

脳循環・代謝改善剤

処方せん医薬品 (注意—医師等の
処方せんにより使用すること)

日本薬局方 ニセルゴリン錠

J・P Nicergoline Tablets

貯 法：気密容器、室温保存
使用期限：3年 (容器又は外箱に記載)

** ニセルゴリン錠5mg「日新」

** 承認番号	22500AMX01173000
** 薬価収載	2013年12月
** 販売開始	

【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】

ニセルゴリン錠5mg「日新」は、1錠中に日本薬局方ニセルゴリン5mg、添加物として、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、エチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン及びカルナウバロウを含有する、白色のフィルムコーティング錠である。

識別コード (表/裏)	大 き さ	外 形		
		表面	裏面	側面
NS/5	錠径 6.1mm 錠厚 2.5mm 重量 76mg	○NS	○5	○

【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、そう痒

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、更には穿孔を起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)。

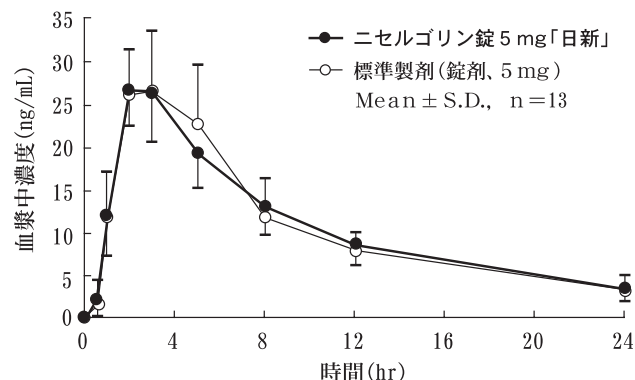
【薬物動態】

** 1. 生物学的同等性試験¹⁾

ニセルゴリン錠5mg「日新」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ4錠 (ニセルゴリンとして20mg) 健康成人男子に絶食時単回経口投与して血漿中主代謝物 (MDL) 濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC, Cmax) について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ニセルゴリン錠 5mg「日新」	261.70±50.89	28.51±4.56	2.46±0.52	7.39±1.55
標準製剤 (錠剤, 5mg)	248.85±46.57	28.63±5.40	2.46±0.52	7.27±1.64

(Mean±S. D., n=13)



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。

** 2. 溶出挙動¹⁾

ニセルゴリン錠5mg「日新」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたニセルゴリン錠の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】²⁾

ニセルゴリンはエステル型麦角アルカロイド誘導体であり、脳血管障害患者における内頸動脈及び椎骨動脈の血流量増加作用及び虚血病巣部の血流増加作用が認められている。臨床あるいは実験動物において、脳循環改善作用、血管流動性改善作用、脳内アセチルコリン系の賦活作用、脳エネルギー代謝改善作用、脳神経機能改善作用などを示し、これらの作用に基づいて脳梗塞後遺症、脳出血後遺症による意欲低下、情緒障害を改善すると考えられる。

【有効成分に関する理化学的知見】

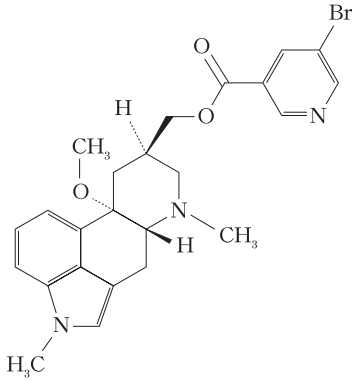
一般名：ニセルゴリン (Nicergoline)

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

分子式：C₂₄H₂₆BrN₃O₃

分子量：484.39

構造式：



性状：本品は白色～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。
本品は光によって徐々に淡褐色となる。

融点：約136℃ (分解)

【取扱い上の注意】

**安定性試験³⁾

ニセルゴリン錠 5 mg「日新」は、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、室温保存において3年間安定であることが推測された。

**【包装】

ニセルゴリン錠 5 mg「日新」 (PTP包装) 100錠 1000錠
(バラ包装) 1000錠

【主要文献】

- 1) 日新製薬株式会社 社内資料：生物学的同等性に関する資料
- 2) 第十五改正日本薬局方解説書
- 3) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

日新製薬株式会社 安全管理部

〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号

TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419

E-mail : d-info@yg-nissin.co.jp

製造販売元

 **日新製薬株式会社**

山形県天童市清池東二丁目3番1号