

◎ウルソ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】ウルソデオキシコール酸 (U) ursodeoxycholic acid 【分類】肝・胆・消化機能改善剤

【単位】◎50mg・◎100mg/錠

【常用量】■利胆・肝機能の改善：150mg/日 ■外殻石灰化を認めないコレステロール系胆石の溶解，PBC：600mg/日 [最大 900mg] ■C型慢性肝炎における肝機能改善：600mg/日 [最大 900mg]

【用法】1日3回

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (5)

【特徴】肝胆汁流量及びビリルビン排泄量増加 (利胆作用)、肝血流量増加、脂肪吸収促進、胆汁のコレステロール不飽和化作用、液晶形成作用 (コレステロール胆石溶解作用) がある。難治性の胆汁うっ滞症にも有用。ケノデオキシコール酸に比し、下痢の発症が少ない。

【主な副作用・毒性】下痢、悪心、嘔吐、腹痛、便秘、胸やけ、胃部不快感、過敏症、全身倦怠感、めまい、間質性肺炎、紅斑、ビリルビン上昇、 γ -GT 上昇など

【モニターすべき項目】肝機能、cholecystgram、エコー

【吸収】90%が小腸から吸収される (U) 吸収はケノデオキシコール酸に比し、完全ではない (Clin Pharmacokinetic 30: 333-358,1996) 溶解性が低いため、吸収は遅く、不完全 (Ital J Gastroenterol 27: 193-195,1995)

【tmax】1~3hr (U)

【代謝】肝で初回通過効果を受ける。体外的に投与されたウルソジオール (ウルソデオキシコール酸) は肝でタウリン抱合、グリシン抱合体になり、抱合体は胆汁に分泌され、内因性胆汁酸とともに腸肝循環する (U)

【排泄】主に糞便中排泄，ごく少量が尿中に排泄される (U) 腸内細菌により lithocholic acid になり主に糞便中に排泄される。大部分の胆汁酸が腸肝循環しているため血中濃度は低いが、重篤な胆汁鬱滞があると腎クリアランスが顕著になる (Clin Pharmacokinetic 30: 333-58, 1996)

【t1/2】100hr (10)

【蛋白結合率】54% (1) 高い (U)

【Vd】大部分の胆汁酸が腸肝循環しているため、血中濃度は低く、Vd は大きい。肝疾患では血中胆汁酸濃度が上昇するため Vd は低下する (Clin Pharmacokinetic 30: 333-358,1996)

【MW】392.57

【透析性】蛋白結合率が高く、Vd が大きいため効率的には除去されないと思われる (5) 資料なし (1)

【O/W 係数】LogP=0.4 [1-オクタノール/水系, pH7] (1) 【pKa】4.63

【相互作用】コレステリドにより吸着され効果減弱のおそれあり，投与間隔を空ける (1) MDR1 と CYP3A4 を軽度誘導してジゴキシンの吸収をわずかに低下させる可能性 (Becquemont L, et al: Clin Pharmacol Ther 79: 449-60, 2006)

【備考】脂溶性ビタミンの吸収を改善するとされ、活性型ビタミン D3 製剤の吸収障害の疑われる HD 症例に有効という報告あり (透析会誌 28:1519-1523,1995)

【更新日】20150205

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。