

「動物用医薬品」
胆汁酸製剤

ウルソ®H注射液

(静注用)

URSO®H injection

本品の主成分ウルソデオキシコール酸は、胆汁酸の一種で、肝機能低下、代謝機能低下によるケトージスなど家畜の各種肝機能障害の治療剤として開発し、本品は静注用として製剤化されました。

【組成・性状】

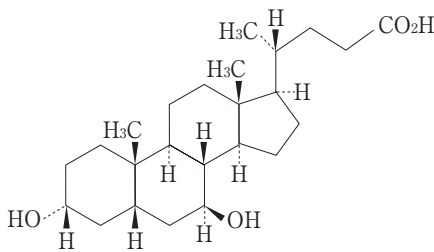
有効成分：1バイアル(40mL)中

日局ウルソデオキシコール酸……………947.0mg
製剤の性状：

無臭で無色～微黄色の澄明で、苦味がある水性注射剤である。pH8.5～10.5

有効成分の性状、構造式、分子式、分子量：

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。



C₂₄H₄₀O₄：392.57

一般名：ursodeoxycholic acid

化学名：3α, 7β-dihydroxy-5β-cholan-24-oic acid

【薬理作用】

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注したところ、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をイヌに静注したところ、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をラットに筋肉注射したところ、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) 膵液分泌促進作用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、基礎流出量に比し膵液量、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とを比較すると、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ヵ月間投与し、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 7α-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 7α-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10⁻⁵～5×10⁻⁵M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	♂	5 g/kg以上	2 g/kg以上	1,080mg/kg	310mg/kg
	♀			890mg/kg	320mg/kg
マウス	♂	10g/kg以上	5,800mg/kg 6,200mg/kg	1,200mg/kg	285mg/kg
	♀			1,250mg/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ヵ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・分布・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、肝細胞への摂取能率、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、呼吸、尿中には活性が認められなかった。

【効能・効果】

牛、犬：ケトージス、肝機能減退症

【用法・用量】

牛：ウルソデオキシコール酸として、1日1回500～1,000mg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】

一般的注意

1. 本剤は効能・効果において定められた目的のみ使用すること。
2. 本剤は定められた用法・用量を厳守すること。
3. 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

4. 本剤は獣医師の指導の下で使用すること。

使用者に対する注意

1. 誤って人に注射した場合は、直ちに医師の診察を受けること。

牛、犬に対する注意

制限事項

1. 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慎重に投与すること。

適用上の注意

1. 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。
2. 単味ブドウ糖以外は混注を避けること。
3. 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。薬剤により消毒を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。
4. 本剤を分割投与する場合は、速やかに使用すること。
5. 使用前にゴム栓部位をエタノール綿等で、清拭すること。

取扱い上の注意

1. 泡が立ちやすいので使用前に容器を振らないこと。
2. 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。

保管上の注意

1. 小児の手の届かないところに保管すること。
2. 室温で保管すること。
3. 本剤の保管は直射日光、高温を避けること。

【包装】 40mLバイアル×5本

【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)

製造販売元

DSファーマアニマルヘルス株式会社

大阪市福島区海老江1-5-51

〔2010年6月 改訂〕

〔2004年1月 作成〕