

\* \* 2014年1月改訂 (第9版)

\* 2009年12月改訂

日本標準商品分類番号

871143

# 解熱鎮痛消炎剤 日本薬局方 アスピリン アスピリン「メタル」

Aspirin  
(アセチルサリチル酸)

承認番号	16000AMZ02252
薬価収載	薬価基準収載
販売開始	1985年8月
再評価結果	1994年9月
効能追加	2005年10月

貯法：室温保存  
使用期限：外箱に表示  
\*注意：湿った空気中で徐々に分解するので注意すること。

## 【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

- 川崎病を除く効能・効果に使用する場合
  - 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
  - 消化性潰瘍のある患者〔胃出血の発現又は消化性潰瘍が悪化するおそれがある。〕(ただし、「慎重投与(13)」の項参照)
  - 重篤な血液の異常のある患者〔血液の異常を悪化させるおそれがある。〕
  - 重篤な肝障害のある患者〔肝障害を悪化させるおそれがある。〕
  - 重篤な腎障害のある患者〔腎障害を悪化させるおそれがある。〕
  - 重篤な心機能不全のある患者〔心機能を悪化させるおそれがある。〕
  - 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〔喘息発作を誘発するおそれがある。〕
  - 出産予定日12週以内の妊婦 (妊婦、産婦、授乳婦等への投与) の項参照)
- 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
  - 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
  - 消化性潰瘍のある患者〔胃出血の発現又は消化性潰瘍が悪化するおそれがある。〕(ただし、「慎重投与(13)」の項参照)
  - 出血傾向のある患者〔出血を増強するおそれがある。〕
  - 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〔喘息発作を誘発するおそれがある。〕
  - 出産予定日12週以内の妊婦〔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。〕

## 【組成・性状】

### 組成

本品1g中に日本薬局方アスピリン1gを含む。

### 製剤の性状

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。

本品は湿った空気中で徐々に加水分解してサリチル酸及び酢酸になる。

## 【効能・効果】【用法・用量】

効能・効果	用法・用量
* 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	①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。
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)	②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、疾患、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ることが望ましい。
③川崎病 (川崎病による心血管後遺症を含む)	③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】

- 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<sup>1)</sup>。
- 川崎病では発症後数ヵ月間、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ヵ月間投与し、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<sup>1),2)</sup>。
- 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)

- 消化性潰瘍の既往歴のある患者〔消化性潰瘍が再発するおそれがある。〕
- 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。〕
- 出血傾向のある患者 (効能・効果①及び②の場合)〔血小板機能異常が起こることがある。〕
- 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。〕
- 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。〕
- 心機能異常のある患者〔心機能を悪化させるおそれがある。〕
- 過敏症の既往歴のある患者

- (8)気管支喘息のある患者〔アスピリン喘息を誘発するおそれがある。〕
- (9)高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕
- (10)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）
- (11)小児（「2.重要な基本的注意」、「7.小児等への投与」の項参照）
- (12)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。〕
- (13)アルコール常飲者〔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）
- (14)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）

## 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才未満の水痘、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(GPK)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**の適切な措置を講ずること。
  - 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。（「3.相互作用」の項参照）
- (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<sup>3)</sup>。
- (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）に対して長期間投与する場合には、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
**	クマリン系抗凝固剤 ワルファリン ナカリウム	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。
	抗凝固剤 血液凝固阻止剤 ヘパリン製剤 ダナバロイド 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ン 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 トロンボキササン合成酵素阻害剤 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I <sub>2</sub> 誘導体制剤 ベラプロソトナトリウム等 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。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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。
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	サリチル酸中毒を起こすことが報告されている。	機序は不明。 併用時に副腎皮質ホルモン剤を減量すると、サリチル酸系製剤の血中濃度が増加したとの報告がある。
リチウム製剤	類薬（インドメタシン等）でリチウム中毒を起こすことが報告されている。	類薬（インドメタシン等）は腎のプロスタグランジン合成を抑制し、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。
チアジド系利尿剤	類薬（インドメタシン等）でチアジド系利尿剤の作用を減弱させることが報告されている。	類薬（インドメタシン等）は腎のプロスタグランジン合成を抑制し、チアジド系利尿剤の作用を減弱させることがある。
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。
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、錯乱等の中枢神経症状、代謝性アシドーシス等を起こ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。
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。	サリチル酸製剤は尿酸の排泄を抑制することが知られているため、これらの薬剤の効果が減弱すると考えられる。
** 非ステロイド系解熱鎮痛消炎剤	インドメタシン ジクロフェナクナトリウム 等	(1)これら薬剤の血中濃度を低下させるおそれがある。 (2)消化器系の副作用を増強させるおそれがある。 (3)出血及び腎機能低下を起こすことがある。
	オキシカム系 消炎鎮痛剤 ピロキシカム 等	両剤又は一方の薬剤の副作用の発現頻度を増加させるおそれがある。
	スリダク	消化器系の副作用の発現率が上昇する。また、スリダクの活性代謝物（スルフィド体）の血中濃度が低下する。
	イブプロフェン ナプロキセン	本剤の血小板凝集抑制作用を減弱するとの報告がある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
** ドネペジル塩酸塩	消化性潰瘍を起こすことがある。	コリン系が賦活され胃酸分泌が促進される。
** β-遮断剤 プロプラノロール塩酸塩等 アンジオテンシン変換酵素阻害剤 カプトプリル等	降圧作用が減弱することがある。	本剤がプロスタグランジン合成を抑制することにより、プロスタグランジンを介した降圧効果を減弱させる。
ループ利尿剤 フロセミド等	(1)これら薬剤の利尿作用を減弱させるおそれがある。 (2)サリチル酸中毒が発現するおそれがある。	(1)本剤が腎のプロスタグランジン合成を抑制することにより、これら薬剤の作用を減弱させるためと考えられる。 (2)腎の排泄部位において両剤の競合が起こり、サリチル酸誘導体の排泄が遅れるためと考えられる。
ニトログリセリン	ニトログリセリンの作用を減弱させるおそれがある。	本剤がプロスタグランジン合成を抑制することにより、ニトログリセリンの血管拡張作用を減弱させる。
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 セラトログラスト ラマトロバン	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。
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。

#### 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

\*\*1) ショック、アナフィラキシー（頻度不明）：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(頻度不明) :

**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(0.1%未満)** :

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(0.1%未満)** :

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(頻度不明)** :

喘息発作を誘発することがある。

6) **肝機能障害、黄疸(頻度不明)** :

AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -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(頻度不明)** :

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

種類\頻度	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、腹痛、胃腸障害、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(出血時間の延長)等
皮膚	そう痒、発汗		
精神神経系 <sup>注3)</sup>	眩暈、頭痛、興奮等		
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) 症状があらわれた場合には投与を中止すること。

注2) 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) 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) 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<sup>6)</sup>。〕

(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のみ投与すること。〔動物実験(ラット)で催奇形性作用<sup>4)</sup>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) 解熱・鎮痛及び抗炎症剤として用いる場合: 低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は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。〔小児等に対する安全性は確立していない。〕〔「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<sup>7)</sup>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、眩暈、頭痛、悪心・嘔吐、消化管出血・潰瘍、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等の酸塩基平衡障害、痙攣、昏睡等の中枢神経系障害、心血管虚脱、呼吸不全等が認められる。

処置: 催吐、胃洗浄を行い、その上で活性炭や下剤を投与する。ブドウ糖輸液などにより体液と電解質のバランスの維持を図る。小児の高熱には、スポンジ浴を行う。炭酸水素ナトリウムの静脈注射などによりアシドーシスを補正すると共に尿のアルカリ化を図る。重篤な場合、血液透析、腹膜灌流などを考慮する。

9. 適用上の注意

服用時: 本剤は空腹時の投与は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。
- (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】<sup>8)</sup>

アスピリンは主として小腸上部から速やかに吸収され、血中での消失も速い。1.2gを内服すると2時間後の血漿濃度は2mg/100mL以下である。血漿蛋白質と結合する。体内の諸臓器組織（血清、肝、腎）で加水分解されてサリチル酸と酢酸を生じる。例えば0.65gを投与すると、1時間後の血漿中アスピリンは全サリチル酸の約30%に過ぎない。代謝産物はサリチル酸ナトリウムの場合と同様で、グリシン抱合体（約50%）、グルクロン酸抱合体（約25%）、水酸化体のゲンチジン酸（4~8%）、2,3-ジヒドロキシ安息香酸、2,3,5-トリヒドロキシ安息香酸などである。ゲンチジン酸は解熱鎮痛作用を有している。

リウマチ患者は正常人に比べてゲンチジン酸の排泄が多く、グリシン抱合体が少ないという。アスピリンはプロスタグランジン合成酵素のシクロオキシゲナーゼを非可逆的にアセチル化して阻害する。

**\*\***本化合物のバイオアベイラビリティ、血漿蛋白結合率、全身クリアランス、分布容積、血中半減期はそれぞれ68%、49%、9.3mL/min/kg、0.25hであり、未変化体の尿中排泄率は1.4%と低い。

リチウム製剤投与時、リチウムの血中濃度が上昇し、リチウム中毒を呈したとの報告がある。

### 【薬効薬理】<sup>8)</sup>

痛覚刺激によるインパルス発生の抑制、発痛物質の活性抑制、プロスタグランジン合成抑制などの末梢作用と中枢神経系（おそらく視床下部）の抑制による中枢作用とによって鎮痛作用を現すとされている。また、視床下部の体温調節中枢に作用し、末梢血管の血流量を増加させて熱放散をたかめること、及びプロスタグランジン合成抑制などにより解熱作用を現すとされている。抗炎症（抗リウマチ）作用は、プロスタグランジン合成抑制や生体内高分子との相互作用（蛋白質分解酵素の活性抑制、リボソーム膜の安定化、肥満細胞からの化学伝達物質の遊離抑制、ムコ多糖類合成抑制など）に基因すると考えられている。他に胆汁分泌促進による利胆作用や尿酸の尿中排泄の増大による抗痛風作用がある。川崎病には抗炎症、解熱及び血栓形成の抑制を目的として使用される。

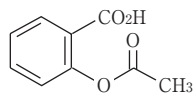
### 【有効成分に関する理化学的知見】

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>

構造式：



分子量：180.16

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。

融点：約136℃

## 【取扱上の注意】

本剤は吸湿によって脱アセチル化がおこり、この際生じる酢酸が更に変化を促進するので、乾燥をよほど厳密にしないとびん等気密容器にたくわえることはかえってよくない。

## 【包装】

500g

## 【主要文献】

- 1) 日本小児循環器学会、川崎病急性期治療のガイドライン（2003）
- 2) 日本循環器学会、日本心臓病学会、日本小児科学会、日本小児循環器学会、日本胸部外科学会合同研究班、川崎病心臓血管後遺症の診断と治療に関するガイドライン：Circulation Journal 67 Suppl. IV:1111-73（2003）
- 3) Harris, W. H. : JAMA, 264 (24), 2808 (1981)
- 4) 長浜萬蔵ほか：先天異常, 6, 20 (1966)
- 5) Stuart, M. J. et al : N.Engl. J. Med., 307 (15)
- 6) 門間和夫, 竹内東光：小児科の進歩, 2, 95 (1983)
- 7) 赤木禎治ら：総合臨床 44(10), 2410~2412 (1995)
- \*\***8) 第十六改正日本薬局方解説書, C-83, 廣川書店 (2011)

## 【文献請求先】

中北薬品株式会社 製薬工場事業部  
〒496-0016 愛知県津島市白浜町字番場52-1  
TEL 0567-32-1431  
FAX 0567-32-2961

製造販売元

 **中北薬品株式会社**  
愛知県津島市白浜町字番場52-1