

◎ビタミンC注射液「フソー」 [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】アスコルビン酸 (U) ascorbic acid 【分類】ビタミンC製剤

【単位】◎500mg/A [2mL]

【常用量】1日 50~2000mg

【用法】静注

【透析患者への投与方法】透析患者にはVC 欠乏時に最小用量に制限すべきである (proc EDTA-ERA 22:147-51,1985)

【その他の報告】腎不全時慎重投与 (1) TSATが高いにもかかわらずエリスロポエチンの効果が低い症例に透析後 500mg 静注が有効 (Keven K, et al: Am J Kidney Dis 41: 1233-9, 2003)

週1回 250mg 投与では血清VC 濃度の正常下限にしかならず、週1回 500mg 投与では血清VC 濃度は正常化するが、1年以上の長期投与でシュウ酸濃度が過飽和になる。そのため、投与期間が数ヶ月以内の短期間であるなら週1回 500mg 投与してもよいと思われる (5)

VCの欠乏には内服で100mg/日程度であれば高シュウ酸血症にはなりにくい (Morgan SH, et al: Nephrol Dial Transplant 3: 28-32,1988)

透析患者の血漿シュウ酸濃度は健常者の30~40倍に上昇している (Canavesi C, et al: Am J Kidney Dis 45: 540-9,2005)

VCの代謝物のシュウ酸が蓄積しシュウ酸Caが組織に沈着するため100mg/日以下が望ましい (Nephron 39:112-6,1985)

EPO抵抗性を示す透析患者で血清フェリチンが100ng/mL以上あるにもかかわらず鉄飽和率が低値を示し、機能的鉄欠乏状態にあると思われる患者に対してVCを静注投与すると組織貯蔵鉄の遊離を促進してrHuEPOの反応性を改善する (Kidney Int 55: 2477-2486,1999 および臨床透析 15: 777-780,1999) 機能的鉄欠乏状態の患者に100mg 週3回あるいは500mg 週1回透析後静注を行ったところ貧血の改善が見られた (透析会誌 34:1491-1496,2001)

【PD】PD患者に100mg/日投与時、血中シュウ酸値は有意に上昇するが、VB6を10mg 併用すると上昇は抑制できる (Am J Kidney Dis 20:42-49,1992)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 10mL/min以上：減量の必要なし、Ccr<10mL/min：100~200mg/日 (5)

【特徴】生体内の水素化反応に関与し、還元型金属イオンを必要とする酵素に電子を供給するコファクターとして働く。生体内で生じるフリーラジカルや過酸化脂質は生体組織の障害作用を示すが、VCはVEとともに活性酸素のスカベンジャーとしての意義を持つ。

【主な副作用・毒性】ほとんど報告されていないが、経口剤では消化器症状がある

【安全性に関する情報】健常人にVCを大量投与しても尿中シュウ酸排泄量は増加しない (J Urol 151: 834-7, 1994) 熱傷に対して大量投与を行った結果、急性腎障害を引き起こした2例 (長野 修, 他: 日救急医学会誌 23: 199-204, 2012)

【モニターすべき項目】血清、血漿、パフコート中のアスコルビン酸濃度

【代謝】肝で代謝 (U) 還元されデヒドロアスコルビン酸に、さらに2, 3-ジケト-L-グルコン酸からシュウ酸またはL-トレオン酸になる (Canavesi C, et al: Am J Kidney Dis 45: 540-9,2005)

【排泄】腎で排泄、大量投与時を除いて未変化体や代謝物としての排泄はほとんどない (U) 60mg/日の投与では尿中未変化体排泄率は20~25%だが投与量が増すと代謝能力に限りがあるため糸球体濾過および尿管分泌の増加により尿中未変化体排泄率は上昇する (Canavesi C, et al: Am J Kidney Dis 45: 540-9,2005)

【t1/2】3~4h (8)

【蛋白結合率】25% (U) Albと結合しないか蛋白結合率は低い (Canavesi C, et al: Am J Kidney Dis 45: 540-9, 2005)

【MW】176.12

【透析性】除去率56% (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinetics 32: 30-57,1997) 透析性は約50%であるが、VC投与、非投与如何に関わらず、44hr後の透析前にはもとの値に戻る (Int J Vitam Nutr Res 67: 262-6,1997) 透析で除去される (U) 血漿濃度低下率は38~59%で、投与量が増加するとともに除去率も上昇する。除去量は38~100mg/session (Canavesi C, et al: Am J Kidney Dis 45: 540-9, 2005) 透析中のT1/2 : 7.5h (8)

【透析CL】7.5mL/min (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinetics 32: 30-57,1997)

【TDMのポイント】TDMの対象にはならない

【相互作用】鉄の吸収を促進するが、鉄が大量 (60mg以上) の場合は影響がみられない (Bendich A, et al: Toxicol Lett 51: 189-201, 1990 PMID: 2184546)

【備考】健常人にVCを大量投与しても尿中シュウ酸排泄量は増加しないという報告もある (J Urol 151, 834-837,1994) 透析患者でVCが低下しているという報告はほとんどが1984年以前のものであり、1985年以降の報告ではほとんどが低下していないとされている。さらにVCが二次性高シュウ酸血症を増悪させることが明らかとなったため、現在ではVCの過量投与は戒められている。このため、食事摂取が十分な患者には補給の必要なし、または100mg/日以内の最小量にとどめるべきである (遠山純子: 腎と透析増刊号 150-155,1992) 投与速度が速い場合にはfree radicalの発生原因となる可能性があるため、投与量は少量にしてゆっくり投与するのが望ましい (Chen WT et al: Am J Kidney Dis 42:158,2003) シュウ酸結石症患者ではシュウ酸の消化管吸収と内因性のシュウ酸生成の両者が亢進している (Chai W, et al: Am J Kidney Dis 44:1060,2004)

【更新日】20171026

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。