

\*\* 2020年3月改訂 (第5版)  
\* 2012年12月改訂

日本標準商品分類番号  
8 7 2 3 6 2

貯 法：室温保存、気密容器

使用期限：外箱等に表示

注 意：「取扱い上の注意」の項参照

	錠50mg[JG]	錠100mg[JG]
* 承認番号	22400AMX 00862000	22400AMX 00863000
* 薬価収載	2012年12月	2012年12月
販売開始	2009年8月	2009年8月
効能追加	2011年2月	2011年2月

## 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

## \*ウルソデオキシコール酸錠50mg「JG」

## \*ウルソデオキシコール酸錠100mg「JG」

### 【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]

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ので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。

### \*【組成・性状】

販売名	ウルソデオキシコール酸錠50mg「JG」	ウルソデオキシコール酸錠100mg「JG」
成分・含量 (1錠中)	ウルソデオキシコール酸 50mg	ウルソデオキシコール酸 100mg
添加物	乳糖水和物、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム	
色・剤形	白色の素錠	片面割線入りの白色の素錠
外形		
大きさ(mm)	直径：6.0 厚さ：2.4	直径：8.0 厚さ：2.7
重量(mg)	75	150
識別コード	JG E51	JG E52

### 【効能・効果】

- 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
- 外殻石灰化を認めないコレステロール系胆石の溶解
- 原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善
- 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>

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が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ので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。

C型慢性肝疾患における肝機能の改善：

- ・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。
- ・非代償性肝硬変患者に対する有効性及び安全性は確

### 【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)重篤な痔疾患のある患者 [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 [利胆作用により、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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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汁溶解の目的で使用する場合は、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、コレステロール胆汁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	紅斑（多形滲出性紅斑等） <sup>注1</sup> 、痒疹、発疹 <sup>注1</sup> 、蕁麻疹 <sup>注1</sup> 等
肝臓	AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、ALP 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ため、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：

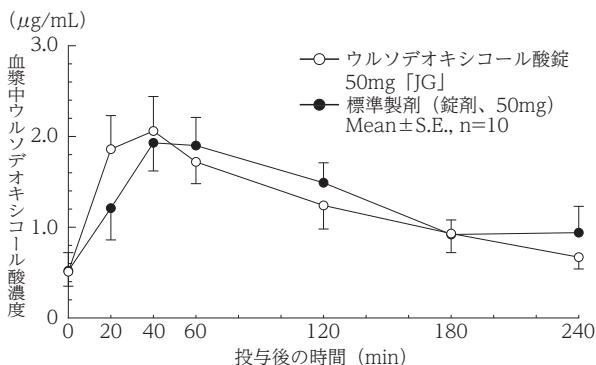
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。（PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている）

## \*【薬物動態】

### 1.生物学的同等性試験

#### (1)ウルソデオキシコール酸錠50mg [JG]

ウルソデオキシコール酸錠50mg [JG] と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（ウルソデオキシコール酸として100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について分散分析に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。<sup>1)</sup>



### 薬物動態パラメータ

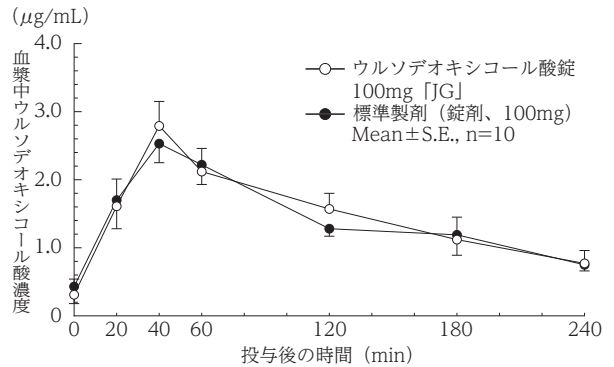
	判定パラメータ	
	AUC <sub>0-240min</sub> (µg・min/mL)	Cmax (µg/mL)
ウルソデオキシコール酸錠50mg [JG]	303±37	2.44±0.40
標準製剤 (錠剤、50mg)	317±35	2.43±0.34

(Mean ± S.E., n = 10)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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)ウルソデオキシコール酸錠100mg [JG]

ウルソデオキシコール酸錠100mg [JG] と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ウルソデオキシコール酸として100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について分散分析に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。<sup>2)</sup>



### 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ	
	AUC <sub>0-240min</sub> (µg・min/mL)	Cmax (µg/mL)
ウルソデオキシコール酸錠100mg [JG]	360±34	3.04±0.29
標準製剤 (錠剤、100mg)	349±21	2.87±0.21

(Mean ± S.E., n = 10)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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

ウルソデオキシコール酸錠50mg [JG] 及びウルソデオキシコール酸錠100mg [JG] は、日本薬局方医薬品各条に定められたウルソデオキシコール酸錠の溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>3)</sup>

## 【薬効薬理】

### 1.利胆作用

ハムスターにウルソデオキシコール酸を持続静脈内投与することにより、胆汁分泌量の増加が認められた。また、胆汁脂質（総胆汁酸、総コレステロール、リン脂質）分泌量も同様に増加傾向が認められた。<sup>4)</sup>

### 2.胆汁うっ滞防止作用

17α-ethynyl estradiol投与によるラット実験的肝内胆汁うっ滞モデルにおいて、ウルソデオキシコール酸の同時経口投与により、胆汁流量の減少が改善された。また、胆汁中への総胆汁酸排泄量は有意に増加した。<sup>4)</sup>

### 3. コレステロールの消化管吸収抑制作用

高コレステロール血症マウスにウルソデオキシコール酸を経口投与したところ、血清及び肝中総コレステロールは用量依存的に低下した。また、糞中への総コレステロールの排泄量は有意な増加を認めた。<sup>4)</sup>

### 4. 胆石生成抑制作用

マウスを用いたコレステロール系胆石モデルにおいて、ウルソデオキシコール酸0.03、0.15%の添加飼料を投与したところ、胆石発生率が著明に低下した。<sup>4)</sup>

### 5. 肝HMG-CoA reductase活性抑制作用

ラット肝ミクロゾーム中HMG-CoA reductaseに対するウルソデオキシコール酸の作用を*in vitro*で検討した。HMG-CoA reductaseに対して $10^{-3}$ 及び $5 \times 10^{-3}$ M添加において無添加時の52.7及び23.2%に活性を低下させた。<sup>4)</sup>

### 〈文献請求先・お問合せ先〉

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室  
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号  
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

## \*\*【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

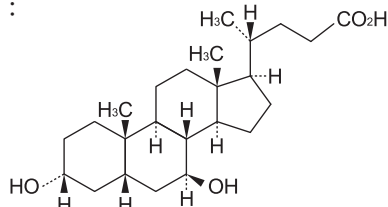
(Ursodeoxycholic Acid)

化学名：3 $\alpha$ ,7 $\beta$ -Dihydroxy-5 $\beta$ -cholan-24-oic acid

分子式：C<sub>24</sub>H<sub>40</sub>O<sub>4</sub>

分子量：392.57

構造式：



性状：白色の結晶又は粉末で、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。

融点：201~205℃

## \*【取扱い上の注意】

### 安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、ウルソデオキシコール酸錠50mg「JG」及びウルソデオキシコール酸錠100mg「JG」は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。<sup>5)</sup>

## \*【包装】

ウルソデオキシコール酸錠50mg「JG」

PTP：100錠（10錠×10）、1000錠（10錠×100）

バラ：1000錠

ウルソデオキシコール酸錠100mg「JG」

PTP：100錠（10錠×10）、1000錠（10錠×100）

バラ：1000錠

## \*【主要文献及び文献請求先】

### 〈主要文献〉

- 1) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；生物学的同等性試験
- 2) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；生物学的同等性試験
- 3) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；溶出試験
- 4) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；薬効薬理試験
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；安定性試験

