

規 制 区 分	
処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）	
貯 法	室温保存
使用期限	外箱、アンプルに表示

日本薬局方 **アスコルビン酸注射液**  
 ※ **アスコルビン酸注射液100mg「ツルハラ」**  
**Ascorbic Acid Injections 100mg「TSURUHARA」**

承認番号	22700AMX 00163000
薬価収載	2015年6月
販売開始	1989年9月

【組成・性状】

組 成

アスコルビン酸注射液100mg「ツルハラ」は1管（1mL）中アスコルビン酸100mg及び添加物としてピロ亜硫酸ナトリウム0.5mg、L-システイン塩酸塩水和物0.5mg、ベンジルアルコール10mg、炭酸水素ナトリウムを含有する。

製剤の性状

アスコルビン酸注射液100mg「ツルハラ」は無色透明なガラスアンプルに入った無色透明な注射液で浸透圧比は約4、pHは5.6～7.4である。（浸透圧比：生理食塩液に対する比）

【効能・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。
  - (1) 毛細管出血（鼻出血、歯肉出血、血尿など）
  - (2) 薬物中毒
  - (3) 副腎皮質機能障害
  - (4) 骨折時の骨基質形成・骨癒合促進
  - (5) 肝斑・雀卵斑・炎症後の色素沈着
  - (6) 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。

【用法・用量】

アスコルビン酸として、通常成人1日50～2,000mgを1～数回に分けて皮下、筋肉内又は静脈内注射する。  
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

※※ (1) 小児等への投与

低出生体重児、新生児に使用するには十分注意すること。  
 [外国において、ベンジルアルコールの静脈内大量投与(99～234mg/kg)により、中毒症状(あえぎ呼吸、アシドーシス、痙攣等)が低出生体重児に発現したとの報告がある。本剤は添加剤としてベンジルアルコールを含有している。]

(2) 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。

(3) 適用上の注意

1) 投与経路

経口投与が困難な場合や緊急の場合、また、経口投与で効果が不十分と考えられる場合にのみ使用すること。また、投与経路は静脈内注射を原則とすること。なお、経口投与が可能で効果が十分と判断された場合には、速やかに経口投与にきりかえること。

2) 投与時

1. 静脈内注射により、血管痛があらわれることがあるので、注射速度はできるだけ遅くすること。
2. 皮下・筋肉内注射により、注射部位に疼痛があらわれることがある。

3) 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、必要最小限に行うこと。なお、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、幼児、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、部位をかえて注射すること。

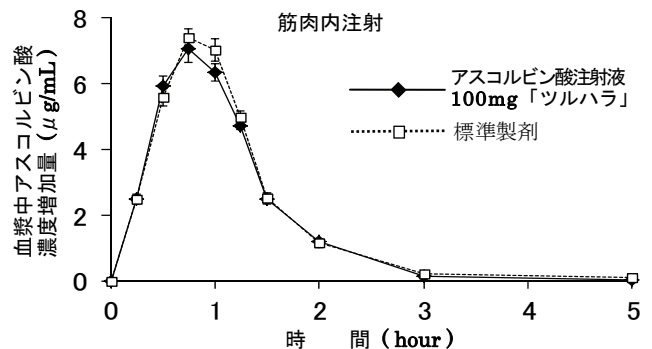
4) アンプルカット時

本剤はワンポイントカットアンプルを使用しているので、丸印マークを上にして両側に引っばるよう下方に折り曲げカットすること。なお、異物の混入を避けるため、アンプルカット直前にカット部分をエタノール綿等で清拭してカットすること。

【薬物動態】

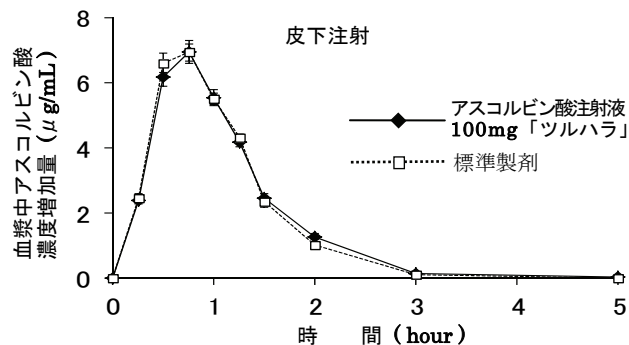
生物学的同等性試験

アスコルビン酸注射液100mg「ツルハラ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2mL（アスコルビン酸200mg）を健康成人男子に絶食時単回筋肉内注射<sup>1)</sup>、または単回皮下注射<sup>2)</sup>して血漿中未変化体濃度を測定し、投与前値からの増加量を算出した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



筋肉内注射	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-5</sub> (μg・hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
アスコルビン酸注射液 100mg「ツルハラ」	8.7±0.3	7.4±0.4	0.7±0.1	0.4±0.0
標準製剤 (注射剤、10%)	9.1±0.3	7.8±0.3	0.8±0.0	0.4±0.0

(Mean±S.E., n=12)



皮下注射	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-5</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g/mL}$ )	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
アスコルビン酸注射液 100mg 「ツルハラ」	8.5 ± 0.3	7.2 ± 0.2	0.7 ± 0.0	0.4 ± 0.0
標準製剤 (注射剤、10%)	8.3 ± 0.3	7.5 ± 0.3	0.6 ± 0.0	0.4 ± 0.0

(Mean ± S.E., n=12)

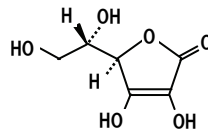
血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

#### 【薬効薬理】

- マウス線維芽細胞でコラーゲン中のプロリンからヒドロキシプロリンへの水酸化過程に関与し結合線維成分であるコラーゲン合成を促進することが示されており<sup>3)</sup>、血管、骨、皮膚などの脆弱化を防止して出血傾向の抑制(マウス)<sup>4)</sup>や骨折の修復を促進(モルモット)する。
- アスコルビン酸欠乏時に肝のγ-アミノレブロン酸合成酵素活性が低下し、ラット肝マイクロソームの P-450 量も低下することから薬物代謝への関与が示唆されている<sup>5)</sup>。
- ラットでエビネフリン投与によるストレス負荷時に副腎での好酸球減少や皮質内層でのステロイドホルモン、アスコルビン酸の減少を抑制する<sup>6)</sup>。
- in vitro でチロシンからメラニン生成反応の酸化過程を阻害し、メラニン色素の沈着を抑制する。

#### 【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：アスコルビン酸 (Ascorbic Acid)

化学名：L-threo-Hex-2-enono-1,4-lactone

分子式：C<sub>6</sub>H<sub>8</sub>O<sub>6</sub>

分子量：176.12

旋光度：[α]<sub>D</sub><sup>20</sup>：+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。

性状：アスコルビン酸は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。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。

融点：約 190°C (分解)

#### 【取扱上の注意】

安定性試験<sup>7)</sup>

最終包装製品を用いた加速試験(40°C、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、アスコルビン酸注射液 100mg 「ツルハラ」は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。

#### 【包装】

1mL×200 管

#### 【主要文献】

- 1) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 2) 鶴原製薬株式会社 社内資料
- 3) Levene, C. I. et al.: Biochim. Biophys. Acta, 257, 384(1972)
- 4) Lee, R. E.: J. Nutr., 72, 203(1960)
- 5) 力石サダ: ビタミン, 56(4), 177(1982)
- 6) Bacchus, H. et al.: Science, 113, 269(1951)
- 7) 鶴原製薬株式会社 社内資料

#### 【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

鶴原製薬株式会社 医薬情報部

〒 563-0036 大阪府池田市豊島北 1 丁目 1 6 番 1 号

TEL: 072-761-1456 (代表) FAX: 072-760-5252



製造販売元  
鶴原製薬株式会社

大阪府池田市豊島北 1 丁目 16 番 1 号

( TC9-60 15-1911 )  
A911-S

