

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 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

副交感神経亢進剤 ベタネコール塩化物散剤 ベサコリン[®] 散 5% Besacolin [®] Powder

剤形	散剤	
製剤の規制区分	劇薬	
規格・含量	1g 中ベタネコール塩化物 50mg 含有	
一般名	和名：ベタネコール塩化物（JAN） 洋名：Bethanechol Chloride（JAN）	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日	2007 年 2 月 28 日（販売名変更による）
	薬価基準収載年月日	2007 年 6 月 15 日（販売名変更による）
	販売開始年月日	1960 年 3 月 10 日
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：アルフレッサ ファーマ株式会社 販売元：エーザイ株式会社	
医薬情報担当者の 連絡先		
問い合わせ窓口	エーザイ株式会社 hhc ホットライン フリーダイヤル 0120-419-497 FAX 03-3811-5033 https://www.eisai.co.jp	

本 IF は 2023 年 4 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

－ 日本病院薬剤師会 －

(2020 年 4 月改訂)

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)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り、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第3小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領 2008 以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIF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IFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2
6. RMPの概要	2

II. 名称に関する項目

1. 販売名	3
2. 一般名	3
3. 構造式又は示性式	3
4. 分子式及び分子量	3
5. 化学名(命名法)又は本質	3
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	3

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法, 定量法	4

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
3. 添付溶解液の組成及び容量	5
4. 力価	5
5. 混入する可能性のある夾雑物	5
6. 製剤の各種条件下における安定性	6
7. 調製法及び溶解後の安定性	6
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6
9. 溶出性	6
10. 容器・包装	7
11. 別途提供される資材類	7
12. その他	7

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	8
2. 効能又は効果に関連する注意	8
3. 用法及び用量	8
4. 用法及び用量に関連する注意	8
5. 臨床成績	8

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	10
2. 薬理作用	10

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移	11
2. 薬物速度論的パラメータ	11
3. 母集団(ポピュレーション)解析	12
4. 吸収	12
5. 分布	12
6. 代謝	13
7. 排泄	13
8. トランスポーターに関する情報	13
9. 透析等による除去率	13
10. 特定の背景を有する患者	13
11. その他	13

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	14
2. 禁忌内容とその理由	14
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	14
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14
5. 重要な基本的注意とその理由	14
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14
7. 相互作用	15
8. 副作用	15
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
10. 過量投与	17
11. 適用上の注意	17
12. その他の注意	17

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 18
2. 毒性試験 18

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分 20
2. 有効期間 20
3. 包装状態での貯法 20
4. 取扱い上の注意 20
5. 患者向け資材 20
6. 同一成分・同効薬 20
7. 国際誕生年月日 20
8. 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準
収載年月日, 販売開始年月日 20
9. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更追加等
の年月日及びその内容 21
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその
内容 21
11. 再審査期間 21
12. 投薬期間制限に関する情報 21
13. 各種コード 21
14. 保険給付上の注意 21

XI. 文献

1. 引用文献 22
2. その他の参考文献 22

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 23
2. 海外における臨床支援情報 23

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたって
の参考情報 24
2. その他の関連資料 24

略 語 表

なし（個別に各項目において解説する.）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アセチルコリンの副交感神経亢進作用が発見されて以来、その臨床応用をめぐって、安定性が高く、かつ副作用の少ないアセチルコリン誘導体の開発研究が行われた。

ベタネコール塩化物は 1935 年 Major によって合成され、その薬理作用は Molitor らにより他のコリンエステルと比較しつつ検討された。1940 年には Starr らによって初めてヒトに投与され、循環器、消化器、膀胱に対する作用が検討された。これらの研究によって、ベタネコール塩化物はコリンエステラーゼに安定で、かつニコチン様作用もなく、膀胱や消化器に特異的に作用し、運動や緊張及び胃液分泌を促進することが認められた。その後、ベタネコール塩化物は米国で上市され、手術後に認められる胃膨満感や尿閉に臨床応用され、有効であることが確認された。

国内では、他社に先がけて消化管及び膀胱に対する基礎、臨床的研究に着手し製造承認を受け、1960 年にベサコリン散、ベサコリン注を、1961 年にベサコリン錠を発売した（ベサコリン注、ベサコリン錠は製造中止）。その後、1984 年 6 月 1 日の再評価結果により、効能又は効果を一部変更した。

なお、「ベサコリン散」は、医療事故防止対策に伴い「ベサコリン散 5%」と販売名を変更（2007 年 2 月製造販売承認取得）し、現在に至っている。

2. 製品の治療学的特性

(1) ベサコリン散 5%は、アセチルコリンと異なり、コリンエステラーゼによる加水分解を受け難いので、体液中でも安定性が高く、内服により効果の期待できる副交感神経亢進剤である。主として消化管、膀胱の平滑筋に作用し、運動、緊張及び胃液分泌を促進するので、特に慢性胃炎や迷走神経切断後の消化管機能低下、術後の腹部ガス膨満、尿閉などの治療に効果を発揮する。

(2) 重大な副作用として、コリン作動性クリーゼが報告されている。「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の項参照

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

I. 概要に関する項目

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない（RMP 策定対象外の事例）

Ⅱ.名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ベサコリン[®] 散 5%

(2) 洋名

Besacolin[®] Powder 5%

(3) 名称の由来

ベサコリンはアセチルコリンの誘導体で、開発当時の一般名が塩化ベサネコールであった。アセチルコリンの「コリン」と塩化ベサネコールの「ベサ」から「ベサコリン」と命名した。

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

ベタネコール塩化物 (JAN)

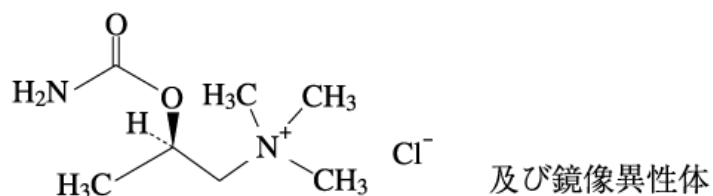
(2) 洋名(命名法)

Bethanechol Chloride (JAN)

(3) ステム(stem)

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_7H_{17}ClN_2O_2$

分子量 : 196.68

5. 化学名(命名法)又は本質

(2*RS*)-2-Carbamoyloxy-*N, N, N*-trimethylpropylaminium chloride (IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

別名 : 塩化ベタネコール、カルバミルメチルコリン

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は無色又は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

本品は水に極めて溶けやすく、酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けにくい。

(3) 吸湿性

本品は吸湿性である。

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点：217～221℃（乾燥後）

(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

本品 1.0 g に水 40mL を加えて溶かした液の pH は 4.8～5.2 である。

本品の水溶液（1→10）は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

ベタネコール塩化物は吸湿性である。

3. 有効成分の確認試験法, 定量法

確認試験法

日本薬局方「ベタネコール塩化物」の確認試験法による。

定量法

日本薬局方「ベタネコール塩化物」の定量法による。

・電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

散剤

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	剤形	色
ベサコリン散 5%	散剤	白色

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販売名	ベサコリン散 5%
有効成分	1g 中ベタネコール塩化物 50mg
添加剤	含水二酸化ケイ素、トウモロコシデンプン、乳糖水和物

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

6. 製剤の各種条件下における安定性

試験方法		保存条件	包装形態	保存期間	試験項目	結果
長期保存試験		25°C/60%RH	ポリエチレン容器＋紙箱	36 カ月	性状 乾燥減量 含量	いずれの試験項目においても規格内。
加速試験		40°C/75%RH	ポリエチレン容器＋紙箱	6 カ月	性状 乾燥減量 含量	3 カ月後の結果で容器臭あり、その他の試験項目においては規格内。
開封後	光	1,000 lx	ポリエチレン容器	50 日 (120 万 lx・hr)	性状 乾燥減量 含量	25 日後の結果で容器臭あり、その他の試験項目においては規格内。
苛酷試験	温度	40°C	ガラス瓶（密栓）	3 カ月	外観 含量	いずれの試験項目においても規格内。
	湿度	25°C/75%RH	シャーレ（開放）	3 カ月	外観 乾燥減量 含量	1 カ月で僅かに黄変、ブロッキングあり、乾燥減量増加傾向（規格内）、含量低下傾向（規格内）。
	光	2 万 lx	シャーレ（蓋）	60 時間※	外観 含量	いずれの試験項目においても規格内。

※：キセノンランプ照射（総照度 120 万 lx・hr＋総近紫外放射エネルギー200W・h/m²以上）

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

ベサコリン散 5%はやや吸湿性の粉末であるため、本剤と配合される薬剤が吸湿性の高い場合、容易にその影響を受け、吸湿→ブロッキング（固結）を起こす。またアルカリ性薬剤などの配合により吸湿（若干の）と共に経時的に着色（黄褐色化）を起こす傾向があり、これらと長期間の接触を避ける必要がある。

他剤との配合変化の詳細は「ⅩⅢ 2 その他の関連資料 ベサコリン散 5% 配合変化一覧」に示した。

9. 溶出性

方法：日局一般試験法、溶出試験法（パドル法）

条件：回転数 50rpm

試験液 水 900mL

測定法 紫外吸光度測定法（波長 190nm）

結果：本品の 15 分間の溶出率が 70%以上のとき適合する。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

100g (ボトル)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ボトル：ポリエチレン

キャップ：ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

○消化管機能低下のみられる下記疾患

慢性胃炎

迷走神経切断後

手術後及び分娩後の腸管麻痺

麻痺性イレウス

○手術後、分娩後及び神経因性膀胱などの低緊張性膀胱による排尿困難（尿閉）

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

ベタネコール塩化物として、通常成人1日30～50mgを3～4回に分けて経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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(一般使用成績調査, 特定使用成績調査, 使用成績比較調査), 製造販売後データベース調査, 製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

消化管機能低下のみられる疾患 500 症例ならびに術後尿閉、ガス膨満及び低緊張性膀胱のみられる疾患 202 症例においては、本剤の有用性が認められている^{1,2)}。

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

アセチルコリン塩化物、ネオスチグミン臭化物、ジスチグミン臭化物

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

該当資料なし

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 消化管運動亢進作用

本薬は、節後副交感神経刺激によるムスカリン様作用により、胃腸の運動と緊張を高め、胃液の分泌を促進することが、ヒト、イヌにより確認されている^{3,4)}。

2) 尿管平滑筋収縮作用

本薬は、ヒト、イヌで膀胱の排尿筋を収縮させ、膀胱内圧を高めると同時に、膀胱頸部を緩解することによって、排尿効果を促進することが確認されている^{5~7)}。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

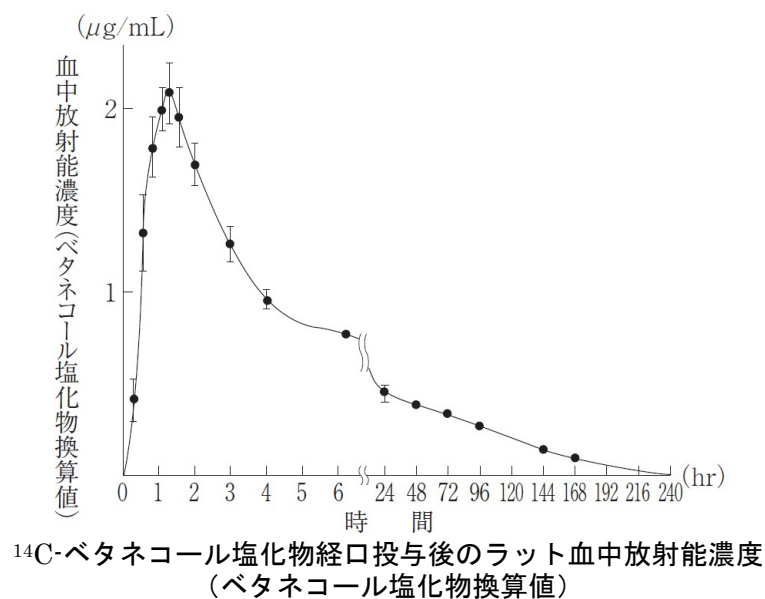
該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

〈参考：ラット〉

ラットに ^{14}C -ベタネコール塩化物を $20\text{mg}/\text{kg}$ *経口投与した際の血中放射能濃度は、投与 75 分後に最高値 $2.1\text{ }\mu\text{g}/\text{mL}$ （ベタネコール塩化物換算値）に達し、以後緩徐に減少した。

* $20\text{mg}/\text{kg}$ は臨床用量の約 120 倍に相当する。



(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

ベタネコールは、通常用量では脳血液関門を通過しない。

[[出典] AHFS Drug Information p.719 (1994)]

〈参考：ラット〉

ラットに ^{14}C -ベタネコール塩化物を 20mg/kg *経口投与した際、各組織の放射能の取り込みは、肝で最も高く、次いで腎であった。その他、腸、胃、肺、脾の順に比較的高い放射能の取り込みが見られた。投与時間 4 時間後では殆どの臓器でピーク時の半分の放射能濃度になったが、肺、睾丸では若干上昇し、脾は僅かに減少した。

* 20mg/kg は臨床用量の約 120 倍に相当する。

(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

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

〈参考：ラット〉

ラットにおける 24 時間尿中の代謝物の放射能の 95%が β -メチルコリンで、3%が未変化体であった。

(2) 代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種,寄与率

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活性比,存在比率

該当資料なし

7. 排泄

排泄部位及び経路

尿及び胆汁

〈参考：ラット〉

ラットに ^{14}C -ベタネコール塩化物 20mg/kg*を経口投与した際、投与 7 日間で尿中に投与放射能の 52.0%、糞中に 46.0%が排泄され、経口投与後 24 時間以内に総排泄放射能の 87.0%が排泄された。

*20mg/kg は臨床用量の約 120 倍に相当する。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 甲状腺機能亢進症の患者

〔心房細動の危険性を増加させるおそれがある。〕

2.2 気管支喘息の患者

〔気管支喘息の症状を悪化させるおそれがある。〕

2.3 消化管及び膀胱頸部に閉塞のある患者

〔消化管の通過障害、排尿障害を起こすおそれがある。〕

2.4 消化性潰瘍の患者

〔消化性潰瘍を悪化させるおそれがある。〕

2.5 妊婦又は妊娠している可能性のある女性

〔9.5 参照〕

2.6 冠動脈閉塞のある患者

〔冠血流量を減少させ、心疾患の症状を悪化させるおそれがある。〕

2.7 強度の徐脈のある患者

〔徐脈を悪化させるおそれがある。〕

2.8 てんかんのある患者

〔てんかん発作を起こすおそれがある。〕

2.9 パーキンソニズムのある患者

〔パーキンソニズムの症状を悪化させるおそれがある。〕

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。[2.5 参照]

(解説)

妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

コリン作動性作用により発汗、潮紅、下痢、悪心、嘔吐等の副作用があらわれやすい。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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
コリン作動薬 ピロカルピン塩酸塩、セビ メリン塩酸塩水和物等 コリンエステラーゼ阻害薬 ジスチグミン臭化物等	本剤のコリン作動性作用 に基づく副作用（発汗、顔 面潮紅等）を増強させるお それがある。	本剤のコリン作動性作用 を増強させるおそれがある。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認め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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 コリン作動性クリーゼ（頻度不明）

悪心、嘔吐、腹痛、下痢、唾液分泌過多、発汗、徐脈、血圧低下、縮瞳等の症状が認められた場合には投与を中止し、アトロピン硫酸塩水和物 0.5～1mg（患者の症状に合わせて適宜増減）を投与すること。また、呼吸不全に至ることもあるので、その場合は気道を確保し、人工換気を考慮すること。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用		
	0.1～5%未満	頻度不明
循環器	心悸亢進	胸内苦悶
消化器	胸やけ、悪心、嘔吐、唾液分泌過多、腹痛、下痢	胃部不快感
精神神経系	頭痛	
過敏症	発熱、発汗、顔面潮紅	

◆副作用頻度一覧表等

総症例 767 例中、45 例 (5.87%) の副作用が報告されている。(再評価結果時)

	合 計
調査症例数	767
副作用発現症例数	45
副作用発現症例率 (%)	5.87%

副作用の種類	発現件数 (%)
〔中枢・末梢神経系障害〕	
頭痛	2 (0.26%)
四肢冷感	1 (0.13%)
〔自律神経系障害〕	
口渇	2 (0.26%)
発汗	3 (0.39%)
唾液分泌過多	2 (0.26%)
心悸亢進	5 (0.65%)
〔消化器障害〕	
腹痛	9 (1.17%)
胸やけ	6 (0.78%)
悪心・嘔吐	7 (0.91%)
下痢 (軟便を含む)	6 (0.78%)
〔一般的全身障害〕	
発熱	2 (0.26%)
顔面紅潮	2 (0.26%)

(1976 年 1 月集計)

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

10. 過量投与

設定されていない

〈参考〉

本剤の大量投与による国内での報告はないが、大量投与時の副作用として以下の症状が予想される。

1. 中枢神経症状：不眠、神経過敏、いらいら感
2. 起立性低血圧：めまい、ふらつき、失神予感
3. 副交感神経刺激：頭痛、流涎・発汗増加、悪心、嘔吐、皮膚の発疹・温感、胃の不快感・胃痛
4. 痙攣発作

11. 適用上の注意

設定されていない

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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) 安全性薬理試験

ベタネコール塩化物は、自律神経系（心脈管系、消化器系、外分泌系）に対して、典型的な副交感神経刺激作用を有し、中枢神経系に対しては軽度の筋弛緩作用と運動障害作用が認められたのみでその他の機能に対する作用は認められない。

(3) 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

LD₅₀ (mg/kg)

動物種 投与経路	マウス		ラット	
	雄	雌	雄	雌
経口	1,470	1,180	1,640	1,440
皮下	275	270	610	570
筋肉内	240	192	220	220
静脈内	105	124	104	114

(2) 反復投与毒性試験

1) 亜急性毒性

ラットに 80、200、500、1,000mg/kg/日を 5 週間経口投与したところ、200mg/kg 以上で流涎、流涙、軟便あるいは下痢がみられたが、80mg/kg では体重、血液、臨床検査、尿検査、組織学的検査に影響はみられなかった。500mg/kg 以上で軽度に腎への影響が示唆された。

2) 慢性毒性

ラットに 32、80、200、500mg/kg/日を 6 カ月間経口投与したところ、80mg/kg で流涎及び排糞の促進、200mg/kg 以上で流涎、流涙、軟便、下痢、自発運動の抑制、腹臥姿勢が 6 カ月間を通じてみられた。死亡例は、どの投与群においても認められなかった。臓器重量では、32mg/kg から耳下腺の用量依存的な増加がみられ、500mg/kg で副腎の増加傾向が認められた。しかし、組織的には特に異常はみられなかった。

雄群で血漿総コレステロール及び尿素窒素の用量依存的な増加がみられた。また、尿中 Na⁺及び Cl⁻の用量依存的な増加、K⁺の軽度の増加傾向が認められた。Na⁺、Cl⁻、K⁺いずれも雄の変化が著明であった。

IX. 非臨床試験に関する項目

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

マウスを用い、10、100、1,000mg/kg/日の妊娠7日目より6日間経口投与したところ、一部に眼瞼開存、口蓋裂、外脳症、指癒合、血腫がみられたが、対照群との間に差は認められなかった。

なお、1,000mg/kg 投与群においては、胎児骨格の形成に影響のあることが示唆された。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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：劇薬（処方箋医薬品以外の医薬品である）

有効成分：ベタネコール塩化物 毒薬

2. 有効期間

3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

開栓後は湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無し

くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：無し

同 効 薬：

一 般 名	商 品 名
ジスチグミン臭化物	ウブレチド錠 5mg

等

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ベサコリン散	1960 年 2 月 29 日	13511KUZ02147000	1961 年 1 月 1 日	1960 年 3 月 10 日
販売名変更 ベサコリン散 5%	2007 年 2 月 28 日 (販売名変更による)	21900AMX00119000	2007 年 6 月 15 日 (販売名変更による)	2007 年 6 月 15 日
製造販売承認承継	〃	〃	〃	2023 年 4 月 1 日

X. 管理的事項に関する項目

9. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1984年6月1日

再評価結果の内容：効能・効果の一部変更

胃下垂症、胃アトニーが慢性胃炎に包含された。

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省 薬価基準収載 医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理 システム用コード
ベサコリン散 5%	1231 004B 1067	1231004B1067	1017410 01	620005100

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

文献請求番号

- | | |
|---|---------|
| 1) 松原弘昌ら : 内科の領域. 1961 ; 9 (7) : 573-584 | BS-0013 |
| 2) 池尻泰二ら : 臨床外科. 1961 ; 16 (1) 69-76 | BS-0004 |
| 3) Machella T. E. et al. : Gastroenterology. 1947 ; 8 (1) : 36-51 (PMID : 20278318) | BS-0001 |
| 4) Brooks A. M. et al. : Clin. Res.. 1970 ; 18 : 173 | BS-0002 |
| 5) Kleeman F. J. : J. Urol.. 1970 ; 104 (4) : 549-554 (PMID : 5476468) | BS-0036 |
| 6) Stein I. F. et al. : JAMA. 1949 ; 140 (6) : 522-525 | BS-0037 |
| 7) Matsumura S. et al. : Tohoku J. Exp. Med.. 1968 ; 96 : 247-258 | BS-0003 |

2. その他の参考文献

該当資料なし

1. 主な外国での発売状況

主な海外での発売状況は、以下の通りである。(2020 年時点)

販売名	国 名
Myocholine	ドイツ、ベルギー、オーストリア、スイス
Myotonine	イギリス
Duvoid	アメリカ、カナダ

注) 上記製品については、ライセンス関係のない企業が発売している。

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦等に関する海外情報

国内における使用上の注意「9.5 妊婦」及び「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、欧州 SPC 記載内容とは異なる。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

欧州 SPC における記載を以下に示した。

出典	記載内容
欧州 SPC (2015 年 3 月)	Pregnancy and lactation Should not be used during pregnancy or lactation.

2023 年 9 月時点

(2) 小児等に関する海外情報

国内における使用上の注意「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりであり、欧州 SPC 記載内容とは異なる。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

欧州 SPC における記載を以下に示した。

出典	記載内容
欧州 SPC (2015 年 3 月)	Children : The experience with children is limited ; therefore no recommended dose is given.

2023 年 9 月時点

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

表紙に記載の「問い合わせ窓口」に個別に照会すること。

2. その他の関連資料

ベサコリン散 5% 配合変化一覧（別表参照）

〈別表〉

ベサコリン散 5% 配合変化一覧

1. 分包時の変化所見

保存条件	量 (g)	分包材質	変化所見
室温／75%RH 40 日間	0.5	グラシン紙	外観変化なし
30℃／92%RH 40 日間	0.5	グラシン紙	外観変化なし

2. 配合変化試験成績一覧

配合量欄に記載の量（配合薬／ベサコリン散 5%）を配合、下記の形態で保存し、外観を観察した。

配合薬	保存期間	配合量		変化所見
232：セルベックス細粒10% (テプレノン) 白色～帯黄白色の細粒 エーザイ＝EAファーマ	14日間	配合	0.5	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし
			0.2	【30℃/92%RH グラシン分包】 外観変化なし
233：㊟ジアスターゼ 淡黄色～淡褐色の粉末	21日間	単味	0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし
			0.2	【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 14日後 固結
		配合	0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし
			0.2	【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 14日後 固結
223：㊟パンクレアチン 白色～淡黄色の粉末	21日間	単味	0.3	【20℃/75%RH グラシン分包】 7日後 湿潤 14日後 一部固結 21日後 固結、異臭
			0.3	【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 14日後 固結 21日後 異臭
		配合	0.3	【20℃/75%RH グラシン分包】 7日後 湿潤 14日後 一部固結 21日後 固結、異臭
			0.2	【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 14日後 固結 21日後 異臭

XIII. 備考

配合薬	保存期間	配合量		変化所見
233：㊟乾燥酵母 淡褐色の粉末	21日間	単味	1.0	【20℃/75%RH グラシン分包】 14日後 湿潤 【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 21日後 固結、異臭
		配合	1.0 0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 14日後 湿潤 【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 21日後 固結、異臭
234：㊟乾燥水酸化アルミニウムゲル細粒 白色の細粒	21日間	配合	0.5 0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし 【30℃/92%RH グラシン分包】 外観変化なし
234：㊟酸化マグネシウム 白色の粉末又は粒	21日間	単味	0.3	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし 【30℃/92%RH グラシン分包】 21日後 湿潤
		配合	0.3 0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし 【30℃/92%RH グラシン分包】 14日後 黄変 21日後 異臭（アミン臭）
234：㊟炭酸水素ナトリウム 白色の結晶又は結晶性の粉末	21日	単味	1.0	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし 【30℃/92%RH グラシン分包】 7日後 湿潤
		配合	1.0 0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし 【30℃/92%RH グラシン分包】 7日後 湿潤 21日後 微黄変、異臭
312：㊟チアミン硝化物 白色の粉末	21日間	単味	0.3	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし 【30℃/92%RH グラシン分包】 21日後 湿潤
		配合	0.3 0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 外観変化なし 【30℃/92%RH グラシン分包】 21日後 湿潤
510：㊟ゲンチアナ末 黄褐色の末剤	21日間	単味	0.1	【20℃/75%RH グラシン分包】 14日後 湿潤 【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 7日後 一部固結 21日後 固結
		配合	0.1 0.2	【20℃/75%RH グラシン分包】 21日後 湿潤 【30℃/92%RH グラシン分包】 4日後 湿潤 7日後 一部固結 21日後 固結

2023年4月作成

