1 回、食後に経口投与する。」である。

Secondary endpoints included the annual rate of change in the serum creatinine concentration, ...	副次的評価項目は、血清中クレアチニン濃度の年間 変化率 、～などとした。
In all three studies, no effects on ECG parameters were observed when the drug was given at tolerated doses.	3 試験すべてにおいて、本剤を耐量で投与したとき、ECG パラメータに対する 影響は認められなかった 。
Accordingly, Drug A was developed and was first approved in Canada in 2015 as a topical product to be used once daily.	そこで、 薬剤 A が開発され、1 日 1 回の 外用剤 として 2015 年にカナダで初めて承認された。
These potency ratios indicate that the Drug A metabolite possesses about 1/1000th the potency of Drug B.	これらの 効力比 が示すように、 薬剤 A のこの代謝物は効力が 薬剤 B の約 1/1000 である。
The purpose of two negative controls was to ascertain that alcohol in the mouthrinse does not contribute to its activity.	2 つの陰性対照を設定した目的は、洗口液中のアルコールがその 薬効に寄与 していないことを確認することであった。
Although approved doses of oseltamivir are reasonable for treating early, mild cases of influenza A, higher doses and treatment for 7 to 10 days are considerations in treating severe infections.	オセルタミビルの 承認用量 は初期で軽症の A 型インフルエンザを治療するのに十分であるが、重症感染の治療にはより高用量を 7~10 日間投与することが考慮される。