



日本標準商品分類番号
87219

貯法	錠5mg：室温保存 散1%：遮光保存、室温保存 開封後湿気を避けて保存のこと
使用期限	外箱、容器に使用期限を表示
規制区分	処方箋医薬品(注意-医師等の処方箋により使用すること)

	錠5mg	散1%
承認番号	21800AMX10273	21800AMX10272
薬価収載	2006年6月	
販売開始	1988年6月	1992年7月
再審査結果	1996年3月	
再評価結果	1998年6月	

脳循環・代謝改善剤

日本薬局方

**ニセルゴリン錠**  
**サアミオン<sup>®</sup>錠5mg**  
SERMION<sup>®</sup> Tablets 5mg

脳循環・代謝改善剤

日本薬局方

**ニセルゴリン散**  
**サアミオン<sup>®</sup>散1%**  
SERMION<sup>®</sup> Powder 1%

**【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	サアミオン錠5mg	サアミオン散1%
成分・含量	日局 ニセルゴリン	
	1錠中5mg	1g中10mg
添加物	ケイ酸アルミニウム、酢酸ビニル樹脂、酸化チタン、ステアリン酸カルシウム、タルク、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000、D-マンニトール	二酸化ケイ素、乳糖水和物、白糖
剤形	フィルムコーティング錠	散剤
色調	白色	
外形		
サイズ(mm)	直径：6.2 厚さ：3.0	
重さ(g)	0.085	
識別コード	TA129	TA504(分包包装コード)

**【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。

(参考：1日量剤形換算)

	成人1日量(15mg)
サアミオン錠5mg	3錠
サアミオン散1%	1.5g

**【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**

臨床試験(治験)：総症例1,017例中、副作用が報告されたのは28例(2.75%)で、主な副作用は食欲不振4例(0.39%)、下痢4例(0.39%)、便秘3例(0.29%)等であった。

使用成績調査(1988年6月～1994年3月)：総症例11,939例中、副作用が報告されたのは56例(0.47%)で、主な副作用は悪心9例(0.08%)、発疹7例(0.06%)、頭痛6例(0.05%)、AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇6例(0.05%)、食欲不振4例(0.03%)、便秘4例(0.03%)、腹痛4例(0.03%)等であった。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	0.1%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、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. 血中濃度

(参考)

外国人のデータでは健康成人にニセルゴリン15mgを経口投与した場合、吸収は速やかで、血漿中濃度(総放射活性)は投与2~4時間後に最高(57~96ng eq./mL)に達した。

### 2. 代謝・排泄

健康成人にサアミオン錠5mg8錠を経口投与したとき、大部分が代謝物として排泄され、24時間までの尿中排泄率は51%であった。<sup>1)</sup>

## 【臨床成績】

### 臨床効果

プラセボを対照薬とする二重盲検比較試験において、本剤の脳梗塞後遺症に伴う意欲低下及び精神症候全般改善度に有意差が認められた。

評価項目	薬剤群	改善以上(%)	検 定
精神症候 全般改善度	サアミオン	30/87 (34.5)	} P=0.000
	プラセボ	12/89 (13.5)	
意欲低下 全般改善度	サアミオン	26/87 (29.9)	} P=0.003
	プラセボ	8/85 ( 9.4)	

## 【薬効薬理】

### 1. 脳循環改善作用

・脳血管障害患者において、内頸及び椎骨動脈の血流量増加<sup>2,3)</sup>が、また、虚血病巣部での脳血流増加<sup>4)</sup>が認められている。

・ネコの内頸動脈血流量を用量依存的に増加させる。<sup>5)</sup>

### 2. 血液流動性改善作用

・健康成人<sup>6)</sup>及び脳血管障害患者<sup>7)</sup>において、ADP、コラーゲン等による血小板凝集抑制作用及び赤血球変形能亢進作用が認められている。

### 3. 神経伝達系に対する作用

・ラットにおいて、加齢により低下した脳内コリンアセチルトランスフェラーゼ(CAT)活性及びムスカリン性アセチルコリン受容体の結合能を大脳皮質及び海馬において回復させる。<sup>8)</sup>

・ラットにおいて、加齢により低下した海馬のアセチルコリン遊離を回復させる。<sup>9)</sup>

・アセチルコリンエステラーゼ(AChE)に選択的なコリンエステラーゼ阻害活性を有し、マウスにおいて、脳内AChE活性阻害と海馬アセチルコリン量の増加作用を示す。<sup>10)</sup>

・ラットにおいて、連続経口投与によりドーパミンの代謝回転の促進作用が認められている。<sup>11)</sup>

### 4. 脳エネルギー代謝改善作用

・マウスの脳虚血モデル<sup>12)</sup>及び低酸素モデル<sup>13)</sup>において、脳エネルギー代謝障害に対し改善作用を示す。

・成熟及び老齢ラットの脳梗塞モデル<sup>14)</sup>において、グルコースの取込み及び消費に対し改善作用を示す。

### 5. 脳神経機能改善作用

・マウスの脳虚血モデル<sup>12)</sup>及び低酸素モデル<sup>13)</sup>において、脳障害に対し保護作用を示す。

・ラット海馬CA1領域神経細胞において、低閾値(T-type)カルシウムチャンネル遮断作用を示す。<sup>15)</sup>

・スナネズミの一過性脳虚血モデルにおいて、海馬CA1領域神経細胞の遅発性壊死を抑制する。<sup>16)</sup>

・老齢ラットの脳梗塞モデル<sup>14)</sup>及びマウスのスコポラミンによる健忘症モデル<sup>17)</sup>において、学習・記憶障害に対し改善作用を示す。

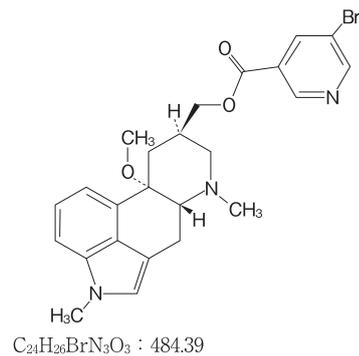
### 6. 脳波改善作用

・脳血管障害患者において、脳波異常の改善が認められている。<sup>7)</sup>

## 【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



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)。

## \*\*【包装】

サアミオン錠5mg： 100錠(10錠×10)、  
500錠(10錠×50)、  
1,000錠(10錠×100)、  
500錠(バラ)

サアミオン散1%： 300g(0.5g×600包)、  
100g

## 【主要文献】

- 1) 河合喜孝 他：基礎と臨床 1986；20(2)：1054-1064
- 2) 宮崎 学：薬理と治療 1984；12(1)：401-407
- 3) 宮崎 学：薬理と治療 1985；13(11)：6817-6821
- 4) 谷本道則 他：薬理と治療 1985；13(4)：2075-2084
- 5) 新富敬一 他：日薬理誌 1986；87：537-549
- 6) 葛谷文男 他：薬理と治療 1983；11(9)：3627-3635
- 7) 浮田義一郎 他：薬理と治療 1985；13(4)：2085-2096
- 8) 小川紀雄 他：Geriatric Medicine 1989；27(8)：1198-1204
- 9) Carfagna, N. et al. : Neurosci. Lett. 1995；197(3)：195-198
- 10) Matsuoka, Y. et al. : Basic, Clinical, and Therapeutic Aspects of Alzheimer's and Parkinson's Disease, Vol. 2, Plenum Press 1990；415-419
- 11) Moretti, A. et al. : Proof of Therapeutical Effectiveness of Nootropic and Vasoactive Drugs, Springer-Verlag 1985；103-110
- 12) 新富敬一 他：日薬理誌 1986；87：427-434
- 13) 新富敬一 他：日薬理誌 1986；87：445-456
- 14) Le Poncin-Lafitte, M. et al. : Gerontology 1984；30：109-119
- 15) Takahashi, K. et al. : Br. J. Pharmacol. 1990；100：705-710
- 16) 岩崎 仁 他：薬理と治療 1990；18(5)：1995-2004
- 17) 工藤幸司 他：薬理と治療 1985；13(11)：6489-6493

## 【文献請求先】

田辺三菱製薬株式会社 くすり相談センター  
〒541-8505 大阪市中央区道修町3-2-10  
電話 0120-753-280



製造販売元

田辺三菱製薬株式会社

大阪市中央区道修町3-2-10