

脳循環・代謝改善剤

処方箋医薬品\*

日本薬局方 ニセルゴリン散

\*ニセルゴリン細粒1%「サワイ」

日本薬局方 ニセルゴリン錠

\*ニセルゴリン錠5mg「サワイ」

NICERGOLINE

日本標準商品分類番号
8 7 2 1 9

貯法
細粒1%：遮光室温保存 開封後は湿気を避けて保存すること
錠5mg：室温保存
使用期限：外箱等に表示

	細粒1%	錠5mg
*承認番号	22400AMX00139000	22400AMX00140000
薬価収載	2012年12月	2012年12月
販売開始	2000年7月	2000年7月

※注意-医師等の処方箋により使用すること

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

頭蓋内出血後、止血が完成していないと考えられる患者〔出血を助長するおそれがある。〕

【組成・性状】

・組成


ニセルゴリン細粒1%「サワイ」：1g中に日局ニセルゴリン10mgを含有する。

添加物として、軽質無水ケイ酸、トレハロース、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

ニセルゴリン錠5mg「サワイ」：1錠中に日局ニセルゴリン5mgを含有する。

添加物として、カルナウバロウ、酸化チタン、ステアリン酸Ca、タルク、トレハロース、白糖、ヒプロメロース、マクロゴール6000を含有する。

・製剤の性状

品名	剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
ニセルゴリン細粒1%「サワイ」	コーティング細粒	〔識別コード：SW-529〕 (分包に表示)	白色
ニセルゴリン錠5mg「サワイ」	フィルムコーティング錠	 6.1 約105 3.7 〔識別コード：SW 528〕	白色～ 帯黄白色

【効能・効果】

脳梗塞後遺症に伴う慢性脳循環障害による意欲低下の改善

【用法・用量】

ニセルゴリンとして、通常成人1日量15mgを3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。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤の投与期間は、臨床効果及び副作用の程度を考慮しながら慎重に決定するが、投与12週で効果が認められない場合には投与を中止すること。

【使用上の注意】

1. 副作用

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。

副作用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。

	頻度不明
消化器	食欲不振、下痢、便秘、悪心、腹痛、口渇
肝臓	肝機能障害
循環器	めまい、立ちくらみ、動悸、ほてり
精神神経系	眠気、倦怠感、頭痛、耳鳴、不眠
過敏症	発疹、蕁麻疹、痒痒

2. 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減量するなど注意すること。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、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。

〔動物実験(ラット)で次世代の発育抑制が報告されている。〕

2) 授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。〔動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。〕

4. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

5. 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)

【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

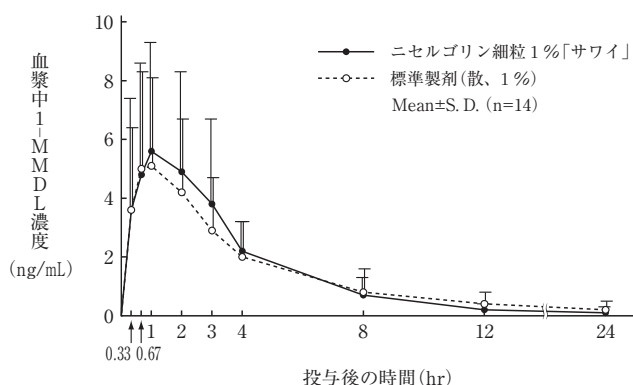
○ニセルゴリン細粒1%「サワイ」

ニセルゴリン細粒1%「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1.5g(ニセルゴリンとして15mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、ニセルゴリンの代謝物である1-MMDLの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C<sub>max</sub>)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

各製剤1.5g投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> (ng·hr/mL)
ニセルゴリン細粒1%「サワイ」	6.1±4.0	1.1±0.9	4.8±5.0	25.7±15.3
標準製剤(散、1%)	5.9±3.0	0.9±0.5	5.5±5.7	25.8±15.5

(Mean ± S. D.)



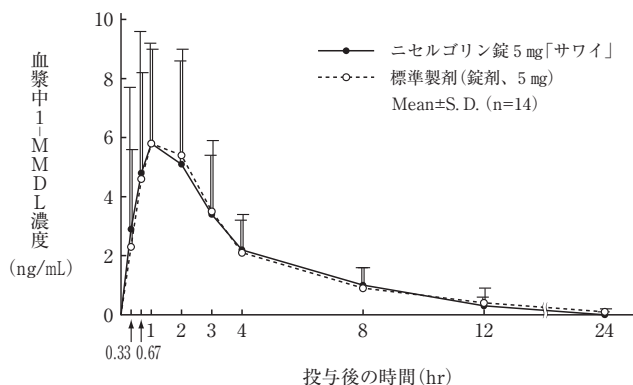
○ニセルゴリン錠5mg「サワイ」

ニセルゴリン錠5mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ3錠(ニセルゴリンとして15mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、ニセルゴリンの代謝物である1-MMDLの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C<sub>max</sub>)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>2)</sup>

各製剤3錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> (ng·hr/mL)
ニセルゴリン錠5mg「サワイ」	6.8±4.6	1.1±0.5	3.2±1.1	26.7±15.6
標準製剤(錠剤、5mg)	6.6±3.5	1.1±0.5	3.3±1.7	27.0±17.7

(Mean ± S. D.)



血漿中濃度ならびにAUC、C<sub>max</sub>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。

2. 溶出挙動

細粒1%は日本薬局方に、錠5mgは日本薬局方外医薬品規格第3部に、それぞれ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。

【薬効薬理】

1. α<sub>1</sub>受容体遮断作用、血管平滑筋の直接弛緩作用による脳血管の選択的拡張作用を示す。
2. 抗血小板作用、赤血球変形能改善作用による微小循環改善作用を示す。
3. 脳酸素・グルコース代謝を改善、ATPの生成を増加させることによりエネルギー代謝障害を改善する。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ニセルゴリン(Nicergoline)

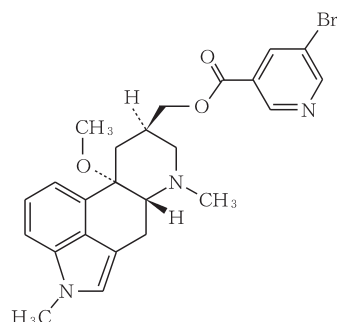
化学名：[(8R,10S)-10-Methoxy-1,6-dimethylergolin-8-y]methyl 5-bromopyridine-3-carboxylate

分子式：C<sub>24</sub>H<sub>26</sub>BrN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>

分子量：484.39

融点：約136℃(分解)

構造式：



性状：ニセルゴリンは白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。アセトニトリル、エタノール(99.5)又は無水酢酸にやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。光によって徐々に淡褐色となる。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

細粒1%：分包包装(分包をアルミピロー包装(乾燥剤入り))及びバラ包装(ポリエチレン瓶(乾燥剤入り))したものを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、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。<sup>3)</sup>

錠5mg：PTP包装(PTPシートをアルミピロー包装)及びバラ包装(アルミ袋)したものを用いた長期保存試験(25℃60%RH、3年間)の結果、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。<sup>4)</sup>

\*\*【包装】

ニセルゴリン細粒1%「サワイ」：

600包(1包0.5g)、100g(バラ)

ニセルゴリン錠5mg「サワイ」：

PTP：100錠(10錠×10)、1,000錠(10錠×100)

バラ：1,000錠

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

- 1)、2) 沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]
- 3)、4) 沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元

沢井製薬株式会社

大阪市淀川区宮原5丁目2-30