2024年5月改訂(第7版)

日本標準商品分類番号
873234

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のＩＦ記載要領2018(2019年更新版)に準拠して作成

キシリトール製剤

日本薬局方

キシリトール注射液

処方箋医薬品

キシリトール注10%「フソー」
キシリトール注20%「フソー」

Xylitol Injection "FUSO"

剤形	水性注射剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	10%：1管（20mL）中　日局 キシリトール 2g 20%：1管（20mL）中　日局 キシリトール 4g
一般名	和名：キシリトール（JAN） 洋名：*meso*-Xylitol（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	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 販売開始年月日：1996年7月5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ＩＦは2024年1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。

医薬品インタビューフォーム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）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、ＩＦ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ＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ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ＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦ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ＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦ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ＩＦ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ＩＦ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、「ＩＦ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. ＩＦとは

ＩＦ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。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ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ＩＦ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ＩＦ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。

ＩＦ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. ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦ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ＩＦを作成・提供するが、ＩＦの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やＩＦ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、ＩＦ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、ＩＦ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、ＩＦ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

ＩＦ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。ＩＦ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ＩＦ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、ＩＦ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
Ⅰ-1 開発の経緯 …… 1
Ⅰ-2 製品の治療学的特性 …… 1
Ⅰ-3 製品の製剤学的特性 …… 1
Ⅰ-4 適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
Ⅰ-5 承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
(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
Ⅱ-1 販売名 …… 2
(1)和名 …… 2
(2)洋名 …… 2
(3)名称の由来 …… 2
Ⅱ-2 一般名 …… 2
(1)和名(命名法) …… 2
(2)洋名(命名法) …… 2
(3)ステム …… 2
Ⅱ-3 構造式又は示性式 …… 2
Ⅱ-4 分子式及び分子量 …… 2
Ⅱ-5 化学名(命名法)又は本質 …… 2
Ⅱ-6 慣用名，別名，略号，記号番号 …… 2

Ⅲ. 有効成分に関する項目 …… 3
Ⅲ-1 物理化学的性質 …… 3
(1)外観・性状 …… 3
(2)溶解性 …… 3
(3)吸湿性 …… 3
(4)融点(分解点)，沸点，凝固点 …… 3
(5)酸塩基解離定数 …… 3
(6)分配係数 …… 3
(7)その他の主な示性値 …… 3
Ⅲ-2 有効成分の各種条件下における安定性 …… 3
Ⅲ-3 有効成分の確認試験法，定量法 …… 3

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
(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
(2)包装 …… 5
(3)予備容量 …… 5
(4)容器の材質 …… 5
Ⅳ-11 別途提供される資材類 …… 6
Ⅳ-12 その他 …… 6

Ⅴ. 治療に関する項目 …… 7
Ⅴ-1 効能又は効果 …… 7
Ⅴ-2 効能又は効果に関連する注意 …… 7
Ⅴ-3 用法及び用量 …… 7
(1)用法及び用量の解説 …… 7
(2)用法及び用量の設定経緯・根拠 …… 7
Ⅴ-4 用法及び用量に関連する注意 …… 7
Ⅴ-5 臨床成績 …… 7
(1)臨床データパッケージ …… 7
(2)臨床薬理試験 …… 7
(3)用量反応探索試験 …… 7
(4)検証的試験 …… 7
1)有効性検証試験 …… 7
2)安全性試験 …… 7
(5)患者・病態別試験 …… 7
(6)治療的使用 …… 7
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 … 7
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

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 …… 9
Ⅵ-1 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 … 9
Ⅵ-2 薬理作用 …… 9
(1)作用部位・作用機序 …… 9
(2)薬効を裏付ける試験成績 …… 9
(3)作用発現時間・持続時間 …… 9

Ⅶ. 薬物動態に関する項目 …… 10
Ⅶ-1 血中濃度の推移 …… 10
(1)治療上有効な血中濃度 …… 10
(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 …… 10

Ⅶ-5 分布 11
(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 11
(3)初回通過効果の有無及びその割合 11
(4)代謝物の活性の有無及び活性比，存在比率 11
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 14
(7)小児等 14
(8)高齢者 14
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 14
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
(7)その他の特殊毒性 16

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 17
Ⅹ-1 規制区分 17
Ⅹ-2 有効期間 17
Ⅹ-3 包装状態での貯法 17
Ⅹ-4 取扱い上の注意 17
Ⅹ-5 患者向け資材 17
Ⅹ-6 同一成分・同効薬 17
Ⅹ-7 国際誕生年月日 17
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 17
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 17
Ⅹ-10 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 18
Ⅹ-11 再審査期間 18
Ⅹ-12 投薬期間制限に関する情報 18
Ⅹ-13 各種コード 18
Ⅹ-14 保険給付上の注意 18

Ⅺ. 文献 19
Ⅺ-1 引用文献 19
Ⅺ-2 その他の参考文献 19

Ⅻ. 参考資料 20
ⅫⅡ-1 主な外国での発売状況 20
ⅫⅡ-2 海外における臨床支援情報 20

ⅩⅢ. 備考 21
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 21
(1)粉砕 21
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 21
ⅩⅢ-2 その他の関連資料 21

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

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 Mellinghoff、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[1)]。

「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．製品の治療学的特性

効能・効果は、糖尿病及び糖尿病状態時の水・エネルギー補給。

３．製品の製剤学的特性

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。

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材，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材	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

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

特になし

２．一般名

(1)和名(命名法)

キシリトール (JAN)

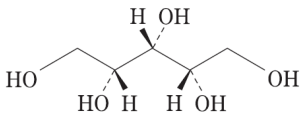
(2)洋名(命名法)

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)又は本質

meso-Xylitol (JAN)

６．慣用名，別名，略号，記号番号

特になし

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℃）。

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℃

(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：5.0g を新たに煮沸して冷却した水 10mL 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：ν_{OH}：3375cm^{-1}、δ_{OH}：1420cm^{-1}、$\nu_{C\text{-}O}$：1125～1065cm^{-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，定量法

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

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

１．剤形

(1)剤形の区別

水性注射剤

(2)製剤の外観及び性状

無色澄明の液で、味は甘い。

(3)識別コード

該当しない

(4)製剤の物性

	キシリトール注 10%「フソー」	キシリトール注 20%「フソー」
pH	4.5～7.5	
浸透圧比 （生理食塩液に対する比）	2.3～2.7	4.5～5.1*

＊（1→4）希釈液で測定

(5)その他

特になし

２．製剤の組成

(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販売名	キシリトール注 10%「フソー」	キシリトール注 20%「フソー」
容量	20mL	20mL
有効成分	1 管中 日局 キシリトール 2g	1 管中 日局 キシリトール 4g

(2)電解質等の濃度

該当しない

(3)熱量

キシリトール注 10%「フソー」	8kcal/20mL
キシリトール注 20%「フソー」	16kcal/20mL

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

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
10%	25℃±2℃ 60%RH±5%RH	3年	最終包装	変化なし
20%				

7. 調製法及び溶解後の安定性

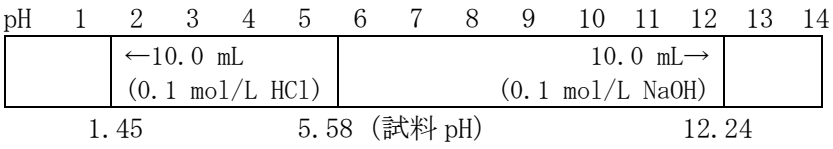
該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

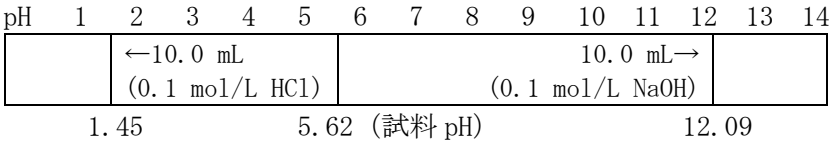
酸、アルカリ、種々の無機イオンで外観変化はみられないという。また、緩衝性がないので混合する他剤のpHの影響を受けやすい[3)]。

＜pH変動スケール＞

・キシリトール注10%「フソー」



・キシリトール注20%「フソー」



9. 溶出性

該当しない

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

特になし

(2) 包装

〈キシリトール注10%「フソー」〉

20mL 50管 プラスチックアンプル

〈キシリトール注20%「フソー」〉

20mL 50管 プラスチックアンプル

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ポリエチレン

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

糖尿病及び糖尿病状態時の水・エネルギー補給

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

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。
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。
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。

(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

(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

該当資料なし

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

該当資料なし

(7)その他

該当資料なし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学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）

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

キシリトールはインスリンの介助を要することなく細胞内に取り込まれるので､インスリン欠乏による糖利用障害時においてもキシリトールの代謝は妨げられず､また血糖値を上昇させることもない。キシリトールはグルクロン酸-キシルロース回路でグロン酸から生成される生理的代謝産物でもあるので、その忍容性も高い。細胞内移行は速やかで、抗ケトン作用を現す。また細胞内に取り込まれ、代謝の最初の段階で補酵素を還元する[1)]。

(2)薬効を裏付ける試験成績

◇生体における利用（インスリン非依存性）

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[4)]。

またラット（正常、アロキサン糖尿病）における実験で、インス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[5)]。

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[6)]。

このように､キシリトールはインスリンを必要とせず代謝系に入るので､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[7)]、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[8)]。

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[9)]。

(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

(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

若年正常人に 0.5g/kg 静脈内注射したとき、終了時 34mg%、120 分後に投与前値に戻る[10]。

(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

該当資料なし

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

４．吸収

該当しない

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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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

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・キシルロース経路、ペントースリン酸経路があり、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､インス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[11]。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-キシルロースとなり、ATP と適当なキナーゼによって D-キシルロース-5-リン酸となって、ペントースリン酸経路に合流する[1]。ペントースリン酸経路、解糖系を経て、CO_2、H_2O、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[10]。

(2)代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種，寄与率

Ⅶ-6.(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活性比，存在比率

該当資料なし

７．排泄

排泄部位及び経路：尿中[10)]

排泄率：ヒトにキシリトール 0.5g/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[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

該当資料なし

９．透析等による除去率

該当資料なし

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

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

低張性脱水症の患者［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

8. 重要な基本的注意

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。

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

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 尿崩症の患者

水分、電解質等に影響を与えるため、症状が悪化するおそれがある。

(2)腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

キシリトールの大量を急速投与すると腎障害があらわれるおそれがある。

(3)肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

キシリトールの大量を急速投与すると肝障害があらわれるおそれがある。

(4)生殖能を有する者

設定されていない

(5)妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

(6)授乳婦

9.6 授乳婦
治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7)小児等

9.7 小児等
小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8)高齢者

9.8 高齢者
投与速度を緩徐にし、減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

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
大量・急速投与	電解質喪失、肝障害、腎障害

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

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 全般的な注意

使用時には、感染に対する配慮をすること。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 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。

14.2.2 ゆっくり静脈内に投与すること。

14.2.3 残液は使用しないこと。

12. その他の注意

(1)臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

キシリトールの大量を急速投与すると、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[12-15]。

(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

ウサギにおける LD_{50} は 520mL/kg 以上（5%液として）である。

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 0.13mL/kg/min では 40 時間以上でも死亡例はなく、LD_{50} 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、0.68g/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、2.1g/kg/hr で肝機能検査値の悪化を認めている。また 4g/kg/日、3 日間投与の実験でも、0.4g/kg/hr では影響はないが、1.2g/kg/hr の速度では肝機能の低下があらわれている[9)]。

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(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

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(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：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：該当しない

２．有効期間

3 年

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

以下の場合には使用しないこと。

・容器表面に水滴や結晶が認められる場合

・容器から薬液が漏れている場合

・性状その他薬液に異状が認められる場合

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：キシリトール製剤

同効薬：ブドウ糖製剤、果糖製剤

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

	10%	20%
製造販売承認年月日	2006 年 8 月 17 日（販売名変更による）	
承認番号	21800AMX10676	21800AMX10675
薬価基準収載年月日	1996 年 7 月 5 日	
販売開始年月日	1996 年 7 月 5 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

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 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	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。 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。 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。	10% ：キシリトールとして10～30g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。 20% ：キシリトールとして10～30gを1日量として1～3回に分けて静注します。 いずれの場合も必要に応じ、キシリトールとして1日100gまで増量することができます。

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
10%	107410906	3234400A4015	3234400A4112	643230013 (620004400)
20%	107413010	3234400A8010	3234400A8215	643230018 (620004401)

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

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の基礎的医薬品である。

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-1502-1506
2) 扶桑薬品工業株式会社（長期保存試験）社内資料
3) 福嶋豁行 ほか：注射剤の配合変化，第２版 エフ・コピント・富士書院. 2002：1305-1308
4) 下重正子：糖尿病. 1967；10：427-433
5) Bässler, K. H., et al.：Klin. Wochenschr. 1964；42：94-95
6) Prellwitz, W., et al.：Klin. Wochenschr. 1963；41：196-199
7) Bässler, K. H., et al.：Klin. Wochenschr. 1963；41：593-595
8) Yamagata, S., et al.：Lancet. 1965；2：918-924
9) Igarashi, T., et al.：Tohoku J. Exp. Med. 1973；111：147-155
10) JPDI 2006 じほう. 2006：438-440
11) Harper, H. A., Review of Physiological Chemistry, 13th ed. Blackwell Scientific Publications. 1971；227-262
12) Thomas, D. W., et al.：Med. J. Aust. 1972；1：1238-1246
13) Evans, G. W., et al.：J. Clin. Pathol. 1973；26：32-36
14) Schröder, R., et al.：In Sieberth, H.G. (Ed.), Akutes Nierenversagen, Schriftenreihe Intensivmedizin,Notfallmedizin,Anästhesiologie,Bd.1979;14:15-19 (Thieme, Stuttgart)
15) Schröder, R., Dtsch. Med. Wochenschr. 1980；105：997-1001

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

(1)本剤と同一製剤は外国で発売されていない。

(2)キシリトール製剤としては、各国で販売されている。(2024 年 5 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

(1) 粉砕

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

該当しない

２．その他の関連資料

該当資料なし