

## 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2008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 |
| プレコート®錠100mg       |
| PRECOAT            |

|                           |                                                                                                                                                          |
|---------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 剤形                        | 錠剤(割線入り素錠)                                                                                                                                               |
| 製剤の規制区分                   | 該当しない                                                                                                                                                    |
| 規格・含量                     | 1錠中にウルソデオキシコール酸を100mg含有する。                                                                                                                               |
| 一般名                       | 和名：ウルソデオキシコール酸<br>洋名：Ursodeoxycholic Acid                                                                                                                |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・発売年月日 | 製造販売承認年月日：2006年 6月27日<br>薬価基準収載年月日：2006年12月 8日<br>発売年月日：1998年 7月21日                                                                                      |
| 開発・製造販売・提携・販売会社名          | 製造販売元：辰巳化学株式会社                                                                                                                                           |
| 医薬情報担当者の連絡先               |                                                                                                                                                          |
| 問い合わせ窓口                   | 辰巳化学株式会社 薬事学術・安全管理部<br>TEL:076-247-2132 FAX:076-247-5740<br>医療関係者向けホームページ<br><a href="http://www.tatsumi-kagaku.com/">http://www.tatsumi-kagaku.com/</a> |

本IFは2010年4月改訂(第9版)の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ <http://www.info.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

## I F 利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

### 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、I F と略す）の位置付け並びにI F 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてI F 記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において新たなI F 記載要領が策定された。

### 2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はI F 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I F は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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。

#### [I F の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②I F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [I F の作成]

- ①I F は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定したI F 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するものI F の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領２００８」（以下、「ＩＦ記載要領２００８」と略す）により作成されたＩＦは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（ＰＤＦ）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[ＩＦの発行]

- ①「ＩＦ記載要領２００８」は、平成２１年４月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「ＩＦ記載要領２００８」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはＩＦが改訂される。

### ３．ＩＦの利用にあたって

「ＩＦ記載要領２００８」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、ＰＤＦファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関でのＩＴ環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体のＩＦについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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

ＩＦを薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。ＩＦは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、ＩＦがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（２００８年９月）

## 目 次

|                          |    |
|--------------------------|----|
| I. 概要に関する項目              | 1  |
| II. 名称に関する項目             | 2  |
| III. 有効成分に関する項目          | 3  |
| IV. 製剤に関する項目             | 4  |
| V. 治療に関する項目              | 8  |
| VI. 薬効薬理に関する項目           | 10 |
| VII. 薬物動態に関する項目          | 11 |
| VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 | 14 |
| IX. 非臨床試験に関する項目          | 17 |
| X. 管理的事項に関する項目           | 18 |
| X I. 文献                  | 20 |
| X II. 参考資料               | 20 |
| X III. 備考                | 20 |

## 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は、肝・胆・消化機能改善剤であり、本邦では1962年に上市されている。

プレコート100は、辰巳化学株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬発第698号（1980年5月30日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、1998年3月に承認を得て、1998年7月発売に至った。

2006年に医療事故防止のためプレコート錠100mgと販売名変更を経て現在に至っている。2010年4月に追加効能として「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」が承認された。

### 2．製品の治療学的・製剤学的特性

○本剤はウルソデオキシコール酸を有効成分とする白色割線入り素錠である。

○重大な副作用として間質性肺炎があらわれることがある。

## Ⅱ．名称に関する項目

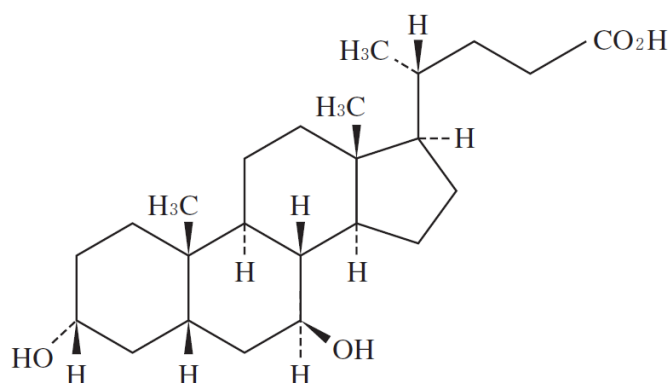
### 1. 販売名

- (1) 和名：プレコート錠100mg
- (2) 洋名：PRECOAT Tablets 100mg
- (3) 名称の由来：特になし

### 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)
- (3) ステム：不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>24</sub>H<sub>40</sub>O<sub>4</sub>  
分子量：392. 57

### 5. 化学名(命名法)

3 $\alpha$ , 7 $\beta$ -Dihydroxy-5 $\beta$ -cholan-24-oic acid

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

### 7. CAS登録番号

128-13-2

### 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。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点:200～204℃

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 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

日局「ウルソデオキシコール酸」の確認試験法による。

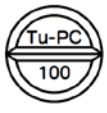
#### 4. 有効成分の定量法

日局「ウルソデオキシコール酸」の定量法による。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、規格及び性状

|                 | 外 形                                                                                      |                                                                                          |                                                                                           | 色 調<br>剤 形     | 識別コード        |
|-----------------|------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|--------------|
|                 | 直径 (mm)                                                                                  | 厚さ (mm)                                                                                  | 重量 (mg)                                                                                   |                |              |
| プレコート錠<br>100mg | <br>8.0 | <br>2.6 | <br>150 | 白色素錠<br>(割線入り) | Tu-PC<br>100 |

#### (2) 製剤の物性

#### (3) 識別コード

|             | 本体        | 包装材料      |
|-------------|-----------|-----------|
| プレコート錠100mg | Tu-PC 100 | Tu PC-100 |

#### (4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当しない

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1錠中にウルソデオキシコール酸を100mg含有する。

#### (2) 添加物

トウモロコシデンプン、セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム

#### (3) その他

該当資料なし

### 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

### 4. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、プレコート錠100mgは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。

試験条件：40℃、相対湿度75%、6ヵ月、PTP包装

|        | 規格            | 試験開始時     | 2ヵ月後  | 4ヵ月後  | 6ヵ月後  |
|--------|---------------|-----------|-------|-------|-------|
| 性状     | 白色の割線入り素錠     | 白色の割線入り素錠 | 変化なし  | 変化なし  | 変化なし  |
| 確認試験   | (1)、(2)       | 適         | 適     | 適     | 適     |
| 崩壊試験   | 日局一般試験法の崩壊試験法 | 適         | 適     | 適     | 適     |
| 定量 (%) | 表示量の          | 100.4     | 100.4 | 100.7 | 100.4 |
|        | 93~107%       | 100.4     | 100.7 | 100.7 | 101.6 |
|        | を含む           | 100.2     | 100.8 | 100.7 | 100.0 |

(3ロット、各ロットn=3)

(1) 析出反応：青緑色の浮遊物を生じる。

(2) TLC：試料溶液及び標準溶液から得られたスポットのRf値は等しい

試験条件：40℃、相対湿度75%、6ヵ月、バラ包装（ポリエチレン容器包装）

|        | 規格                     | 試験開始時                   | 2ヵ月後                    | 4ヵ月後                    | 6ヵ月後                   |
|--------|------------------------|-------------------------|-------------------------|-------------------------|------------------------|
| 性状     | 白色の割線入り素錠              | 白色の割線入り素錠               | 変化なし                    | 変化なし                    | 変化なし                   |
| 確認試験   | (1)、(2)                | 適                       | 適                       | 適                       | 適                      |
| 崩壊試験   | 日局一般試験法の崩壊試験法          | 適                       | 適                       | 適                       | 適                      |
| 定量 (%) | 表示量の<br>93～107%<br>を含む | 100.0<br>100.2<br>100.5 | 100.4<br>101.0<br>100.6 | 100.3<br>100.5<br>100.3 | 101.0<br>100.8<br>99.6 |

(3ロット、各ロットn=3)

(1) 析出反応：青緑色の浮遊物を生じる

(2) TLC：試料溶液及び標準溶液から得られたスポットのRf値は等しい

## 5. 調製法及び溶解後の安全性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

## 7. 溶出性<sup>2)</sup>

【溶出挙動における類似性】

(「医療用医薬品の品質に係る再評価の実施等について：平成10年7月15日付 医薬発第634号」)

試験方法：日本薬局方一般試験法溶出試験法第2法(パドル法)

試験条件

試験液量：900 mL

温度：37℃±0.5℃

試験液：pH1.2 = 日本薬局方崩壊試験第1液

pH4.0 = 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液(0.05mol/L)

pH6.8 = 日本薬局方試薬・試液のリン酸塩緩衝液(1→2)

水 = 日本薬局方精製水

回転数：50rpm(pH1.2、pH4.0、pH6.8、水)

標準製剤の平均溶出率が85%を越えた時点で、試験を終了することができる。

判定基準

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(5分)、及び規定された試験時間(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±8%の範囲にある。

pH4.0

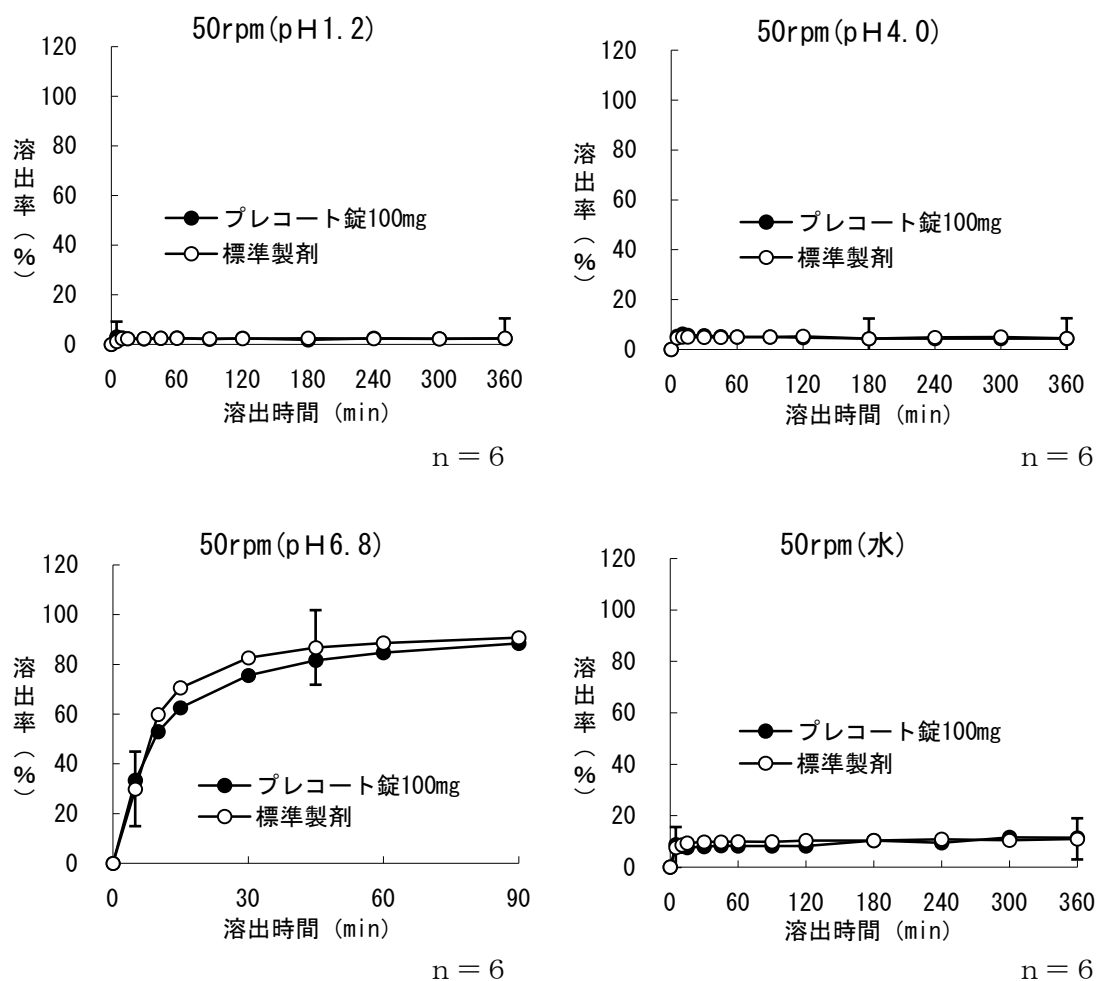
標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点(180分)、及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にある。

pH6.8

標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点(5分及び45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±15%の範囲にある。

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(5分)、及び規定された試験時間(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±8%の範囲にある。



○ pH1. 2、pH4. 0、水：標準製剤の平均溶出率±8%  
 ○ pH6. 8:標準製剤の平均溶出率±15%

表 溶出挙動における類似性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

| 試験条件 |       |        |      | 標準製剤<br>(錠剤、100mg) | プレコート錠100mg | 判定  |
|------|-------|--------|------|--------------------|-------------|-----|
| 方法   | 回転数   | 試験液    | 採取時間 | 平均溶出率%             | 平均溶出率%      |     |
| パドル法 | 50rpm | pH1. 2 | 5分   | 1. 1               | 2. 9        | 範囲内 |
|      |       |        | 360分 | 2. 4               | 2. 2        | 範囲内 |
|      |       | pH4. 0 | 180分 | 4. 4               | 4. 4        | 範囲内 |
|      |       |        | 360分 | 4. 5               | 4. 3        | 範囲内 |
|      |       | pH6. 8 | 5分   | 29. 9              | 33. 3       | 範囲内 |
|      |       |        | 45分  | 86. 8              | 81. 6       | 範囲内 |
|      |       | 水      | 5分   | 7. 6               | 8. 9        | 範囲内 |
|      |       |        | 360分 | 11. 0              | 11. 5       | 範囲内 |

(n=6)

【公的溶出規格への適合】

プレコート錠100mgは、日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

**8. 生物学的試験法**

該当しない

**9. 製剤中の有効成分の確認試験法**

日局「ウルソデオキシコール酸錠」の確認試験法による。

**10. 製剤中の有効成分の定量法**

日局「ウルソデオキシコール酸錠」の定量法による。

**11. 力価**

該当しない

**12. 混入する可能性のある夾雑物**

該当資料なし

**13. 治療上注意が必要な容器に関する情報**

該当しない

**14. その他**

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

1. ・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
2. 外殻石灰化を認めないコレステロール系胆石の溶解
3. 原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善
4. C型慢性肝疾患における肝機能の改善

#### [効能又は効果に関連する使用上の注意]

原発性胆汁性肝硬変における肝機能の改善：

- ・硬変期で高度の黄疸のある患者に投与する場合は、症状が悪化するおそれがあるので慎重に投与すること。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。

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剤の投与を考慮すること。
- ・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。高度の黄疸のある患者に投与する場合は、症状が悪化するおそれがあるので慎重に投与すること。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。

### 2. 用法及び用量

1. 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。
2. 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。
3. 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。
4. 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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

表中の◎：評価資料 ー：非検討もしくは評価の対象とせず を表す

| phase     | 対象        | 有効性 | 安全性 | 薬物動態 | 概要             |
|-----------|-----------|-----|-----|------|----------------|
| 生物学的同等性試験 | 日本人健康成人男子 | ー   | ◎   | ◎    | 非盲検化<br>単回経口投与 |

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

**(3) 臨床薬理試験：忍容性試験**

該当資料なし

**(4) 探索的試験：用量反応探索試験**

該当資料なし

**(5) 検証的試験**

**1) 無作為化並行用量反応試験**

該当資料なし

**2) 比較試験**

該当資料なし

**3) 安全性試験**

該当資料なし

**4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）**

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試験の概要**

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理学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、アネトールトリチオン など

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>3)</sup>

利胆作用（肝胆汁流量及びビリルビン排泄量の増加）、肝血流量増加作用、脂肪吸収促進作用、胆汁のコレステロール不飽和化作用、液晶形成作用（胆汁中に多成分系の液晶が認められるようになる）、コレステロールの腸管吸収抑制作用がある。また、動物実験により、血清コレステロール低下作用、リパーゼ活性の促進作用、膵液分泌促進作用、胆石生成抑制作用、肝HMG-CoA reductase活性抑制及びcholesterol 7 $\alpha$ -hydroxylase活性上昇作用が認められている。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間<sup>4)</sup>

|             | T <sub>max</sub> (hr) |
|-------------|-----------------------|
| プレコート錠100mg | 1.48±0.73             |

(Mean±S. D., n=14)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>4)</sup>

##### 【生物学的同等性試験】

ウルソデオキシコール酸製剤であるプレコート錠100mgの医薬品製造販売承認申請を行うに当たり、標準製剤又はプレコート錠100mgを健康成人男子に単回経口投与し、血漿中のウルソデオキシコール酸濃度を測定して、薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。

##### ・試験デザイン

生物学的同等性に関する試験基準(薬審第718号 1980年5月30日)に準じ、非盲検下における2剤2期クロスオーバー法を用いる。

はじめの入院期間を第Ⅰ期とし、2回目の入院期間を第Ⅱ期とする。なお、第Ⅰ期と第Ⅱ期の間の休薬期間は7日間とする。

##### ・投与条件

被験者に対して投与前夜10時以降の絶食下において、1錠中にウルソデオキシコール酸を100mg含有するプレコート錠100mg 2錠又は標準製剤2錠を150mLの水とともに経口投与する。投与後4時間までは、絶食とする。

##### ・採血時点

第Ⅰ期及び第Ⅱ期ともに投与前、0.25、0.5、1、1.5、2、3、5、8及び12時間後の10時点とする。

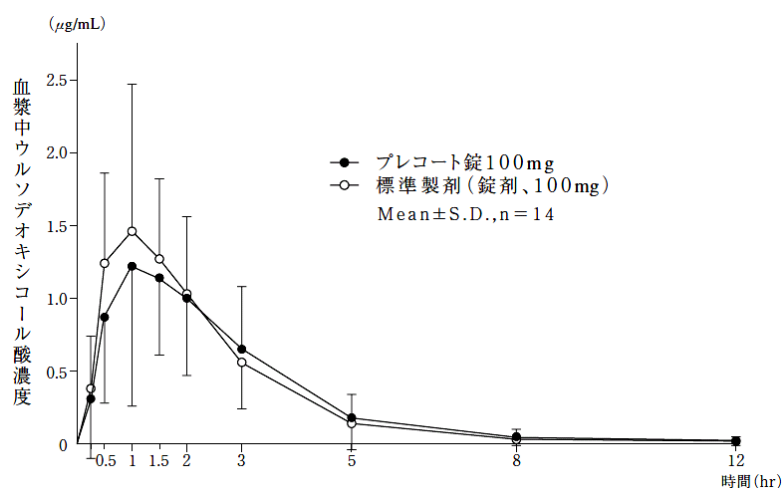
##### ・分析法：HPLC法

<薬物動態パラメータ>

|                    | 判定パラメータ                                                            |                                     | 参考パラメータ      |                          |
|--------------------|--------------------------------------------------------------------|-------------------------------------|--------------|--------------------------|
|                    | AUC <sub>0→12hr</sub><br>( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ ) | Cmax<br>( $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| プレコート錠100mg        | 3.97±0.86                                                          | 1.69±0.79                           | 1.48±0.73    | 2.67±1.81                |
| 標準製剤<br>(錠剤、100mg) | 4.03±1.03                                                          | 1.80±0.96                           | 1.18±0.52    | 2.43±2.44                |

(Mean±S. D., n=14)

得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について95%信頼区間法にて統計解析を行った結果、±20%の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 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」の項を参照すること。

(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

Ⅶ. 1. (3) 参照

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

**(6) 分布容積**

該当資料なし

**(7) 血漿蛋白結合率**

該当資料なし

**3. 吸収**

該当資料なし

**4. 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**

該当資料なし

**(3) 乳汁への移行性**

該当資料なし

**(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

**5. 代謝**

**(1) 代謝部位及び代謝経路**

該当資料なし

**(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種**

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比率**

該当資料なし

**(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ**

該当資料なし

**6. 排泄**

**(1) 排泄部位と経路**

該当資料なし

**(2) 排泄率**

該当資料なし

**(3) 排泄速度**

該当資料なし

**7. 透析等による除去率**

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

(1) 完全胆道閉塞のある患者〔利胆作用があるため、症状が増悪するおそれがある。〕

(2) 劇症肝炎の患者〔症状が増悪するおそれがある。〕

### 3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

### 4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

(1) 重篤な膵疾患のある患者〔原疾患が悪化するおそれがある。〕

(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。〕

(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。〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

#### (2) 併用注意とその理由

| 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                                                                 |
| スルフォニル尿素系経口<br>糖尿病用薬<br>トルブタミド等 | 血糖降下作用を増強する<br>おそれがある。                                  | 本剤は血清アルブミンと<br>トルブタミドとの結合を<br>阻害するとの報告がある。                              |
| コレスチラミン等                        | 本剤の作用を減弱するお<br>それがあるので、可能な限<br>り間隔をあけて投与する<br>こと。       | 本剤と結合し、本剤の吸収<br>を遅滞あるいは減少させ<br>るおそれがある。                                 |
| 制酸剤<br>水酸化アルミニウムゲ<br>ル等         | 本剤の作用を減弱するお<br>それがある。                                   | アルミニウムを含有する<br>制酸剤は、本剤を吸着し、<br>本剤の吸収を阻害するお<br>それがある。                    |
| 脂質低下剤<br>クロフィブラート等              | 本剤をコレステロール胆<br>石溶解の目的で使用する<br>場合は、本剤の作用を減弱<br>するおそれがある。 | クロフィブラートは胆汁<br>中へのコレステロール分<br>泌を促進するため、コレス<br>テロール胆石形成が促進<br>されるおそれがある。 |

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### (1) 重大な副作用（頻度不明）

間質性肺炎：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。

### (3) その他の副作用

|       | 頻 度 不 明                                                              |
|-------|----------------------------------------------------------------------|
| 消 化 器 | 下痢、悪心、食欲不振、便秘、胸やけ、嘔吐、胃不快感、腹痛、腹部膨満                                    |
| 過 敏 症 | 痒疹、発疹 <sup>注)</sup> 、蕁麻疹 <sup>注)</sup> 、紅斑（多形滲出性紅斑等） <sup>注)</sup> 等 |
| 肝 臓   | AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、Al-P上昇、ビリルビン上昇、 $\gamma$ -GTP上昇            |
| そ の 他 | 全身けん怠感、めまい、白血球減少                                                     |

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

### (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

その他の副作用

過敏症：痒疹、発疹<sup>注)</sup>、蕁麻疹<sup>注)</sup>、紅斑（多形滲出性紅斑等）<sup>注)</sup>等

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

## 9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、用量に注意して投与すること。

## 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。〔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（胎児吸収）が報告されている。〕

## 11. 小児等への投与

該当しない

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 13. 過量投与

該当資料なし

**14. 適用上の注意**

薬剤交付時：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報告されている。)

**15. その他の注意**

該当しない

**16. その他**

該当しない

## 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」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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：プレコート錠100mg 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. 有効期間又は使用期限

使用期限：外装に表示（3年）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### （1）薬局での取り扱いについて

該当資料なし

#### （2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」を参照すること。

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

PTP包装：100錠、1, 200錠

バラ包装：1, 200錠

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

バラ包装：ポリエチレン容器

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ウルソ錠50mg／錠100mg

同 効 薬：ケノデオキシコール酸、アネトールトリチオン など

### 9. 国際誕生年月日

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2006年6月27日

承認番号：21800AMX10460000

### 11. 薬価基準収載年月日

2006年12月8日

(1998年7月10日 -旧販売名- プレコート100)

### 12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

2001年3月28日

「高トリグリセリド血症」の効能を自主削除

2010年4月28日

「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」の効能又は効果を追加、またそれに伴う用法及び用量を追加

**13. 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

**14. 再審査期間**

該当しない

**15. 投与期間制限医薬品に関する情報**

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。

**16. 各種コード**

| 販売名         | HOT番号     | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | レセプト電算コード |
|-------------|-----------|-----------------------|-----------|
| プレコート錠100mg | 112788101 | 2362001F2157          | 620004569 |

**17. 保険給付上の注意**

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## **X I . 文 献**

### **1. 引用文献**

- 1) 辰巳化学株式会社 社内資料（安定性試験）
- 2) 辰巳化学株式会社 社内資料（溶出試験）
- 3) 第十五改正 日本薬局方解説書
- 4) 辰巳化学株式会社 社内資料（生物学的同等性試験）

### **2. その他の参考文献**

なし

## **X II . 参 考 資 料**

### **1. 主な外国での発売状況**

### **2. 海外における臨床支援情報**

## **X III . 備 考**

### **その他の関連資料**

なし



〒921-8164 金沢市久安3丁目406番地  
電話 (076) 247-1231 代表