

貯 法：室温保存

使用期限：製造後3年(外箱に表示の期限内に使用すること)

脳循環・代謝改善剤

処方箋医薬品^{注)}マリレオン[®]N錠5mg

日本薬局方 ニセルゴリン錠


承認番号	21900AMX00202
薬価収載	2007年6月
販売開始	2001年2月

MARILEON[®]N

【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】

販売名	マリレオン [®] N錠5mg
成分	日局ニセルゴリン
含量(1錠中)	5mg
添加物	乳糖水和物、D-マンニトール、部分アルファー化デンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロース、ステアリン酸カルシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、カルナウバロウ
色・剤形	白色のフィルムコーティング錠
外形	
大きさ(mm)	直径：6.1、厚さ：3.4
識別コード(PTP)	TYK252

【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

【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。

〈用法及び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。

種類	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】

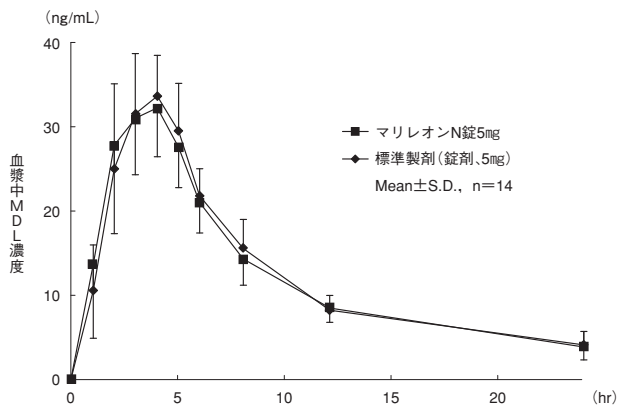
1. 生物学的同等性試験¹⁾

マリレオンN錠5mg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*)を健康成人男子に空腹時単回経口投与し、主代謝物である10-methoxy-6-methylergoline-8-β-methanol(MDL)の血漿中濃度を測定し、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。

*本剤の承認された1回用量は5mgである。

	AUC ₀₋₂₄ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
マリレオンN錠5mg	302.77 ± 46.14	36.46 ± 5.10	3.4 ± 1.1	9.14 ± 1.82
標準製剤(錠剤, 5mg)	304.57 ± 33.79	37.03 ± 5.01	3.5 ± 1.0	8.89 ± 1.73

(Mean ± S.D., n = 14)



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²⁾

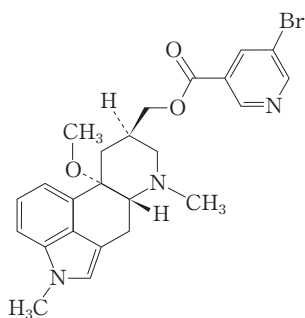
マリレオンN錠5mgは、日本薬局方医薬品各条に定められたニセルゴリン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】³⁾

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量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による意欲低下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 (JAN)
 化学名：[(8*R*, 10*S*)-10-Methoxy-1, 6-dimethylergolin-8-yl]methyl 5-bromopyridine-3-carboxylate
 構造式：



分子式：C₂₄H₂₆BrN₃O₃

分子量：484.39

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℃(分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験⁴⁾

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、マリレオンN錠5mgは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。

【包装】

マリレオンN錠5mg：100錠(PTP)

*【主要文献】

- 1) 武田テバ薬品株式会社：社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 武田テバ薬品株式会社：社内資料(溶出試験)
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書、廣川書店 2006；C-2945
- 4) 武田テバ薬品株式会社：社内資料(安定性試験)

【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。

大正富山医薬品株式会社 メディカルインフォメーションセンター
 〒170-8635 東京都豊島区高田3-25-1
 電話 0120-591-818