

△バファリン配合錠 A330 [内]

【重要度】★【TDM】 【一般製剤名】アスピリン, ダイアルミネート aspirin/dialuminate 【分類】解熱鎮痛消炎剤

【単位】△330mg/錠

【常用量】■頭痛, 歯痛, 月経痛, 感冒の解熱: 1回2錠, 1日2回■関節リウマチ, リウマチ熱, 症候性神経痛; 1回2~4錠, 1日2~3回

【用法】分2~3 [食後]

【透析患者への投与方法】減量の必要ないが, 透析患者の消化管は脆弱なため慎重に投与する (5)

【保存期 CKD 患者への投与方法】腎障害悪化の恐れのため慎重投与, Ccr<10mL/min: 投与を避ける (10,12) Ccr 10~50mL/min: 投与間隔を1~1.5倍に延長 (12)

【その他の報告】GFR>50mL/min: 650mgを4hr毎, GFR 10~50mL/min: 650mgを6hr毎, GFR 10mL/min未満: データなし (17) 腎障害患者では副作用が強くあらわれることがあるため慎重投与, 重篤な腎障害のある患者では血中濃度が上昇し, 重篤な副作用が発現するおそれがあるため禁忌 (1)

【特徴】頭痛, 歯痛, 月経痛, 感冒の解熱, 関節リウマチ, リウマチ熱, 症候性神経痛など, 鎮痛目的で用いるアスピリン. ダイアルミネートは緩衝目的で添加されており, アスピリンの溶解・吸収を促進して急速かつ高い血中濃度が得られ, 短時間で効果を発揮させること, 胃液の酸度を調整することにより, 胃中でアスピリンの結晶を溶解させ, 胃中のpHを4~6に維持して胃障害を少なくさせることがその理由である.

【主な副作用・毒性】ショック・アナフィラキシー, SJS, TEN, 出血, 消化性潰瘍, 喘息発作誘発, 難聴, 急性腎不全, 味覚異常など. 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 (1) アスピリン中毒症状として, めまい・耳鳴り (初期症状), 過呼吸, 呼吸性アルカローシス, 代謝性アシドーシス, 肺水腫, 発熱, 肝障害, 脳浮腫, 低血糖, 高アンモニア血症を呈し, 重症例では死に至る. アスピリン中毒はライ症候群に酷似しており, しばしば両者の鑑別は困難である.

【安全性に関する情報】

【吸収】100% (14) 80% (11) 胃・小腸上部で吸収 (1)

【F】68% (10,13,15) 80~100%, 肝のFPEにより32%が分解 (1)

【代謝】吸収されたアスピリンは諸臓器のエステラーゼにより加水分解され, サリチル酸と酢酸を生じる (1) サリチル酸はゲンチジン酸に変換 [以後水酸化安息香酸], グルクロン酸抱合, グリシン抱合などにより肝代謝される (1) 代謝物のゲンチジン酸, サリチル酸は解熱鎮痛作用を有する (1) サリチル酸の肝代謝は飽和する (1)

【排泄】未変化体尿中排泄率は2~30% (6) で尿中排泄は用量依存性. 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) 尿中回収率87% [po, 52hrまで] (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) 濃度依存的に低下して0.18~0.88mL/min/kg (1) 【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) 高用量で延長 (1) 【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】83.1% (1) 70% (10) 変動する (11) 49%, 腎障害で低下 (13) 約90% [血中サリチル酸濃度100μg/mL以下]. 約75% [血中サリチル酸濃度400μg/mL以上] (1)

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

【MW】180.16 (アスピリン)

【透析性】50%以上 (6) 除去率15% (15) HDクリアランス35~100mL/min (1) 急性アスピリン中毒時の重篤なアシドーシスやCK高値, ミオグロビン高値例では速やかにHDを施行すべき (横山 隆 透析会誌 48: S450, 2015)

【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) 基準値は抗炎症作用として100~250μg/mL (SRL検査案内)

【O/W係数】0.08 (11) LogP=15.49 [1-オクタノール/水系] (1) 【pKa】3.49 (1)

【相互作用】尿酸排泄促進剤, チアジド系利尿剤, 他のNSAIDs, ニトログリセリン, ACE-I, β遮断薬の作用減弱 (1) 血糖降下剤, ワルファリン, MTX, リチウム製剤の作用増強の可能性 (1) フロセミドによるサリチル酸の副作用増強 (1) アセタゾラミドの毒性増強 (1) ダイアルミネートとのキレート作用によるテトラサイクリン, ニューキノロン経口剤の吸収率低下 (1) ステロイドによるサリチル酸の作用増強 (1) 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) ザフィルルカストの血中濃度上昇 (1) SSRI併用による出血傾向 (1)

【肝障害患者への投与方法】重篤な肝障害のある患者では血中濃度が上昇し, 重篤な副作用が発現するおそれがあるため投与禁忌 (1)

【備考】

【更新日】20200919

※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.