

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019年更新版）に準拠して作成

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」

Ursodeoxycholic Acid Tablets

剤形	素錠
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠 50mg：1錠中 日局 ウルソデオキシコール酸 50mg 含有 錠 100mg：1錠中 日局 ウルソデオキシコール酸 100mg 含有
一般名	和名：ウルソデオキシコール酸（JAN） 洋名：Ursodeoxycholic Acid（JAN、INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2012年8月3日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2012年12月14日（販売名変更による） 販売開始年月日：1997年7月11日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本ジェネリック株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客さま相談室 TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/

本 IF は 2025 年 12 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、
「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには
十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I Fは
日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正
使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性
及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オ
ブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承
認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うこ
とは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自ら
がI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得ら
れる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは
薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	8
1. 開発の経緯	1	9. 溶出性	8
2. 製品の治療学的特性	1	10. 容器・包装	12
3. 製品の製剤学的特性	1	(1)注意が必要な容器・包装、外観が特殊な 容器・包装に関する情報	12
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	12
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	13
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	13
(2)流通・使用上の制限事項	1	11. 別途提供される資材類	13
6. RMPの概要	1	12. その他	13
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	14
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	14
(1)和名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	14
(2)洋名	2	3. 用法及び用量	14
(3)名称の由来	2	(1)用法及び用量の解説	14
2. 一般名	2	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	15
(1)和名（命名法）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	15
(2)洋名（命名法）	2	5. 臨床成績	15
(3)ステム（stem）	2	(1)臨床データパッケージ	15
3. 構造式又は示性式	2	(2)臨床薬理試験	15
4. 分子式及び分子量	2	(3)用量反応探索試験	15
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(4)検証的試験	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1)有効性検証試験	15
III. 有効成分に関する項目	3	2)安全性試験	16
1. 物理化学的性質	3	(5)患者・病態別試験	16
(1)外観・性状	3	(6)治療的使用	16
(2)溶解性	3	1)使用成績調査（一般使用成績調査、特 定使用成績調査、使用成績比較調査）、 製造販売後データベース調査、製造販 売後臨床試験の内容	16
(3)吸湿性	3	2)承認条件として実施予定の内容又は実 施した調査・試験の概要	16
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(7)その他	16
(5)酸塩基解離定数	3	VI. 薬効薬理に関する項目	17
(6)分配係数	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	17
(7)その他の主な示性値	3	2. 薬理作用	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1)作用部位・作用機序	17
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	17
IV. 製剤に関する項目	4	(3)作用発現時間・持続時間	18
1. 剤形	4	VII. 薬物動態に関する項目	19
(1)剤形の区別	4	1. 血中濃度の推移	19
(2)製剤の外観及び性状	4	(1)治療上有効な血中濃度	19
(3)識別コード	4	(2)臨床試験で確認された血中濃度	19
(4)製剤の物性	4	(3)中毒域	20
(5)その他	4	(4)食事・併用薬の影響	20
2. 製剤の組成	4	2. 薬物速度論的パラメータ	20
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	4	(1)解析方法	20
(2)電解質等の濃度	4	(2)吸収速度定数	20
(3)熱量	4	(3)消失速度定数	20
3. 添付溶解液の組成及び容量	5		
4. 力価	5		
5. 混入する可能性のある夾雑物	5		
6. 製剤の各種条件下における安定性	5		
7. 調製法及び溶解後の安定性	8		

(4)クリアランス	20	(1)臨床使用に基づく情報	26
(5)分布容積	21	(2)非臨床試験に基づく情報	26
(6)その他	21		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	21	IX. 非臨床試験に関する項目	27
(1)解析方法	21	1. 薬理試験	27
(2)パラメータ変動要因	21	(1)薬効薬理試験	27
4. 吸収	21	(2)安全性薬理試験	27
5. 分布	21	(3)その他の薬理試験	27
(1)血液－脳関門通過性	21	2. 毒性試験	27
(2)血液－胎盤関門通過性	21	(1)単回投与毒性試験	27
(3)乳汁への移行性	21	(2)反復投与毒性試験	27
(4)髄液への移行性	21	(3)遺伝毒性試験	27
(5)その他の組織への移行性	21	(4)がん原性試験	27
(6)血漿蛋白結合率	21	(5)生殖発生毒性試験	27
6. 代謝	22	(6)局所刺激性試験	27
(1)代謝部位及び代謝経路	22	(7)その他の特殊毒性	27
(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	22	X. 管理的事項に関する項目	28
(3)初回通過効果の有無及びその割合	22	1. 規制区分	28
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	22	2. 有効期間	28
7. 排泄	22	3. 包装状態での貯法	28
8. トランスポーターに関する情報	22	4. 取扱い上の注意	28
9. 透析等による除去率	22	5. 患者向け資材	28
10. 特定の背景を有する患者	22	6. 同一成分・同効薬	28
11. その他	22	7. 国際誕生年月日	28
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	23	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	28
1. 警告内容とその理由	23	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	29
2. 禁忌内容とその理由	23	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	29
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	23	11. 再審査期間	29
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	23	12. 投薬期間制限に関する情報	29
5. 重要な基本的注意とその理由	23	13. 各種コード	29
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	23	14. 保険給付上の注意	29
(1)合併症・既往歴等のある患者	23	X I. 文献	30
(2)腎機能障害患者	23	1. 引用文献	30
(3)肝機能障害患者	23	2. その他の参考文献	30
(4)生殖能を有する者	24	X II. 参考資料	31
(5)妊婦	24	1. 主な外国での発売状況	31
(6)授乳婦	24	2. 海外における臨床支援情報	31
(7)小児等	24	X III. 備考	32
(8)高齢者	24	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	32
7. 相互作用	24	(1)粉碎	32
(1)併用禁忌とその理由	24	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	34
(2)併用注意とその理由	24	2. その他の関連資料	34
8. 副作用	25		
(1)重大な副作用と初期症状	25		
(2)その他の副作用	25		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	25		
10. 過量投与	25		
11. 適用上の注意	26		
12. その他の注意	26		

略語表

略語	略語内容
ALP	アルカリホスファターゼ (Alkaline phosphatase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
AUC	血漿中濃度-時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC _{0-240min}	投与 240 分後までの AUC (AUC from zero to 240 minutes)
CA	コール酸 (Cholic acid)
CDCA	ケノデオキシコール酸 (Chenodeoxycholic acid)
Cmax	最高血漿中濃度 (Maximum plasma concentration)
γ -GTP	γ -グルタミルトランスぺプチターゼ (γ -Glutamyl transpeptidase)
GUDCA	グリコウルソデオキシコール酸 (Glycoursodeoxycholic Acid)
IL	インターロイキン (Interleukin)
MIP	マクロファージ炎症性タンパク質 (Macrophage inflammatory protein)
PMT	N-ピリドキシル-5-メチルトリプトファン (N-Pyridoxyl-5-methyltryptophan)
RH	相対湿度 (Relative humidity)
S.E.	標準誤差 (Standard error)
TNF	腫瘍壊死因子 (Tumor Necrosis Factor)

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

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、ウルソデオキシコール酸を含有する肝・胆・消化機能改善剤である。

本邦では、1962年に発売されている。

本剤は、扶桑薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料について」（昭和55年5月30日 薬発第698号）に基づき、規格及び試験方法、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1996年4月に製造承認を取得した。その後、2009年7月に扶桑薬品工業株式会社から日本ジェネリック株式会社が製造販売承認を承継した。

2011年2月には、「原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善」及び「C型慢性肝疾患における肝機能の改善」の効能・効果が追加され、それに伴い、用法・用量が変更された。

なお、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、「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成12年9月19日 厚生省医薬安全局長通知 医薬発第935号）に基づき、2012年8月にレプター錠 50及びレプター錠 100の販売名を変更した。

2. 製品の治療学的特性

重大な副作用として、間質性肺炎が報告されている。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 - 8. 副作用、(1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

- ・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」

(2) 洋名

- ・Ursodeoxycholic Acid Tablets 50mg “JG”
- ・Ursodeoxycholic Acid Tablets 100mg “JG”

(3) 名称の由来

「一般的名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」より命名
〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ウルソデオキシコール酸（JAN）

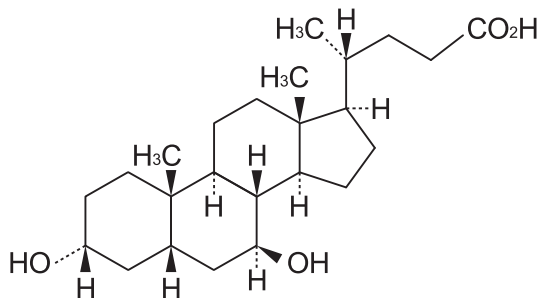
(2) 洋名（命名法）

Ursodeoxycholic Acid（JAN、INN、EP）

(3) ステム（s t e m）

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₄H₄₀O₄

分子量：392.57

5. 化学名（命名法）又は本質

3α,7β-Dihydroxy-5β-cholan-24-oic acid（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は粉末で、味は苦い。

(2) 溶解性

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。

溶解度 (37°C) ¹⁾	pH1.2 : 0.0027mg/mL pH4.0 : 0.0036mg/mL pH6.8 : 0.222mg/mL pH7.0 [*] : 0.314mg/mL 水 : 0.0064mg/mL ※：薄めた McIlvaine 緩衝液
--------------------------	---

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点：201～205°C

(5) 酸塩基解離定数

pKa：4.63 (カルボキシル基、滴定法) ¹⁾

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ ：+ 59.0～+ 62.0° (乾燥後、1g、エタノール (99.5)、25mL、100mm) ²⁾

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

有効成分の確認試験法

日局「ウルソデオキシコール酸」の確認試験による。

赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

有効成分の定量法

日局「ウルソデオキシコール酸」の定量法による。

電位差滴定法 (0.1mol/L 水酸化ナトリウム液 1mL = 39.26mg C₂₄H₄₀O₄)







IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

素錠

(2) 製剤の外観及び性状

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」		
色 ・ 剤 形	白色の素錠			片面割線入りの白色の素錠		
外 形	表面	裏面	側面	表面	裏面	側面
						
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		

(3) 識別コード

- ・ウルソデオキシコール酸錠 50mg「JG」
錠剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG E51
- ・ウルソデオキシコール酸錠 100mg「JG」
錠剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG E52

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分（活性成分）の含量

- ・ウルソデオキシコール酸錠 50mg「JG」
1 錠中 日局 ウルソデオキシコール酸 50mg 含有
- ・ウルソデオキシコール酸錠 100mg「JG」
1 錠中 日局 ウルソデオキシコール酸 100mg 含有

添加剤

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

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」

◎加速試験³⁾

包装形態：①PTP 包装

②バラ包装

保存条件：40±2℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、質量偏差試験、溶出試験、定量試験

①PTP 包装

試験項目	性状	確認試験			純度試験	質量偏差試験	溶出試験	定量試験 (%)
		(2)	(3)	(4)				
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	101.6
1 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	99.9
3 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	101.6
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	—	適合	100.8

②バラ包装

試験項目	性状	確認試験			純度試験	質量偏差試験	溶出試験	定量試験 (%)
		(2)	(3)	(4)				
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	101.6
1 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	99.7
3 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	101.3
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	—	適合	100.5

(1) 白色の素錠である

(2) 硫酸試液による呈色反応：青緑色の浮遊物を生じる（承認時の規格）

(3) 1-ナフチルアミン試液による呈色反応：だいたい赤色を呈する（承認時の規格）

(4) 薄層クロマトグラフィーにより試験を行うとき、スポットの R_f 値が等しい

(5) 薄層クロマトグラフィーにより試験を行うとき、標準溶液のスポットより濃くない（承認時の規格）

(6) 質量偏差試験：判定値が 15.0%を超えない。

(7) 30 分間、80%以上 (pH.6.8 リン酸緩衝液 (1→2)、パドル法、50rpm)

(8) 表示量の 95~105%

最終包装製品を用いた加速試験 (40°C、相対湿度 75%、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。

◎無包装状態での安定性試験⁴⁾

試験条件：①温度に対する安定性試験：40°C、3 ヶ月

②湿度に対する安定性試験：25°C/75%RH、3 ヶ月

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr

試験項目：性状、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時		適合	適合	97.8	40
①温度	3 ヶ月後	適合	適合	98.9	48
②湿度	3 ヶ月後	適合	適合	99.1	41
③光	120 万 lx・hr	適合	適合	98.6	45

(1) 白色の素錠である

(2) 30 分間、80%以上 (溶出試験第 2 液、パドル法、50rpm)

(3) 表示量の 95.0~105.0%

(4) 下記答申では、硬度変化が 30%以上で「変化あり (規格内)」、かつ硬度が 2.0kg 重 (19.6N) 未満の場合、「変化あり (規格外)」とされている。

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について (答申) 平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

ウルソデオキシコール酸錠 100mg 「JG」

◎加速試験⁵⁾

包装形態：①PTP包装

②バラ包装

保存条件：40±2℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、質量偏差試験、溶出試験、定量試験

①PTP包装

試験項目	性状	確認試験			純度試験	質量偏差試験	溶出試験	定量試験 (%)
		(2)	(3)	(4)				
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	101.0
1 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	100.1
3 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	101.4
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	—	適合	100.5

②バラ包装

試験項目	性状	確認試験			純度試験	質量偏差試験	溶出試験	定量試験 (%)
		(2)	(3)	(4)				
規格	(1)	(2)	(3)	(4)	(5)	(6)	(7)	(8)
試験開始時	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	101.0
1 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	99.8
3 ヶ月後	適合	—	—	—	適合	—	適合	101.2
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	—	適合	100.3

(1) 片面割線入りの白色の素錠である

(2) 硫酸試液による呈色反応：青緑色の浮遊物を生じる（承認時の規格）

(3) 1-ナフチルアミン試液による呈色反応：だいたい赤色を呈する（承認時の規格）

(4) 薄層クロマトグラフィーにより試験を行うとき、スポットの R_f 値が等しい

(5) 薄層クロマトグラフィーにより試験を行うとき、標準溶液のスポットより濃くない（承認時の規格）

(6) 質量偏差試験：判定値が 15.0%を超えない。

(7) 45 分間、70%以上（pH.6.8 リン酸緩衝液（1→2）、パドル法、50rpm）

(8) 表示量の 95～105%

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、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。

◎無包装状態での安定性試験⁶⁾

試験条件：①温度に対する安定性試験：40℃、3 ヶ月

②湿度に対する安定性試験：25℃/75%RH、3 ヶ月

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr

試験項目：性状、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)
試験開始時		適合	適合	100.7	56
①温度	3 ヶ月後	適合	適合	100.6	56
②湿度	3 ヶ月後	適合	適合	100.8	49
③光	120 万 lx・hr	適合	適合	101.1	56

(1) 片面割線入りの白色の素錠である

(2) 45 分間、70%以上（溶出試験第 2 液、パドル法、50rpm）

(3) 表示量の 95.0～105.0%

(4) 下記答申では、硬度変化が 30%以上で「変化あり（規格内）」、かつ硬度が 2.0kg 重（19.6N）未満の場合、「変化あり（規格外）」とされている。

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

【溶出挙動の同等性又は類似性】

ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」⁷⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日 医薬審第 487 号、一部改正 平成 13 年 5 月 31 日 医薬食発第 786 号)」に準じる。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 崩壊試験第 1 液
			pH4.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 崩壊試験第 2 液
			水	日本薬局方 精製水
試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

・判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。又は f2 関数の値は 55 以上である。
	pH4.0	
	pH6.8	標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。又は f2 関数の値は 45 以上である。
	水	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。又は f2 関数の値は 55 以上である。

・試験結果

<p>(50rpm、pH1.2)</p>	<p>(50rpm、pH4.0)</p>
<p>判定時点である 10 分及び 120 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±8%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である 10 分及び 360 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±8%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>
<p>(50rpm、pH6.8)</p>	<p>(50rpm、水)</p>
<p>判定時点である 5 分及び 15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±15%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である 10 分及び 360 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±8%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>

溶出挙動の類似性の判定（平均溶出率）

回転数 (rpm)	試験液	判定 時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤（ウルソ錠 50mg）	試験製剤（ウルソデオキシ コール酸錠 50mg「JG」）	
50	pH1.2	10	1.3	2.7	適合
		120	2.9	4.7	
	pH4.0	10	2.0	3.7	適合
		360	4.2	6.3	
	pH6.8	5	52.5	51.0	適合
		15	79.9	77.0	
	水	10	9.3	8.4	適合
		360	15.5	12.9	

・結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合していた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

ウルソデオキシコール酸錠 100mg「JG」⁸⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日医薬審第487号、一部改正平成13年5月31日医薬食発第786号)」に準じる。

試験方法	日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	日本薬局方 崩壊試験第1液
			pH4.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	日本薬局方 崩壊試験第2液
			水	日本薬局方 精製水
試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル				
分析法	液体クロマトグラフィー			

・判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
50	pH1.2	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。又は f2 関数の値は 55 以上である。
	pH4.0	
	pH6.8	標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。又は f2 関数の値は 45 以上である。
	水	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。又は f2 関数の値は 55 以上である。

・試験結果

<p>(50rpm、pH1.2)</p>	<p>(50rpm、pH4.0)</p>
<p>判定時点である 10 分及び 120 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±8%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である 5 分及び 360 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±8%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>
<p>(50rpm、pH6.8)</p>	<p>(50rpm、水)</p>
<p>判定時点である 5 分及び 60 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±10%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>	<p>判定時点である 10 分及び 360 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率の±8%の範囲であり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>

溶出挙動の類似性の判定（平均溶出率）

回転数 (rpm)	試験液	判定 時点 (min)	平均溶出率 (%)		判定
			標準製剤（ウルソ錠 100mg）	試験製剤（ウルソデオキシ コール酸錠 100mg「JG」）	
50	pH1.2	10	0.9	1.7	適合
		120	1.4	2.2	
	pH4.0	5	0.7	1.8	適合
		360	2.0	3.3	
	pH6.8	5	39.1	40.8	適合
		60	85.1	83.5	
	水	10	6.3	5.9	適合
		360	9.7	7.4	

・結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合していた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

【公的溶出規格への適合性】

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。

試験方法	日局 一般試験法溶出試験法（パドル法）
試験条件	回転数：50rpm 試験液：溶出試験第2液 試験液量：900mL
分析法	液体クロマトグラフィー
溶出規格	錠 50mg；30 分間、80%以上 錠 100mg；45 分間、70%以上

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

- ・ウルソデオキシコール酸錠 50mg「JG」
100錠 [10錠 (PTP) ×10]
1000錠 [10錠 (PTP) ×100]
1000錠 [プラスチック容器、バラ]
- ・ウルソデオキシコール酸錠 100mg「JG」
100錠 [10錠 (PTP) ×10]
1000錠 [10錠 (PTP) ×100]
1000錠 [プラスチック容器、バラ]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP 包装：塩化ビニルフィルム/アルミニウム箔 (PTP)、ポリプロピレンフィルム (ピロー)、紙箱

バラ包装：ポリエチレン容器、ポリプロピレン製キャップ、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 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

2. 効能又は効果に関連する注意

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]

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

効能又は効果	用法及び用量
<ul style="list-style-type: none"> ・ 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。
<ul style="list-style-type: none"> ・ 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。
<ul style="list-style-type: none"> ・ 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。

効能又は効果	用法及び用量
・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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

二重盲検試験

胆道系疾患（胆石症、胆道炎、胆道ジスキネジー、胆のう切除後症候群）患者にウルソデオキシコール酸 150mg/日を2週間投与し、自覚症状に対する改善効果を検討したところ、右季肋部痛などに対してプラセボ投与群に比し有意な改善効果を認めた⁹⁾。

慢性肝疾患（慢性肝炎、肝硬変）患者にウルソデオキシコール酸 150mg/日を4週間投与したところ、ウルソデオキシコール酸投与群はプラセボ投与群に比しAST、ALT値が有意に低下した¹⁰⁾。

コレステロール系胆石症患者にウルソデオキシコール酸 150mg/日、600mg/日を6～12ヵ月間投与し、胆石溶解効果を検討したところ、X線造影像による胆石の消失、縮小・減少を合わせた有効率は150mg/日投与群 17.4%（4/23例）、600mg/日投与群 34.5%（10/29例）、プラセボ投与群 5.0%（1/20例）で、600mg/日投与群はプラセボ投与群に比し有意な溶解効果を認めた¹¹⁾。

原発性胆汁性肝硬変（PBC）患者にウルソデオキシコール酸 150mg/日、600mg/日を24週間投与し肝機能改善効果を検討したところ、改善以上の改善率は150mg/日投与群 22.7%（5/22例）、600mg/日投与群 92.0%（23/25例）で、600mg/日投与群は150mg/日投与群に比し、有意な改善効果を認めた¹²⁾。

C型慢性肝炎患者にウルソデオキシコール酸 150mg/日、600mg/日、900mg/日を24週間投与し、ALTの変化率（中央値）を比較検討したところ、150mg/日投与群（195例）－15.3%、600mg/日投与群（198例）－29.2%、900mg/日投与群（193例）－36.2%であり、600mg/日投与群、900mg/日投与群は150mg/日投与群に比し、有意な改善効果を認めた。副作用の発現頻度は150mg/日投与群、600mg/日投与群、900mg/日投与群そ

それぞれ18.1% (36/199例)、21.5% (43/200例)、17.8% (35/197例)と全体ではほぼ同様に、各群間に有意差は認められなかった。なお、下痢については高用量で発現頻度が高い傾向が認められた¹³⁾。

2) 安全性試験

長期投与試験

原発性胆汁性肝硬変 (PBC) 患者にウルソデオキシコール酸 600mg/日を 48~132 週間投与し肝機能改善効果を検討したところ、改善以上の改善率は 81.8% (27/33 例)であった¹⁴⁾。

C 型慢性肝炎患者にウルソデオキシコール酸 600mg/日 (必要に応じ 900mg/日へ増量) を 1 年以上投与したところ、ALT の変化率 (中央値) は -43.4% (257 例) と有意な低下を認め、効果の持続が確認された¹⁵⁾。

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査 (一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ケノデオキシコール酸、コール酸、デヒドロコール酸

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ウルソデオキシコール酸は胆汁分泌を促進する作用（利胆作用）により胆汁うっ滞を改善する。また、投与されたウルソデオキシコール酸は肝臓において、細胞障害性の強い疎水性胆汁酸と置き換わり、その相対比率を上昇させ、疎水性胆汁酸の肝細胞障害作用を軽減する（置換効果）。さらに、ウルソデオキシコール酸はサイトカイン・ケモカイン産生抑制作用や肝臓への炎症細胞浸潤抑制作用により肝機能を改善する。そのほか、下記の胆石溶解作用、消化吸収改善作用が知られている^{16~30)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 利胆作用及び胆汁うっ滞改善作用

胆石摘出術後患者 5 例に T-チューブドレナージを設置し、ウルソデオキシコール酸 150mg/日を 14 日間経口投与したところ、肝胆汁流量は投与 5 日目より増加した¹⁶⁾。

2) 肝機能改善作用

肝の摂取・排泄機能改善作用

慢性肝疾患患者にウルソデオキシコール酸 150mg/日を 3 ヶ月間経口投与し、その前後に^{99m}Tc-PMT を静注して動態解析を行ったところ、肝の摂取排泄曲線のピークタイムが有意に短縮した¹⁷⁾。

動物モデルにおける肝障害抑制作用

自己免疫性肝炎モデルマウスに 0.3%濃度になるように調製したウルソデオキシコール酸飼料を摂取させたところ、リポポリサッカライド投与による生存率の低下、血中 AST 及び ALT の上昇、肝組織における壊死及び炎症細胞浸潤を抑制した¹⁸⁾。

コンカナバリン A 誘発肝障害モデルマウスにウルソデオキシコール酸 50 及び 150mg/kg を経口投与したところ、血中 AST 及び ALT の上昇を抑制した。また、本モデルにウルソデオキシコール酸 150mg/kg を経口投与したところ、血中 TNF- α 、IL-6 及び MIP-2（ヒトの IL-8 に相当）上昇を抑制した。さらに、肝臓において好中球浸潤の指標となるミエロペルオキシダーゼ（MPO）活性の上昇を抑制した¹⁹⁾。

ケノデオキシコール酸（CDCA）誘発肝障害モデルハムスターにウルソデオキシコール酸 50 及び 150mg/kg を経口投与したところ、血中 ALT の上昇を抑制した²⁰⁾。

疎水性胆汁酸の肝細胞障害性に対する軽減作用

ヒト肝細胞由来の Chang 細胞を用いた in vitro 実験で、培養液中に CA、CDCA あるいはウルソデオキシコール酸を添加して細胞障害性を検討したところ、細胞障害性の強さは CDCA が最も強く、CA とウルソデオキシコール酸は同程度に弱かった。また、CDCA による細胞障害性はウルソデオキシコール酸の添加により有意に低下した²¹⁾。

3) 消化吸収改善作用

回腸切除患者 12 例にウルソデオキシコール酸 150mg/日を 1 ヶ月間経口投与し、その前後で血中高級脂肪酸、脂溶性ビタミン濃度を測定したところ、血中リノール酸、リノレン酸、ビタミン D、E の各濃度が上昇した²²⁾。

膵液分泌促進作用

ラット及びイヌの十二指腸内に $2.55 \times 10^{-2} \text{M}$ に調製したウルソデオキシコール酸溶液 2.5mL/kg を投与したところ、ラットにおいて膵液量の増加を、またイヌでは重炭酸濃度の増加及びアミラーゼなど膵酵素活性の上昇を認めた²³⁾。

4) 胆石溶解作用

胆のう胆汁のコレステロール不飽和化作用

コレステロール系胆石症患者 5 例にウルソデオキシコール酸 300mg/日を 2 ヶ月間、その後増量し、600mg/日を 2 ヶ月間経口投与したところ、いずれの用量においても胆のう胆汁中のコレステロールの相対比率は低下し、Lithogenic Index の改善を認めた²⁴⁾。

液晶形成作用

コレステロール系胆石症患者 5 例にウルソデオキシコール酸 600mg/日を 1 週間経口投与し、胆のう胆汁を採取し、偏光顕微鏡で観察したところ、胆汁中に多成分型の液晶が認められ、コレステロールはこの液晶中に多量に可溶化されていた²⁵⁾。

コレステロールの腸管吸収抑制作用

健康成人 6 例にウルソデオキシコール酸 600mg/日を 1 ヶ月間経口投与したところ、腸管におけるコレステロール吸収を抑制した²⁶⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

【単回投与】

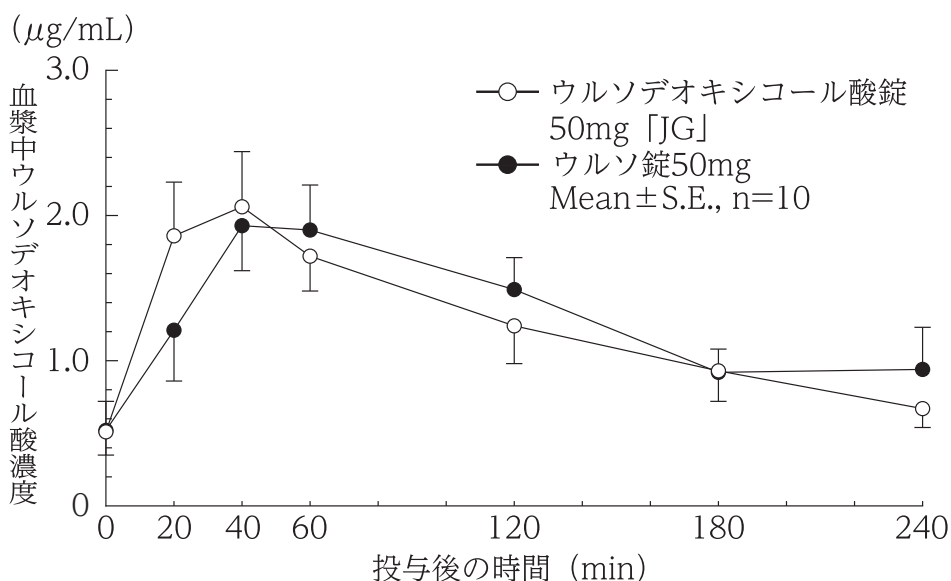
健康成人を対象とし、ウルソデオキシコール酸 200mg を投与（100mg 錠を 2 錠、6 例）したとき、最高血清中濃度は $1.90 \pm 0.25 \mu\text{g/mL}$ であった。また、400mg を投与（100mg 錠を 4 錠、6 例）したとき、最高血清中濃度は $7.09 \pm 1.43 \mu\text{g/mL}$ であった³¹⁾。

【生物学的同等性試験】

「生物学的同等性に関する試験基準：昭和 55 年 5 月 30 日 薬審第 718 号）」に準じる。

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」とウルソ錠 50mg 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）健康成人男性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³²⁾。



<薬物動態パラメータ>

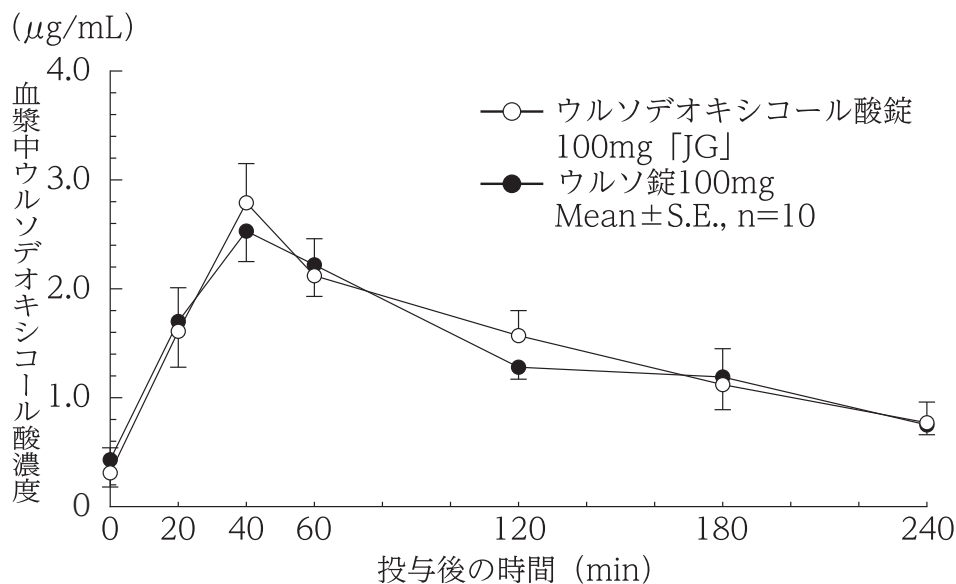
	判定パラメータ	
	AUC _{0-240min} ($\mu\text{g}\cdot\text{min/mL}$)	Cmax ($\mu\text{g/mL}$)
ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」	303 ± 37	2.44 ± 0.40
ウルソ錠 50mg	317 ± 35	2.43 ± 0.34

(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。

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）健康成人男性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³³⁾。



<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ	
	AUC _{0-240min} (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
ウルソ錠 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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 7. 相互作用」の項参照

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

健康成人にウルソデオキシコール酸 1g/日を 2 週間経口投与後、¹⁴C-ウルソデオキシコール酸を静注し、同位体希釈分析法を用いてその吸収量などを測定した。腸肝循環中のウルソデオキシコール酸のプールサイズは約 940mg であり、投与されたウルソデオキシコール酸はそのほとんどが腸肝循環を行っていた。また、胆汁中胆汁酸分画に占めるウルソデオキシコール酸は最大 56%でありケノデオキシコール酸（CDCA）とコール酸（CA）の比率はともに減少した³⁴⁾（外国人のデータ）。

注）本剤の最大承認用量は 900mg である。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意、(5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意、(6) 授乳婦」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

健康成人 6 例を対象とし、ウルソデオキシコール酸 400mg (100mg 錠を 4 錠) を投与したとき、血清中の主な代謝物は、グリコウルソデオキシコール酸 (GUDCA) 及びその硫酸抱合体 (GUDCA-S) であった。また、尿中の主な代謝物は GUDCA-S 及びウルソデオキシコール酸の N-アセチルグルコサミン抱合体であった³¹⁾。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

健康成人 6 例を対象とし、ウルソデオキシコール酸 400mg (100mg 錠を 4 錠) を投与したとき、投与後 24 時間の GUDCA-S 及びウルソデオキシコール酸の N-アセチルグルコサミン抱合体の尿中排泄率は 0.5% であった³¹⁾。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

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. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 2. 効能又は効果に関連する注意」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

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。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

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]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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。

(6) 授乳婦

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。

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

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。

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 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。

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

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。

(2) その他の副作用

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。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

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。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

過去に胆石治療のための十二指腸乳頭部の処置（内視鏡的乳頭切開術や胆道と十二指腸との吻合術など）を受けた患者において、本剤を長期使用した際に、ウルソデオキシコール酸を主成分とする胆石の形成が報告されている。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 6. 特定の背景を有する患者に関する注意、(5) 妊婦」の項参照

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤	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」	該当しない
有 効 成 分	ウルソデオキシコール酸	該当しない

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

- ・くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ウルソ錠 50mg/100mg 他

同 効 薬：

胆道（胆管・胆のう）系疾患及び胆汁うっ滞を伴う肝疾患における利胆；デヒドロコール酸外殻石灰化を認めないコレステロール系胆石の溶解；ケノデオキシコール酸

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

- ・ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 レプター錠 50	1996年4月19日	(08AM) 0705	1997年7月11日	1997年7月11日
製造販売承認承継	〃	〃	〃	2009年8月10日
販売名変更 ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」	2012年8月3日	22400AMX00862000	2012年12月14日	2012年12月14日

・ウルソデオキシコール酸錠 100mg 「JG」

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 レプター錠 100	1996年4月19日	(08AM) 0706	1997年7月11日	1997年7月11日
製造販売承認承継	〃	〃	〃	2009年8月10日
販売名変更 ウルソデオキシコール酸錠 100mg 「JG」	2012年8月3日	22400AMX00863000	2012年12月14日	2012年12月14日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

2011年2月3日

効能・効果の内容：「原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善」及び「C型慢性肝疾患における肝機能の改善」の効能・効果を追加した。

用法・用量の内容：効能・効果追加に伴い、関連の用法・用量を追加した。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」	2362001F1100	2362001F1100	104944202	620494402
ウルソデオキシコール酸錠 100mg 「JG」	2362001F2190	2362001F2190	104951002	620495102

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1)ジェネリック医薬品品質情報検討会；医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）
<http://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>（2024/7/4 アクセス）
- 2)第十八改正 日本薬局方解説書 廣川書店 2021；C825-C829
- 3)社内資料：加速試験（錠 50mg）
- 4)社内資料：無包装状態での安定性試験（錠 50mg）
- 5)社内資料：加速試験（錠 100mg）
- 6)社内資料：無包装状態での安定性試験（錠 100mg）
- 7)社内資料：溶出試験（錠 50mg）
- 8)社内資料：溶出試験（錠 100mg）
- 9)戸田安士 他：基礎と臨床 1976；10（1）：103-119
- 10)宮地一馬 他：臨床と研究 1976；53（5）：1395-1403
- 11)芦沢真六 他：医学のあゆみ 1977；101（13）：922-936
- 12)戸田剛太郎 他：肝胆膵 1998；37（3）：443-460
- 13)Omata, M. et al. : Gut. 2007；56（12）：1747-1753
- 14)戸田剛太郎 他：医学と薬学 1999；41（4）：609-633
- 15)長期投与試験（ウルソ錠：2007年3月2日承認、審査報告書）
- 16)吉岡正智 他：診断と治療 1976；64（10）：1953-1963
- 17)早川富博 他：日本消化器病学会雑誌 1988；85（11）：2389-2395
- 18)武内喜茂 他：薬理と治療 1998；26（2）：169-176
- 19)Ishizaki, K. et al. : Eur. J. Pharmacol. 2008；578（1）：57-64
- 20)Iwaki, T. et al. : World J. Gastroenterol. 2007；13（37）：5003-5008
- 21)木村恒夫：日本消化器病学会雑誌 1980；77（2）：185-194
- 22)土屋周二 他：厚生省特定疾患消化吸収障害調査研究班 昭和 57 年度業績集 1982；99-104
- 23)原泰寛 他：福岡医誌 1974；65（12）：933-940
- 24)菅田文夫 他：日本消化器病学会雑誌 1978；75（4）：492-499
- 25)Igimi, H. et al. : Gastroenterol. Jpn. 1983；18（2）：93-97
- 26)堀内至：胆道 1988；2（3）：239-247
- 27)Crosignani, A. et al. : Hepatology. 1991；14（6）：1000-1007
- 28)Terasaki, S. et al. : Am. J. Gastroenterol. 1991；86（9）：1194-1199
- 29)Yoshikawa, M. et al. : Hepatology. 1992；16（2）：358-364
- 30)Tanaka, H. et al. : J. Immunol. 1996；156（4）：1601-1608
- 31)永松信哉 他：薬理と治療 1997；25（6）：1637-1651
- 32)社内資料：生物学的同等性試験（錠 50mg）
- 33)社内資料：生物学的同等性試験（錠 100mg）
- 34)Fedorowski, T. et al. : Gastroenterology. 1977；73（5）：1131-1137

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉砕

ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」

1. 保存条件

蛍光灯 60 万 Lx/月、室温（18～29℃、17～52%RH）、ラップにより防湿

室内自然光、室温（18～29℃、17～59%RH）

遮光、25℃、60%RH

2. 試験項目

性状、定量試験

3. 試験結果

		性状	定量試験 (%)
製剤の規格<参考> (粉砕前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	100*
蛍光灯	1 週間後	白色の粉末	99.3
	2 週間後	白色の粉末	99.7
	3 週間後	白色の粉末	99.5
	1 ヶ月後	白色の粉末	99.5
自然光	1 週間後	白色の粉末	99.2
	2 週間後	白色の粉末	99.3
	3 週間後	白色の粉末	99.2
	1 ヶ月後	白色の粉末	99.3
遮光	1 週間後	白色の粉末	99.3
	2 週間後	白色の粉末	99.4
	3 週間後	白色の粉末	99.3
	1 ヶ月後	白色の粉末	99.4

(1) 白色の素錠である

(2) 表示量の 95～105%

※試験開始時を 100 とした残存率で表示

ウルソデオキシコール酸錠 100mg 「JG」

1. 保存条件

蛍光灯 60 万 Lx/月、室温 (18～28℃、22～51%RH)、ラップにより防湿

室内自然光、室温 (14～29℃、22～60%RH)

遮光、25℃、60%RH

2. 試験項目

性状、定量試験

3. 試験結果

		性状	定量試験 (%)
製剤の規格<参考> (粉碎前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	100※
蛍光灯	1 週間後	白色の粉末	99.9
	2 週間後	白色の粉末	99.8
	3 週間後	白色の粉末	100.1
	1 ヶ月後	白色の粉末	100.5
自然光	1 週間後	白色の粉末	99.9
	2 週間後	白色の粉末	99.6
	3 週間後	白色の粉末	99.9
	1 ヶ月後	白色の粉末	99.9
遮光	1 週間後	白色の粉末	99.6
	2 週間後	白色の粉末	99.3
	3 週間後	白色の粉末	99.8
	1 ヶ月後	白色の粉末	99.6

(1) 片面割線入りの白色の素錠である

(2) 表示量の 95～105%

※試験開始時を 100 とした残存率で表示

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

1. 試験方法

崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置した。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認した。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行った。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を粉碎してから同様に試験を行った。

通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管栄養チューブの注入端より 2~3mL/秒の速度で注入し、チューブのサイズ、8, 12, 14, 16, 18 フレンチ（以下 Fr.とする）において通過する最小経管栄養チューブのサイズを確認した。

2. 試験結果

崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」	5 分の時点で崩壊・懸濁した
ウルソデオキシコール酸錠 100mg 「JG」	5 分の時点で崩壊・懸濁した

通過性試験結果

品目名	通過性
ウルソデオキシコール酸錠 50mg 「JG」	8Fr.チューブを通過した
ウルソデオキシコール酸錠 100mg 「JG」	8Fr.チューブを通過した

8Fr.：8 フレンチ 約 2.7 mm<外径>

2. その他の関連資料

該当資料なし

Memo

Memo

Memo

