

貯法：室温保存
使用期限：外箱、アンプルラベルに表示の使用期限内に使用すること。

意識障害治療剤

処方箋医薬品^{注)}

シチコリン注100mg/2mL「日医工」 シチコリン注500mg/10mL「日医工」 シチコリン注250mg/2mL「日医工」 シチコリン注500mg/2mL「日医工」 シチコリン注1000mg/4mL「日医工」

CITICOLINE

(シチコリン注射液)

【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

品名	シチコリン注 100mg/2mL 「日医工」	シチコリン注 500mg/10mL 「日医工」	シチコリン注 250mg/2mL 「日医工」	シチコリン注 500mg/2mL 「日医工」	シチコリン注 1000mg/4mL 「日医工」
有効成分	シチコリン				
含量	1管(2mL)中 100mg	1管(10mL)中 500mg	1管(2mL)中 250mg	1管(2mL)中 500mg	1管(4mL)中 1000mg
剤形・色調	無色澄明の注射液				
pH	6.5~8.0				
浸透圧比(生理食塩液に対する比)	0.6~0.8		1.5~1.8		3.0~3.6
添加物	pH調整剤 適量				

【効能・効果】

- ・頭部外傷に伴う意識障害、脳手術に伴う意識障害
- ・脳卒中片麻痺患者の上肢機能回復促進
- ただし、発作後1年以内で、リハビリテーション及び通常の内服薬物療法(脳代謝賦活剤、脳循環改善剤などの投与)を行っている症例のうち、下肢の麻痺が比較的軽度なもの。
- ・下記疾患に対する蛋白分解酵素阻害剤との併用療法
 - (1)急性膵炎
 - (2)慢性再発性膵炎の急性増悪期
 - (3)術後の急性膵炎
- ・脳梗塞急性期意識障害

【用法・用量】

- ・頭部外傷に伴う意識障害、脳手術に伴う意識障害の場合
シチコリンとして、通常成人1回100~500mgを1日1~2回点滴静脈内注射、静脈内注射又は筋肉内注射する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
- ・脳卒中後の片麻痺の場合
通常、シチコリンとして1日1回1,000mgを4週間連日静注する。又は、シチコリンとして1日1回250mgを4週間連日静注し、改善傾向が認められる場合には更に4週間継続投与する。
- ・膵炎の場合
通常、蛋白分解酵素阻害剤と併用して、1日1回シチコリンとして1,000mgを2週間連日静脈内投与する。
- ・脳梗塞急性期意識障害の場合
通常、1日1回シチコリンとして1,000mgを2週間連日静脈内投与する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)
薬剤過敏症の既往歴のある患者
2. 重要な基本的注意
(1)急性重症かつ進行性の頭部外傷並びに脳手術に伴う意識障害の患者に投与する場合には、止血剤、脳圧下降剤や低体温等の

日本標準商品分類番号		87119、872399	
	承認番号	薬価収載	販売開始
シチコリン注 100mg/2mL 「日医工」	21800AMX10739000	2006年12月	1998年12月
シチコリン注 500mg/10mL 「日医工」	21800AMX10740000		
シチコリン注 250mg/2mL 「日医工」	21800AMX10857000		
シチコリン注 500mg/2mL 「日医工」	21800AMX10741000	2004年12月	
シチコリン注 1000mg/4mL 「日医工」	21800AMX10742000		
再評価結果：1996年3月		効能追加：1988年6月	

の処置とともに用いること。
(2)脳梗塞急性期意識障害の患者に使用する場合、卒中発作後2週間以内に投与を開始することが望ましい。

3. 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。

(1)重大な副作用 (頻度不明)

ショックを起こすことがあるので、観察を十分に行い、血圧降下、胸内苦悶、呼吸困難等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2)その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{*)}	発疹
精神神経系	不眠、麻痺肢のしびれ感の発現又は増強 (脳卒中片麻痺に用いた場合)、頭痛、めまい、興奮、痙攣
消化器	悪心、食欲不振
肝臓	肝機能検査値の異常
眼	一過性の複視
その他	熱感、一過性の血圧変動、倦怠感

注1) このような場合には投与を中止すること。

4. 適用上の注意

- (1)静脈内注射時：静脈内注射にあたっては、できるだけゆっくり投与すること。
- (2)筋肉内注射時：筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響を避けるため下記の点に注意すること。
 - 1)筋肉内注射は、やむを得ない場合にのみ、必要最少限に行うこと。なお、特に同一部位への反復注射は行わないこと。また、低出生体重児、新生児、乳児、小児には特に注意すること。
 - 2)神経走行部位を避けるよう注意すること。
 - 3)注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。
- (3)アンプルカット時：本品のプラスチックアンプル以外はワンポイントアンプルであるが、アンプルのカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

【薬物動態】

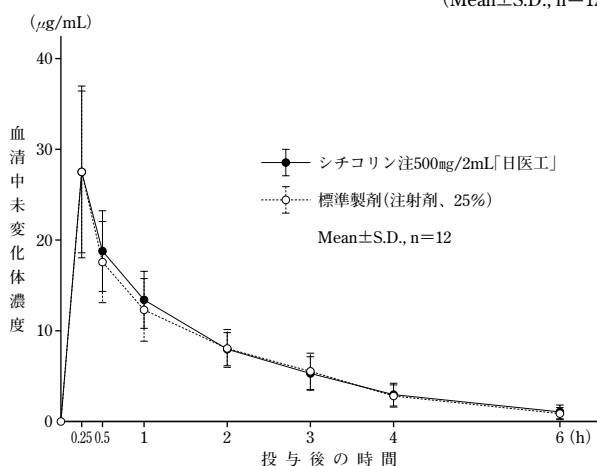
生物学的同等性試験

シチコリン注500mg/2mL「日医工」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1アンプル(シチコリンとして500mg)健康成人男子に絶食単回筋肉内投与して血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})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⁾

注) 処方箋医薬品：注意—医師等の処方箋により使用すること

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₆ ($\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$)	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (h)	t _{1/2} (h)
シチコリン注 500mg/2mL「日医工」	39.30±8.19	29.31±7.33	0.31±0.11	1.32±0.43
標準製剤 (注射剤、25%)	37.91±9.75	28.32±8.01	0.31±0.11	1.29±0.37

(Mean±S.D., n=12)



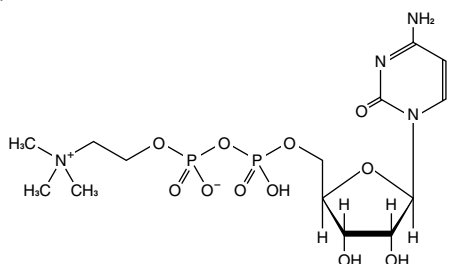
血清中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬効薬理】

シチコリンは広義の脳代謝改善薬である。作用機序として、上行性網様体賦活系促進（意識水準上昇）、錐体路系促進（運動機能亢進）、脳血流改善、脳内ドパミン増加、等の関与が示唆されている。²⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：シチコリン (Citicoline)
 化学名：*N*-(2-(Trimethylammonio)ethyl) cytidine 5'-
 (monohydrogen diphosphate)
 構造式：



分子式：C₁₄H₂₆N₄O₁₁P₂

分子量：488.32

性状：白色の結晶性の粉末である。

水に極めて溶けやすく、エタノール (99.5) にほとんど溶けない。

本品は0.01mol/L塩酸試液に溶ける。

【取扱い上の注意】

安定性試験

シチコリン注500mg/10mL「日医工」、シチコリン注1000mg/4mL「日医工」（プラスチックアンプル）：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、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。³⁾

シチコリン注100mg/2mL「日医工」、シチコリン注250mg/2mL「日医工」、シチコリン注500mg/2mL「日医工」：最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

【包装】

シチコリン注100mg/2mL「日医工」 50管
 シチコリン注500mg/10mL「日医工」 50管
 （プラスチックアンプル）
 シチコリン注250mg/2mL「日医工」 50管
 シチコリン注500mg/2mL「日医工」 50管
 シチコリン注1000mg/4mL「日医工」 50管
 （プラスチックアンプル）

【主要文献】

- 1) 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 第十七改正日本薬局方解説書 C-2130、廣川書店、東京(2016)
- 3) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

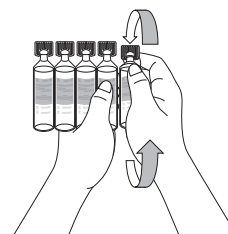
【文献請求先】

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。
 日医工株式会社 お客様サポートセンター
 〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21
 ☎(0120)517-215
 Fax (076)442-8948

【プラスチックアンプル使用方法】

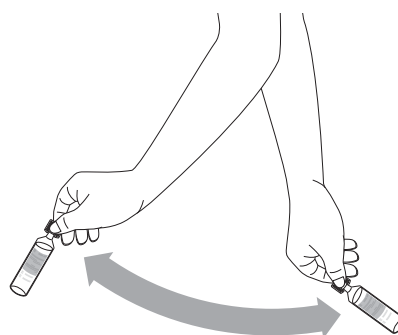
操作①

アンプルの接合部分をねじって切り離す。



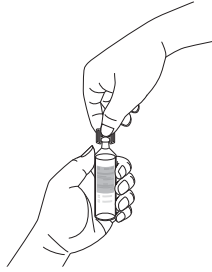
操作②

アンプル頭部を持ち、上下にゆっくりと大きく振る。
 (液だまりの液を胴体部に落して少なくします。)



操作③

片手で胴体の肩部を持ち、もう一方の手で頭部の平らな部分をつまむ。
(胴体の肩部以外を押すと、開栓時に液が飛び出す可能性があります。)



操作④

胴体部分に力を掛けないようにゆっくりと頭部を回し、切り離す。
(手に付いた時は直ちに水で洗い流して下さい。)

