

※※印：2009年 6月改訂(第8版、指定医薬品の廃止に伴う改訂)
 ※印：2008年12月改訂

日本標準商品分類番号
87219

貯 法：室温保存
 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。
 取扱い上の注意：「取扱い上の注意」の項参照
 ※※ 規制区分：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)

※ 承認番号	21900AMX01159000
※ 薬価収載	2008年12月
販売開始	2000年 7月

日本薬局方

ニセルゴリン錠

脳循環・代謝改善剤

※ ニセルゴリン錠5mg「タイヨー」

NICERGOLINE

【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	1錠中：ニセルゴリン……………5mg (添加物) 酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、炭酸マグネシウム、乳糖水和物、ヒプロメロース、部分アルファー化デンプン、マクロゴール6000		
性 状	白色のフィルムコーティング錠		
識別コード (PTP)	NC 5mg		
外 形 (サイズ)	表(直径mm)	裏(重量mg)	断面(厚さmm)
	NC 6.2	95	3.1

【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(本剤3錠)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まわ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)。

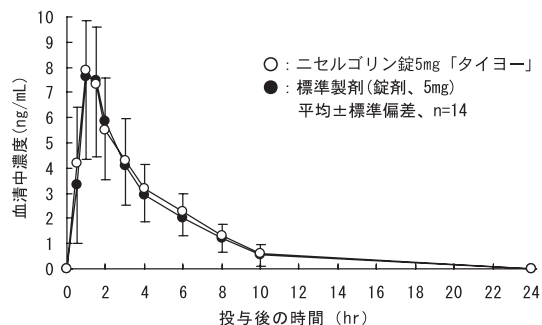
5 適用上の注意

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¹⁾

ニセルゴリン錠5mg「タイヨー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ3錠(ニセルゴリンとして15mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中活性代謝物(10-メトキシ-1,6-ジメチルエルゴリン-8β-メタノール)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、両剤の生物学的同等性が確認された。
 (1回投与量：承認外用量)



薬物動態パラメータ

(平均±標準偏差、n=14)

	投与量 (mg)	AUC ₀₋₂₄ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ニセルゴリン錠5mg「タイヨー」	15	35.0±6.8	9.1±1.6	1.2±0.4	2.4±0.5
標準製剤(錠剤、5mg)	15	32.9±7.2	9.2±2.4	1.2±0.4	3.1±1.1

血清中濃度並びに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 溶出性²⁾

本剤の溶出性は、日本薬局方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。

【薬効薬理】³⁾

ニセルゴリンは、エステル型交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すことが報告されている。

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

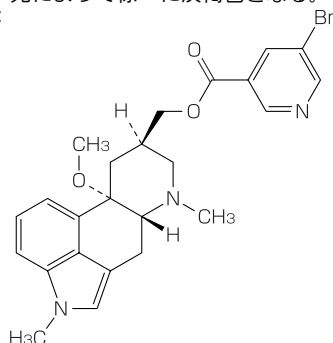
分子式：C₂₄H₂₆BrN₃O₃

分子量：484.39

融点：約136°C (分解)

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。

構造式：



【取扱い上の注意】⁴⁾

安定性試験結果の概要

最終包装製品を用いた加速試験(40°C、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ニセルゴリン錠5mg「タイヨー」は通常の市場流通下において安定であることが推測された。

【包装】

ニセルゴリン錠5mg「タイヨー」

PTP包装：100錠(10錠×10)、1,200錠(10錠×120)

バラ包装：1,200錠

【主要文献】

- 1) 大洋薬品工業株式会社資料(生物学的同等性試験)
- 2) 大洋薬品工業株式会社資料(溶出試験)
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書
- 4) 大洋薬品工業株式会社資料(安定性試験)

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。
大洋薬品工業株式会社 タイヨーDIセンター
〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
TEL 0120-080-601 FAX 052-459-2853

製造販売元



大洋薬品工業株式会社

名古屋市中村区太閤一丁目24番11号