

※2017年5月改訂(第6版)  
※2014年1月改訂

貯法：室温、密閉容器に保存  
使用期限：容器に表示  
注意：湿った空気中で徐々に分解するので注意すること

解熱・鎮痛・消炎剤  
川崎病用剤

日本薬局方 アスピリン  
アスピリン「バイエル」

日本標準商品分類番号	
871143, 873399	
承認番号	21700AMY00243
薬価収載	2006年3月
販売開始	2006年3月



Aspirin Bayer

D7

### ■ 禁忌(次の患者には投与しないこと)

#### 1. 川崎病を除く効能又は効果に使用する場合

- (1)本剤又はサリチル酸系製剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2)消化性潰瘍のある患者[プロスタグランジン生合成抑制作用により、胃の血流量が減少し、消化性潰瘍を悪化させることがある。(ただし、「1. 慎重投与」の項参照)]
- (3)重篤な血液の異常のある患者[血小板機能障害を起こし、血液の異常をさらに悪化させるおそれがある。]
- (4)重篤な肝障害のある患者[肝障害をさらに悪化させるおそれがある。]
- (5)重篤な腎障害のある患者[腎障害をさらに悪化させるおそれがある。]
- (6)重篤な心機能不全のある患者[腎のプロスタグランジン生合成抑制作用により、浮腫、循環体液量の増加が起こり、心臓の仕事量が増加するため、心機能をさらに悪化させるおそれがある。]
- (7)アスピリン喘息(非ステロイド性消炎鎮痛剤等による喘息発作の誘発)又はその既往歴のある患者[重篤なアスピリン喘息発作を誘発させることがある。]
- (8)出産予定日12週以内の妊婦[「6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照]

#### 2. 川崎病(川崎病による心血管後遺症を含む)に使用する場合

- (1)本剤又はサリチル酸系製剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2)消化性潰瘍のある患者[プロスタグランジン生合成抑制作用により、胃の血流量が減少し、消化性潰瘍を悪化させることがある。(ただし、「1. 慎重投与」の項参照)]
- (3)出血傾向のある患者[血小板機能異常が起こることがあるため、出血傾向を助長するおそれがある。]
- (4)アスピリン喘息(非ステロイド性消炎鎮痛剤等による喘息発作の誘発)又はその既往歴のある患者[重篤なアスピリン喘息発作を誘発させることがある。]
- (5)出産予定日12週以内の妊婦[「6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照]

### ■ 組成・性状

販売名	アスピリン「バイエル」
成分・含量	1g中、日局アスピリン1g含有
色・剤形	白色の結晶、粒又は粉末

### ■ 効能・効果

- ①関節リウマチ、リウマチ熱、変形性関節症、強直性脊椎炎、関節周囲炎、結合織炎、術後疼痛、歯痛、症候性神経痛、関節痛、腰痛症、筋肉痛、捻挫痛、打撲痛、痛風による痛み、頭痛、月経痛
- ②下記疾患の解熱・鎮痛  
急性上気道炎(急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む)
- ③川崎病(川崎病による心血管後遺症を含む)

### ■ 用法・用量

#### 効能・効果①の場合

通常、成人にはアスピリンとして、1回0.5~1.5g、1日1.0~4.5gを経口投与する。  
なお、年齢、疾患、症状により適宜増減する。ただし、上記の最高量までとする。

#### 効能・効果②の場合

通常、成人にはアスピリンとして、1回0.5~1.5gを頓用する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、原則として1日2回までとし、1日最大4.5gを限度とする。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。

#### 効能・効果③の場合

急性期有熱期間は、アスピリンとして1日体重1kgあたり30~50mgを3回に分けて経口投与する。解熱後の回復期から慢性期は、アスピリンとして1日体重1kgあたり3~5mgを1回経口投与する。  
なお、症状に応じて適宜増減する。

#### 用法・用量に関連する使用上の注意

- (1)原則として川崎病の診断がつき次第、投与を開始することが望ましい。
- (2)川崎病では発症後数ヶ月間、血小板凝集能が亢進しているため、川崎病の回復期において、本剤を発症後2~3ヶ月間投与し、その後断層心エコー図等の冠動脈検査で冠動脈障害が認められない場合には、本剤の投与を中止すること。冠動脈瘤を形成した症例では、冠動脈瘤の退縮が確認される時期まで投与を継続することが望ましい。
- (3)川崎病の治療において、低用量では十分な血小板機能の抑制が認められない場合もあるため、適宜、血小板凝集能の測定等を考慮すること。

### ■ 使用上の注意

#### 1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1)消化性潰瘍の既往歴のある患者[消化性潰瘍を再発させることがある。]
- (2)血液の異常又はその既往歴のある患者[血液の異常を悪化又は再発させるおそれがある。]

- (3)出血傾向のある患者〔血小板機能異常が起こることがあるため、出血傾向を助長するおそれがある。効能・効果①及び②の場合〕
- (4)肝障害又はその既往歴のある患者〔肝障害を悪化又は再発させるおそれがある。〕
- (5)腎障害又はその既往歴のある患者〔腎障害を悪化又は再発させるおそれがある。〕
- (6)心機能異常のある患者〔腎のプロスタグランジン生合成抑制作用により、浮腫、循環体液量の増加が起こり、心臓の仕事量が増加するため、心機能をさらに悪化させるおそれがある。〕
- (7)過敏症の既往歴のある患者
- (8)気管支喘息のある患者〔気管支喘息の患者の中にはアスピリン喘息患者も含まれており、それらの患者では重篤な喘息発作を誘発させることがある。〕
- (9)アルコールを常飲している患者〔アルコールと同時に服用すると、消化管出血を誘発又は増強することがある。〔3.相互作用〕の項参照〕
- (10)高齢者〔2.重要な基本的注意〕及び〔5.高齢者への投与〕の項参照〕
- (11)妊婦(ただし、出産予定日12週以内の妊婦は禁忌)又は妊娠している可能性のある婦人〔6.妊婦、産婦、授乳婦等への投与〕の項参照〕
- (12)小児〔7.小児等への投与〕の項参照〕
- (13)手術、心臓カテーテル検査又は抜歯前1週間以内の患者〔手術、心臓カテーテル検査又は抜歯時の失血を増加させるおそれがある。〔2.重要な基本的注意〕の項参照〕
- (14)非ステロイド性消炎鎮痛剤の長期投与による消化性潰瘍のある患者で、本剤の長期投与が必要であり、かつミソプロストールによる治療が行われている患者〔ミソプロストールは非ステロイド性消炎鎮痛剤により生じた消化性潰瘍を効能・効果としているが、ミソプロストールによる治療に抵抗性を示す消化性潰瘍もあるので、本剤を継続投与する場合には、十分経過を観察し、慎重に投与すること。〕

## 2. 重要な基本的注意

- (1)サリチル酸系製剤の使用実態は我が国と異なるものの、米国においてサリチル酸系製剤とライ症候群との関連性を示す疫学調査報告があるので、本剤を15歳未満の水痘、インフルエンザの患者に投与しないことを原則とするが、やむを得ず投与する場合には、慎重に投与し、投与後の患者の状態を十分に観察すること。〔ライ症候群：小児において極めてまれに水痘、インフルエンザ等のウイルス性疾患の先行後、激しい嘔吐、意識障害、痙攣(急性脳浮腫)と肝臓ほか諸臓器の脂肪沈着、ミトコンドリア変形、AST(GOT)・ALT(GPT)・LDH・CK(CPK)の急激な上昇、高アンモニア血症、低プロトロンビン血症、低血糖等の症状が短期間に発現する高死亡率の病態である。〕
- (2)解熱鎮痛剤による治療は原因療法ではなく対症療法であることに留意すること。
- (3)慢性疾患(関節リウマチ、変形性関節症等)に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
  - 1)長期投与する場合には、定期的に臨床検査(尿検査、血液検査及び肝機能検査等)を行うこと。また、異常が認められた場合には減量、休薬等の適切な措置を講じること。
  - 2)薬物療法以外の療法も考慮すること。
- (4)急性疾患に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
  - 1)疼痛、発熱の程度を考慮し投与すること。

2)原則として同一の薬剤の長期投与を避けること。

3)原因療法があればこれを行うこと。

- (5)患者の状態を十分観察し、副作用の発現に留意すること。過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等があらわれることがあるので、特に高熱を伴う小児及び高齢者又は消耗性疾患の患者においては、投与後の患者の状態に十分注意すること。
- (6)感染症を不顕性化するおそれがあるので、感染による炎症に対して用いる場合には適切な抗菌剤を併用し、観察を十分に行い慎重に投与すること。
- (7)他の消炎鎮痛剤との併用を避けることが望ましい。
- (8)高齢者及び小児には副作用の発現に特に注意し、必要最小限の使用にとどめるなど慎重に投与すること。
- (9)手術前1週間以内にアスピリンを投与した例では失血量が有意に増加したとの報告があるので、術前の投与は慎重に行うこと。
- (10)川崎病の急性期に対して投与する場合には、適宜、肝機能検査を行い、異常が認められた場合には減量、休薬等の適切な措置を講ずること。
- (11)川崎病患者(川崎病による心血管後遺症を含む)に対して長期投与する場合には、定期的に臨床検査(尿検査、血液検査及び肝機能検査等)を行うこと。また、異常が認められた場合には減量、休薬等の適切な措置を講ずること。

## 3. 相互作用

併用注意(併用に注意すること)

	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
*	抗凝固剤 クマリン系抗凝固剤 ワルファリンカリウム	クマリン系抗凝固剤の作用を増強し、出血時間の延長、消化管出血等を起こすことがあるので、クマリン系抗凝固剤を減量するなど慎重に投与すること。	本剤は血漿蛋白に結合したクマリン系抗凝固剤と置換し、遊離させる。また、本剤は血小板凝集抑制作用、消化管刺激による出血作用を有する。
	血液凝固阻止剤 ヘパリン製剤 ダナパロイドナトリウム 第Xa因子阻害剤 リバーロキサパン等 抗トロンビン剤 ダビガトランエテキシラートメタンスルホン酸塩等 トロンボモデュリン アルファ等	これら薬剤との併用により、出血の危険性が増大するおそれがあるのので、観察を十分に行い、注意すること。	本剤は血小板凝集抑制作用を有するため、これら薬剤との併用により出血傾向が増強されるおそれがある。

	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
*	血小板凝集抑制作用を有する薬剤 チクロピジン塩酸塩 シロスタゾール クロピドグレル硫酸塩 トロンボキサン合成阻害剤 オザグレルナトリウム プロスタグランジンE <sub>1</sub> 製剤, E <sub>1</sub> 及びE <sub>2</sub> 誘導体制剤 ベラプロストナトリウム等 サルボグレラート塩酸塩 イコサペント酸エチル等	これら薬剤との併用により, 出血の危険性が増大するおそれがあるので, 観察を十分に行い, 注意すること.	本剤は血小板凝集抑制作用を有するため, これら薬剤との併用により出血傾向が増強されるおそれがある.
*	血栓溶解剤 ウロキナーゼ t-PA製剤等		
	糖尿病用剤 ヒトインスリン トルブタミド等	糖尿病用剤の作用を増強し, 低血糖を起こすことがあるので, 糖尿病用剤を減量するなど慎重に投与すること.	本剤は血漿蛋白に結合した糖尿病用剤と置換し, 遊離させる. また, 本剤は大量で血糖降下作用を有する.
*	メトトレキサート	メトトレキサートの副作用(骨髄抑制, 肝・腎・消化器障害等)が増強されることがある.	本剤は血漿蛋白に結合したメトトレキサートと置換し, 遊離させる. また, 本剤はメトトレキサートの腎排泄を阻害すると考えられている.
	バルプロ酸ナトリウム	バルプロ酸ナトリウムの作用を増強し, 振戦等を起こすことがある.	本剤は血漿蛋白に結合したバルプロ酸ナトリウムと置換し, 遊離させる.
	フェニトイン	総フェニトイン濃度を低下させるが, 非結合型フェニトイン濃度を低下させないとの報告があるので, 総フェニトイン濃度に基づいて増量する際には臨床症状等を慎重に観察すること.	本剤は血漿蛋白に結合したフェニトインと置換し, 遊離させる.

	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
	副腎皮質ホルモン剤 ベタメタゾン プレドニゾン メチルプレドニゾン等	本剤との併用時に副腎皮質ホルモン剤を減量すると, サリチル酸中毒を起こすことが報告されている. また, 消化管出血を増強させることが考えられる.	機序は不明.
	リチウム製剤	リチウム中毒を起こすことが報告されている.	本剤は腎のプロスタグランジンの生合成を抑制し, 腎血流量を減少させることにより, リチウムの腎排泄を低下させることが考えられる.
	チアジド系利尿剤 ヒドロクロロチアジド等 ループ利尿剤 フロセミド	これらの薬剤の作用を減弱させることが報告されている.	本剤は腎のプロスタグランジンの生合成を抑制して, 水, 塩類の体内貯留が生じ, 利尿剤の水, 塩類排泄作用に拮抗するためと考えられる.
	β遮断剤 プロプラノロール塩酸塩 ピンドロール等 ACE阻害剤 エナラプリルマレイン酸塩等	これらの薬剤の作用を減弱させることが報告されている.	本剤は血管拡張作用を有する腎プロスタグランジンの生合成, 遊離を抑制し, 血圧を上昇させることが考えられる.
	ニトログリセリン製剤	ニトログリセリンの作用を減弱させることがある.	本剤はプロスタグランジンの生合成を抑制することにより, 冠動脈を収縮させ, ニトログリセリンの作用を減弱させることが考えられる.
*	尿酸排泄促進剤 プロベネシド ベンズプロマロン	これらの薬剤の作用を減弱させることがある.	本剤はこれらの薬剤の尿酸排泄に拮抗する.
	乳酸ナトリウム	本剤の作用を減弱させることがある.	乳酸ナトリウムにより尿がアルカリ性となり, サリチル酸の尿中排泄が増加し, 血中濃度が治療域以下になることがある.

	薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
*	非ステロイド性解熱鎮痛消炎剤 インドメタシン ジクロフェナク ナトリウム等	出血及び腎機能の低下を起すことがある。	作用機序は不明。
**	イブプロフェン ナプロキセン ピロキシカム	本剤の血小板凝集抑制作用を減弱するとの報告がある。	血小板のシクロオキシゲナーゼ-1 (COX-1)と本剤の結合を阻害するためと考えられる。
	炭酸脱水酵素阻害剤 アセタゾラミド 等	アセタゾラミドの副作用を増強し、嗜眠、錯乱等の中枢神経系症状、代謝性アシドーシス等を起すことが報告されている。	本剤は血漿蛋白に結合したアセタゾラミドと置換し、遊離させる。
	ドネベジル塩酸塩	消化性潰瘍を起すことがある。	コリン系が賦活され胃酸分泌が促進される。
	タクロリムス水和物、シクロスポリン	腎障害が発現することがある。	腎障害の副作用が相互に増強されると考えられる。
	ザフィルルカスト	ザフィルルカストの血漿中濃度が上昇することがある。	機序不明。
	プロスタグランジンD <sub>2</sub> 、トロンボキサンA <sub>2</sub> 受容体拮抗剤 ラマトロバン、セラトロダスト	ヒト血漿蛋白結合に対する相互作用の検討(in vitro)において、本剤によりこれらの薬剤の非結合型分率が上昇することがある。	これら薬剤が本剤と血漿蛋白結合部位で置換し、遊離型血中濃度が上昇すると考えられる。
*	選択的セロトニン再取り込み阻害剤 (SSRI) フルボキサミン マレイン酸塩 塩酸セルトラリン等	皮膚の異常出血(斑状出血、紫斑等)、出血症状(胃腸出血等)が報告されている。	SSRIの投与により血小板凝集が阻害され、本剤との併用により出血傾向が増強すると考えられる。
	アルコール	消化管出血が増強されるおそれがある。	アルコールによる胃粘膜障害と本剤のプロスタグランジン合成阻害作用により、相加的に消化管出血が増強すると考えられる。

#### 4. 副作用

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。

##### (1) 重大な副作用 (頻度不明)

\* 1) ショック、アナフィラキシー：ショックやアナフィラキシー（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等）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し、適切な処置を行うこと。

##### 2) 出血：

脳出血等の頭蓋内出血：脳出血等の頭蓋内出血（初期症状：頭痛、悪心・嘔吐、意識障害、片麻痺等）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

肺出血、消化管出血、鼻出血、眼底出血等：肺出血、消化管出血、鼻出血、眼底出血等があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

\* 3) 中毒性表皮壊死融解症 (Toxic Epidermal Necrolysis: TEN)、皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群)、剥脱性皮膚炎：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群、剥脱性皮膚炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4) 再生不良性貧血、血小板減少、白血球減少：再生不良性貧血、血小板減少、白血球減少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し、適切な処置を行うこと。

5) 喘息発作の誘発：喘息発作を誘発することがある。

6) 肝機能障害、黄疸：AST (GOT)、ALT (GPT)、γ-GTP等の著しい上昇を伴う肝機能障害や黄疸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。

7) 消化性潰瘍、小腸・大腸潰瘍：下血(メレナ)を伴う胃潰瘍・十二指腸潰瘍等の消化性潰瘍があらわれることがある。また、消化管出血、腸管穿孔を伴う小腸・大腸潰瘍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し、適切な処置を行うこと。

##### (2) その他の副作用

	頻度不明	0.1~5%未満	0.1%未満
消化器	食欲不振、胸やけ、悪心・嘔吐、胃痛、胃腸障害、腹痛、便秘、下痢、食道炎、口唇腫脹、吐血、胃部不快感等		
過敏症 <sup>注1)</sup>	蕁麻疹	発疹、浮腫、鼻炎様症状等	
血液 <sup>注2)</sup>			貧血、血小板機能低下(出血時間延長)等
皮膚	掻痒、発汗		

	頻度不明	0.1～5% 未満	0.1%未満
精神神経系 <sup>注3)</sup>	めまい, 頭痛, 興奮		
肝 臓	AST (GOT) 上昇, ALT (GPT) 上昇		
腎 臓			腎障害
循 環 器	血圧低下, 血 管炎, 心窩部 痛		
呼 吸 器	気管支炎		
感 覚 器	耳鳴, 難聴, 角膜炎	結膜炎	
そ の 他 <sup>注4)</sup>	過呼吸, 代謝 性アシドーシ ス, 倦怠感, 低血糖等		

注1) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

注2) このような異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

注3) このような症状があらわれた場合には減量又は投与を中止すること。

注4) このような異常が認められた場合には減量又は投与を中止すること(血中濃度が著しく上昇していることが考えられる)。

#### 5. 高齢者への投与

高齢者では副作用があらわれやすいので、少量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。〔2. 重要な基本的注意〕の項参照]

#### 6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 出産予定日12週以内の妊婦には投与しないこと。〔妊娠期間の延長、動脈管の早期閉鎖、子宮収縮の抑制、分娩時出血の増加につながるおそれがある。海外での大規模な疫学調査では、妊娠中のアスピリン服用と先天異常児出産の因果関係は否定的であるが、長期連用した場合は、母体の貧血、産前産後の出血、分娩時間の延長、難産、死産、新生児の体重減少・死亡などの危険が高くなるおそれを否定できないとの報告がある。また、ヒトで妊娠末期に投与された患者及びその新生児に出血異常があらわれたとの報告がある。さらに、妊娠末期のラットに投与した実験で、弱い胎児の動脈管収縮が報告されている。〕

(2) 妊婦(ただし、出産予定日12週以内の妊婦は除く)又は妊娠している可能性のある婦人には、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。〔動物実験(ラット)で催奇形性作用があらわれたとの報告がある。妊娠期間の延長、過期産につながるおそれがある。〕

(3) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔母乳中へ移行することが報告されている。〕

#### 7. 小児等への投与

(1) 効能・効果①及び②の場合、低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立されていない。〔2. 重要な基本的注意〕の項参照]

(2) 小児等では、副作用があらわれやすいので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。川崎病の治療において肝機能障害の報告があるので、適宜、肝機能検査を行い、注意すること。〔2. 重要な基本的注意〕の項参照]

(3) 15歳未満の水痘、インフルエンザの患者に投与しないことを原則とするが、やむを得ず投与する場合には、慎重に投与し、投与後の患者の状態を十分に観察すること。〔2. 重要な基本的注意〕の項参照]

(4) 本剤投与中の15歳未満の川崎病の患者が水痘、インフルエンザを発症した場合には、投与を中断することを原則とするが、やむを得ず投与を継続する場合には、慎重に投与し、投与後の患者の状態を十分に観察すること。〔2. 重要な基本的注意〕の項参照]

#### 8. 過量投与

徴候と症状：耳鳴、めまい、頭痛、嘔吐、難聴、軽度の頻呼吸等の初期症状から血中濃度の上昇に伴い、重度の過呼吸、呼吸性アルカローシス、代謝性アシドーシス、痙攣、昏睡、呼吸不全等が認められる。〔薬物動態〕の項参照]

処 置：催吐、胃洗浄、活性炭投与(ただし、催吐及び胃洗浄後)、輸液注入によるアシドーシス是正、アルカリ尿促進(ただし、腎機能が正常の場合)、血液透析、腹膜透析を必要に応じて行う。

#### 9. 適用上の注意

##### 服用時：

- 1) 炭酸水素ナトリウム、炭酸マグネシウム等のアルカリ性製剤と配合しないこと。
- 2) 湿潤しやすい製剤との配合は望ましくない。
- 3) 本剤は空腹時の服用を避けることが望ましい。

#### 10. その他の注意

(1) *In vitro*の試験において、アスピリン等のグルクロン酸抱合により代謝される薬剤が抗ウイルス剤(ジドブジン)のグルクロン酸抱合を阻害したとの報告がある<sup>2)</sup>。

(2) 非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。

#### ■ 薬物動態

##### 分 布<sup>3)</sup>

サリチル酸は中枢神経系、母乳、胎児組織を含む全身の組織及び体液中に広く分布する。高濃度の分布が認められるのは血漿、肝臓、腎皮質、心臓、肺である。サリチル酸の蛋白結合率は血中濃度依存性を示し、低濃度域(<100 $\mu$ g/mL)では約90%であるのに対し、高濃度域(>400 $\mu$ g/mL)では約75%である。耳鳴等の過量投与の初期徴候は、血中サリチル酸濃度が約200 $\mu$ g/mLに達すると認められる。重度の毒性作用は400 $\mu$ g/mLを超えると発現する。〔8. 過量投与〕の項参照]

##### 代 謝<sup>3-5)</sup>

アスピリンは腸管での吸収過程及び生体内(主として肝臓)でサリチル酸に加水分解される。サリチル酸はさらに、生体内でグリシン抱合及びグルクロン酸抱合を受け、また、ごく一部は水酸化を受けゲンチジン酸に代謝される。血中濃度の上昇に伴い、サリチル酸代謝能は飽和に達し、全身クリアランスが低下する。毒性用量(10~20g)投与後では、サリチル酸の半減期は20時間を超えるほど延長することがある。

## 排泄<sup>3)</sup>

サリチル酸の腎クリアランスは尿pH依存性を示し、低pHでは5%未満であるが、pH>6.5では80%以上となることから、尿のアルカリ化は過量投与の処置上重要である。〔8. 過量投与〕の項参照

## 臨床成績

### 臨床効果<sup>6,7)</sup>

川崎病患者に対しアスピリンを急性期有熱期間には30~50mg/kg/日(患者の重症度に応じて免疫グロブリン製剤併用療法又はアスピリン単独療法を選択)、解熱後には5mg/kg/日を投与した試験等において、冠動脈障害の発生に対する抑制効果が認められている。

## 薬効薬理

### (1) 解熱作用

視床下部の体温調節中枢に作用して、末梢血管を拡張し、血流量を増加させて、熱放散を高めることにより解熱する。

### (2) 鎮痛作用

痛覚などの知覚系通路のシナプスの感受性を低下させ、また、プロスタグランジン(PG)の合成阻害により、鎮痛効果をあらわす。

### (3) 消炎作用

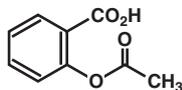
炎症におけるPGの合成過程において、アラキドン酸からのPGE<sub>2</sub>などの生成を阻害することにより、抗炎症作用をあらわす。

### (4) 血小板凝集抑制作用<sup>8)</sup>

アスピリンはシクロオキシゲナーゼ-1(COX-1)を阻害(セリン残基のアセチル化)することにより、トロンボキサンA<sub>2</sub>(TXA<sub>2</sub>)の合成を阻害し、血小板凝集抑制作用を示す。血小板におけるCOX-1阻害作用は、血小板が本酵素を再合成できないため、不可逆的である。

## 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：アスピリン(Aspirin)

化学名：2-Acetoxybenzoic acid

分子式：C<sub>9</sub>H<sub>8</sub>O<sub>4</sub>

分子量：180.16

融点：約136℃

性状：本品は白色の結晶、粒又は粉末で、においはなく、わずかに酸味がある。

本品はエタノール(95)又はアセトンに溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けやすく、水に溶けにくい。

本品は水酸化ナトリウム試液又は炭酸ナトリウム試液に溶ける。

本品は湿った空气中で徐々に加水分解してサリチル酸及び酢酸になる。

## 包装

500g×1

## 主要文献

- 1) 厚生省医薬安全局：医薬品等安全性情報No. 151(1998)
- 2) Sim, S. M. et al. : *Br. J. Clin. Pharmacol.*, **32**, 17(1991)
- 3) *Federal Register*, **63**(205), 56802(October 23, 1998)
- 4) Wilson, J. T. et al. : *Clin. Pharmacol. Ther.*, **23**, 635(1978)
- 5) Pütter, J. : International symposium on present state of acetylsalicylic acid in research and therapeutic application, p49(1982)
- 6) Sato, N. et al. : *Pediatr. Int.*, **41**, 1(1999)
- 7) 草川三治他：日本小児科学会雑誌, **87**, 2486(1983)
- 8) Lecomte, M. et al. : *J. Biol. Chem.*, **269**, 13207(1994)

## 文献請求先

バイエル薬品株式会社・メディカルインフォメーション  
〒530-0001 大阪市北区梅田二丁目4番9号

## バイエル医療用医薬品のお問い合わせ先

バイエル薬品株式会社・くすり相談 ☎ 0120-106-398