

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

ビタミンC製剤
日本薬局方
アスコルビン酸散
ビタミンC散「フソー」- **100**mg
Vitamin C Powder "FUSO"

剤形	散剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1g 中 日局 アスコルビン酸 100mg
一般名	和名：アスコルビン酸 (JAN) 洋名：Ascorbic Acid (JAN)
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日：1986年3月8日
薬価基準収載・ 販売開始年月日	薬価基準収載年月日：1964年10月15日 販売開始年月日：1964年10月15日
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：扶桑薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	扶桑薬品工業株式会社 研究開発センター 学術室 TEL 06-6964-2763 FAX 06-6964-2706 (9:00~17:30/土日祝日を除く) 医療関係者向けホームページ https://www.fuso-pharm.co.jp/cnt/seihin/

本 I F は 2022 年 10 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の電子添文情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ

（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「I F記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたI Fは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I Fの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体の I F は、PMDA の医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I F を日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I F は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らが I F の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I F を活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020 年 4 月)

目次

I. 概要に関する項目	1	(1) 注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報	5
I-1 開発の経緯	1	(2) 包装	5
I-2 製品の治療学的特性	1	(3) 予備容量	5
I-3 製品の製剤学的特性	1	(4) 容器の材質	5
I-4 適正使用に関して周知すべき特性	1	IV-11 別途提供される資材類	6
I-5 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	IV-12 その他	6
(1) 承認条件	1		
(2) 流通・使用上の制限事項	1		
I-6 RMP の概要	1		
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	7
II-1 販売名	2	V-1 効能又は効果	7
(1) 和名	2	V-2 効能又は効果に関連する注意	7
(2) 洋名	2	V-3 用法及び用量	7
(3) 名称の由来	2	(1) 用法及び用量の解説	7
II-2 一般名	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	7
(1) 和名(命名法)	2	V-4 用法及び用量に関連する注意	7
(2) 洋名(命名法)	2	V-5 臨床成績	7
(3) ステム	2	(1) 臨床データパッケージ	7
II-3 構造式又は示性式	2	(2) 臨床薬理試験	7
II-4 分子式及び分子量	2	(3) 用量反応探索試験	7
II-5 化学名(命名法)又は本質	2	(4) 検証的試験	8
II-6 慣用名，別名，略号，記号番号	2	1) 有効性検証試験	8
		2) 安全性試験	8
		(5) 患者・病態別試験	8
		(6) 治療的使用	8
		1) 使用成績調査(一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査)，製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容	8
		2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要	8
		(7) その他	8
III. 有効成分に関する項目	3	VI. 薬効薬理に関する項目	9
III-1 物理化学的性質	3	VI-1 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	9
(1) 外観・性状	3	VI-2 薬理作用	9
(2) 溶解性	3	(1) 作用部位・作用機序	9
(3) 吸湿性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	9
(4) 融点(分解点)，沸点，凝固点	3	(3) 作用発現時間・持続時間	9
(5) 酸塩基解離定数	3		
(6) 分配係数	3	VII. 薬物動態に関する項目	10
(7) その他の主な示性値	3	VII-1 血中濃度の推移	10
III-2 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1) 治療上有効な血中濃度	10
III-3 有効成分の確認試験法，定量法	3	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	10
		(3) 中毒域	10
		(4) 食事・併用薬の影響	10
		VII-2 薬物速度論的パラメータ	10
		(1) 解析方法	10
		(2) 吸収速度定数	10
		(3) 消失速度定数	10
		(4) クリアランス	10
		(5) 分布容積	10
		(6) その他	10
		VII-3 母集団(ポピュレーション)解析	10
		(1) 解析方法	10
		(2) パラメータ変動要因	10
		VII-4 吸収	11
IV. 製剤に関する項目	4		
IV-1 剤形	4		
(1) 剤形の区別	4		
(2) 製剤の外観及び性状	4		
(3) 識別コード	4		
(4) 製剤の物性	4		
(5) その他	4		
IV-2 製剤の組成	4		
(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤	4		
(2) 電解質等の濃度	4		
(3) 熱量	4		
IV-3 添付溶解液の組成及び容量	4		
IV-4 力価	4		
IV-5 混入する可能性のある夾雑物	4		
IV-6 製剤の各種条件下における安定性	5		
IV-7 調製法及び溶解後の安定性	5		
IV-8 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5		
IV-9 溶出性	5		
IV-10 容器・包装	5		

VII-5 分布	11	(7)その他の特殊毒性	17
(1)血液－脳関門通過性	11		
(2)血液－胎盤関門通過性	11		
(3)乳汁への移行性	11		
(4)髄液への移行性	11		
(5)その他の組織への移行性	11		
(6)血漿蛋白結合率	11		
VII-6 代謝	11		
(1)代謝部位及び代謝経路	11		
(2)代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種, 寄与率	12		
(3)初回通過効果の有無及びその割合	12		
(4)代謝物の活性の有無及び活性比, 存在比率	12		
VII-7 排泄	12		
VII-8 トランスポーターに関する情報	12		
VII-9 透析等による除去率	12		
VII-10 特定の背景を有する患者	12		
VII-11 その他	12		
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	13		
VIII-1 警告内容とその理由	13		
VIII-2 禁忌内容とその理由	13		
VIII-3 効能又は効果に関連する注意とその理由	13		
VIII-4 用法及び用量に関連する注意とその理由	13		
VIII-5 重要な基本的注意とその理由	13		
VIII-6 特定の背景を有する患者に関する注意	13		
(1)合併症・既往歴等のある患者	13		
(2)腎機能障害患者	13		
(3)肝機能障害患者	13		
(4)生殖能を有する者	13		
(5)妊婦	13		
(6)授乳婦	13		
(7)小児等	13		
(8)高齢者	13		
VIII-7 相互作用	14		
(1)併用禁忌とその理由	14		
(2)併用注意とその理由	14		
VIII-8 副作用	14		
(1)重大な副作用と初期症状	14		
(2)その他の副作用	14		
VIII-9 臨床検査結果に及ぼす影響	14		
VIII-10 過量投与	15		
VIII-11 適用上の注意	15		
VIII-12 その他の注意	15		
(1)臨床使用に基づく情報	15		
(2)非臨床試験に基づく情報	15		
IX. 非臨床試験に関する項目	16		
IX-1 薬理試験	16		
(1)薬効薬理試験	16		
(2)安全性薬理試験	16		
(3)その他の薬理試験	16		
IX-2 毒性試験	16		
(1)単回投与毒性試験	16		
(2)反復投与毒性試験	16		
(3)遺伝毒性試験	16		
(4)がん原性試験	16		
(5)生殖発生毒性試験	16		
(6)局所刺激性試験	16		
X. 管理的事項に関する項目	18		
X-1 規制区分	18		
X-2 有効期間	18		
X-3 包装状態での貯法	18		
X-4 取扱い上の注意	18		
X-5 患者向け資材	18		
X-6 同一成分・同効薬	18		
X-7 国際誕生年月日	18		
X-8 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準収載年月日, 販売開始年月日	18		
X-9 効能又は効果追加, 用法及び用量変更追加等 の年月日及びその内容	18		
X-10 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	19		
X-11 再審査期間	19		
X-12 投薬期間制限に関する情報	19		
X-13 各種コード	19		
X-14 保険給付上の注意	19		
XI. 文献	20		
XI-1 引用文献	20		
XI-2 その他の参考文献	20		
XII. 参考資料	21		
XII-1 主な外国での発売状況	21		
XII-2 海外における臨床支援情報	21		
XIII. 備考	22		
XIII-1 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うに あたっての参考情報	22		
(1)粉碎	22		
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	22		
XIII-2 その他の関連資料	22		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1911年 Holst 及び Frölich は動物の壊血病がある種の物質の欠如によって起こることを明らかにした。その後 Szent-Györgyi らの研究により食品中に含まれる色素脱色性要素がビタミンCであることが推定された。一方、King はレモン汁中からビタミンCの結晶の分離に成功し、Szent-Györgyi も抗壊血病作用がビタミンCにあることを確認し、抗壊血病の意味で ascorbic acid と命名した。

2. 製品の治療学的特性

ビタミンCの代表的な欠乏症が壊血病であり、出血傾向の増大、骨・歯牙の発育遅延、抗体産生能や創傷治癒能の低下などを起こす。本薬の投与はこれらの疾患や症状に効果があるが、生理的意義や作用は十分明らかではない。コラーゲン生成への関与、毛細血管抵抗性の増強や血液凝固時間の短縮などによる出血傾向の改善、副腎皮質機能への関与（ストレス反応の防止）、メラニン色素生成の抑制などが報告されている¹⁾。

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料，最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

特になし

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない（RMP 策定対象外の事例）

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ビタミンC散「フソー」-100mg

(2) 洋名

Vitamin C Powder "FUSO" -100mg

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

アスコルビン酸 (JAN)

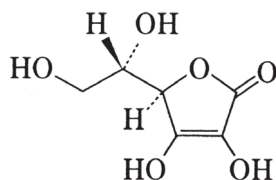
(2) 洋名(命名法)

Ascorbic Acid (JAN)

(3) ステム

該当しない

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_6H_8O_6$

分子量 : 176.12

5. 化学名(命名法)又は本質

L-threo-Hex-2-enono-1,4-lactone

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当しない

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、酸味がある。

(2) 溶解性

水に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点: 約 190°C (分解)

(5) 酸塩基解離定数

$pK_1=4.17$ $pK_2=11.57$

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値¹⁾

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$: +20.5~+21.5° (2.5g、水、25mL、100mm)。

pH: 本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 2.2~2.5 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

光によって徐々に着色する。

3. 有効成分の確認試験法, 定量法

確認試験法

1) 過マンガン酸カリウム試液、2,6-ジクロロインドフェノールナトリウム試液の色の消失

2) Tipson 変法

定量法

ヨウ素液滴定

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

散剤

(2) 製剤の外観及び性状

白色

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

1g 中日局アスコルビン酸 100mg を含む。

添加剤：賦形剤 乳糖水和物

賦形剤 バレイショデンプン

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

6. 製剤の各種条件下における安定性

長期保存試験²⁾

保存条件	保存期間	保存形態	結果
25°C±2°C 60%RH±5%RH	3年	最終包装	変化なし

無包装状態での安定性試験³⁾

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
温度	40°C±2°C	6ヵ月	無包装	変化なし
湿度	75%RH±5%RH 30°C±2°C	6ヵ月		外観：微黄白色着色、3ヵ月、規格外 含量：約9%低下、6ヵ月、規格外
光	120万 lx・hr			変化なし

無包装状態での安定性試験は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（日病薬答申）」に準拠して実施

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）¹⁾

本薬は還元性、キレート性が強いので配合変化を起こしやすく、その際本薬の効力は低下する。例えば本薬の注射剤と、強アルカリ溶液、銅塩、第二鉄塩、酸化剤、重金属の塩などとの混合は注意を要する。経口・経管栄養剤と混合することにより2～3時間で40%が分解する。また、輸液中でビタミンB₂注射液と共存するとB₂の光増感反応により酸化分解される。

9. 溶出性

該当資料なし

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報

X-4.の項 参照

(2) 包装

(バラ) 500g 箱

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

内袋：アルミニウム

個装箱：紙

IV. 製剤に関する項目

11. 別途提供される資材類

特になし

12. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- (1) ビタミンC欠乏症の予防及び治療（壊血病、メルレル・バロー病）
- (2) ビタミンCの需要が増大し、食事からの摂取が不十分な際の補給（消耗性疾患、妊産婦、授乳婦、はげしい肉体労働時など）
- (3) 下記疾患のうち、ビタミンCの欠乏又は代謝障害が関与すると推定される場合
 - ・毛細管出血（鼻出血、歯肉出血、血尿など）
 - ・薬物中毒
 - ・副腎皮質機能障害
 - ・骨折時の骨基質形成・骨癒合促進
 - ・肝斑・雀卵斑・炎症後の色素沈着
 - ・光線過敏性皮膚炎
- (3) の適応に対して、効果がないのに月余にわたって漫然と使用すべきでない。

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

アスコルビン酸として、通常成人1日50～2,000mgを1～数回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

特になし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ビタミン剤

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

1. 作用機序

I-2. の項 参照

2. コラーゲン形成促進作用

壊血病の病理所見は骨、歯牙及びその他の結合織のコラーゲン合成能の低下によるものと考えられている^{4,5)}。

壊血病生成食飼育モルモットの皮膚再生を指標にアスコルビン酸の結合織形成に及ぼす影響を調べた実験では、アスコルビン酸の投与により組織のヒドロキシプロリン産生増とともに非コラーゲン性プロリンの減少が認められ、創傷部のプロリン含有物質がコラーゲンに変換されていることを示唆する成績が得られている⁶⁾。

また、結合織のコラーゲンと類似の組成から成る上皮基底膜の合成もアスコルビン酸依存性であり、壊血病の徴候のいくつかは基底膜の合成不全によることが示されている⁷⁾。

3. 副腎防禦作用

ラットにエピネフリン注射によるストレスを負荷すると、好酸球の減少とともに組織学的には副腎の警告反応を示唆する像が得られるが、アスコルビン酸を前投与しておいた動物では有意の好酸球増加が認められ、また組織学的に副腎は正常で、副腎防禦作用を有することが示されている⁸⁾。

4. メラニン生成に及ぼす影響

*In vitro*においてアスコルビン酸はドパキノン→ドパクロムの酸化に還元系として作用してドパクロムの生成を阻害する成績が得られており、モルモット及びウサギに大量投与した場合にも *in vitro*で認められたドパクロム生成阻害を起こし得る量が皮膚へ到達することが認められている⁹⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他¹⁾

ヒトの半減期は16日といわれている。

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性¹⁰⁾

アスコルビン酸は母乳中に分泌される。母乳が十分な乳児の場合にはアスコルビン酸の補給を必要としない。

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性¹⁰⁾

アスコルビン酸は体内においては、代謝活動の盛んな臓器（網膜、脳下垂体、黄体、副腎、肝臓）に多く分布する。

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

主に肝臓¹⁰⁾。

摂取されたアスコルビン酸は消化管から速やかに吸収され、特異的な能動輸送機構により各組織に運ばれ貯留されると考えられる。組織中のアスコルビン酸は大部分還元型として存在するが、腎や腸間膜の静脈血中では全アスコルビン酸の約80%が酸化型(デヒドロアスコルビン酸)となっているという。還元型と酸化型の相互変換は生体内で可逆的である。

デヒドロアスコルビン酸は生体内で加水分解を受けて不可逆的にジケトグルン酸となり、更に脱炭酸され、L-リキソン酸とL-キシロン酸となって分解されていく。これらの反応は肝などで酵素的に起こり動物種による差が著しく、ヒトでの分解は比較的小さい。アスコルビン酸の代謝産物としてシュウ酸が尿中に排泄されることが知られているが、これはジケトグルン酸が非酵素的にシュウ酸とL-スレオン酸となるのであろうと考えられている。しかしアスコルビン酸をヒトに大量に投与した場合、未変化体のまま尿中に速やかに排出され、尿中のシュウ酸はほとんど増加しないという結果が得られている¹⁾。

VII. 薬物動態に関する項目

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種, 寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比, 存在比率

該当資料なし

7. 排泄

排泄部位：腎臓¹⁰⁾

排泄率：300mg 投与により尿中排泄は 4 時間後にピークになり、飽和後の排泄率は 45%¹⁰⁾。

排泄速度：該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報¹¹⁾

細胞外のビタミン C は、ナトリウム依存性ビタミン C トランスポーター (SVCT) により細胞内に能動輸送される。一方、デヒドロアスコルビン酸は、促進拡散型グルコーストランスポーター (GLUT) ファミリーを介して細胞内に取り込まれる。

ビタミン C やデヒドロアスコルビン酸の細胞外への排出を司る特異的なトランスポーターの同定には至っていない。

9. 透析等による除去率¹⁰⁾

血液透析：

血液透析を受けている腎不全患者では、透析後、血漿中のアスコルビン酸が 40% 減少する。

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

特になし

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

設定されていない

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

設定されていない

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

設定されていない

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
消化器	悪心・嘔吐、下痢

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

12.1 各種の尿糖検査で、尿糖の検出を妨害することがある。

12.2 各種の尿検査（潜血、ビリルビン、亜硝酸塩）・便潜血反応検査で、偽陰性を呈することがある。

<参考>¹²⁻¹⁶⁾

尿潜血、ビリルビン、亜硝酸塩試験及び便潜血反応検査には酸化還元反応を利用したものがあり、これらの反応は強い還元作用を有するアスコルビン酸の影響を受けることが知られている。

尿・便潜血：ヘモグロビンが特異的に試験紙に含まれている過酸化物質から活性酸素を遊離し、活性酸素がクロモゲンを酸化し呈色させる。アスコルビン酸は還元型クロモゲンよりも酸化され易いため、クロモゲン酸化（発色）を阻害することになる。

過酸化物質 → (Hb の POD 様作用) → H₂O + 活性酸素(O)

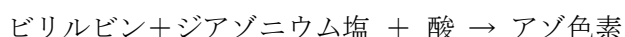
還元型クロモゲン + (O) → 酸化型クロモゲン (発色)

ヘモグロビンの POD 様作用（偽ペルオキシダーゼ活性）

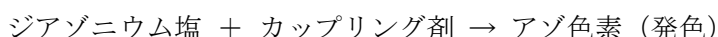
ペルオキシダーゼは過酸化水素を水素受容体として種々の物質の酸化を触媒する酵素の総称である。ヘモグロビンはペルオキシダーゼではないが、ペルオキシダーゼと同様な触媒作用を示すため、ヘモグロビンのペルオキシダーゼ様活性という。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

尿中ビリルビン：ビリルビンとジアゾニウム塩を結合してアゾ色素（発色）を形成させる。アスコルビン酸の存在により反応が阻害される。



尿中亜硝酸塩：尿中に細菌が多数存在すると細菌の酵素によって尿中の食物由来の硝酸塩が還元されて亜硝酸塩となり、ジアゾカップリング反応により亜硝酸塩を呈色させる。アスコルビン酸により反応が妨害される。



検査結果への影響について次のような報告がある。

潜血	尿中アスコルビン酸 25mg/dL 以上は潜血試験紙を 1 段階陰性化させる有意の濃度である ¹²⁾ 。
ビリルビン	25mg/dL で検査値に影響が出る ¹³⁾ 。
亜硝酸塩	25mg/dL 以上で偽陰性となる可能性がある ¹²⁾ 。

以上より、25mg/dL 以下であれば測定値への影響は避けられると考えられる。

ビタミン C 大量（1,000mg）投与時の尿中排泄量について、投与後 3～6 時間内がピークで 108mg、その後減少して 9～24 時間の尿中には 44mg という報告がある¹⁶⁾。従って 9～24 時間の尿量が 200mL 以上であれば尿中アスコルビン酸濃度は 25mg/dL 以下となるので、この間に採取された尿（9～24 時間の蓄尿）ではビタミン C による偽陰性は生じないと考えられる。

また、尿検査実施 24 時間前からは可能なかぎり投薬は控えるべきであるとの報告もある¹²⁾。

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

本剤は還元性、キレート性が強いので配合変化を起こしやすく、その際、本剤の効力が低下するので注意すること¹⁾。

IV-8. の項 参照

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験¹⁰⁾

モルモットにアスコルビン酸 0.5～5.0g/kg/日を経口、皮下及び静脈内に投与しても毒性はみられなかった。

マウスにアスコルビン酸 0.5～1.0g/kg/日を7日間投与した場合でも何ら毒性症状はみられていない。

(2) 反復投与毒性試験¹⁰⁾

モルモットにアスコルビン酸 500 および 1,000mg の大量を毎日、150～170 日間にわたって投与しても何ら認むべき変化は生じなかった。しかし、性的未熟のモルモットにアスコルビン酸 15mg 又は 50mg/kg/日を30日間皮下に投与した結果、アスコルビン酸投与群のいずれにおいても卵巢の重量低下がみられ（卵巢の重量：対照群 454mg、15mg 投与群 167mg、50mg 投与群 140mg）、また子宮内膜の萎縮性変化、腺の内膜減少、腺の結合織の増殖、卵巢の軽度の繊維性増殖及び睾丸の性細胞並びにろ胞細胞の増殖がみられた。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験¹⁷⁾

妊娠マウス及びラットに対して妊娠 6～15 日の間大量（150～1,000mg/kg）のアスコルビン酸を経口投与した実験で、母体及び胎児に対する毒性効果や催奇形性は認められていない。また、妊娠 0 日～分娩後 21 日までラットに連日経口投与した場合、妊娠の経過、胎児・新生児の発育、再妊娠率、哺乳能力等において対象群との間に有意の差は認められていない。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

区. 非臨床試験に関する項目

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：該当しない（処方箋医薬品以外の医薬品である）

有効成分：該当しない

2. 有効期間

有効期間：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

アルミ袋開封後は、湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資材

くすりのしおり：あり

患者向医薬品ガイド：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：

ビタミンC注「フソー」-100mg（扶桑）

ビタミンC注「フソー」-500mg（扶桑）

ビタミンC注「フソー」-2g（扶桑）

同効薬：

アスコルビン酸製剤

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製造販売承認年月日：1986年3月8日

承認番号：16100AMZ02216

薬価基準収載年月日：1964年10月15日

販売開始年月日：1964年10月15日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

X-10.の項 参照

X. 管理的事項に関する項目

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1977年5月11日（その11）

	変更後	変更前				
効能・効果	<ul style="list-style-type: none"> ◇ビタミンC欠乏症の予防及び治療（壊血病、メルレル・パロー病） ◇ビタミンCの需要が増大し、食事からの摂取が不十分な際の補給（消耗性疾患、妊産婦、授乳婦、はげしい肉体労働時など） ◇下記疾患のうち、ビタミンCの欠乏又は代謝障害が関与すると推定される場合： <ul style="list-style-type: none"> ・毛細管出血（鼻出血、歯肉出血、血尿など） ・薬物中毒 ・副腎皮質機能障害 ・骨折時の骨基質形成・骨癒合促進 ・肝斑・雀卵斑・炎症後の色素沈着 ・光線過敏性皮膚炎 <p>上記の諸症のうちビタミンC欠乏症の予防及び治療、ビタミンCの需要が増大し、食事からの摂取が不十分な際の補給以外の効能・効果に対しては、効果がないのに月余にわたって漫然と使用すべきでない。</p>	<ul style="list-style-type: none"> ◇壊血病、メルレルパロー病。 ◇アジソン病、悪性貧血、各種中毒、色素沈着症。 ◇口内炎、歯ぎん炎、脳出血、腎炎、腎出血、胃腸出血などの炎症および出血時。 ◇肺結核、肺炎、脳炎、耳下腺炎、ジフテリア、リウマチ、がんなどの疾患時。 ◇骨折、骨膜炎、歯槽膿漏などの骨・歯牙疾患時。 ◇病後・手術後の回復期、疲労、高熱・寒冷作業時、妊産授乳婦の栄養障害。 				
用法・用量	<p>アスコルビン酸として、通常成人1日50～2,000mgを1～数回に分割経口投与する。</p> <p>なお、年齢、症状により適宜増減する。</p>	<p>1日量アスコルビン酸として50～500mgを1～3回に分割経口投与します。</p> <p>▽常用量：アスコルビン酸として1日50～500mg</p>				
副作用	<table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <tr> <td style="width: 50%;"></td> <td style="width: 50%; text-align: center;">頻度不明</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">消化器</td> <td style="text-align: center;">悪心・嘔吐、 下痢等</td> </tr> </table>		頻度不明	消化器	悪心・嘔吐、 下痢等	記載なし
	頻度不明					
消化器	悪心・嘔吐、 下痢等					
臨床検査値への影響	各種の尿糖検査で、尿糖の検出を妨害することがある。	記載なし				

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	レセプト電算コード
107120704	3140001B2011	3140001B2100	613140003 (613140025)

注：統一名収載品において、レセプト電算コード欄の()内は銘柄名のコードを示す。

14. 保険給付上の注意

特になし

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店. 2021 : C-95-100
- 2) 社内資料 : 長期保存試験
- 3) 社内資料 : 無包装状態での安定性試験
- 4) Fullmer, H. M., et al. : Ann. New York Acad. Sci. 1961 ; 92 : 286-294
- 5) 梶原章 : 最新医学. 1962 ; 17 : 1429-1446
- 6) Gould, B. S., et al. : J. Biol. Chem. 1957 ; 226 : 289-300
- 7) Priest, R. E. : Nature. 1970 ; 225 : 744-745
- 8) Bacchus, H., et al. : Science. 1951 ; 113 : 269-270
- 9) 竹内勝 ほか : ビタミン. 1963 ; 28 : 501-507
- 10) JPDI 2001 じほう. 2001 : 15-17
- 11) 石神昭人 : ビタミン. 2014 ; 88 : 555-559
- 12) 伊藤機一 ほか : 臨床と薬物治療. 1992 ; 11 : 202-211
- 13) 南雲文夫 : 日本臨床. 1985 ; 43 : 1607-1612
- 14) 金井正光 : 臨床検査法提要 改訂第30版 金原出版. 1993 : 102, 143, 174
- 15) 水田亘 : 検査と技術. 1992 ; 20 : 62-67
- 16) 村田晃 ほか : ビタミン. 1995 ; 69 : 175-182
- 17) Froberg, H. et al. : Arzneim. Forsch. 1973 ; 23 : 1081-1082
- 18) 社内資料 : 簡易懸濁試験及び通過性試験

2. その他の参考文献

特になし

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

- (1)本剤と同一製剤は外国で発売されていない。
- (2)アスコルビン酸製剤としては、各国で発売されている。(2022年12月時点)

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備 考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性¹⁸⁾

試験方法：

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に本剤 1g を入れ、ピストンを戻し、55℃のお湯 20mL を吸い取り、筒先に栓をして 5 分間放置した。5 分後にディスペンサーを手で 90 度 15 往復横転して攪拌した。その後、溶解・懸濁の状況を観察した。

得られた懸濁液が入ったディスペンサーを経鼻用経管チューブ（8Fr. チューブ）と接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入し、通過性を観察した。この時チューブは先端から 2/3 を水平にし、他端を 30cm の高さにセットした。注入後に約 10mL の水を同じディスペンサーで吸い取り、注入してチューブ内を洗い、薬が残存していなければ通過性に問題なしとした。

結果：

5 分以内に崩壊し、8Fr. チューブを通過した。

簡易懸濁法					備考
最小通過 サイズ	水（55℃ 20mL）		破壊→水		
	5 分	10 分	5 分	10 分	
8Fr.	良	—	—	—	・試験使用量：1g ・水溶解後 pH2.9

良：溶解またはすぐに懸濁

やや悪：懸濁しにくい

悪：溶解・懸濁せず分散しない

—：試験実施せず

（注）本試験結果は懸濁状態の安定性を保証するものではない。また、経管投与時の薬物動態、有効性、安全性の評価は行っていない。

2. その他の関連資料

該当資料なし