

## ◎バイアスピリン錠・▼バファリン配合錠A81・○アスピリン(末) [内]

【重要度】 【一般製剤名】アスピリン(U) Aspirin 【分類】抗血小板剤

【単位】◎100mg/錠・▼81mg/配合錠A, ○末

【常用量】■バイアスピリン: 100mg/日 [最大300mg]

■バファリン配合錠A: 81mg/日 [最大324mg/日]

【用法】分1(食後)

【透析患者への投与方法】減量の必要なし [通常81~100mg/日で使用] (5)

【その他の報告】81~162mg/日 [HD日はHD後] (17) ダイアライザーや回路内の凝固防止、シャント血流の改善目的に1日100mg投与する。300mg以上のアスピリン投与は血管内皮のCOXも不可逆的に抑制することによりプロスタサイクリンの生成も阻害するため、アスピリン330mg錠よりも低用量アスピリンの方が優れている(腎と透析増刊624-6,1989)

【PD】81mg/日として注意してモニター (17) 100mg/日 (5)

【CRRT】81~162mg/日 (17)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし [通常81~100mg/日で使用] (5)

【その他の報告】GFR>50mL/min: 81~325mg/日, GFR 10~50mL/min: 81~162mg/日, GFR 10mL/min未満: データはないが、81mg/日として注意してモニター (17)

【特徴】血小板TXA<sub>2</sub>を不可逆的に阻害し抗血小板作用を発揮する。血小板内でCOXを不可逆的にアセチル化することにより阻害するため、wash outには7日間を要する。

【主な副作用・毒性】ライ症候群(ミトコンドリア機能障害)、喘息発作誘発、難聴、出血傾向、胃腸管出血、胃潰瘍、浮腫、急性腎不全、味覚異常

【吸収】80% (11)

【F】68% (10) 100% (14) 68% (13,15) 未変化体として20%, 50~80%が肝臓の初回通過効果又はそれ以前に加水分解 (1) 腸溶錠でもFの低下はない (1)

【tmax】未変化体4hr、活性代謝物4.5hr (1) 0.39hr、1.2g単回投与でCmaxは24μg/mL (13)

【代謝】末梢の酵素によりサリチル酸に代謝され、サリチル酸は肝代謝される (1) 代謝物に抗血小板作用はないが、代謝物の一部であるゲンチジン酸は解熱鎮痛作用を有する (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率2~30% (6) で用量依存性。尿のアルカリ化で排泄が増加する (3) pH5で2~3%, pH8で80% (15) 15% (14) 68% (13) 1.4% (13) 未変化体としては排泄されず、サリチル酸のグリシン抱合体、グルクロン酸抱合体、遊離サリチル酸としても尿中に排泄 (1)

【CL】650mL/min (10) 未変化体9.3mL/min/kgでサリチル酸は用量依存的に変化 (13,15) 【非腎CL/総CL】100% (10)

【t1/2】未変化体24min、活性代謝物2hr (1) サリチル酸2~30hr (10) サリチル酸4hr (14) 2~5hr (15) 未変化体15min、サリチル酸は用量依存的 (13)

【透析患者のt1/2】2~19hr (腎と透析臨時増刊624-6,1989) 2~30hr (4)

【蛋白結合率】80~90% (1) 70% (10) 変動する (11) 49%、腎障害で低下 (13)

【Vd】0.15L/kg (10,13) 0.2L/kg (11) 0.14L/kg (14)

【MW】180.16

【透析性】50%以上 (6) 15% (15) 中毒発現時にはHDやPDは有用 (1) HD時のクリアランス35~100mL/min (1)

【TDMのポイント】通常の使用方法ではTDMの対象にはならないが、鎮痛薬として大量使用するときにはTDMの対象となる。有効治療域はサリチル酸として20~300μg/mL (14) または100~400μg/mL (15) 【O/W係数】0.08 (11) 15.49 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】3.49 (1)

【相互作用】イブプロフェンとの同時併用投与はアスピリンによって誘導される不可逆性の血小板阻害作用を拮抗的に減弱させるが、ロフェコキシブ・アセトアミノフェンあるいはジクロフェナクではこの作用を認めない。心血管系のリスクが上昇している患者に対するイブプロフェンによる治療はアスピリンの心臓保護作用を損なう可能性がある (Francesca CL, et al: N Engl J Med 345:1809-17,2001) メトトレキサートの副作用増強 (1)

【最大効果発現時間】腸溶錠を内服: 6hr, かみ砕いて内服: 30min (1)

【更新日】20221222

※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、当院では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。