

胆汁酸製剤

ウルソ®注射液10%

承認指令書番号	29 動薬 第1895号
販売開始	2018年9月

®登録商標

【成分及び分量】

品名	ウルソ注射液10%
有効成分	日本薬局方 ウルソデオキシコール酸
含量	本品 10mL 中 1000mg

【効能又は効果】

牛、犬：ケトーシス、肝機能減退症

【用法及び用量】

牛：ウルソデオキシコール酸として、1日1回500～1000mgを2～3日間静脈内に注射する。

犬：ウルソデオキシコール酸として、1回量50mgを3～7日間静脈内に注射する。

なお、症状に応じて適宜増減する。

【使用上の注意】

(基本的事項)

1. 守らなければならないこと

(一般的注意)

- 本剤は、効能・効果において定められた目的にのみ使用すること。
- 本剤は、定められた用法・用量を厳守すること。
- 本剤投与後、下記の期間は食用に供する目的で出荷等を行わないこと。
牛：1日
- 本剤は獣医師の指導の下で使用すること。

(取扱い及び廃棄のための注意)

- 小児の手の届かないところに保管すること。
- 本剤は室温で保管し、直射日光及び高温を避けること。
- 使用済みの容器は、地方公共団体条例等に従い処分すること。

2. 使用に際して気をつけること

(使用者に対する注意)

- 誤って注射された者は、直ちに医師の診察を受けること。

(取扱い上の注意)

- 泡が立ちやすいので、使用前に容器を振らないこと。
- 注射器具は滅菌又は煮沸消毒されたものを使用すること。薬剤により消毒した器具又は他の薬剤に使用した器具は使用しないこと(ガス滅菌によるものを除く)。なお、乾熱、高圧蒸気滅菌又は煮沸消毒等を行った場合は、室温まで冷えたものを使用すること。
- 本剤を分割投与する場合は、速やかに使用すること。
- 使用前にゴム栓部位をエタノール綿等で、清拭すること。

(専門的事項)

1. 重要な基本的事項

- 静脈内への注射速度が速すぎると、まれにショック症状を起こすことがあるので、注射速度はできるだけ遅くすること。
- 単味ブドウ糖以外は混注を避けること。
- 本剤は必ず静脈内に注射し、幼弱及び衰弱の激しい動物には投与の可否を含め慎重に判断すること。

【薬理学的情報等】

(薬効薬理)

1. 利胆作用¹⁾

各種用量(1.25～20.0mg/kg)のウルソデオキシコール酸をイヌに静脈内投与したところ、用量に比例して肝胆汁量の分泌促進が認められた。

2. 肝血流量の増加作用²⁾

ウルソデオキシコール酸10mg/kgをイヌに静脈内投与したところ、肝血流量の増加が認められた。

3. 肝グリコーゲン蓄積作用³⁾

アロキサン家兎にウルソデオキシコール酸を0.4g/kg経口投与したところ、肝グリコーゲンの増加、血糖値の低下が認められた。

4. 胃液分泌促進作用⁴⁾

ウルソデオキシコール酸3mg/kgをラットに筋肉内投与したところ、対照に比して胃液分泌量が68.3%増加し、また胃液酸度の増加が認められた。

5. 唾液分泌促進作用⁵⁾

ウルソデオキシコール酸をイヌの十二指腸内に投与したところ、基礎流出量に比し唾液量、酵素活性、重炭酸塩濃度の増加が認められた。

6. 解毒作用⁶⁾マウスに硝酸ストリキニーネを投与し、ウルソデオキシコール酸投与群と対照群を比較すると、ウルソデオキシコール酸投与群は硝酸ストリキニーネに対するLD₅₀値を3倍以上に拡大した。7. 血清コレステロール低下作用⁷⁾

0.5%ウルソデオキシコール酸添加飼料で飼育したマウスでは、対照に比し血清コレステロール、肝コレステロールが低下した。

8. 肝HMG-CoA還元酵素の活性抑制作用⁸⁾

ウルソデオキシコール酸を赤毛ザルに、1日40～100mg/kg、6カ月間投与し、コレステロール合成を律速する肝HMG-CoA還元酵素を測定したところ、酵素活性が30%抑制された。

9. Cholesterol 7 α -hydroxylaseに及ぼす影響⁹⁾ウルソデオキシコール酸の胆汁酸合成律速酵素Cholesterol 7 α -hydroxylaseに及ぼす影響をラット肝臓を使い*in vitro*で検討したところ、添加濃度10⁻⁵～5×10⁻⁶Mで20～30%の酵素活性の増加がみられた。

(毒性)

1. 急性毒性(LD₅₀)¹⁰⁾

動物	投与法	投与法			
		経口投与	皮下投与	腹腔内投与	静脈内投与
ラット	♂	5g/kg以上	2g/kg以上	1,080mg/kg	310mg/kg
	♀			890mg/kg	320mg/kg
マウス	♂	10g/kg以上	5,800mg/kg	1,200mg/kg	285mg/kg
	♀			6,200mg/kg	240mg/kg

2. 慢性毒性¹¹⁾

ウルソデオキシコール酸500mg/kgをラットに6カ月間経口投与したところ、毒性は検出されなかった。

3. 催奇毒性¹²⁾

ウルソデオキシコール酸300、4,000mg/kgをラットに妊娠第9日から14日まで、また300、1,500mg/kgをマウスに妊娠第7日から12日まで経口投与したところ、いずれも催奇毒性は認められなかった。

(吸収・分泌・排泄)¹³⁾¹⁴C-ウルソデオキシコール酸を胆管瘻ラットに経口投与すると、高濃度で胆汁中にあらわれ、消化管からの吸収率、肝細胞への摂取率、肝細胞から胆汁への分泌率のいずれも高いことが認められた。¹⁴C-ウルソデオキシコール酸をマウスに経口投与すると、15分後に肝臓、胆汁、腸管に放射性活性が認められ、3日間の測定期間中、放射能濃度の経時的変動は認められなかった。またマウスにおいて、経口及び静脈内投与時の¹⁴C-ウルソデオキシコール酸の排泄を測定すると、放射活性はほとんど糞便にみられ、呼気、尿中には活性が認められなかった。

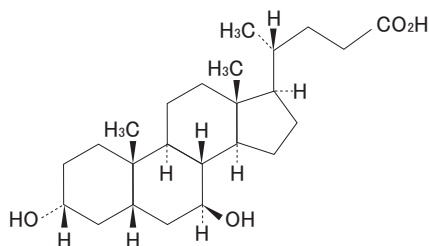
(製剤に関する理化学的知見)

1. 製剤

ウルソ注射液10%は、1バイアル(10mL)中に、日局ウルソデオキシコール酸1000mgを含有する。

性状:無臭～微黄色澄明な液である。
pH 8.5～10.5

2.有効成分



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、においはなく、味は苦い。

水酸化ナトリウム試液に溶ける。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。

【文献】

- 1)戸田 安士 他:基礎と臨床, 10, 103(1976)
- 2)玉沢 佳己:基礎と臨床, 9, 2371(1975)
- 3)白川 芳:大阪市立大学医学雑誌, 9, 4405(1960)
- 4)伊藤 信也 他:基礎と臨床, 10, 24(1976)
- 5)原 泰寛 他:福岡医誌, 65, 933(1974)
- 6)久保木 憲人 他:薬学研究, 31, 6, 29(1959)
- 7)中村 治雄:日消会誌, 62, 1105(1965)
- 8)Fedorowski,T.et al.Gastroenterology,74,75(1978)
- 9)平林 紀雄 他:応用薬理, 15, 125(1978)
- 10)細野 仁一 他:基礎と臨床, 9, 3159(1975)
- 11)高橋 日出彦 他:基礎と臨床, 9, 3209(1975)
- 12)高橋 日出彦 他:基礎と臨床, 9, 3223(1975)
- 13)穂下 剛彦 他:薬学雑誌, 94, 1196(1974)

【包装】

ウルソ注射液10% 10mL バイアル×10本

【製品情報お問い合わせ先】

DSファーマアニマルヘルス株式会社

〒541-0053 大阪市中央区本町 2-5-7

<https://animal.ds-pharma.co.jp>

製造販売元

DSファーマアニマルヘルス株式会社

大阪市中央区本町 2-5-7

獣医師、薬剤師等の医薬関係者は、本剤による副作用などによると疑われる疾病、障害若しくは死亡の発生又は本剤の使用によるものと疑われる感染症の発生に関する事項を知った場合において、保健衛生上の危害の発生又は拡大を防止するために必要があると認めるときは、上記【製品情報お問い合わせ先】に連絡するとともに、農林水産省動物医薬品検査所(<http://www.maff.go.jp/nval/iyakutou/fukusayo/sousa/index.html>)にも報告をお願いします。