

肝・胆・消化機能改善剤
日本薬局方 ウルソデオキシコール酸錠

日本標準商品分類番号
8 7 2 3 6 2

**ウルソデオキシコール酸錠100mg「サワイ」
URSODEOXYCHOLIC ACID

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示

**承認番号	22400AMX01434000
薬価収載	2013年6月
販売開始	1998年7月
効能追加	2009年11月

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)


- 1) 完全胆道閉塞のある患者〔利胆作用があるため、症状が増悪するおそれがある。〕
- 2) 劇症肝炎の患者〔症状が増悪するおそれがある。〕

【組成・性状】

・組成

ウルソデオキシコール酸錠100mg「サワイ」は、1錠中に日局ウルソデオキシコール酸100mgを含有する。
添加物として、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ステアリン酸Mg、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリソルベート80を含有する。

・製剤の性状

剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
割線入り素錠	 8.0 約155 2.8 〔識別コード：SW 170〕	白色 においはなく、 味は苦い

【効能・効果】

1. 下記疾患における利胆
 - 胆道(胆管・胆のう)系疾患及び胆汁うっ滞を伴う肝疾患
 - 慢性肝疾患における肝機能の改善
 - 下記疾患における消化不良
 - 小腸切除後遺症、炎症性小腸疾患
2. 外殻石灰化を認めないコレステロール系胆石の溶解
3. 原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善
4. C型慢性肝疾患における肝機能の改善

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

- 1) 原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善：
硬変期で高度の黄疸のある患者に投与する場合は、症状が悪化するおそれがあるため慎重に投与すること。血清ビリルビン値の上昇等がみられた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 2) C型慢性肝疾患における肝機能の改善：
(1) C型慢性肝疾患においては、まずウイルス排除療法を考慮することが望ましい。本薬にはウイルス排除作用はなく、現時点ではC型慢性肝疾患の長期予後に対する肝機能改善の影響は明らかではないため、ウイルス排除のためのインターフェロン治療無効例若しくはインターフェロン治療が適用できない患者に対して本薬の投与を考慮すること。
(2) 非代償性肝硬変患者に対する有効性及び安全性は確立していない。高度の黄疸のある患者に投与する場合は、症状が悪化するおそれがあるため慎重に投与すること。血清ビリルビン値の上昇等がみられた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

【用法・用量】

1. ウルソデオキシコール酸として、通常、成人1回50mg(本剤0.5錠)を1日3回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
2. 外殻石灰化を認めないコレステロール系胆石の溶解には、ウルソデオキシコール酸として、通常、成人1日600mg(本剤6錠)を3回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
3. 原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善には、ウルソデオキシコール酸として、通常、成人1日600mg(本剤6錠)を3回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。増量する場合の1日最大投与量は900mg(9錠)とする。
4. C型慢性肝疾患における肝機能の改善には、ウルソデオキシコール酸として、通常、成人1日600mg(本剤6錠)を3回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。増量する場合の1日最大投与量は900mg(9錠)とする。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 重篤な膵疾患のある患者〔原疾患が悪化するおそれがある。〕
- 2) 消化性潰瘍のある患者〔粘膜刺激作用があるため、症状が増悪するおそれがある。〕
- 3) 胆管に胆石のある患者〔利胆作用があるため、胆汁うっ滞を惹起するおそれがある。〕

2. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
スルフォニル尿素系経口糖尿病用薬 トルブタミド等	血糖降下作用を増強するおそれがある。	本剤は血清アルブミンとトルブタミドとの結合を阻害するとの報告がある。
コレステラミン等	本剤の作用を減弱するおそれがあるため、可能な限り間隔をあけて投与すること。	本剤と結合し、本剤の吸収を遅滞あるいは減少させるおそれがある。
制酸剤 水酸化アルミニウムゲル等	本剤の作用を減弱するおそれがある。	アルミニウムを含有する制酸剤は、本剤を吸着し、本剤の吸収を阻害するおそれがある。
脂質低下剤 クロフィブラート等	本剤をコレステロール胆石溶解の目的で使用する場合、本剤の作用を減弱するおそれがある。	クロフィブラートは胆汁中へのコレステロール分泌を促進するため、コレステロール胆石形成が促進されるおそれがある。

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用 (頻度不明)

間質性肺炎：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には、投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
消化器	下痢、悪心、食欲不振、便秘、胸やけ、胃不快感、腹痛、腹部膨満、嘔吐
過敏症	痒痒、発疹 ^{注)} 、蕁麻疹 ^{注)} 、紅斑(多形滲出性紅斑等) ^{注)} 等
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、ビリルビン上昇、 γ -GTP上昇
その他	全身倦怠感、めまい、白血球数減少

注)このような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、用量に注意して投与すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。〔動物実験(ラット)で妊娠前及び妊娠初期の大量(2,000mg/kg/日)投与により胎児毒性(胎児吸収)が報告されている。〕

6. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

【薬物動態】

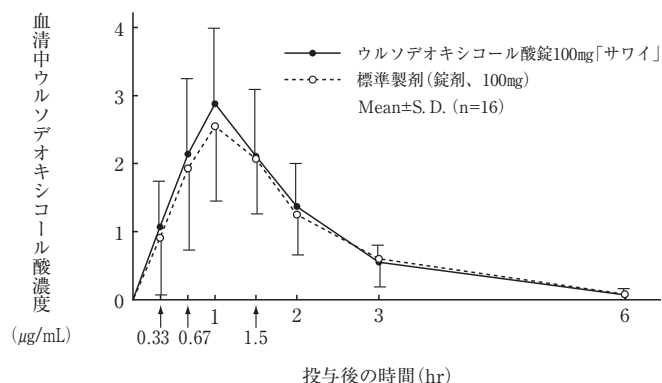
1. 生物学的同等性試験

ウルソデオキシコール酸錠100mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ3錠(ウルソデオキシコール酸として300mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血清中ウルソデオキシコール酸濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、 C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

各製剤3錠投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC _{0-6hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)
ウルソデオキシコール酸錠100mg「サワイ」	3.14 \pm 1.06	1.1 \pm 0.4	1.0 \pm 0.4	5.54 \pm 1.35
標準製剤(錠剤、100mg)	3.06 \pm 1.07	1.0 \pm 0.3	1.2 \pm 0.6	5.29 \pm 1.62

(Mean \pm S. D.)



血清中濃度ならびにAUC、 C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

本剤は熊胆(くまのい)の生理活性成分を化学的に合成したものであり強い利胆作用を持つ。

利胆作用(肝胆汁流量及びビリルビン排泄量の増加)、肝血流量増加作用、脂肪吸収促進作用、胆汁コレステロールの不飽和化作用、液晶形成作用、コレステロールの腸管吸収抑制作用を有す。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ウルソデオキシコール酸(Ursodeoxycholic Acid)

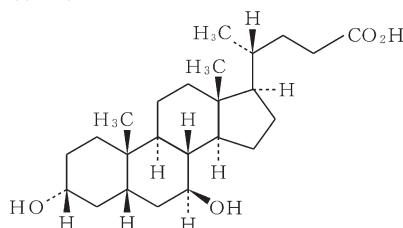
化学名：3 α ,7 β -Dihydroxy-5 β -cholan-24-oic acid

分子式：C₂₄H₄₀O₄

分子量：392.57

融点：200~204 $^{\circ}$ C

構造式：



性状：ウルソデオキシコール酸は白色の結晶又は粉末で、においはなく、味は苦い。メタノール、エタノール(99.5)又は酢酸(100)に溶けやすく、水にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

- 安定性試験
PTP包装及びバラ包装したものをを用いた加速試験(40 $^{\circ}$ C75%RH、6ヶ月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。³⁾

【包装】

PTP：100錠(10錠 \times 10)、1,000錠(10錠 \times 100)

バラ：1,000錠

【主要文献及び文献請求先】

- 主要文献
1) 沢井製薬(株)社内資料 [生物学的同等性試験]
2) “第14改正日本薬局方 解説書,” 廣川書店, 東京, 2001, C-318~C-322.
3) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]
- 文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]
沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL: 0120-381-999 FAX: 06-6394-7355

* 製造販売元
沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K17 A121217