

貯法：室温保存

有効期間：3年

ベルベリン塩化物水和物製剤

キョウベリン錠100

Kyoberin Tablets 100

承認番号	14700AMZ01111
販売開始	1978年2月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）


2.1 出血性大腸炎の患者〔腸管出血性大腸菌（O157等）や赤痢菌等の重篤な細菌性下痢患者では、症状の悪化、治療期間の延長をきたすおそれがある。〕[9.1.1 参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	キョウベリン錠100
有効成分	1錠中ベルベリン塩化物水和物（無水物として）..... 100mg
添加剤	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースCa、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、エチルセルロース、グリセリン脂肪酸エステル、無水ケイ酸、酸化チタン、黄色5号アルミニウムレーキ

3.2 製剤の性状

販売名	キョウベリン錠100
色、形状	片面割線を有する黄色のフィルムコーティング錠
外形	
直径	8.2mm
厚さ	3.9mm
重量	190mg
識別コード	KR002

4. 効能・効果

下痢症

6. 用法・用量

ベルベリン塩化物として、通常成人1日150～300mg（本剤1.5～3錠）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。

8. 重要な基本的注意

8.1 長期・大量投与を避けること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 細菌性下痢患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。治療期間の延期をきたすおそれがある。[2.1 参照]

9.5 妊婦

治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

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。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

11. 副作用

次の副作用が現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。

11.2 その他の副作用

消化器	便秘	0.1～5%未満
-----	----	----------

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

16. 薬物動態

16.8 その他

16.8.1 溶出挙動

キョウベリン錠100は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたベルベリン塩化物水和物錠の溶出規格に適合していることが確認されている¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

総症例158例中、有効率は78.5%（124/158）であった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

腸内有害細菌（赤痢菌、チフス菌、ブドウ球菌、有害大腸菌など）に対して殺菌作用を示す。赤痢菌では抗生物質耐性菌に対しても有効である。腸内でインドール、スカトールなどの有害アミンの生成酵素に拮抗し、腸内腐敗・発酵を抑制する。そのほか胆汁分泌作用、腸内細菌叢を正常に保持し、腸管内の病原菌の増殖を抑える作用などが認められている²⁾。

18.2 腸内腐敗、醗酵抑制作用

ベルベリン塩化物は腸内においてインドール、スカトール等の有害アミンの生成に関与する酵素と拮抗し、腸内の腐敗醗酵を防止する。従って便の悪臭もなくなる³⁻⁶⁾。

18.3 蠕動抑制作用

ベルベリン塩化物は家兔摘出腸管の蠕動を抑制し、弛緩作用を示す⁷⁾。

18.4 胆汁分泌作用

ベルベリンは動物実験において胆汁分泌作用を有する。ベルベリンのこの胆汁分泌作用は腸内細菌叢を正常な状態に保持し、腸管内における病原菌の増殖を抑えるものと考えられる^{8,9)}。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：ベルベリン塩化物水和物

（Berberine Chloride Hydrate）

化学名：9,10-Dimethoxy-5,6-dihydro[1,3]dioxolo[4,5-g]

isoquino[3,2-a]isoquinolin-7-ium chloride hydrate

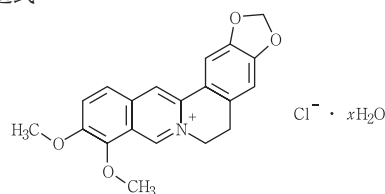
分子式：C₂₀H₁₈ClNO₄・ γ H₂O

分子量：371.81（C₂₀H₁₈ClNO₄）

性状：ベルベリン塩化物水和物は、黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なおいがあり、味は極めて苦い。

メタノールにやや溶けにくく、エタノール（95）に溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

本品はロットにより錠剤の色に違いがあることもあるが、生薬原料のロット差によるものであり、有効性、安全性に問題はない。

22. 包装

100錠 [10錠 (PTP) × 10]

500錠 [10錠 (PTP) × 10 × 5]

1,000錠 [10錠 (PTP) × 10 × 10]

23. 主要文献

- 1) 大峰堂薬品工業 (株) 社内資料
- 2) 第17改正日本薬局方解説書 C-5071-5075 2017 (廣川書店)
- 3) Shigeaki Kuwano et al. : Chem. Pharm. Bull., 8, 491-496 (1960)
- 4) Shigeaki Kuwano et al. : Chem. Pharm. Bull., 8, 497-503 (1960)
- 5) Shigeaki Kuwano et al. : Chem. Pharm. Bull., 9, 651-653 (1961)
- 6) 桑野 重昭 : 漢方研究, 107, 106-115 (1964)
- 7) 阿南 新二 : 長崎医学会雑誌, 5, 243-261 (1927)
- 8) 川谷 豊彦 : 薬局の領域, 12, 23-26 (1963)
- 9) Susumu Oshiba et al. : Nihon Univ. J. Med., 16, 69-79 (1974)

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本化薬株式会社 医薬品情報センター
〒100-0005 東京都千代田区丸の内二丁目1番1号
TEL.0120-505-282

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

大峰堂薬品工業株式会社

奈良県大和高田市根成柿574番地

26.2 発売元

日本化薬株式会社
東京都千代田区丸の内二丁目1番1号