

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  
 ウルデストン<sup>®</sup>錠50mg  
 ウルデストン<sup>®</sup>錠100mg

URDESTON<sup>®</sup> TABLETS 50mg / TABLETS 100mg







貯 法：室温保存、気密容器  
 使用期限：外箱、ラベルに記載

日本標準商品分類番号 872362					
	承認番号	薬価収載	販売開始	※効能追加	再評価(品質)
錠50mg	22100AMX00124	2009年11月	1997年9月	2010年1月	2004年9月
錠100mg	22100AMX00768	2009年9月	1997年7月	2010年1月	2004年9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】

		ウルデストン錠50mg	ウルデストン錠100mg
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
添加物		トウモロコシデンプン、乳糖水和物、カルメロースCa、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸Mg	トウモロコシデンプン、セルロース、ポビドン、クロスカルメロースNa、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg
性状		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	TM 103	TwUS
	包装		Tw. US
外形	表		
	裏		
	側面		
錠径(mm)		6.0	8.0
厚さ(mm)		2.9	2.7
質量(mg)		75	150

※【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】

※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。

※【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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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、嘔吐、胃不快感、腹痛、腹部膨満
過敏症	そう痒、発疹 <sup>2)</sup> 、蕁麻疹 <sup>2)</sup> 、紅斑（多形滲出性紅斑等） <sup>2)</sup> 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	全身けん怠感、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女性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（2000mg/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

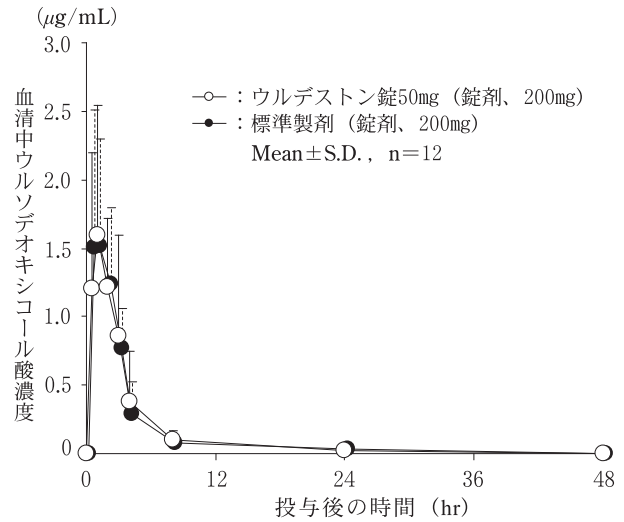
薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

#### \*\*\*【薬物動態】

#### 生物学的同等性試験

##### 1) ウルデiston錠50mg

ウルデiston錠50mgと標準製剤を、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（n=12）に単回経口投与して血清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（昭和55年5月30日 薬審第718号に基づく）<sup>1)</sup>。



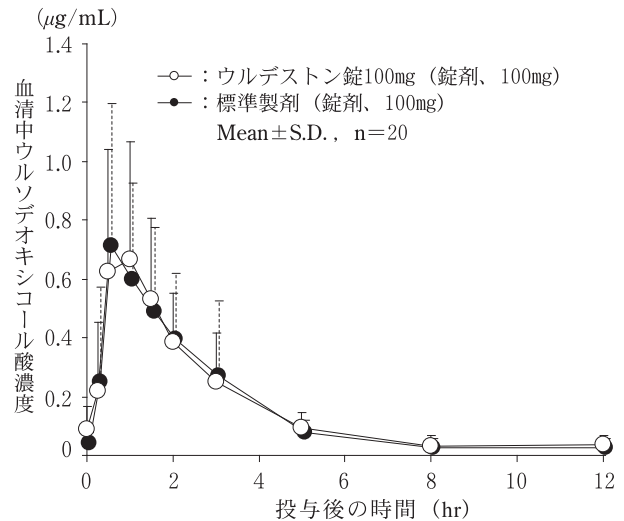
	判定パラメータ			参考パラメータ
	AUC <sub>48</sub> (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	
ウルデiston錠50mg (錠剤、200mg)	6.308 ± 1.264	2.233 ± 0.474	1.33 ± 0.94	
標準製剤 (錠剤、200mg)	6.157 ± 0.607	2.164 ± 0.375	1.13 ± 0.80	

(Mean ± S.D., n=12)

血清中濃度並びに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) ウルデiston錠100mg

ウルデiston錠100mg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（n=20）に絶食単回経口投与して血清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（昭和55年5月30日 薬審第718号に基づく）<sup>2)</sup>。



	判定パラメータ			参考パラメータ
	AUC <sub>12</sub> (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	
ウルデiston錠100mg (錠剤、100mg)	1.99 ± 0.59	0.87 ± 0.39	1.28 ± 0.88	
標準製剤 (錠剤、100mg)	1.91 ± 0.58	0.92 ± 0.38	1.23 ± 0.91	

(Mean ± S.D., n=20)

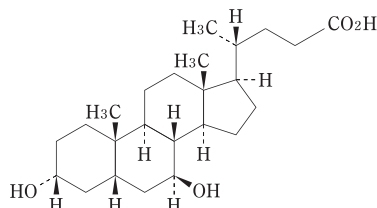
血清中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### ※※溶出挙動

ウルデストン錠50mg及びウルデストン錠100mg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それぞれ適合していることが確認されている<sup>3)4)</sup>。

### 【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 $\alpha$ ,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

性状：白色の結晶又は粉末で、においはなく、味は苦い。エタノール(95)、エタノール(99.5)又は酢酸(100)に溶けやすく、クロロホルムに溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。水酸化ナトリウム試液に溶ける。

融点：200～204℃

### 【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、ウルデストン錠50mg及びウルデストン錠100mgは通常の市場流通下においてそれぞれ3年間安定であることが推測された<sup>5)6)</sup>。

### 【包装】

ウルデストン錠50mg：100錠、1000錠 (PTP)

ウルデストン錠100mg：100錠、1000錠 (PTP) 1000錠 (バラ)

### 【主要文献】

- 1) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(錠50mg)
- 2) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(錠100mg)
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験(錠50mg)
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験(錠100mg)
- 5) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験(錠50mg)
- 6) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験(錠100mg)

### 【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい。

東和薬品株式会社 学術部DIセンター (24時間受付)

〒571-8580 大阪府門真市新橋町2番11号

☎0120-108-932 TEL 06-6900-9108 FAX 06-6908-5797

<http://www.towayakuhin.co.jp/forstaff>



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