

貯 法：室温保存

有効期間：3年

脳循環・代謝改善剤

日本標準商品分類番号

87219

日本薬局方 ニセルゴリン錠

処方箋医薬品^注ニセルゴリン錠5mg「NP」
NICERGOLINE Tablets “NP”

承認番号 22500AMX00777

販売開始 2000年4月

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

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

販売名	有効成分	添加剤
ニセルゴリン錠5mg「NP」	1錠中 日本薬局方 ニセルゴリン 5mg	結晶セルロース、無水乳糖、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、カルナウバロウ

3.2 製剤の性状

販売名	性状	外形・大きさ		
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
ニセルゴリン錠5mg「NP」	白色のフィルムコーティング錠			
		110	HD	
		5.6	3.4	81
		HD-110		

4. 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

6. 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。

7. 用法・用量に関連する注意

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。

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

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

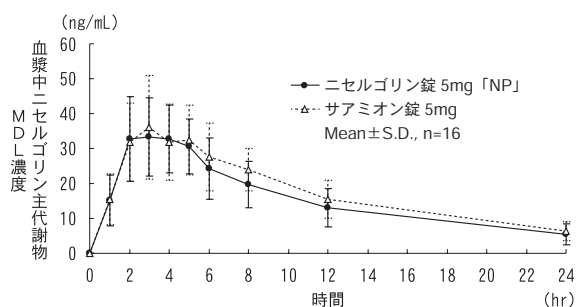
ニセルゴリン錠5mg「NP」とサアミオン錠5mgのそれぞれ8錠（ニセルゴリンとして40mg^注）を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に単回経口投与して血漿中ニセルゴリン主代謝物MDL濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（ $AUC_{0\rightarrow 24hr}$ 、 C_{max} ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、両剤は生物学的に同等と判断された¹⁾。

注) ニセルゴリン40mgの単回経口投与は承認外用量である。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\rightarrow 24hr}$ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ニセルゴリン錠5mg「NP」	377.22±85.16	38.0±8.0	3.31±1.01	9.70±4.52
サアミオン錠5mg	422.25±94.57	40.6±11.2	3.44±0.81	8.71±2.85

(Mean ± S.D., n=16)



血漿中ニセルゴリン主代謝物 MDL 濃度推移

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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

脳血管を選択的に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、脳内アセチルコリン系及びドーパミン系の神経伝達機能を促進し、脳虚血時のグルコース、ATP 及びピ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^{2)・3)}。

19. 有効成分に関する理化学的知見

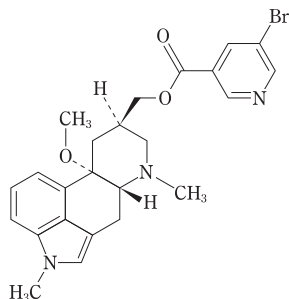
一般名：ニセルゴリン (Nicergoline)

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

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。
 ・融点：約 136°C (分解)。

22. 包装

- 100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]
 500 錠 [瓶、バラ、乾燥剤入り]
 1000 錠 [10 錠 (PTP) × 100]

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験
- 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
- Moretti A, et al. : Proof of Therapeutical Effectiveness of Nootropic and Vasoactive Drugs. 1985；103-110
- 新富敬一，他：日薬理誌. 1986；87(4)：427-434

- Moretti A. : Arzneimittelforschung. 1979；29(8a)：1213-1223
- 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

株式会社三和化学研究所 コンタクトセンター
 〒461-8631 名古屋市東区東外堀町 35 番地
 TEL 0120-19-8130
 FAX 052-950-1305

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



NIPRO

ニプロ株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号

26.2 販売元



株式会社 三和化学研究所

SKK 名古屋市東区東外堀町35番地 〒461-8631