

代謝性強心剤



〈ユビデカレノン製剤〉

〔貯 法〕 室温保存 (ユビデカレノンの融点 (約48℃) 以上になると、まだら変色を起こすことがある。)(「取扱い上の注意」の項参照)

〔使用期限〕 外箱又はラベルに表示の使用期限内に使用すること。

	錠 5 mg	錠10mg	糖衣錠10mg
承認番号	15200AMZ00880000	15100AMZ00371000	15400AMZ01434000
薬価収載	1978年 4月	1978年 4月	1981年 9月
販売開始	1978年 4月	1978年 4月	1981年 9月
再評価結果	1988年 1月		

	カプセル 5 mg	顆粒 1 %
承認番号	21800AMX10306000	21800AMX10422000
薬価収載	2006年 6月	2006年12月
販売開始	1974年 4月	1976年10月
再評価結果	1988年 1月	

【組成・性状】

1. 組成

錠 5mg : 1錠中にユビデカレノン 5mg を含有する黄色～橙黄色の素錠である。

添加物としてカルナウバロウ、カルメロースカルシウム、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、ステアリン酸、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

錠 10mg : 1錠中にユビデカレノン10mgを含有する黄色～橙黄色の素錠である。

添加物としてカルナウバロウ、カルメロースカルシウム、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、ステアリン酸、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロースを含有する。

糖衣錠10mg : 1錠中にユビデカレノン10mgを含有する橙色の糖衣錠である。

添加物として黄色5号、カルナウバロウ、含水二酸化ケイ素、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、精製白糖、タルク、沈降炭酸カルシウム、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、白色セラック、ヒドロキシプロピルセルロース、プルラン、ポビドン、マクロゴール6000を含有する。

カプセル 5mg : 1カプセル中にユビデカレノン 5mg を含有する橙色と微褐色の硬カプセル剤である。

添加物として黄色5号、結晶セルロース、ゼラチン、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ラウリル硫酸ナトリウムを含有する。

顆粒 1% : 1g中にユビデカレノン10mgを含有する黄色～橙黄色の顆粒剤である。

添加物として乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトールを含有する。

2. 製剤の性状

販売名	剤形 識別コード	外 形			性 状
		表	裏	側 面	
ノイキノン 錠 5mg	素錠				黄色～橙黄色
	EISAI NQ005	直径(mm)・質量(mg)・厚さ(mm) 5.1                      50                      2.5			
ノイキノン 錠10mg	素錠				黄色～橙黄色
	EISAI NQ010	直径(mm)・質量(mg)・厚さ(mm) 6.1                      100                      3.4			
ノイキノン 糖衣錠10mg	糖衣錠				橙色
	€224	直径(mm)・質量(mg)・厚さ(mm) 7.5                      170                      4.2			
ノイキノン カプセル 5mg	硬カプセル				カプセル 上半分: 橙色 下半分: 微褐色 内容物: 黄色
	NQ05€	全長(mm)・質量(mg)・号数 14.3                      170                      4号			
ノイキノン 顆粒 1%	顆粒剤				黄色～橙黄色 わずかに甘味あり

【効能・効果】

基礎治療施行中の軽度及び中等度のうっ血性心不全症状

【用法・用量】

ユビデカレノンとして通常成人は1回10mgを1日3回食後に経口投与する。

錠 5mg : 通常成人、1回2錠を1日3回食後に経口投与する。

錠 10mg : 通常成人、1回1錠を1日3回食後に経口投与する。

糖衣錠10mg : 通常成人、1回1錠を1日3回食後に経口投与する。

カプセル 5mg : 通常成人、1回2カプセルを1日3回食後に経口投与する。

顆粒 1% : 通常成人、1回1gを1日3回食後に経口投与する。

(裏面につづく)

## 【使用上の注意】

### 1. 副作用

総症例数5,350例中、78例（1.46%）の副作用が報告されている。（副作用発現頻度調査終了時）

	0.1～5%未満
消化器	胃部不快感、食欲減退、吐気、下痢
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹

注) このような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

### 2. 適用上の注意

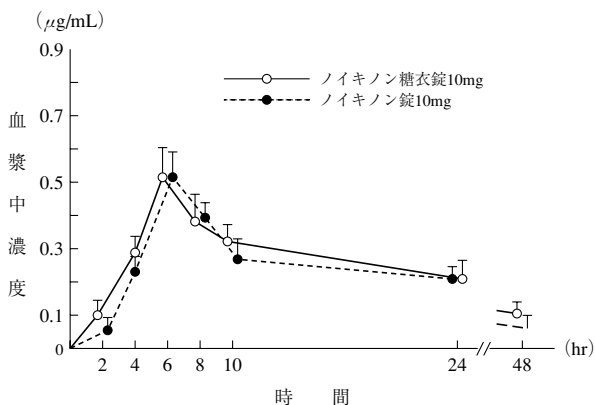
薬剤交付時（錠、糖衣錠、カプセル）

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に刺入し、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. ノイキノン錠10mg、糖衣錠10mgの血中濃度

健康成人男子を対象に、クロスオーバー法により錠10mgあるいは糖衣錠10mgをそれぞれ10錠（ユビデカレノンとして100mg<sup>注)</sup>）単回経口投与した際の、血漿中濃度の推移を比較検討した。両製剤共に投与後6時間で最高血漿中濃度（外因性CoQ<sub>10</sub>として約0.5 $\mu$ g/mL）に達し、以後緩やかに低下して、剤形間に統計学的有意差は認められなかった。



ユビデカレノン100mg<sup>注)</sup>単回経口投与時の血漿中外因性CoQ<sub>10</sub>濃度

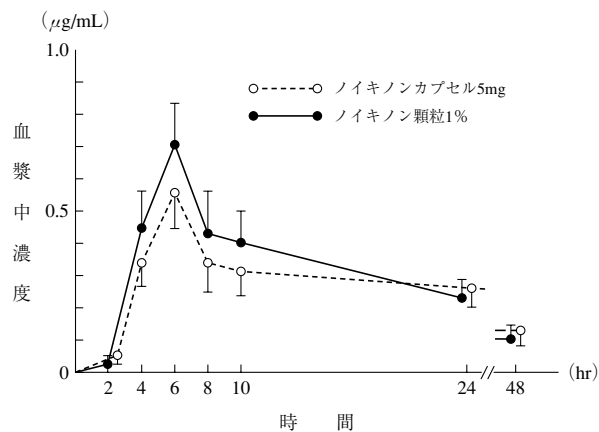
ノイキノン糖衣錠10mg・錠10mgの薬物動態パラメータ

	t <sub>max</sub> (hr)	C <sub>max</sub> (μg/mL)	AUC (μg·hr/mL)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ノイキノン糖衣錠10mg	6	0.51	10.5	25.0
ノイキノン錠10mg	6	0.52	9.5	19.2

注) 100mg単回経口投与は承認外用量である。

### 2. ノイキノンカプセル5mg、顆粒1%の血中濃度

健康成人男子を対象に、クロスオーバー法によりカプセルあるいは顆粒をそれぞれユビデカレノンとして100mg<sup>注)</sup>）単回経口投与した際の、血漿中濃度の推移を比較検討した。両製剤共に投与後6時間で最高血漿中濃度（外因性CoQ<sub>10</sub>として0.55～0.7 $\mu$ g/mL）に達し、以後緩やかに低下した。血漿中濃度はカプセルの方が低い傾向にあったが、剤形間に統計学的有意差は認められなかった。



ユビデカレノン100mg<sup>注)</sup>単回経口投与時の血漿中外因性CoQ<sub>10</sub>濃度

ノイキノンカプセル5mg・顆粒1%の薬物動態パラメータ

	t <sub>max</sub> (hr)	C <sub>max</sub> (μg/mL)	AUC (μg·hr/mL)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ノイキノンカプセル5mg	6	0.55	11.7	32.2
ノイキノン顆粒1%	6	0.70	12.1	20.7

注) 100mg単回投与は承認外用量である。

## 【臨床成績】

### 臨床効果

虚血性心疾患、高血圧症やリウマチ性心疾患等に基づくうっ血性心不全の自覚症状（浮腫、肺うっ血、肝腫脹や狭心症症状等）に対して、二重盲検試験及び一般臨床試験において本剤の有用性が認められている。 (①②③④)

## 【薬効薬理】

### 1. 虚血心筋での酸素利用効率の改善

モルモットの心室乳頭筋を用いた研究で、低酸素灌流条件下で低下した心筋収縮力はユビデカレノンの添加で改善した。 (⑤)

### 2. 心筋でのATP産生の賦活

家兎を用いた研究で、ユビデカレノンを腹腔内に前投与した心筋では心筋を虚血・再灌流した際に見られるATP産生速度の低下が抑制され、虚血・再灌流による心筋細胞障害が軽度で保たれた。 (⑥⑦)

### 3. 低下した心機能の改善

心筋症モデル動物を用いた研究で、心筋障害期から心肥大期までユビデカレノンを経口投与した動物では、心筋の収縮性ならびに拡張性の低下は薬物非投薬群、ジゴキシン投与群に比べ軽度であった。（心筋症ハムスター）(⑧) また、心筋梗塞モデルを用いた研究では、心筋梗塞発症後のユビデカレノンを投与し心機能の低下が軽度で抑制された。心筋梗塞後の生命予後に対してはユビデカレノン投与では薬物非投与群に比べ長期生存率が良好に保たれた。（ラット心筋梗塞モデル） (⑨⑩)

### 4. 抗アルドステロン作用

ラットを用いた研究で、ユビデカレノンはアルドステロンの分泌を抑制すると同時にアルドステロンによるNa<sup>+</sup>貯留に対し拮抗的に働き、Na<sup>+</sup>利尿は促進するが、K<sup>+</sup>排泄に対しては影響を与えなかった。 (⑪)



## 【有効成分に関する理化学的知見】

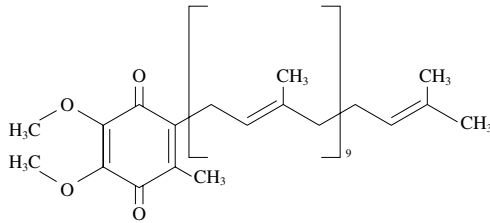
一般名：ユビデカレノン (Ubidecarenone)

化学名：(2E, 6E, 10E, 14E, 18E, 22E, 26E, 30E, 34E, 38E)-2-(3, 7, 11, 15, 19, 23, 27, 31, 35, 39-Decamethyltetraconta-2, 6, 10, 14, 18, 22, 26, 30, 34, 38-decaen-1-yl)-5, 6-dimethoxy-3-methyl-1, 4-benzoquinone

分子式：C<sub>59</sub>H<sub>90</sub>O<sub>4</sub>

分子量：863.34

構造式：



物理化学的性状：

ユビデカレノンは黄色～だいたい色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。

本品はジエチルエーテルに溶けやすく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

本品は光によって徐々に分解し、着色が強くなる。

融点：約48℃

### \*\*【取扱い上の注意】

- 錠5mg・錠10mgのPTP包装は外箱開封後、バラ包装は開栓後、光を遮り保存すること（変色及び含量が低下することがある）。
- 顆粒は開栓後、光を遮り保存すること（変色及び含量が低下することがある）。

### \*【包装】

- \*ノイキノン錠5mg ……100錠(PTP)・1,000錠(PTP)  
ノイキノン錠10mg ……100錠(PTP)・210錠(PTP21T×10)  
500錠(バラ)・1,000錠(PTP)  
3,150錠(PTP21T×150)  
ノイキノン糖衣錠10mg ……100錠(PTP)・1,000錠(PTP)  
ノイキノンカプセル5mg ……100カプセル(PTP)・500カプセル(バラ)  
1,000カプセル(PTP)  
ノイキノン顆粒1% ……100g

### 【主要文献】

- |  | 文献請求番号   |
|--|----------|
| ① 寺沢富士夫ら：心臓, 2, 695 (1970)   | NEQ-0110 |
| ② 猪岡英二ら：診断と治療, 69, 872 (1981)                                      | NEQ-0576 |
| ③ 橋場邦武ら：心臓, 4, 1579 (1972)   | NEQ-0127 |
| ④ 岩淵 勉ら：臨牀と研究, 49, 2604 (1972)                                     | NEQ-0128 |
| ⑤ Arita, M. et al. : Jpn. Heart J., 23, 961 (1982)                 | NEQ-0528 |
| ⑥ Nayler, W.G. et al. : Biomed. Clin. Asp. CoQ, 2, 409 (1980)      | NEQ-0308 |
| ⑦ Takeo, S. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 243, 1131 (1987)    | NEQ-0906 |
| ⑧ Momomura, S. et al. : Jpn. Heart J., 32, 101 (1991)              | NEQ-1030 |
| ⑨ Zimmer, H.G. et al. : Basic Res. Cardiol., 84, 332 (1989)        | NEQ-0995 |
| ⑩ Bech, O.M. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 255, 346 (1990)    | NEQ-0998 |
| ⑪ Igarashi, T. et al. : Proc. West Pharmacol. Soc., 18, 399 (1975) | NEQ-0046 |

## 【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

エーザイ株式会社 お客様ホットライン  
フリーダイヤル 0120-419-497

製造販売元



エーザイ株式会社  
東京都文京区小石川4-6-10

A36931-1  
A361560-01