

貯法 室温保存

動物用医薬品

胆汁酸製剤

ウルソ[®]H注射液

®登録商標

【成分及び分量】

品名	ウルソH注射液
有効成分	日本薬局方 ウルソデオキシコール酸
含量	本品 100 mL 中 2367.4 mg

【効能又は効果】

牛、犬：ケトージス、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 500～1000 mg 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 50 mg 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）

- (1) 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。
- (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。

（取扱い及び廃棄のための注意）

- (1) 小児の手の届かないところに保管すること。
- (2) 本剤は室温で保管し、直射日光及び高温を避けること。
- (3) 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）

- (1) 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）

- (1) 泡が立ちやすいので、使用前に容器を振らないこと。
- (2) 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。
- (3) 本剤を分割投与する場合は、速やかに使用すること。
- (4) 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

- (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) 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（1.25～20.0 mg/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 10 mg/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⁾

アロキササン家兎にウルソデオキシコール酸を 0.4 g/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 3 mg/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. 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 40～100 mg/kg、6 ヶ月間投

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^{-5} M 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	投与方法		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	1,080 mg/kg	310 mg/kg
	♀				890 mg/kg	320 mg/kg
マウス	♂		10 g/kg 以上	5,800 mg/kg	1,200 mg/kg	285 mg/kg
	♀			6,200 mg/kg	1,250 mg/kg	240 mg/kg

2. 慢性毒性¹¹⁾

ウルソデオキシコール酸 500 mg/kg をラットに 6 ヶ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、4,000 mg/kg をラットに妊娠第 9 日から 14 日まで、また 300、1,500 mg/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)

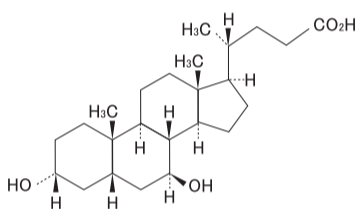
1. 製剤

ウルソH注射液は、1 バイアル (40 mL) 中に、日局ウルソデオキシコール酸 947 mg を含有する。

性状：無臭で無色～微黄色の澄明で、苦味がある注射剤である。

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H注射液 40 mL 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。