2023年11月改訂（第11版）

日本標準商品分類番号
873962

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

経口糖尿病用剤

日本薬局方　メトホルミン塩酸塩錠

メトホルミン塩酸塩錠250mg「SN」

Metformin Hydrochloride Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	劇薬 処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1錠中　メトホルミン塩酸塩…250mg
一般名	和名：メトホルミン塩酸塩（JAN） 洋名：Metformin Hydrochloride（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：2013年12月27日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2014年6月20日（販売名変更による） 販売開始年月日：2005年7月
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売：武田薬品工業株式会社 発売元：日医工株式会社 製造販売元：シオノケミカル株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社　お客様サポートセンター TEL：0120-517-215　FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ　https://www.nichiiko.co.jp/

本IFは2023年11月改訂の電子添文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（https://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
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 1
6. ＲＭＰの概要 1
Ⅱ．名称に関する項目 2
1. 販売名 2
2. 一般名 2
3. 構造式又は示性式 2
4. 分子式及び分子量 2
5. 化学名（命名法）又は本質 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 2
Ⅲ．有効成分に関する項目 3
1. 物理化学的性質 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性 3
3. 有効成分の確認試験法、定量法 3
Ⅳ．製剤に関する項目 4
1. 剤形 4
2. 製剤の組成 4
3. 添付溶解液の組成及び容量 4
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 5
7. 調製法及び溶解後の安定性 5
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） 5
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 8
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 10
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 11
1. 血中濃度の推移 11
2. 薬物速度論的パラメータ 12
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 14
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 15
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 16
7. 相互作用 17
8. 副作用 19
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 20
10. 過量投与 20
11. 適用上の注意 21
12. その他の注意 21
Ⅸ．非臨床試験に関する項目 22
1. 薬理試験 22
2. 毒性試験 22
Ⅹ．管理的事項に関する項目 23
1. 規制区分 23
2. 有効期間 23
3. 包装状態での貯法 23
4. 取扱い上の注意 23
5. 患者向け資材 23
6. 同一成分・同効薬 23
7. 国際誕生年月日 23
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 23
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 24
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 24
11. 再審査期間 24
12. 投薬期間制限に関する情報 24
13. 各種コード 24
14. 保険給付上の注意 24
ⅩⅠ．文献 25
1. 引用文献 25
2. その他の参考文献 25
ⅩⅡ．参考資料 26
1. 主な外国での発売状況 26
2. 海外における臨床支援情報 26
ⅩⅢ．備考 27
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 27
2. その他の関連資料 29

Ⅰ．概要に関する項目

1.　開発の経緯

メトホルミン塩酸塩は経口糖尿病用剤であり、本邦では昭和 36 年に上市されている。

旧販売名であるメトリオン錠 250 は、シオノケミカル株式会社が後発医薬品として開発を企画し、医薬審発第 786 号（平成 13 年 5 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、平成 17 年 3 月に承認を得て、平成 17 年 7 月に発売された。

平成 21 年 11 月に効能・効果及び用法・用量の一部変更承認を得て、スルホニルウレア剤が効果不十分な場合あるいは副作用等により使用不適当な場合に制限されず、食事療法・運動療法のみで十分な効果が得られない場合も本剤の単独投与が可能になった。

その後、医療事故防止のため、メトリオン錠 250 の名称をメトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」とする代替新規申請を行い、平成 25 年 12 月に承認を得て、平成 26 年 6 月に発売された。

令和 3 年 2 月より日医工株式会社が販売を開始した。

2.　製品の治療学的特性

（1）膵β細胞のインスリン分泌を介することなく血糖降下作用を示す。血糖降下作用の主な機序として、（1）肝での糖新生抑制、（2）末梢での糖利用促進、（3）腸管からのグルコース吸収抑制が提唱されている [1]。

（2）重大な副作用として、乳酸アシドーシス、低血糖、肝機能障害、黄疸、横紋筋融解症が報告されている。（「Ⅷ.－8.（1）重大な副作用と初期症状」の項（P.19）参照）

3.　製品の製剤学的特性

該当資料なし

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	タイトル、参照先
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	

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

Ⅱ．名称に関する項目

1.　販売名

（1）和名

メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」

（2）洋名

Metformin Hydrochloride Tablets 250mg「SN」

（3）名称の由来

「有効成分名」＋「剤形」＋「規格」＋「屋号」より命名した。

2.　一般名

（1）和名（命名法）

メトホルミン塩酸塩（JAN）

（2）洋名（命名法）

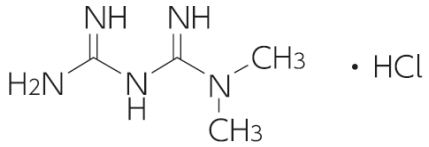
Metformin Hydrochloride（JAN）

Metformin（INN）

（3）ステム

ビグアナイド系薬剤：-formin

3.　構造式又は示性式



4.　分子式及び分子量

分子式：$C_4H_{11}N_5$・HCl

分子量：165.62

5.　化学名（命名法）又は本質

1,1-Dimethylbiguanide monohydrochloride（IUPAC）

6.　慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水に溶けやすく、酢酸（100）にやや溶けにくく、エタノール（99.5）に溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 221℃（分解）

(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、定量法

確認試験法：

日本薬局方「メトホルミン塩酸塩」の確認試験法による

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）

(3) 塩化物の定性反応

定量法：

日本薬局方「メトホルミン塩酸塩」の定量法による

0.05mol/L 過塩素酸による電位差滴定法

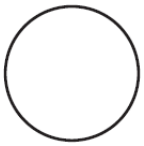
Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」		
剤形	フィルムコーティング錠		
色調	白色		
外形	表面	裏面	側面
			
直径（mm）	9.6		
厚さ（mm）	5.4		
質量（mg）	380		

(3) 識別コード

表示部位：錠剤、PTP シート

表示内容：ME

(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	メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」
有効成分	1 錠中 メトホルミン塩酸塩 250mg
添加剤	ステアリン酸マグネシウム、タルク、デンプングリコール酸ナトリウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール 6000

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

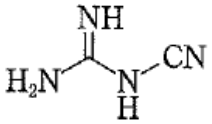
該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

1-シアノグアニジン [2]



6. 製剤の各種条件下における安定性

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヵ月）の結果、メトホルミン塩酸塩錠250mg「SN」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。

長期保存試験（3 年）の結果、メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが確認された。

(1) 加速試験 [3]

試験条件：40℃、75%RH

試験製剤：紙箱入りの PTP 包装

試験項目	規格	開始時	1 ヵ月	3 ヵ月	6 ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠である	適合	適合	適合	適合
定量試験(%)注)	95～105	101.0	99.3	100.3	100.5

注）3 ロット各 3 回測定の平均値

その他の試験項目（確認試験、溶出試験）についても規格内であった。

(2) 長期保存試験 [4]

試験条件：5.0～26.0℃、19.0～91.0%RH

試験製剤：ポリプロピレンフィルムピロー入りの PTP 包装

試験項目	規格	開始時	36 ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠である	適合	適合
定量試験(%)注)	95.0～105.0	100.3	98.8

注）3 ロット各 1 回測定の平均値

その他の試験項目（溶出試験）についても規格内であった。

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（物理化学的変化）

本剤とオルメサルタン　メドキソミル製剤等との一包化は避けること。一包化して高温高湿度条件下にて保存した場合、本剤が変色することがある。（「Ⅷ.－11. 適用上の注意」の項参照）

9.　溶出性

(1) 溶出挙動における類似性 [5]

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」(平成 13 年 5 月 31 日　医薬審発第 786 号) に基づき実施

試験方法：日本薬局方　一般試験法　溶出試験法　パドル法

試験条件

試験液量：900mL

温　　度：37.0±0.5℃

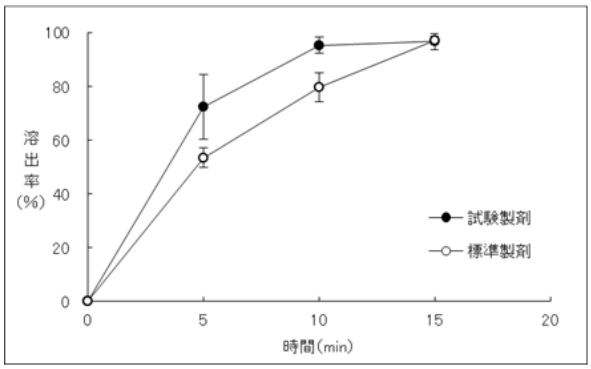
試 験 液：pH1.2、pH5.0、pH6.8、水

回 転 数：50rpm (pH1.2、pH5.0、pH6.8、水)、100rpm (pH6.8)

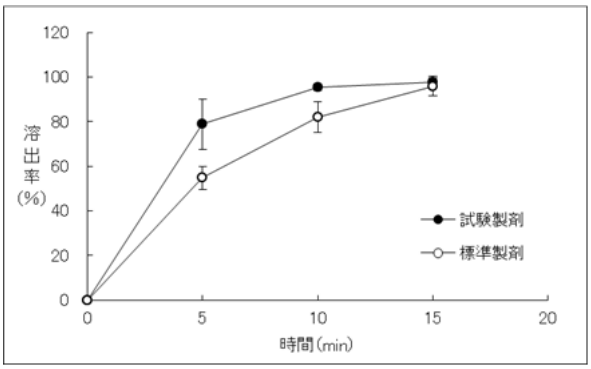
試験結果：全ての条件において判定基準に適合した。

＜溶出曲線＞

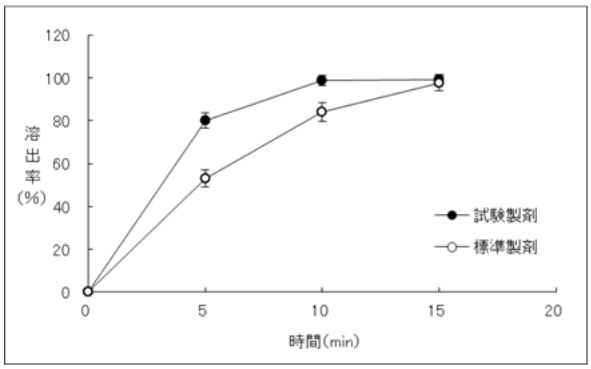
pH1.2、50rpm



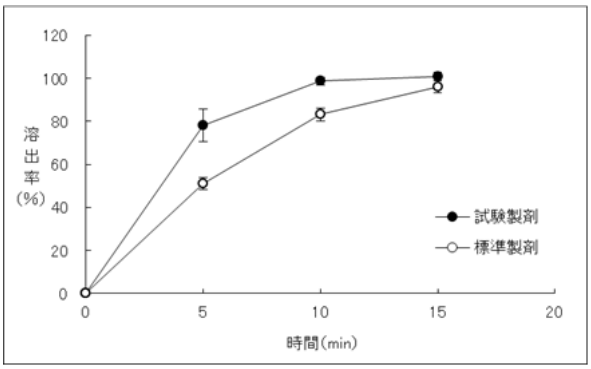
pH5.0、50rpm



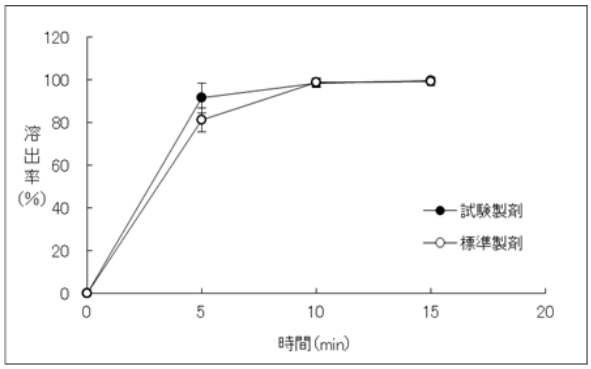
pH6.8、50rpm



水、50rpm



pH6.8、100rpm



(Mean±S.D., n＝12)

(2) 公的溶出規格への適合性 [6]

メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められた規格に適合していることが確認されている。

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

100 錠［10 錠×10 ; PTP］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ＰＴＰ：ポリ塩化ビニル、アルミニウム

ピロー：ポリプロピレン

個装箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

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

2 型糖尿病

ただし、下記のいずれかの治療で十分な効果が得られない場合に限る。

（1）食事療法・運動療法のみ

（2）食事療法・運動療法に加えてスルホニルウレア剤を使用

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

通常、成人にはメトホルミン塩酸塩として 1 日量 500mg より開始し、1 日 2～3 回食後に分割経口投与する。維持量は効果を観察しながら決めるが、1 日最高投与量は 750mg とする。

（2）用法及び用量の設定経緯・根拠

＜副作用等による減量・中止規定＞

「Ⅷ.－5. 重要な基本的注意とその理由」の項、「Ⅷ.－6.（8）高齢者」の項、「Ⅷ.－7.（2）併用注意とその理由」の項及び「Ⅷ.－8. 副作用」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

中等度の腎機能障害患者（eGFR 30mL/min/1.73m^2 以上 60mL/min/1.73m^2 未満）では、メトホルミンの血中濃度が上昇し、乳酸アシドーシスの発現リスクが高くなる可能性があるため、以下の点に注意すること。特に、eGFR が 30mL/min/1.73m^2 以上 45mL/min/1.73m^2 未満の患者では、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。［8.1、9.2.2、11.1.1、16.6.1 参照］

・投与は、少量より開始すること。

・投与中は、より頻回に腎機能（eGFR 等）を確認するなど慎重に経過を観察し、投与の適否及び投与量の調節を検討すること。

・効果不十分な場合は、メトホルミン塩酸塩として 1 日最高投与量を 750mg まで増量することができるが、効果を観察しながら徐々に増量すること。また、投与にあたっては、1 日量を 1 日 2～3 回に分割投与すること。

5. 臨床成績

（1）臨床データパッケージ

該当資料なし

（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

有効性及び安全性に関する試験

国内臨床試験

糖尿病患者 684 例を対象として、単独あるいは他剤との併用投与により実施され、有効率 65.6%（425/648 例）であった。

副作用発現頻度は 23.7%（137/577 例）であった。主な副作用は、下痢 6.8%（39/577 例）、胃腸症状 6.1%（35/577 例）、食欲不振 4.0%（23/577 例）であった。

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

該当資料なし

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

ビグアナイド系化合物

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

膵 β 細胞のインスリン分泌を介することなく血糖降下作用を示す。血糖降下作用の主な機序として、(1) 肝での糖新生抑制、(2) 末梢での糖利用促進、(3) 腸管からのグルコース吸収抑制が提唱されている [1]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

血糖低下作用

メトホルミン塩酸塩は各種動物（マウス [7]、ラット [8]等）において血糖低下作用を示す。この血糖低下作用はエタノール（ウサギ [9]）、クロルプロマジン、クロルプロチキセン（ラット [8]）により抑制され、水素化麦角アルカロイド（ウサギ [10]）により増強される。

(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

生物学的同等性試験

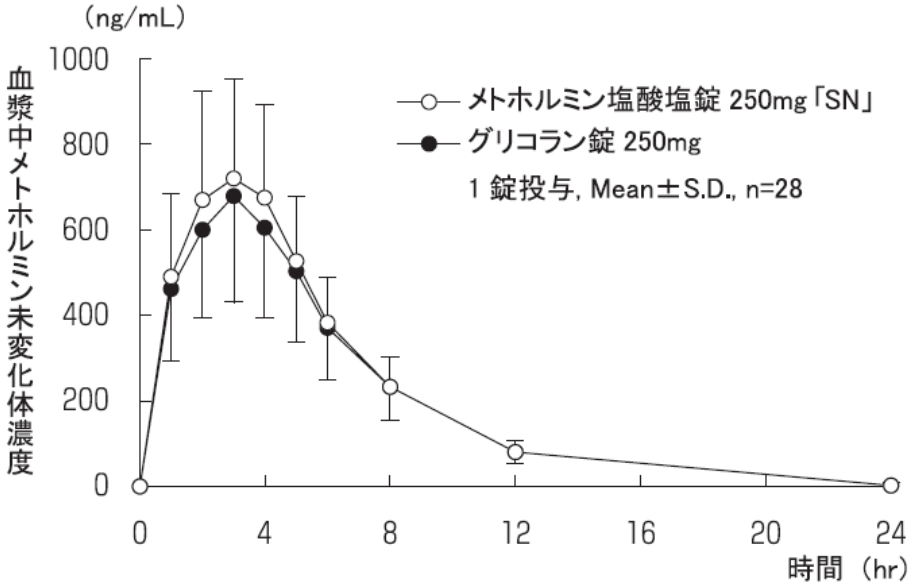
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」（平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）に基づき実施

メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」とグリコラン錠 250mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（メトホルミン塩酸塩として 250mg）健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中のメトホルミン未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された [11]。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-24} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」	5018.8±1351.1	776.6±229.5	3.0±0.8	2.8±0.8
グリコラン錠 250mg	4745.3±1329.7	718.9±225.8	2.9±0.8	2.9±0.9

（1錠投与，Mean±S.D.，n=28）



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

該当資料なし

2）併用薬の影響

①ドルテグラビルとの併用

健康成人に対しメトホルミンとドルテグラビル 50mg/日及び 100mg/日を併用して反復投与した場合、メトホルミンの C_{max} がそれぞれ 66%及び 111%上昇し、AUC がそれぞれ 79%及び 145%増加した [12]（外国人データ）。［10.2 参照］

②バンデタニブとの併用

健康成人に対しメトホルミンとバンデタニブを併用して単回投与した場合、メトホルミンの C_{max} 及び $AUC_{0-\infty}$ がそれぞれ 50%及び 74%増加し、腎クリアランスが 52%減少した [13]（外国人データ）。［10.2 参照］

「Ⅷ.－7. 相互作用」の項参照

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

0.2622±0.0519（hr^{-1}）（Mean±S.D., n=28）

（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

該当資料なし

（2）血液－胎盤関門通過性

「Ⅷ.－6.（5）妊婦」の項参照

（3）乳汁への移行性

「Ⅷ.－6.（6）授乳婦」の項参照

（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

該当資料なし

（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

該当資料なし

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

参考：本剤は腹膜透析を含む透析患者に禁忌である。（「Ⅷ.－2. 禁忌内容とその理由」の項及び「Ⅷ.－6.（2）腎機能障害患者」の項参照）

10. 特定の背景を有する患者

腎機能障害患者

腎機能正常者（クレアチニンクリアランス：＞90mL/min）、軽度（クレアチニンクリアランス：61～90mL/min）及び中等度（クレアチニンクリアランス：31～60mL/min）の腎機能障害者にメトホルミン塩酸塩 850mg 注）を空腹時に単回経口投与したときの薬物動態パラメータは以下のとおりであった[14]（外国人データ）。［7.、9.2 参照］

	C_{max}（μg/mL）	$AUC_{0-\infty}$（μg・hr/mL）	$t_{1/2}$（hr）	CL_R（mL/min）
腎機能正常者（3例）	1.64±0.50	11.22±3.19	11.2±5.2	394.7±83.8
軽度腎機能障害者（5例）	1.86±0.52	13.22±2.00	17.3±21.2	383.6±122.3
中等度腎機能障害者（4例）	4.12±1.83	58.30±36.58	16.2±7.6	108.3±57.2

（Mean±S.D.，CL_R：腎クリアランス）

注）本剤の用法・用量：1 日量 500mg（2～3 回食後に分割経口投与）より開始し、1 日最高投与量は 750mg である。

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

1. 警告

1.1 重篤な乳酸アシドーシスを起こすことがあり、死亡に至った例も報告されている。乳酸アシドーシスを起こしやすい患者には投与しないこと。[2.1、2.3、8.1、9.2、9.3、11.1.1 参照]

1.2 腎機能障害患者又は肝機能障害患者、高齢者に投与する場合には、定期的に腎機能や肝機能を確認するなど慎重に投与すること。特に 75 歳以上の高齢者では、本剤投与の適否を慎重に判断すること。[8.1、9.2、9.3、9.8、11.1.1 参照]

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 次に示す患者［乳酸アシドーシスを起こしやすい。］［1.1、8.1、11.1.1 参照］

・乳酸アシドーシスの既往歴のある患者

・重度の腎機能障害患者(eGFR 30mL/min/1.73m^2 未満)又は透析患者(腹膜透析を含む)［9.2.1 参照］

・重度の肝機能障害患者［9.3.1 参照］

・心血管系、肺機能に高度の障害（ショック、心不全、心筋梗塞、肺塞栓等）のある患者及びその他の低酸素血症を伴いやすい状態にある患者［嫌気的解糖の亢進により乳酸産生が増加する。］

・脱水症の患者又は脱水状態が懸念される患者（下痢、嘔吐等の胃腸障害のある患者、経口摂取が困難な患者等）

・過度のアルコール摂取者［肝臓における乳酸の代謝能が低下する。また、脱水状態を来すことがある。］［10.1 参照］

2.2 重症ケトーシス、糖尿病性昏睡又は前昏睡、1 型糖尿病の患者［輸液、インスリンによる速やかな高血糖の是正が必須である。］

2.3 重症感染症、手術前後、重篤な外傷のある患者［インスリン注射による血糖管理が望まれるので本剤の投与は適さない。また、乳酸アシドーシスを起こしやすい。］［1.1、8.1、11.1.1 参照］

2.4 栄養不良状態、飢餓状態、衰弱状態、脳下垂体機能不全又は副腎機能不全の患者［低血糖を起こすおそれがある。］［11.1.2 参照］

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 本剤の成分又はビグアナイド系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者

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

「Ⅴ.－4. 用法及び用量に関連する注意」の項参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 まれに重篤な乳酸アシドーシスを起こすことがある。リスク因子としては、腎機能障害、肝機能障害、低酸素血症を伴いやすい状態、脱水（利尿作用を有する薬剤の併用を含む）、過度のアルコール摂取、感染症、高齢者等が知られている。特に、脱水、過度のアルコール摂取等により患者の状態が急変することもあるので、以下の点に注意すること。［1.1、1.2、2.3、11.1.1 参照］

（1）本剤の投与開始前及びその後も投与中は定期的に、腎機能（eGFR 等）及び肝機能を確認するとともに、患者の状態に十分注意して投与の適否及び投与量の調節を検討すること。なお、高齢者等、特に慎重な経過観察が必要な場合には、より頻回に確認すること。［2.1、7.、9.2、9.3、9.8 参照］

（2）脱水症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。利尿作用を有する薬剤（利尿剤、SGLT2 阻害剤等）との併用時には、特に脱水に注意すること。［2.1、10.2 参照］

（3）本剤の投与開始時及びその後も投与中は適切に、以下の内容を患者及びその家族に十分指導すること。

・過度のアルコール摂取を避けること。［2.1、10.1 参照］

・発熱、下痢、嘔吐、食事摂取不良等の体調不良（シックデイ）の時は脱水状態が懸念されるため、いったん服用を中止し、医師に相談すること。［2.1、9.1.2 参照］

・乳酸アシドーシスの症状（胃腸障害、倦怠感、筋肉痛、過呼吸等）があらわれた場合には、直ちに受診すること。［11.1.1 参照］

（4）ヨード造影剤を用いて検査を行う患者においては、本剤の併用により乳酸アシドーシスを起こすことがあるので、検査前は本剤の投与を一時的に中止すること（ただし、緊急に検査を行う必要がある場合を除く）。ヨード造影剤投与後 48 時間は本剤の投与を再開しないこと。なお、投与再開時には、患者の状態に注意すること。［10.2 参照］

8.2 低血糖症状を起こすことがあるので、高所作業、自動車の運転等に従事している患者に投与するときには注意すること。［11.1.2 参照］

8.3 本剤の使用にあたっては、患者及びその家族に対し低血糖症状及びその対処方法について十分説明すること。［9.1.1、11.1.2 参照］

8.4 投与する場合には、少量より開始し、血糖値、尿糖等を定期的に検査し、薬剤の効果を確かめ、本剤を 3～4 ヵ月投与しても効果が不十分な場合には、速やかに他の治療法への切り替えを行うこと。

8.5 本剤とイメグリミン塩酸塩は作用機序の一部が共通している可能性があること、また、イメグリミン塩酸塩の国内臨床試験[15]において、ビグアナイド系薬剤と併用した場合、他の糖尿病用薬との併用療法と比較して消化器症状が多く認められたとの報告があることから、併用薬剤の選択の際には留意すること。［10.2 参照］

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

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 低血糖を起こすおそれのある以下の患者又は状態

・不規則な食事摂取、食事摂取量の不足

・激しい筋肉運動

［8.3、11.1.2 参照］

9.1.2 感染症

乳酸アシドーシスを起こすおそれがある。［8.1、11.1.1 参照］

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

腎臓における排泄が減少しメトホルミンの血中濃度が上昇するため、乳酸アシドーシス等の発現リスクが高くなる可能性がある。［1.1、1.2、9.8、11.1.1、16.6.1 参照］

9.2.1 重度の腎機能障害患者（eGFR 30mL/min/1.73m^{2}未満）又は透析患者（腹膜透析を含む）

投与しないこと。［2.1 参照］

9.2.2 中等度の腎機能障害患者（eGFR 30mL/min/1.73m^{2}以上 60mL/min/1.73m^{2}未満）

慎重に経過を観察し、投与の適否及び投与量の調節を検討すること。特に、eGFR が 30mL/min/1.73m^{2}以上 45mL/min/1.73m^{2}未満の患者には、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。［7.、8.1 参照］

9.2.3 軽度の腎機能障害患者

［8.1 参照］

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

肝臓における乳酸の代謝能が低下し、乳酸アシドーシスの発現リスクが高くなる可能性がある。［1.1、1.2、9.8、11.1.1 参照］

9.3.1 重度の肝機能障害患者

投与しないこと。［2.1 参照］

9.3.2 軽度～中等度の肝機能障害患者

［8.1 参照］

(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。動物実験（ラット、ウサギ）で胎児への移行が認められており、一部の動物実験（ラット）で催奇形作用が報告されている。また、妊婦は乳酸アシドーシスを起こしやすい。［2.5、11.1.1 参照］

(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有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

高齢者では、腎機能、肝機能等が低下していることが多く、また脱水症状を起こしやすい。これらの状態では乳酸アシドーシスを起こしやすいので、以下の点に注意すること。[1.2、8.1、9.2、9.3、11.1.1 参照]

・本剤の投与開始前、投与中は定期的に、特に慎重な経過観察が必要な場合にはより頻回に腎機能や肝機能を確認するなど十分に観察しながら慎重に投与すること。メトホルミンはほとんど代謝されず、未変化体のまま尿中に排泄される。また、肝機能の低下により乳酸の代謝能が低下する。

・腎機能や脱水症状等患者の状態に十分注意して投与の中止や減量を検討すること。特に 75 歳以上の高齢者では、乳酸アシドーシスが多く報告されており、予後も不良であることが多いため、本剤投与の適否をより慎重に判断すること。

・血清クレアチニン値が正常範囲内であっても、年齢によっては実際の腎機能が低下していることがあるので、eGFR 等も考慮して、慎重に患者の状態を観察すること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

10. 相互作用

10.1 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アルコール（過度の摂取） [2.1、8.1、11.1.1 参照]	乳酸アシドーシスを起こすことがある。本剤投与中は過度のアルコール摂取（飲酒）を避けること。	肝臓における乳酸の代謝能が低下する。また、脱水状態を来すことがある。

(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
(1)	ヨード造影剤 [8.1、11.1.1 参照]	乳酸アシドーシスを起こすことがある。ヨード造影剤を用いて検査を行う場合には、本剤の投与を一時的に中止すること。	腎機能が低下し、本剤の排泄が低下することが考えられている。
	腎毒性の強い抗生物質 ゲンタマイシン等 [11.1.1 参照]	乳酸アシドーシスを起こすことがある。本剤の投与を一時的に減量・中止するなど適切な処置を行うこと。	
	利尿作用を有する薬剤 利尿剤 SGLT2 阻害剤等 [8.1、11.1.1 参照]	脱水により乳酸アシドーシスを起こすことがある。脱水症状があらわれた場合には、本剤の投与を中止し、適切な処置を行うこと。	利尿作用を有する薬剤により、体液量が減少し脱水状態になることがある。

	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
（2）血糖降下作用を増強する薬剤			
	糖尿病用薬 インスリン製剤 スルホニルウレア剤 速効型インスリン分泌促進薬 α-グルコシダーゼ阻害剤 チアゾリジン系薬剤 DPP-4 阻害剤 GLP-1 受容体作動薬 SGLT2 阻害剤 イメグリミン塩酸塩等 ［11.1.2 参照］	低血糖が起こることがある。 スルホニルウレア剤併用時に低血糖のリスクが増加するおそれがある。患者の状態を十分観察しながら投与すること。	血糖降下作用の増強
	たん白同化ホルモン剤		機序不明
	サリチル酸剤 アスピリン等		サリチル酸剤の血糖降下作用が考えられている。
	β-遮断剤 プロプラノロール等		β遮断作用によりアドレナリンを介した低血糖からの回復を遅らせることが考えられている。
	モノアミン酸化酵素阻害剤		モノアミン酸化酵素阻害剤によるインスリン分泌促進、糖新生抑制が考えられている。
（3）血糖降下作用を減弱する薬剤			
	アドレナリン	血糖降下作用が減弱することがある。 患者の状態を十分観察しながら投与すること。	アドレナリンによる末梢での糖利用抑制、肝での糖新生促進、インスリン分泌抑制が考えられている。
	副腎皮質ホルモン		副腎皮質ホルモンによる肝での糖新生促進等が考えられている。
	甲状腺ホルモン		甲状腺ホルモンは糖代謝全般に作用し血糖値を変動させると考えられている。
	卵胞ホルモン		卵胞ホルモンには耐糖能を変化させ、血糖を上昇させる作用が認められている。

	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
	利尿剤	血糖降下作用が減弱することがある。 患者の状態を十分観察しながら投与すること。	利尿剤によるカリウム喪失によりインスリン分泌の低下が考えられている。
	ピラジナミド		機序不明
	イソニアジド		イソニアジドによる炭水化物代謝阻害が考えられている。
	ニコチン酸		ニコチン酸による血糖上昇作用が考えられている。
	フェノチアジン系薬剤		フェノチアジン系薬剤によるインスリン分泌抑制、副腎からのアドレナリン遊離が考えられている。
(4) その他			
	OCT2、MATE1、又はMATE2-K を阻害する薬剤 シメチジン ドルテグラビル ビクテグラビル バンデタニブ イサブコナゾニウム硫酸塩 ピミテスピブ等 ［16.7 参照］	本剤の血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。観察を十分に行い、必要に応じて本剤を減量するなど慎重に投与すること。	OCT2、MATE1、又はMATE2-K を介した本剤の腎排泄が阻害されると考えられている。
	イメグリミン塩酸塩 ［8.5 参照］	消化器症状の発現に注意すること。	特に併用初期に多く発現する傾向が認められている。

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 乳酸アシドーシス（頻度不明）

乳酸アシドーシス（血中乳酸値の上昇、乳酸/ピルビン酸比の上昇、血液 pH の低下等を示す）は予後不良のことが多い。一般的に発現する臨床症状は様々であるが、胃腸症状、倦怠感、筋肉痛、過呼吸等の症状がみられることが多く、これらの症状があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、必要な検査を行うこと。なお、乳酸アシドーシスの疑いが大きい場合には、乳酸の測定結果等を待つことなく適切な処置を行うこと。［1.1、1.2、2.1、2.3、7.、8.1、9.1.2、9.2、9.3、9.5、9.8、10.1、10.2、13.1 参照］

11.1.2 **低血糖**（頻度不明）

低血糖症状（初期症状：脱力感、高度の空腹感、発汗等）が認められた場合には、糖質を含む食品を摂取するなど適切な処置を行うこと。ただし、α-グルコシダーゼ阻害剤（アカルボース、ボグリボース、ミグリトール）との併用により低血糖症状が認められた場合にはブドウ糖を投与すること。［2.4、8.2、8.3、9.1.1、10.2 参照］

11.1.3 **肝機能障害、黄疸**（頻度不明）

AST、ALT、Al-P、γ-GTP、ビリルビンの著しい上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

11.1.4 **横紋筋融解症**（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがある。

（2）**その他の副作用**

11.2 **その他の副作用**

	5%以上	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器[注1)]	下痢	食欲不振、腹痛、悪心、嘔吐、腹部膨満感、便秘	消化不良	胃炎、胃腸障害、放屁増加
血液				貧血、白血球減少、血小板減少、白血球増加、好酸球増加
過敏症		発疹		そう痒
肝臓				肝機能異常
腎臓				BUN 上昇、クレアチニン上昇
代謝異常				CK 上昇、ケトーシス、乳酸上昇、血中カリウム上昇、血中尿酸増加
その他		全身倦怠感[注1)]、頭痛、頭重	眠気	筋肉痛[注1)]、めまい・ふらつき、味覚異常、浮腫、動悸、発汗、脱力感、空腹感、ビタミン B_{12} 減少[注2)]

注 1）乳酸アシドーシスの初期症状であることもあるので注意すること。

注 2）長期使用によりビタミン B_{12} の吸収不良があらわれることがある。

注）発現頻度は使用成績調査を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. **過量投与**

13.1 **症状**

乳酸アシドーシスが起こることがある。［11.1.1 参照］

13.2 **処置**

アシドーシスの補正（炭酸水素ナトリウム静注等）、輸液（強制利尿）、血液透析等の適切な処置を行う。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

本剤とオルメサルタン　メドキソミル製剤等との一包化は避けること。一包化して高温高湿度条件下にて保存した場合、本剤が変色することがある。

14.2 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。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

インスリン又は経口血糖降下剤の投与中にアンジオテンシン変換酵素阻害剤を投与することにより、低血糖が起こりやすいとの報告がある。

(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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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（注意－医師等の処方箋により使用すること）
有効成分：劇薬

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

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り
くすりのしおり：有り
その他の患者向け資材：有り（「ⅩⅢ.－2. その他の関連資料」の項参照）

6. 同一成分・同効薬

同一成分：グリコラン錠 250mg、メトグルコ錠 250mg/500mg
同 効 薬：ブホルミン塩酸塩

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

販売名	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 メトリオン錠 250	2005 年 3 月 9 日	21700AMY00095000	2005 年 7 月 8 日	2005 年 7 月
販売名変更 メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」	2013 年 12 月 27 日 （代替新規承認）	22500AMX01979000	2014 年 6 月 20 日	2014 年 6 月 20 日

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

効能・効果及び用法・用量追加（一部変更承認年月日：2009 年 11 月 24 日）

改訂内容［下線部：追加改訂箇所］

改訂後	改訂前
【効能・効果】 2 型糖尿病 ただし、下記のいずれかの治療で十分な効果が得られない場合に限る。 （1）食事療法・運動療法のみ （2）食事療法・運動療法に加えてスルホニルウレア剤を使用	**【効能・効果】** インスリン非依存型糖尿病 （ただし、SU 剤が効果不十分な場合あるいは副作用等により使用不適当な場合に限る。）
【用法・用量】 通常、成人にはメトホルミン塩酸塩として 1 日量 500mg より開始し、1 日 2～3 回食後に分割経口投与する。維持量は効果を観察しながら決めるが、1 日最高投与量は 750mg とする。	**【用法・用量】** 本剤は SU 剤が効果不十分な場合あるいは副作用等により使用不適当な場合にのみ使用すること。 通常、塩酸メトホルミンとして 1 日量 500mg より開始し、1 日 2～3 回食後に分割経口投与する。維持量は効果を観察しながら決めるが、1 日最高投与量は 750mg とする。

10. 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

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

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 番号	レセプト電算処理システム用コード
3962002F1110	3962002F1110	116760303	621676001

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

ＸＩ．文献

1. 引用文献

1. Lee AJ. Pharmacotherapy. 1996；16（3）：327-351（PMID：8726592）
2. 第十八改正日本薬局方解説書
3. 社内資料：安定性に関する資料
4. 社内資料：安定性に関する資料（長期保存試験）
5. 社内資料：溶出比較による生物学的同等性に関する資料
6. 社内資料：溶出性に関する資料（公的）
7. Proske G, et al. Arzneimittel-Forsch. 1962；12（3）：314-318（PMID：14038507）
8. Opitz K, et al. Deut Med Wochenschr. 1962；87（2）：105-106（PMID：14482118）
9. 小澤　光, 他. 日薬理誌. 1971；67（2）：12-13
10. Kroneberg G, et al. Arzneimittel-Forsch. 1958；8（7a）：470-475（PMID：13572273）
11. 社内資料：生物学的同等性に関する資料
12. Song IH, et al. J Acquir Immune Defic Syndr. 2016；72（4）：400-407（PMID：26974526）
13. Johansson S, et al. Clin Pharmacokinet. 2014；53（9）：837-847（PMID：25117183）
14. Sambol NC, et al. J Clin Pharmacol. 1995；35（11）：1094-1102（PMID：8626883）
15. Dubourg J, et al. Diabetes Obes Metab. 2022；24（4）：609-619（PMID：34866306）
16. 社内資料：粉砕後の安定性に関する資料
17. 社内資料：簡易懸濁法に関する資料

2. その他の参考文献

該当資料なし

ⅩⅡ. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

海外で発売されていない（2023 年 11 月時点）

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

（「Ⅷ.－6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

	Drug Name	Category
オーストラリアの分類	metformin	C

（2023 年 11 月検索）

参考：分類の概要

オーストラリアの分類（An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy）

Category C：

Drugs which, owing to their pharmacological effects, have caused or may be suspected of causing, harmful effects on the human fetus or neonate without causing malformations. These effects may be reversible. Accompanying texts should be consulted for further details.

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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

掲載根拠：「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する Q&A について（その 3)」（令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

(1) 粉砕

粉砕後の安定性に関する試験 [16]

【試験製剤】

メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」: PTP シートから取り出し、粉砕したもの

【保存条件及び保存期間】

条件	内容
1	温度に対する安定性（40±2℃、遮光・気密容器（瓶)） 保存期間：開始時、1、2 及び 3 ヵ月
2	湿度に対する安定性（75±5%RH／25℃、遮光・開放容器） 保存期間：開始時、1、2 及び 3 ヵ月
3	光に対する安定性（曝光量 120 万 lx・hr、透明・気密容器） 保存期間：曝光量 60 万 lx・hr 及び 120 万 lx・hr

【試験項目】

1.性状

2.定量試験

【試験結果】

試験結果を表 1～3 に示した。

表 1　条件 1 における試験結果

試験項目 / 保存期間	性状	定量試験（%）
開始時	白色の粉末であった	100.3
1 ヵ月	変化無し	100.9
2 ヵ月	変化無し	96.9
3 ヵ月	変化無し	99.9

表 2　条件 2 における試験結果

試験項目 保存期間	性状	定量試験（%）
開始時	白色の粉末であった	100.3
1 ヵ月	変化無し	100.7
2 ヵ月	変化無し	96.9
3 ヵ月	変化無し	99.5

表 3　条件 3 における試験結果

試験項目 保存期間	性状	定量試験（%）
開始時	白色の粉末であった	100.3
60 万 lx・hr	変化無し	99.5
120 万 lx・hr	変化無し	98.4

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

簡易懸濁法に関する試験 [17]

【試験製剤】

メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」

【試験方法】

崩壊懸濁試験：ディスペンサー内に 1 錠を入れ、55℃の温湯 20mL を吸い取り、5 分間放置した。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認した。5 分後に崩壊しない場合、更に 5 分放置後、同様の操作を行った。

通過性試験：崩壊懸濁試験で得られた懸濁液の入ったディスペンサーに経管栄養チューブを装着し、経管栄養チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブのサイズによる通過性を観察した。

【試験結果】

崩壊懸濁試験の結果を表 1 に、通過性試験の結果を表 2 に示した。

表 1　崩壊懸濁試験結果

製品名	崩壊・懸濁の状況
メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」	5 分以内に崩壊・懸濁した。

表 2　通過性試験結果

製品名	チューブの最小通過サイズ
メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」	8Fr.チューブを通過した。

【備考】

本製剤はマクロゴール 6000 を含有するため、高温度ではチューブへ通す前に固まる恐れがある。そのため、本製剤につき簡易懸濁法を適用する場合には、55℃より若干温度が下がった時点で崩壊させることが望ましいと考える。

2. その他の関連資料

患者向け資材

メトホルミン塩酸塩錠 250mg「SN」を服用される患者さんへ

メトホルミン塩酸塩錠250mg「SN」を服用される患者さんへ

このお薬は血糖(血液中の糖分)を下げる糖尿病の治療薬です。
お飲みになる前に必ずお読みください。

お薬の服用方法

- ●食後に服用してください。
- ●飲み忘れた時は、次の服用の時間に1回分を飲んでください。絶対に２回分を一度に飲んではいけません。
- ●食事をとれなかった場合の服用方法については、主治医または薬剤師に相談してください。

服用を始めてからしばらくの間は消化器症状(嘔吐、下痢、便秘等)がみられることがありますが、服用を続けるうちに徐々におさまります。少し様子をみて、おさまらないようであれば主治医または薬剤師に相談してください。
また、低血糖症状や、まれに乳酸アシドーシスを起こすことがあります。

中面もご覧ください