

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 2008 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

Ascorbic Acid Powder

ビタミンC散「フソー」- **50** mg
 ビタミンC散「フソー」- **100** mg

剤形	散剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	ビタミンC散「フソー」-50mg : 1g 中アスコルビン酸 50mg ビタミンC散「フソー」-100mg : 1g 中アスコルビン酸 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 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日 : 1986年3月8日 薬価基準収載年月日 : 1964年10月15日 発売年月日 : 1964年10月15日
開発・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 学術部門 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 http://www.fuso-pharm.co.jp/

本I Fは2013年2月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

I F 利用の手引きの概要 — 日本病院薬剤師会 —

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、添付文書と略す)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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す) 学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、I F と略す) の位置付け並びに I F 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において I F 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな I F 記載要領が策定された。

2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A 4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② I F 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「I F 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[I F の作成]

- ① I F は原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ② I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの I F の主旨に沿って必要な情報が記載される。

- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「I F 記載要領 2008」と略す）により作成された I F は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[I F の発行]

- ①「I F 記載要領 2008」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「I F 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「I F の記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での I T 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の I F については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。I F は日病薬の記載要領を受けて、該当医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、I F があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008 年 9 月)

目次

I. 概要に関する項目	1	V. 治療に関する項目	7
I-1 開発の経緯	1	V-1 効能又は効果	7
I-2 製品の治療学的・製剤学的特性	1	V-2 用法及び用量	7
II. 名称に関する項目	2	V-3 臨床成績	7
II-1 販売名	2	(1) 臨床データパッケージ	7
(1) 和名	2	(2) 臨床効果	7
(2) 洋名	2	(3) 臨床薬理試験：忍容性試験	7
(3) 名称の由来	2	(4) 探索的試験：用量反応探索試験	7
II-2 一般名	2	(5) 検証的試験	7
(1) 和名(命名法)	2	1) 無作為化並行用量反応試験	7
(2) 洋名(命名法)	2	2) 比較試験	7
(3) ステム	2	3) 安全性試験	7
II-3 構造式又は示性式	2	4) 患者・病態別試験	7
II-4 分子式及び分子量	2	(6) 治療的使用	7
II-5 化学名(命名法)	2	1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)	
II-6 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2	・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	7
II-7 CAS登録番号	2	2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要	7
III. 有効成分に関する項目	3	VI. 薬効薬理に関する項目	8
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	8
(1) 外観・性状	3	VI-2 薬理作用	8
(2) 溶解性	3	(1) 作用部位・作用機序	8
(3) 吸湿性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	8
(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点	3	(3) 作用発現時間・持続時間	8
(5) 酸塩基解離定数	3	VII. 薬物動態に関する項目	9
(6) 分配係数	3	VII-1 血中濃度の推移・測定法	9
(7) その他の主な示性値	3	(1) 治療上有効な血中濃度	9
III-2 有効成分の各種条件下における安定性	3	(2) 最高血中濃度到達時間	9
III-3 有効成分の確認試験法	3	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	9
III-4 有効成分の定量法	3	(4) 中毒域	9
IV. 製剤に関する項目(内用剤)	4	(5) 食事・併用薬の影響	9
IV-1 剤形	4	(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因	9
(1) 剤形の区別, 規格及び性状	4	VII-2 薬物速度論的パラメータ	9
(2) 製剤の物性	4	(1) コンパートメントモデル	9
(3) 識別コード	4	(2) 吸収速度定数	9
(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等	4	(3) バイオアベイラビリティ	9
IV-2 製剤の組成	4	(4) 消失速度定数	9
(1) 有効成分(活性成分)の含量	4	(5) クリアランス	9
(2) 添加物	4	(6) 分布容積	9
(3) その他	4	(7) 血漿蛋白結合率	9
IV-3 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意	4	VII-3 吸収	9
IV-4 製剤の各種条件下における安定性	4	VII-4 分布	9
IV-5 調製法及び溶解後の安定性	5	(1) 血液-脳関門通過性	9
IV-6 他剤との配合変化(物理化学的变化)	5	(2) 血液-胎盤関門通過性	9
IV-7 溶出性	6	(3) 乳汁への移行性	9
IV-8 生物学的試験法	6	(4) 髄液への移行性	9
IV-9 製剤中の有効成分の確認試験法	6	(5) その他の組織への移行性	9
IV-10 製剤中の有効成分の定量法	6	VII-5 代謝	10
IV-11 力価	6	(1) 代謝部位及び代謝経路	10
IV-12 混入する可能性のある夾雑物	6	(2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種	10
IV-13 治療上注意が必要な容器に関する情報	6	(3) 初回通過効果の有無及びその割合	10
IV-14 その他	6	(4) 代謝物の活性の有無及び比率	10

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	10	X-6 包装	15
VII-6 排泄	10	X-7 容器の材質	15
(1) 排泄部位及び経路	10	X-8 同一成分・同効薬	15
(2) 排泄率	10	X-9 国際誕生年月日	15
(3) 排泄速度	10	X-10 製造販売承認年月日及び承認番号	15
VII-7 透析等による除去率	10	X-11 薬価基準収載年月日	15
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	11	X-12 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	15
VIII-1 警告内容とその理由	11	X-13 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	16
VIII-2 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	11	X-14 再審査期間	16
VIII-3 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	11	X-15 投薬期間制限医薬品に関する情報	16
VIII-4 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	11	X-16 各種コード	16
VIII-5 慎重投与内容とその理由	11	X-17 保険給付上の注意	16
VIII-6 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	11	XI. 文献	17
VIII-7 相互作用	11	XI-1 引用文献	17
(1) 併用禁忌とその理由	11	XI-2 その他の参考文献	17
(2) 併用注意とその理由	11	XII. 参考資料	18
VIII-8 副作用	11	XII-1 主な外国での発売状況	18
(1) 副作用の概要	11	XII-2 海外における臨床支援情報	18
(2) 重大な副作用と初期症状	11	XIII. 備考	19
(3) その他の副作用	11	その他の関連資料	19
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	11		
(5) 基礎疾患, 合併症, 重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度	11		
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	11		
VIII-9 高齢者への投与	12		
VIII-10 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与	12		
VIII-11 小児等への投与	12		
VIII-12 臨床検査結果に及ぼす影響	12		
VIII-13 過量投与	12		
VIII-14 適用上の注意	12		
VIII-15 その他の注意	12		
VIII-16 その他	12		
IX. 非臨床試験に関する項目	14		
IX-1 薬理試験	14		
(1) 薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)	14		
(2) 副次的薬理試験	14		
(3) 安全性薬理試験	14		
(4) その他の薬理試験	14		
IX-2 毒性試験	14		
(1) 単回投与毒性試験	14		
(2) 反復投与毒性試験	14		
(3) 生殖発生毒性試験	14		
(4) その他の特殊毒性	14		
X. 管理的事項に関する項目	15		
X-1 規制区分	15		
X-2 有効期間又は使用期限	15		
X-3 貯法・保存条件	15		
X-4 薬剤取扱い上の注意点	15		
(1) 薬局での取り扱いについて	15		
(2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)	15		
X-5 承認条件等	15		

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・製剤学的特性

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。

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」-50mg
ビタミンC散「フソー」-100mg

(2) 洋名

Vitamin C Powder "Fuso" -50mg
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)

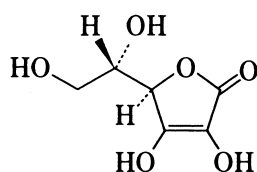
(2) 洋名(命名法)

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)

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

7. CAS登録番号

50-81-7 (アスコルビン酸)

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

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

- 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

4. 有効成分の定量法

ヨウ素液滴定

IV. 製剤に関する項目（内用剤）

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 規格及び性状

剤形の区別： 散剤

規 格：

ビタミンC散「フソー」-50mg：1g 中アスコルビン酸 50mg を含む。

ビタミンC散「フソー」-100mg：1g 中アスコルビン酸 100mg を含む。

性 状： 白色の散剤である。

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

該当しない

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

IV-1. (1) の項 参照

(2) 添加物

賦形剤 乳糖水和物

賦形剤 バレイショデンプン

(3) その他

特になし

3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

ビタミンC散「フソー」-50mg

加速試験

保存条件	保存期間	保存形態	結 果
40±1℃ 75±5%RH	6 ヶ月	最終包装	変化なし

長期保存試験¹⁾

保存条件	保存期間	保存形態	結 果
25±2℃ 60±5%RH	3 年	最終包装	変化なし

IV. 製剤に関する項目（内用剤）

無包装状態での安定性試験

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
温度	40℃	6 ヶ月	無包装	変化なし
湿度	30℃ 75%RH	6 ヶ月		淡黄色に着色し、約 13% 含量低下する(規格外)
光	120 万 Lux・hr			変化なし

ビタミンC散「フソー」-100mg

加速試験

保存条件	保存期間	保存形態	結果
40±1℃ 75±5%RH	6 ヶ月	最終包装	変化なし

長期保存試験¹⁾

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

無包装状態での安定性試験

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
温度	40℃	6 ヶ月	無包装	変化なし
湿度	30℃ 75%RH	6 ヶ月		黄色に着色し、約 10% 含量低下する(規格外)
光	120 万 Lux・hr			変化なし

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）²⁾

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。

IV. 製剤に関する項目（内用剤）

7. 溶出性	該当しない
8. 生物学的試験法	該当しない
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	過マンガン酸カリウム試液の滴加 硫酸銅（Ⅱ）五水和物溶液及びピロールによる呈色反応
10. 製剤中の有効成分の定量法	2,6-ジクロロインドフェノールナトリウム試液滴定
11. 力価	該当しない
12. 混入する可能性のある夾雑物	該当資料なし
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	該当資料なし
14. その他	特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

◇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）
 ◇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：

- 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

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。

2. 用法及び用量

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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

該当資料なし

1) 無作為化並行用量反応試験

2) 比較試験

3) 安全性試験

4) 患者・病態別試験

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

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

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

◇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^{3,4)}。

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⁵⁾。

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⁶⁾。

◇副腎防禦作用⁷⁾

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。

◇メラニン生成に及ぼす影響⁸⁾

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し得る量が皮膚へ到達することが認められている。

(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

VII-1. の項 参照

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法	
(1) 治療上有効な血中濃度	該当資料なし
(2) 最高血中濃度到達時間 ⁹⁾	300mg 経口投与で 3 時間
(3) 臨床試験で確認された血中濃度 ²⁾	ヒトの半減期は 16 日といわれている。
(4) 中毒域	該当資料なし
(5) 食事・併用薬の影響	該当資料なし
(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因	該当資料なし
2. 薬物速度論的パラメータ	該当資料なし
(1) コンパートメントモデル	
(2) 吸収速度定数	
(3) バイオアベイラビリティ	
(4) 消失速度定数	
(5) クリアランス	
(6) 分布容積	
(7) 血漿蛋白結合率	
3. 吸収	該当資料なし
4. 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 ⁹⁾	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 ⁹⁾	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。

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

主に肝臓⁹⁾。

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ロン酸となり、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、これはジケトグロ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²⁾。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路⁹⁾

腎臓

(2) 排泄率⁹⁾

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%。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

血液透析⁹⁾：

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。

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 添付文書に記載なし

2. 禁忌内容とその理由
(原則禁忌を含む) 添付文書に記載なし

3. 効能又は効果に関連する
使用上の注意とその理由 添付文書に記載なし

4. 用法及び用量に関連する
使用上の注意とその理由 添付文書に記載なし

5. 慎重投与内容とその理由 添付文書に記載なし

6. 重要な基本的注意とその
理由及び処置方法 添付文書に記載なし

7. 相互作用 添付文書に記載なし

(1) 併用禁忌とその理由

(2) 併用注意とその理由

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状 添付文書に記載なし

(3) その他の副作用

	頻度不明
消 化 器	悪心・嘔吐、下痢等

(4) 項目別副作用発現頻度及
び臨床検査値異常一覧 該当資料なし

(5) 基礎疾患, 合併症, 重症
度及び手術の有無等背
景別の副作用発現頻度 該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対す
る注意及び試験法 該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

9. 高齢者への投与

添付文書に記載なし

10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与

添付文書に記載なし

11. 小児等への投与

添付文書に記載なし

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

(1) 各種の尿糖検査で、尿糖の検出を妨害することがある。

(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。(VIII-16. の項 参照)

13. 過量投与

添付文書に記載なし

14. 適用上の注意

添付文書に記載なし

15. その他の注意

添付文書に記載なし

16. その他

<参考>^{10~14)}

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化物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 → (Hb の POD 様作用) → H₂O + 活性酸素(O)

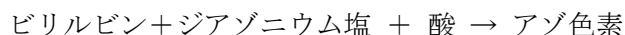
還元型クロモゲン + (O) → 酸化型クロモゲン (発色)

ヘモグロビンの POD 様作用 (偽ペルオキシダーゼ活性)

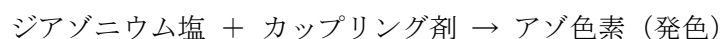
ペルオキシダーゼは過酸化水素を水素受容体として種々の物質の酸化を触媒する酵素の総称である。ヘモグロビンはペルオキシダーゼではないが、ペルオキシダーゼと同様な触媒作用を示すため、ヘモグロビンのペルオキシダーゼ様活性という。

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¹⁰⁾。
- ・ ビリルビン 25mg/dL で検査値に影響が出る¹¹⁾。
- ・ 亜硝酸塩 25mg/dL 以上で偽陰性となる可能性がある¹⁰⁾。

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¹⁴⁾。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¹⁰⁾。

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」参照)

(2) 副次的薬理試験

(3) 安全性薬理試験

(4) 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⁹⁾

①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。

②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⁹⁾

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巣の重量低下がみられ (卵巣の重量: 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、卵巣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) 生殖発生毒性試験¹⁵⁾

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。

(4) 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	該当しない
2. 有効期間又は使用期限	使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）
3. 貯法・保存条件	室温保存
4. 薬剤取扱い上の注意点	
(1) 薬局での取り扱いについて	該当資料なし
(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	該当資料なし
5. 承認条件等	該当しない
6. 包装	ビタミンC散「フソー」-50mg 500g ビタミンC散「フソー」-100mg 500g
7. 容器の材質	紙・(内袋) アルミニウム
8. 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
9. 国際誕生年月日	不明
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	製造販売承認年月日：1986年3月8日 承認番号： ビタミンC散「フソー」-50mg：(61AM)第2215号 ビタミンC散「フソー」-100mg：(61AM)第2216号
11. 薬価基準収載年月日	薬価基準収載日：1964年10月15日 発売年月日：1964年10月15日
12. 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-13. の項 参照

X. 管理的事項に関する項目

13. 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	<p>◇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）</p> <p>◇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）</p> <p>◇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：</p> <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>	<p>◇壊血病、メルレルバロー病。</p> <p>◇アジソン病、悪性貧血、各種中毒、色素沈着症。</p> <p>◇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。</p> <p>◇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。</p> <p>◇骨折、骨膜炎、歯槽膿漏などの骨・歯牙疾患時。</p> <p>◇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。</p>				
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%;"> <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	<p>各種の尿糖検査で、尿糖の検出を妨害することがある。</p>	記載なし				

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

16. 各種コード

	HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
散 50 mg	107119103	3140001B1066	613140016
散 100 mg	107120704	3140001B2100	613140025

17. 保険給付上の注意

特になし

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 扶桑薬品工業株式会社 (安定性試験) 社内資料
- 2) 第十六改正 日本薬局方解説書, C-63 (2011)
- 3) Fullmer, H. M. et al., Ann. New York Acad. Sci., **92**, 286 (1961)
- 4) 梶原 章, 最新医学, **17**, 1429 (1962)
- 5) Gould, B. S. et al., J. Biol. Chem., **226**, 289 (1957)
- 6) Priest, R. E., Nature, **225**, 744 (1970)
- 7) Bacchus, H. et al., Science, **113**, 269 (1951)
- 8) 竹内 勝 ほか, ビタミン, **28**, 501 (1963)
- 9) JPDI 2001, じほう, 15 (2001)
- 10) 伊藤 機一 ほか, 臨床と薬物治療, **11**, 202 (1992)
- 11) 南雲 文夫, 日本臨床, **43**, 1607 (1985)
- 12) 金井 正光, 臨床検査法提要 改訂第 30 版, 金原出版 102, 143, 174 (1993)
- 13) 水田 亘, 検査と技術, **20**, 62 (1992)
- 14) 村田 晃 ほか, ビタミン, **69**, 175 (1995)
- 15) Froberg, H. et al., Arzneim. Forsch., **23**, 1081 (1973)

2. その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

- | | |
|-----------------|--------|
| 1. 主な外国での発売状況 | 該当しない |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 該当資料なし |

XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし