

# 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

<p>日本薬局方</p> <p>処方せん医薬品</p> <h2>キシリトール注射液</h2> <p>Xylitol Injection</p> <p>キシリトール注10%「フソー」</p> <p>キシリトール注20%「フソー」</p>
---

剤形	水性注射液
製剤の規制区分	処方せん医薬品(注意—医師等の処方せんにより使用すること)
規格・含量	キシリトール 10w/v% キシリトール 20w/v%
一般名	和名：キシリトール (JAN) 洋名： <i>meso</i> -Xylitol (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：2006年8月17日(販売名変更による) 薬価基準収載年月日：1996年7月5日 発売年月日：1996年7月5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 <a href="http://www.fuso-pharm.co.jp/">http://www.fuso-pharm.co.jp/</a>

本 I F は 2006 年 12 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	IV-13 治療上注意が必要な容器に関する情報	5
I-1 開発の経緯	1	IV-14 その他	5
I-2 製品の治療学的・製剤学的特性	1		
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	6
II-1 販売名	2	V-1 効能又は効果	6
(1) 和名	2	V-2 用法及び用量	6
(2) 洋名	2	V-3 臨床成績	6
(3) 名称の由来	2	(1) 臨床データパッケージ	6
II-2 一般名	2	(2) 臨床効果	6
(1) 和名(命名法)	2	(3) 臨床薬理試験：忍容性試験	6
(2) 洋名(命名法)	2	(4) 探索的試験：用量反応探索試験	6
(3) ステム	2	(5) 検証的試験	6
II-3 構造式又は示性式	2	1) 無作為化並行用量反応試験	6
II-4 分子式及び分子量	2	2) 比較試験	6
II-5 化学名(命名法)	2	3) 安全性試験	6
II-6 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2	4) 患者・病態別試験	6
II-7 CAS登録番号	2	(6) 治療的使用	6
III. 有効成分に関する項目	3	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)	6
III-1 物理化学的性質	3	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	6
(1) 外観・性状	3		
(2) 溶解性	3	VI. 薬効薬理に関する項目	7
(3) 吸湿性	3	VI-1 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	7
(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点	3	VI-2 薬理作用	7
(5) 酸塩基解離定数	3	(1) 作用部位・作用機序	7
(6) 分配係数	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	7
(7) その他の主な示性値	3	(3) 作用発現時間・持続時間	7
III-2 有効成分の各種条件下における安定性	3	VII. 薬物動態に関する項目	8
III-3 有効成分の確認試験法	3	VII-1 血中濃度の推移・測定法	8
III-4 有効成分の定量法	3	(1) 治療上有効な血中濃度	8
IV. 製剤に関する項目(注射剤)	4	(2) 最高血中濃度到達時間	8
IV-1 剤形	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	8
(1) 剤形の区別, 規格及び性状	4	(4) 中毒域	8
(2) 溶液及び溶解時の pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等	4	(5) 食事・併用薬の影響	8
(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類	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	8
IV-2 製剤の組成	4	VII-2 薬物速度論的パラメータ	8
(1) 有効成分(活性成分)の含量	4	(1) コンパートメントモデル	8
(2) 添加物	4	(2) 吸収速度定数	8
(3) 電解質の濃度	4	(3) バイオアベイラビリティ	8
(4) 添付溶液の組成及び容量	4	(4) 消失速度定数	8
(5) その他	4	(5) クリアランス	8
IV-3 注射液の調製法	4	(6) 分布容積	8
IV-4 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意	4	(7) 血漿蛋白結合率	8
IV-5 製剤の各種条件下における安定性	4	VII-3 吸収	8
IV-6 溶解後の安定性	5	VII-4 分布	8
IV-7 他剤との配合変化(物理化学的变化)	5	(1) 血液-脳関門通過性	8
IV-8 生物学的試験法	5	(2) 血液-胎盤関門通過性	8
IV-9 製剤中の有効成分の確認試験法	5	(3) 乳汁への移行性	8
IV-10 製剤中の有効成分の定量法	5	(4) 髄液への移行性	8
IV-11 力価	5	(5) その他の組織への移行性	8
IV-12 混入する可能性のある夾雑物	5		

VII-5	代謝	9	X-4	薬剤取扱い上の注意点	14
	(1)代謝部位及び代謝経路	9		(1)薬局での取り扱いについて	14
	(2)代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種	9		(2)薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)	14
	(3)初回通過効果の有無及びその割合	9	X-5	承認条件等	14
	(4)代謝物の活性の有無及び比率	9	X-6	包装	14
	(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	9	X-7	容器の材質	14
VII-6	排泄	9	X-8	同一成分・同効薬	14
	(1)排泄部位及び経路	9	X-9	国際誕生年月日	14
	(2)排泄率	9	X-10	製造販売承認年月日及び承認番号	14
	(3)排泄速度	9	X-11	薬価基準収載年月日	14
VII-7	透析等による除去率	9	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	14
<b>VIII.</b>	<b>安全性(使用上の注意等)に関する項目</b>	<b>10</b>	X-13	再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	15
VIII-1	警告内容とその理由	10	X-14	再審査期間	15
VIII-2	禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	10	X-15	投薬期間制限医薬品に関する情報	15
VIII-3	効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	10	X-16	各種コード	15
VIII-4	用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	10	X-17	保険給付上の注意	15
VIII-5	慎重投与内容とその理由	10	<b>XI.</b>	<b>文献</b>	<b>16</b>
VIII-6	重要な基本的注意とその理由及び処置方法	10	XI-1	引用文献	16
VIII-7	相互作用	10	XI-2	その他の参考文献	16
	(1)併用禁忌とその理由	10	<b>XII.</b>	<b>参考資料</b>	<b>17</b>
	(2)併用注意とその理由	10	XII-1	主な外国での発売状況	17
VIII-8	副作用	10	XII-2	海外における臨床支援情報	17
	(1)副作用の概要	10	<b>XIII.</b>	<b>備考</b>	<b>18</b>
	(2)重大な副作用と初期症状	10		その他の関連資料	18
	(3)その他の副作用	11			
	(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	11			
VIII-10	妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与	11			
VIII-11	小児等への投与	11			
VIII-12	臨床検査結果に及ぼす影響	11			
VIII-13	過量投与	11			
VIII-14	適用上の注意	12			
VIII-15	その他の注意	12			
VIII-16	その他	12			
<b>IX.</b>	<b>非臨床試験に関する項目</b>	<b>13</b>			
IX-1	薬理試験	13			
	(1)薬効薬理試験(「VI.薬効薬理に関する項目」参照)	13			
	(2)副次的薬理試験	13			
	(3)安全性薬理試験	13			
	(4)その他の薬理試験	13			
IX-2	毒性試験	13			
	(1)単回投与毒性試験	13			
	(2)反復投与毒性試験	13			
	(3)生殖発生毒性試験	13			
	(4)その他の特殊毒性	13			
<b>X.</b>	<b>管理的事項に関する項目</b>				
X-1	規制区分	14			
X-2	有効期間又は使用期限	14			
X-3	貯法・保存条件	14			

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯<sup>1)</sup>

1953年 Cohen、Horecker、Racker によって五炭糖が生化学の分野で解糖系につながるという、いわゆるブドウ糖の酸化的経路が確立された。

1960～1961年に Mellinshoff、Lang は糖尿病患者の代用糖としての検討を開始した。1962年 Lang、Unbehaun、Prellwitz、Bässler らは臨床的利用面について検討した結果、糖尿病患者の輸液に有効であろうと示唆した。そして本品はブドウ糖や果糖などの六炭糖と同じようにエネルギー源となるほか、核酸など体成分の生合成や体内解毒機構に関与する生理的に重要な代謝物としても知られるようになった。その後、本品はインスリンの作用を介せず細胞内に取り込まれ、血糖に影響を与えず、強い抗ケトン作用を持つなど、六炭糖に見られないすぐれた特性が判明し、糖尿病の代謝異常の是正や糖質の補給に好適な補液として用いられるようになった。

「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成12年9月19日医薬発第935号）により、2006年8月17日付で、キシリット10%-PLからキシリトール注10%「フソー」へ、キシリット20%-PLからキシリトール注20%「フソー」へ販売名変更の承認を受けた。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

糖尿病及び糖尿病状態時の水・エネルギー補給。

スノープルは頭部を軽く捻るだけで簡単に開封できるポリエチレン製のアンプルである。

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

キシリトール注 10% 「フソー」  
キシリトール注 20% 「フソー」

#### (2) 洋名

10% Xylitol Injection " Fuso"  
20% Xylitol Injection " Fuso"

#### (3) 名称の由来

該当しない

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

キシリトール (JAN)

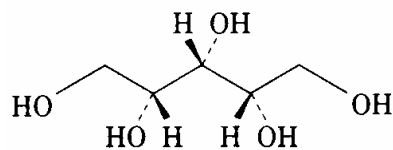
#### (2) 洋名 (命名法)

*meso*-Xylitol (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 :  $C_5H_{12}O_5$   
分子量 : 152.15

### 5. 化学名 (命名法)

*meso*-Xylitol

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

特になし

### 7. CAS登録番号

87-99-0

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の結晶又は粉末で、においはなく、味は甘い。

##### (2) 溶解性

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

##### (3) 吸湿性

吸湿性である。

相対湿度 60% まではほとんど吸湿しないが、70% で約 1.3% 吸湿し、これ以上で急激に吸湿量を増し、82% では約 50% 吸湿する (37°C)。

各糖アルコールの臨界湿度を比較すると、ソルビトール (約 50%) > キシリトール (約 60%) > キシロース (約 70%) > マンニトール (約 90%) の順である。

##### (4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点

93.0~95.0°C

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

pH: 5.0 g を新たに煮沸して冷却した水 10 mL に溶かした液の pH は 5.0~7.0 である。

赤外吸収スペクトル:  $\nu_{\text{OH}}$ : 3375  $\text{cm}^{-1}$        $\delta_{\text{OH}}$ : 1420  $\text{cm}^{-1}$   
 $\nu_{\text{C-O}}$ : 1125~1065  $\text{cm}^{-1}$

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

- (1) 糖アルコールと硫酸鉄 (II) 試液の反応
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法

#### 4. 有効成分の定量法

チオ硫酸ナトリウム液による滴定



## IV. 製剤に関する項目（注射剤）

### 1. 剤形

(1) 剤形の区別，規格及び性状

剤形の区別：水性注射液

規 格：

キシリトール注 10%「フソー」：

1 ポリアル（プラスチックアンプル）20 mL 中キシリトール 2 g（10w/v%）を含む。

キシリトール注 20%「フソー」：

1 ポリアル（プラスチックアンプル）20 mL 中キシリトール 4 g（20w/v%）を含む。

性 状：無色澄明で、味は甘い。

(2) 溶液及び溶解時の pH，浸透圧比，粘度，比重，安定な pH 域等

	pH	浸透圧比
キシリトール注 10%「フソー」	4.5～7.5	2.3～2.7
キシリトール注 20%「フソー」		4.5～5.1*

\*（1→4）希釈溶液で測定

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

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

該当しない

(3) 電解質の濃度

該当資料なし

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

特になし

### 3. 注射液の調製法

該当しない

4. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

	保存条件	保存期間	保存形態	結 果
10%	室温	48 ヶ月	最終包装	変化なし
20%				

## IV. 製剤に関する項目（注射剤）

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

酸、アルカリ、種々の無機イオンで外観変化はみられないという。また、緩衝性がないので混合する他剤の pH の影響を受けやすい<sup>2)</sup>。

### <pH 変動スケール>

・キシリトール注 10% 「フソー」

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0 mL (0.1 mol/L HCl)					10.0 mL→ (0.1 mol/L NaOH)								
	1.45				5.58 (試料 pH)				12.24					

・キシリトール注 20% 「フソー」

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0 mL (0.1 mol/L HCl)					10.0 mL→ (0.1 mol/L NaOH)								
	1.45				5.62 (試料 pH)				12.09					

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

薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

チオ硫酸ナトリウム液による滴定

11. 力価

本剤は力価表示に該当しない

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

特になし

14. その他

特になし

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	糖尿病及び糖尿病状態時の水・エネルギー補給。
2. 用法及び用量	<p>キシリトールとして、通常成人1日2～50gを1～数回に分けて静脈内注射又は点滴静注する。</p> <p>なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、キシリトールとして1日量100gまでとする。</p> <p>点滴静注する場合、その速度はキシリトールとして0.3g/kg/hr以下とすること。</p>
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

糖質（ブドウ糖、果糖、マルトース、D-ソルビトール等）

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

◇代謝経路<sup>3)</sup>

(2) 薬効を裏付ける試験成績

糖質代謝には、ブドウ糖で代表される六炭糖が分解されピルビン酸となってエネルギー産生過程に入るエムデン・マイエルホーフ経路とよばれる解糖系代謝経路のほかに、グルクロン酸・キシロース経路、五炭糖・リン酸経路があり、それぞれ生体にとって重要な役割を果たしていることが明らかにされている。

キシリトールはこれらの代謝経路の中間代謝産物であり、インシュリンの介在なく細胞内にとりこまれ、リン酸化されることなく直接代謝系へ導入される。

◇生体における利用（インシュリン非依存性）

点滴静注後のキシリトールのウサギ血中からの消失は速やかで、血糖値の上昇も少なく、生体で良好に代謝、利用されることを示唆する成績が得られている<sup>4)</sup>。

またラット（正常、アロキサン糖尿病）における実験で、インシュリンはキシリトールの分布相に影響しないことが示されている<sup>5)</sup>。

ヒトでの観察でも、静注後の血糖値、尿酸値、血中キシリトール値の変動が、糖尿病例、非糖尿病例で差がなかったことが認められている<sup>6)</sup>。

このように、キシリトールはインシュリンを必要とせず代謝系に入るため、糖尿病状態時の糖質補給剤として有用である。

◇抗ケトン作用、蛋白節約作用

糖質投与の主な目的はエネルギーを補給し、蛋白異化や脂肪酸化を防ぐことにあるが、キシリトールはすぐれた抗ケトン作用、蛋白節約作用を示す。

アロキサン糖尿病ラットにおける尿中アセトン排泄量は、キシリトールの経口投与期間中有意に低かったことが示されており<sup>7)</sup>、また糖尿病のヒトに静注し、血中ケトン体、NEFA が減少したことが報告されている<sup>8)</sup>。

一方、ウサギを用いた実験で、10日間の絶食期間中ブドウ糖、キシリトールを含む液を静注した場合、尿中への窒素排泄が著しく低下し、特にキシリトールの投与で、この窒素節約作用がより著明であったことが示されている<sup>9)</sup>。

(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	該当資料なし
(3) 臨床試験で確認された血中濃度 <sup>10)</sup>	若年正常人に 0.5 g/kg 静脈内注射したとき、終了時 34 mg%、120 分後に投与前値に戻る。
(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	該当しない
4. 分布	該当資料なし
(1) 血液－脳関門通過性	
(2) 血液－胎盤関門通過性	
(3) 乳汁への移行性	
(4) 髄液への移行性	
(5) その他の組織への移行性	

## 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

糖質代謝には、ブドウ糖で代表される六炭糖が分解されピルビン酸となってエネルギー産生過程に入るエムデン・マイエルホーフ経路とよばれる解糖系代謝経路のほかに、グルクロン酸・キシロース経路、五炭糖・リン酸経路があり、それぞれ生体にとって重要な役割を果していることが明らかにされている。

キシリトールはこれらの代謝経路の中間代謝産物であり、インシュリンの介在なく細胞内にとりこまれ、リン酸化されることなく直接代謝系に導入される<sup>3)</sup>。すなわち、NADを補酵素とし酵素的（キシリトール脱水素酵素）に酸化されてD-キシロースとなり、ATPと適当なキナーゼによってD-キシロース-5-リン酸となって、五炭糖・リン酸経路に合流する<sup>1)</sup>。五炭糖・リン酸経路、解糖系を経て、CO<sub>2</sub>、H<sub>2</sub>O、乳酸に代謝される。代謝部位は肝が最も活性が高く、次いで腎、精巣、小腸、心、肺などである<sup>10)</sup>。

#### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450等)の分子種

VII-5. (1) の項 参照

#### (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<sup>10)</sup>

尿中

#### (2) 排泄率<sup>10)</sup>

ヒトにキシリトール 0.5 g/kg/90min で点滴静注した場合、8~12%が尿中に排泄される。ラットにキシリトールを投与した場合、50%以上が酸化されて呼気中に排出される。

#### (3) 排泄速度

該当資料なし

### 7. 透析等による除去率

該当資料なし

## 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	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)	<b>低張性脱水症の患者</b> (解説) 本症はナトリウムの欠乏により血清の浸透圧が低張になることによって起こる。このような患者に本剤を投与すると、水分量を増加させることになり、症状が悪化するおそれがある。
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	<b>(1) 尿崩症の患者</b> (解説) 本症には適切な水分、電解質管理が必要であり、本剤の投与により電解質等に影響を与え、症状が悪化するおそれがある。 <b>(2) 肝障害、腎障害のある患者</b> (解説) キシリトールの大量を急速投与すると肝障害、腎障害があらわれるおそれがある。
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 (1) 併用禁忌とその理由  (2) 併用注意とその理由	添付文書に記載なし
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

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(3) その他の副作用

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。

	頻度不明
大量・急速投与	キシリトールの大量を急速投与すると電解質喪失、肝障害、腎障害

(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

特になし

9. 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、投与速度を緩徐にし、減量するなど注意すること。

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

添付文書に記載なし

13. 過量投与

添付文書に記載なし

V-2.、VIII-8. (3)、VIII-14.、VIII-15. の項 参照



## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 14. 適用上の注意

(1) 皮下大量投与：皮下大量投与により、血漿中から電解質が移動して循環不全を招くおそれがあるので、皮下投与しないこと。

#### (2) 投与前：

- 1) 投与に際しては、感染に対する配慮をすること（患者の皮膚や器具消毒）。
- 2) 体温程度に温めて使用すること。
- 3) 開封後直ちに使用し、残液は決して使用しないこと。

(3) 投与速度：ゆっくり静脈内に投与すること。

(4) 高濃度液投与：高濃度液投与の急激な中止により、低血糖を起こすおそれがある。

### 15. その他の注意<sup>1)</sup>

キシリトールの大量を急速に静注した場合、諸臓器、特に腎、脳にシュウ酸カルシウムの沈着が認められたとの報告がある。

### 16. その他

特になし

## 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<sup>9)</sup>

ウサギにおいてキシリトールの静脈内注入速度と毒性との関連が検討されている。

臨床投与速度に相当する5%液0.13 mL/kg/minでは40時間以上でも死亡例はなく、LD<sub>50</sub>は520 mL/kg以上であったことが示されている。

しかし、投与速度が速すぎれば肝障害を起こす危険がある。すなわち、0.68 g/kg/hr、3時間20分の投与では肝機能に影響をみないが、1.2、2.1 g/kg/hrで肝機能検査値の悪化を認めている。また4 g/kg/日、3日間投与の実験でも、0.4 g/kg/hrでは影響はないが、1.2 g/kg/hrの速度では肝機能の低下があらわれている。

(1) 単回投与毒性試験

ウサギにおけるLD<sub>50</sub>は520 mL/kg以上（5%液として）である。

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(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	製剤：処方せん医薬品（注意－医師等の処方せんにより使用すること）
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	該当しない
(1) 薬局での取り扱いについて	該当しない
(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	該当しない
5. 承認条件等	該当しない
6. 包装	<p>キシリトール注 10%「フソー」 20 mL 10 ポリアル（スノープル） 50 ポリアル（スノープル）</p> <p>キシリトール注 20%「フソー」 20 mL 10 ポリアル（スノープル） 50 ポリアル（スノープル）</p> <p>スノープル：頭部を軽く捻るだけで簡単に開封できるポリエチレン製のアンプルである。</p>
7. 容器の材質	ポリエチレン
8. 同一成分・同効薬	<p>同一成分薬：キシリトール製剤</p> <p>同 効 薬：ブドウ糖製剤、果糖製剤</p>
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	<p>製造販売承認年月日：10%：2006年 8月 17日（販売名変更による） 20%：2006年 8月 17日（販売名変更による）</p> <p>承 認 番 号：10%：21800AMX10676 20%：21800AMX10675</p>
11. 薬価基準収載年月日	<p>薬価基準収載年月日：1996年 7月 5日</p> <p>発 売 年 月 日：1996年 7月 5日</p>
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 10 月 28 日

内容：

	変 更 後	変 更 前
効能・効果	糖尿病及び糖尿病状態時の水・エネルギー補給。	糖尿病時の代謝異常是正の補液。
用法・用量	<p>キシリトールとして、通常成人 1 日 2～50 g を 1～数回に分けて静脈内注射又は点滴静注する。</p> <p>なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、キシリトールとして 1 日量 100g までとする。</p> <p>点滴静注する場合、その速度はキシリトールとして 0.3 g/kg/hr 以下とすること。</p>	<p><b>10%</b>：キシリトールとして 10～30 g を 1 日量として 1～3 回に分けて静注または点滴静注します。</p> <p><b>20%</b>：キシリトールとして 10～30 g を 1 日量として 1～3 回に分けて静注します。</p> <p>いずれの場合も必要に応じ、キシリトールとして 1 日 100 g まで増量することができます。</p>

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

キシリトール注 10%「フソー」

HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
107410906	3234400A4015 (3234400A4112)	643230013 (620004400)

キシリトール注 20%「フソー」

HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
107413010	3234400A8215	620004401

注：統一名収載品において、薬価基準収載医薬品コード欄の（ ）内は個別医薬品コード、レセプト電算コード欄の（ ）内は銘柄名コードを示す。

17. 保険給付上の注意

特になし

## XI. 文 献

### 1. 引用文献

- 1) 第十五改正 日本薬局方解説書, C-1040 (2006)
- 2) 注射剤の配合変化, エフ・コピント・富士書院, 1305 (2002)
- 3) Harper, H. A., Review of Physiological Chemistry, 13th ed., 227 (1971)
- 4) 下重正子, 糖尿病, **10**, 427 (1967)
- 5) Bäessler, K. H. et al., Klin. Wschr., **42**, 94 (1964)
- 6) Prellwitz, W. et al., Klin Wschr., **41**, 196 (1963)
- 7) Bäessler, K. H. et al., Klin. Wschr., **41**, 593 (1963)
- 8) Yamagata, S. et al., Lancet, **2**, 918 (1965)
- 9) Igarashi, T. et al., Tohoku J. Exp. Med., **111**, 147 (1973)
- 10) JPDI 2006, じほう, 438 (2006)
- 11) Schröder, R. et al., Schriftenreihe Intensivmedizin, Notfallmedizin, Anästhesiologie, **14**, 15 (1979)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## 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