

貯法：室温保存
有効期間：3年処方箋医薬品[※]

脳循環・代謝改善剤

日本薬局方 ニセルゴリン錠

ニセルゴリン錠5mg「サワイ」

日本薬局方 ニセルゴリン散

ニセルゴリン細粒1%「サワイ」

NICERGOLINE Tablets, Fine Granules [SAWAI]

注)注意—医師等の処方箋により使用すること

	錠5mg	細粒1%
承認番号	22400AMX00140000	22400AMX00139000
販売開始	2000年7月	2000年7月

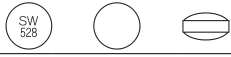
2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

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。]

3. 組成・性状**3.1 組成**

品名	ニセルゴリン錠5mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局ニセルゴリン 5mg
添加剤	カルナウパロウ、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
品名	ニセルゴリン細粒1%「サワイ」
有効成分 [1g中]	日局ニセルゴリン 10mg
添加剤	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

3.2 製剤の性状

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

4. 効能又は効果

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

6. 用法及び用量

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。

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 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。

7.2 成人1日量の剤形換算は、以下のとおりである。

	成人1日量(15mg)
ニセルゴリン錠5mg「サワイ」	3錠
ニセルゴリン細粒1%「サワイ」	1.5g

9. 特定の背景を有する患者に関する注意**9.5 妊婦**

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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)で胎児及び出生児の発育抑制が報告されている。

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。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。

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。

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。

11.2 その他の副作用

	0.1～1%未満	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、そう痒	蕁麻疹

14. 適用上の注意**14.1 薬剤交付時の注意****(錠)**

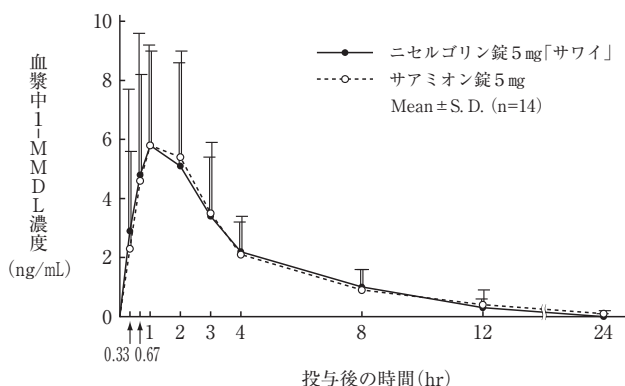
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

16. 薬物動態**16.1 血中濃度****16.1.1 生物学的同等性試験****(ニセルゴリン錠5mg「サワイ」)**ニセルゴリン錠5mg「サワイ」とサアミオン錠5mg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、Cmax)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¹⁾。

各製剤3錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (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
サアミオン錠5mg	6.6±3.5	1.1±0.5	3.3±1.7	27.0±17.7

(Mean ± S. D.)

**(ニセルゴリン細粒1%「サワイ」)**

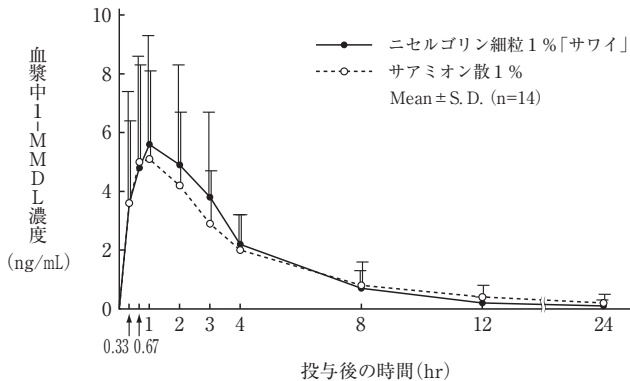
ニセルゴリン細粒1%「サワイ」とサアミオン散1%を健康成人男子にそれぞれ1.5g(ニセルゴリンとして15mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、ニセルゴリンの代謝物である1-MMDLの血漿中濃度を測定

した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)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²⁾。

各製剤1.5g投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (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
サアミオン散1%	5.9±3.0	0.9±0.5	5.5±5.7	25.8±15.5

(Mean±S. D.)



血漿中濃度ならびに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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

脳血管を拡張し脳血流を増加させると共に、血小板凝集抑制作用、赤血球変形能改善作用及びPAF産生能抑制作用等により血液流動性を改善し脳循環を改善する。また、脳内の神経伝達機能を促進し、脳虚血時のグルコース、ATP及びビルビン酸等の各種脳エネルギー関連物質の代謝改善作用により脳代謝を改善する³⁾⁻⁷⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：ニセルゴリン(Nicergoline)

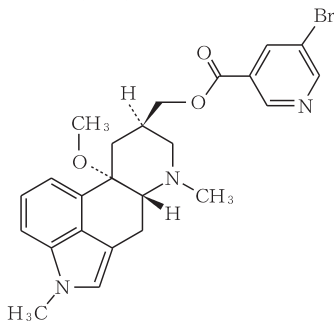
化学名：[(8*R*, 10*S*)-10-Methoxy-1,6-dimethylergolin-8-yl]methyl 5-bromopyridine-3-carboxylate

分子式：C₂₄H₂₆BrN₃O₃

分子量：484.39

融点：約136℃(分解)

構造式：



性状：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。

20. 取扱い上の注意

〈細粒〉

容器開封後は遮光し湿気を避けて保存すること。

22. 包装

〈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

〈ニセルゴリン細粒1%「サワイ」〉

バラ〔乾燥剤入り〕：100g

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験(錠5mg)
- 社内資料：生物学的同等性試験(細粒1%)
- 葛谷文男他：薬理と治療, 1983; 11(9)：3627-3635
- Matsuoka, Y. et al. : Basic, Clinical, and Therapeutic Aspects of Alzheimer's and Parkinson's Diseases, 1990 : Vol.2 : 415-419
- 新富敬一他：日薬理誌, 1986; 87(4)：427-434
- Nagakawa, Y. et al. : Arzneimittelforschung, 1990; 40(8)：862-864
- 仲村恒敬他：医学のあゆみ, 1990; 154(7)：447-448

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

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 : 06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 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