

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「トワ」
ウルソデオキシコール酸錠100mg「トワ」

URSODEOXYCHOLIC ACID TABLETS 50mg “TOWA” / TABLETS 100mg “TOWA”

貯 法：室温保存
有効期間：3年

	錠50mg	錠100mg
承認番号	22500AMX00722	22500AMX00723
販売開始	1997年9月	1997年7月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）
- 2.1 完全胆道閉塞のある患者 [9.3.1参照]
- 2.2 劇症肝炎の患者 [9.3.2参照]

3. 組成・性状
3.1 組成

販売名	ウルソデオキシコール酸錠 50mg「トワ」	ウルソデオキシコール酸錠 100mg「トワ」
1錠中の 有効成分	日局 ウルソデオキシコール酸50mg	日局 ウルソデオキシコール酸100mg
添加剤	トウモロコシデンプン、乳 糖水合物、カルメロースカ ルシウム、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	トウモロコシデンプン、結 晶セルロース、ポビドン、 クロスカルメロースナトリ ウム、軽質無水ケイ酸、ス テアリン酸マグネシウム

3.2 製剤の性状

販売名		ウルソデオキシコール酸錠 50mg「トワ」	ウルソデオキシコール酸錠 100mg「トワ」
性状・剤形		白色、円形、レンズ状の素錠である。	片面割線入りの白色素錠で、においはなく、味は苦い。
識別コード	本体	Tw U01	Tw U02
	包装	Tw. U01	Tw. U02
外形	表		
	裏		
	側面		
直径(mm)		6.0	8.0
厚さ(mm)		2.9	2.7
質量(mg)		75	150

4. 効能又は効果

- 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

5. 効能又は効果に関連する注意

- 〈C型慢性肝疾患における肝機能の改善〉
- 5.1 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。
- 5.2 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。[9.3.5参照]

6. 用法及び用量

効能又は効果	用法及び用量
・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	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。
・外殻石灰化を認めないコレステロ ール系胆石の溶解	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。
・原発性胆汁性肝硬変における肝機能 の改善	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。
・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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

- 9.1 合併症・既往歴等のある患者
- 9.1.1 重篤な脾疾患のある患者
原疾患が悪化するおそれがある。
- 9.1.2 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。
- 9.3 肝機能障害患者
- 9.3.1 完全胆道閉塞のある患者
投与しないこと。利胆作用があるため、症状が増悪するおそれ
がある。[2.1参照]
- 9.3.2 劇症肝炎の患者
投与しないこと。症状が増悪するおそれがある。[2.2参照]

9.3.3 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。

9.3.4 原発性胆汁性肝硬変の硬変期で高度の黄疸のある患者

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。症状が悪化するおそれがある。

9.3.5 C型慢性肝疾患で高度の黄疸のある患者

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。症状が悪化するおそれがある。[5.2 参照]

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。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が報告されている。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒトで母乳への移行が認められている。

9.8 高齢者

用量に注意して投与すること。一般に生理機能が低下している。

10. 相互作用

10.2 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
コレステラミン コレステミド	本剤の作用を減弱するおそれがあるので、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 合成ケイ酸アルミニウム 水酸化アルミニウム ゲル・水酸化マグネシウム	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 ベザフィブラート フェノフィブラート	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。	クロフィブラート等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。

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認め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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 間質性肺炎（頻度不明）

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。

11.2 その他の副作用

	1～5%未満	0.1～1%未満	0.1%未満	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		そう痒、発疹	蕁麻疹等	紅斑（多形滲出性紅斑等）
肝臓		AST上昇、ALT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	白血球数減少	

注）発現頻度は製造販売後調査の結果を含む。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

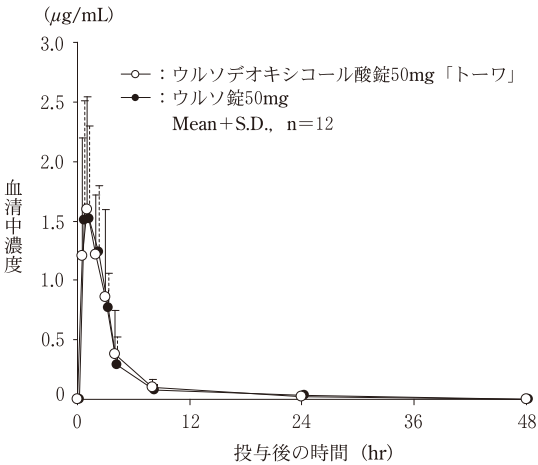
16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

〈ウルソデオキシコール酸錠50mg「トーワ」〉

ウルソデオキシコール酸錠50mg「トーワ」とウルソ錠50mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ4錠（ウルソデオキシコール酸として200mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血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⁾



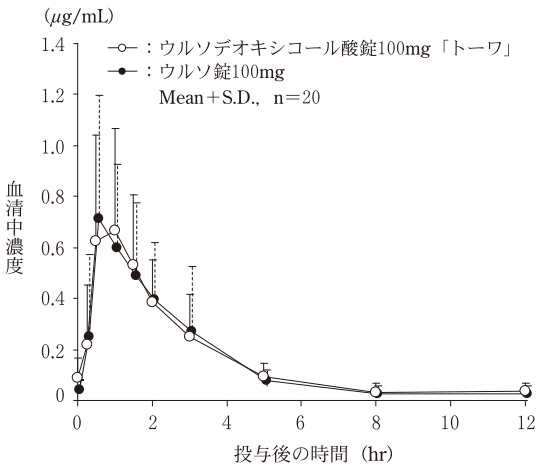
	製剤投与量 (ウルソデオキシ コール酸として)	判定パラメータ		参考パラメータ
		AUC ₀₋₄₈ (μg・hr/mL)	Cmax (μg/mL)	
ウルソデオキシコール酸錠 50mg「トーワ」	4錠 (200mg)	6.308±1.264	2.233±0.474	1.33±0.94
ウルソ錠50mg	4錠 (200mg)	6.157±0.607	2.164±0.375	1.13±0.80

(Mean±S.D., n=12)

血中濃度並びに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。

〈ウルソデオキシコール酸錠100mg「トーワ」〉

ウルソデオキシコール酸錠100mg「トーワ」とウルソ錠100mg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。²⁾



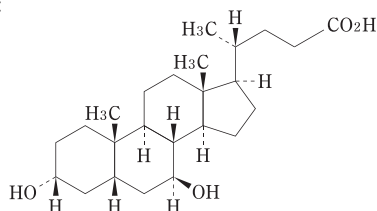
	判定パラメータ		参考パラメータ
	AUC ₀₋₁₂ (μg・hr/mL)	Cmax (μg/mL)	
ウルソデオキシコール酸錠 100mg「トーワ」	1.99±0.59	0.87±0.39	1.28±0.88
ウルソ錠100mg	1.91±0.58	0.92±0.38	1.23±0.91

(Mean±S.D., n=20)

血中濃度並びに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。

19. 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



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

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℃

22. 包装

〈ウルソデオキシコール酸錠50mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

〈ウルソデオキシコール酸錠100mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10：PTP]

1000錠 [10錠×100：PTP]

1000錠 [バラ]

23. 主要文献

- 1) 社内資料：生物学的同等性試験（錠50mg）
- 2) 社内資料：生物学的同等性試験（錠100mg）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学術部DIセンター

〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号

TEL 0120-108-932 FAX 06-7177-7379

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号