

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

抗血小板剤

アスピリン腸溶錠

アスピリン腸溶錠 100mg「ZE」

ASPIRIN ENTERIC COATED TABLETS 100mg「ZE」

剤形	フィルムコーティング錠(腸溶錠)
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1錠中日局アスピリン100mg含有
一般名	和名：アスピリン(JAN) 洋名：Aspirin(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2019年7月1日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：2019年12月13日(販売名変更) 販売開始年月日：2003年7月4日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	発売元：沢井製薬株式会社 製造販売元：全星薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2026年1月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

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・表現には薬機法の広告規則や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、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月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	21
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	21
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	21
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	21
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	21
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	21
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	21
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	23
1. 販売名	3	8. 副作用	26
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	27
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	27
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	28
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	28
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	IX. 非臨床試験に関する項目	29
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理試験	29
1. 物理化学的性質	4	2. 毒性試験	29
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	X. 管理的事項に関する項目	30
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 規制区分	30
IV. 製剤に関する項目	5	2. 有効期間	30
1. 剤形	5	3. 包装状態での貯法	30
2. 製剤の組成	5	4. 取扱い上の注意	30
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	5. 患者向け資材	30
4. 力価	6	6. 同一成分・同効薬	30
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	7. 国際誕生年月日	30
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	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	30
7. 調製法及び溶解後の安定性	7	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	30
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	31
9. 溶出性	8	11. 再審査期間	31
10. 容器・包装	10	12. 投薬期間制限に関する情報	31
11. 別途提供される資材類	10	13. 各種コード	31
12. その他	11	14. 保険給付上の注意	31
V. 治療に関する項目	12	XI. 文献	32
1. 効能又は効果	12	1. 引用文献	32
2. 効能又は効果に関連する注意	12	2. その他の参考文献	33
3. 用法及び用量	12	XII. 参考資料	34
4. 用法及び用量に関連する注意	12	1. 主な外国での発売状況	34
5. 臨床成績	13	2. 海外における臨床支援情報	34
VI. 薬効薬理に関する項目	15	XIII. 備考	35
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たつての参考情報	35
2. 薬理作用	15	2. その他の関連資料	36
VII. 薬物動態に関する項目	16		
1. 血中濃度の推移	16		
2. 薬物速度論的パラメータ	18		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	19		
4. 吸収	19		
5. 分布	19		
6. 代謝	19		
7. 排泄	20		
8. トランスポーターに関する情報	20		
9. 透析等による除去率	20		
10. 特定の背景を有する患者	20		
11. その他	20		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アスピリンは100年以上の長きにわたって世界で繁用されている非ステロイド性解熱鎮痛消炎剤であり、本邦では1900年に上市されている。その後、血小板凝集抑制作用を有することが見出され、平成11年2月厚生省医薬審104号通知「適応外使用に係る医療用医薬品の取扱いについて」に準じ抗血小板剤としてアスピリン腸溶性製剤が2001年に上市されている。アスピリン腸溶錠100mg「ZE」は、全星薬品工業が後発医薬品として開発を企画し、医薬発第481号(平成11年4月8日)に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2003年3月に承認を得た腸溶性フィルムコーティング錠であり、2003年7月に上市した。その後、品質向上・製造上の改善のため製剤処方変更の一変申請を行い、2011年8月に承認され、2019年12月に医療事故防止のための販売名変更を経て現在に至っている。(Ⅶ. - 1. 及びⅩ. - 8. 参照)

2. 製品の治療学的特性

- 1) アスピリン100mgを含有する抗血小板剤である。
- 2) 本剤は腸溶錠で、主成分による胃粘膜の局所刺激を緩和するよう工夫している。
- 3) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、出血、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)、はく脱性皮膚炎、再生不良性貧血、血小板減少、白血球減少、喘息発作、肝機能障害、黄疸、消化性潰瘍、小腸・大腸潰瘍、アレルギー反応に伴う急性冠症候群が報告されている。(Ⅶ. - 8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

「Ⅳ. 製剤に関する項目」及び沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」
<https://med.sawai.co.jp/> 参照

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

(2026年5月7日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

1) 承認条件

該当しない

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

I. 概要に関する項目

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

アスピリン腸溶錠100mg「ZE」

2) 洋名

ASPIRIN ENTERIC COATED TABLETS 100mg「ZE」

3) 名称の由来

医薬発第935号(平成12年9月19日)に従う「一般名＋剤形＋含量＋屋号」販売名である

2. 一般名

1) 和名(命名法)

アスピリン(JAN)

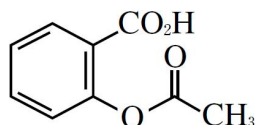
2) 洋名(命名法)

Aspirin(JAN)

3) ステム(stem)

鎮痛抗炎症薬：-sal-

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₉H₈O₄

分子量：180.16

5. 化学名(命名法)又は本質

2-Acetoxybenzoic acid (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：アセチルサリチル酸

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、粒又は粉末で、においはなく、わずかに酸味がある。

2) 溶解性

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。

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。

3) 吸湿性

該当資料なし

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：約136℃

5) 酸塩基解離定数

pKa：3.49(25℃)¹⁾

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

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¹⁾。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

＜確認試験法＞

日局「アスピリン」の確認試験に準ずる。

1) 塩化鉄(Ⅲ)試液による呈色反応

2) 炭酸ナトリウム試液及び希硫酸によるおいの確認及び沈殿反応

＜定量法＞

日局「アスピリン」の定量法に準ずる。(中和滴定法)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠(腸溶錠)

2) 製剤の外観及び性状

表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚みmm)	性 状
 7.2	 138	 3.4	白色

3) 識別コード

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：ZE100

4) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

成分・分量 (1錠中)	日局 アスピリン 100mg
添加剤	トウモロコシデンプン、粉末セルロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、メタクリル酸コポリマーLD、ラウリル硫酸Na、ポリソルベート80、タルク、ヒプロメロース、クエン酸トリエチル、カルナウバロウ

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

IV. 製剤に関する項目

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

1) 加速試験²⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。

その結果、規格に適合した。

PTP：[PTPシート]ポリプロピレンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミ袋、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
質量偏差試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.3	99.1

※：表示量に対する含有率(%)

バラ：[本体]ポリエチレン瓶

[キャップ]ポリプロピレン、乾燥剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
質量偏差試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.1	98.9

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験³⁾

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{A)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
102P	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	光	25°C/60%RH、1200lx、気密容器

試験項目

試験項目
性状・硬度(10錠の平均値)*・純度試験・溶出試験・定量試験

*：本製剤の未設定規格のため参考値

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(N)	純度試験	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	135	適合	適合	100.0
温度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 133	変化なし	変化なし	変化なし 99.3
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 119	変化なし	変化なし	変化なし 98.6
光(120万lx・hr)	変化なし	変化なし 131	変化なし	変化なし	変化なし 99.4

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

(a)：白色のフィルムコーティング錠

A) 評価分類基準

【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり(規格内)	わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合

【硬度】

分類	評価基準
変化なし	硬度変化が30%未満の場合
変化あり(規格内)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合
変化あり(規格外)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合

【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

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(物理化学的变化)

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

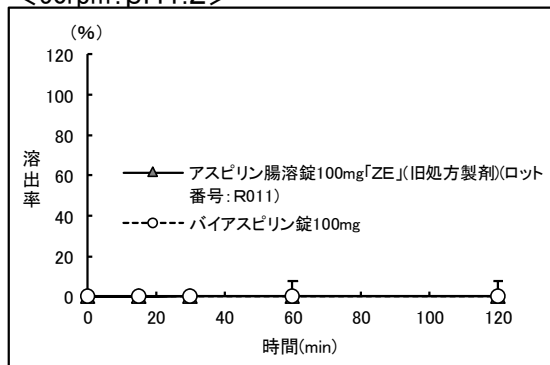
9. 溶出性

＜溶出挙動における同等性及び類似性＞⁴⁾

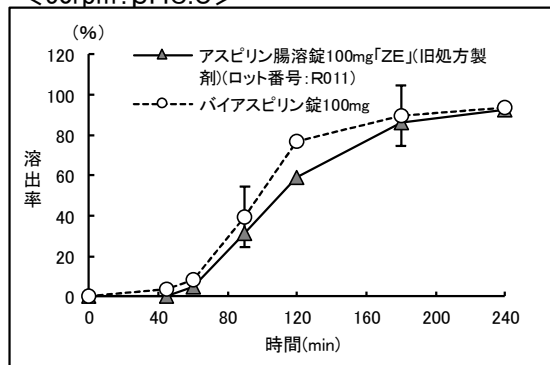
【先発医薬品との比較】

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成9年12月22日 医薬審第487号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、6.0、6.8)、100rpm(pH6.0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(旧処方製剤)(ロット番号：R011)	
標準製剤	バイアスピリン錠100mg(ロット番号：B025)	
結果及び考察	＜50rpm：pH1.2＞ 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(60分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。 下記の3液性では、標準製剤の溶出にラグ時間があり、試験製剤との平均溶出ラグ時間の差は10分以内であったため、ラグ時間以降の平均溶出率で判定した。 ＜50rpm：pH6.0＞ 標準製剤の平均溶出率が40%(90分)及び85%(180分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 ＜50rpm：pH6.8＞ 標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(60分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 ＜100rpm：pH6.0＞ 標準製剤の平均溶出率が60%(55分)及び85%(60分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。	

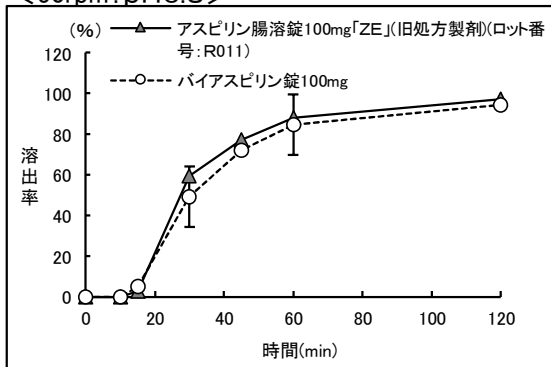
＜50rpm：pH1.2＞



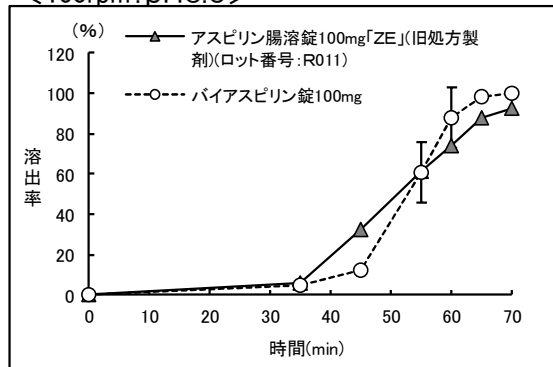
＜50rpm：pH6.0＞



<50rpm : pH6.8>



<100rpm : pH6.0>



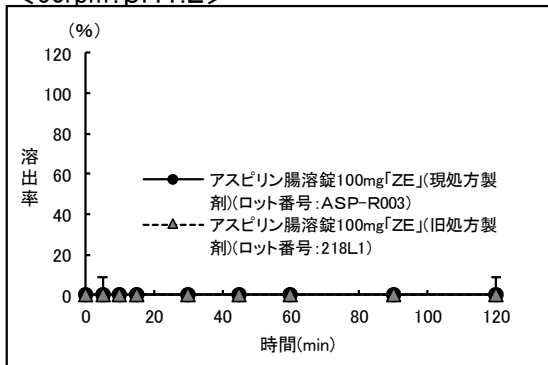
($\bar{}$: 判定基準の適合範囲)

【処方変更前後の比較】

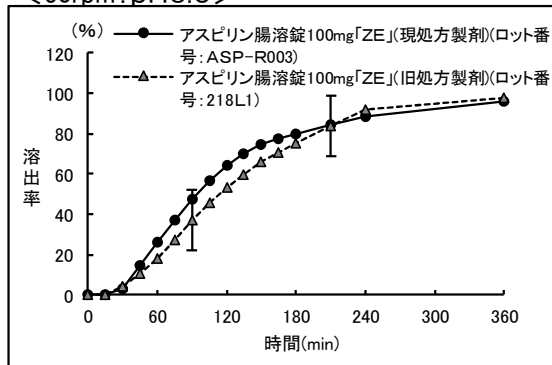
通知等	「経口固形剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドラインについて」：平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、6.0、6.8)、100rpm (pH6.0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(現処方製剤) (ロット番号：ASP-R003)	
標準製剤	アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(旧処方製剤) (ロット番号：218L1)	
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率$\pm 9\%$の範囲にあった。 <50rpm : pH6.0> 標準製剤の平均溶出率が40%(90分)及び85%(210分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率$\pm 15\%$の範囲にあった。 <50rpm : pH6.8> 標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(90分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率$\pm 15\%$の範囲にあった。 <100rpm : pH6.0> 標準製剤の平均溶出率が40%(30分)及び85%(50分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率$\pm 15\%$の範囲にあった。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。 本剤の処方変更水準はE水準であることから、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従って生物学的同等性試験を実施し、両製剤の同等性を確認した。	

IV. 製剤に関する項目

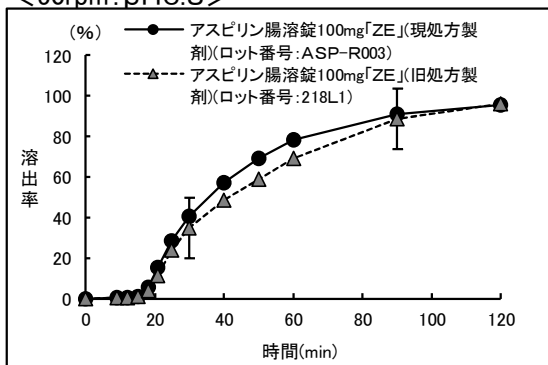
<50rpm: pH1.2>



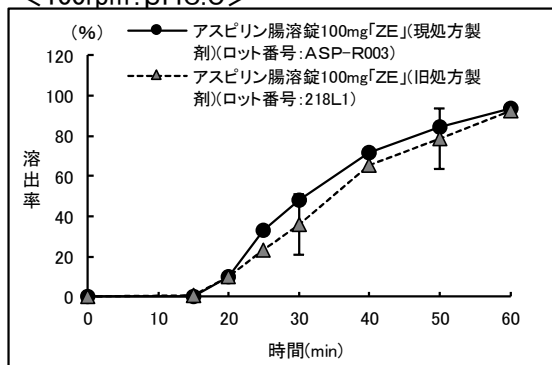
<50rpm: pH6.0>



<50rpm: pH6.8>



<100rpm: pH6.0>



($\bar{}$: 判定基準の適合範囲)

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

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

PTP[乾燥剤入り] : 100錠(10錠×10)

バラ[乾燥剤入り] : 500錠

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP=ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム、乾燥剤、紙箱

バラ=ポリエチレン容器、ポリプロピレンキャップ、乾燥剤、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他.....
 該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

- 下記疾患における血栓・塞栓形成の抑制
 - ・狭心症(慢性安定狭心症、不安定狭心症)
 - ・心筋梗塞
 - ・虚血性脳血管障害(一過性脳虚血発作(TIA)、脳梗塞)
- 冠動脈バイパス術(CABG)あるいは経皮経管冠動脈形成術(PTCA)施行後における血栓・塞栓形成の抑制
- 川崎病(川崎病による心血管後遺症を含む)

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

6. 用法及び用量

〈狭心症(慢性安定狭心症、不安定狭心症)、心筋梗塞、虚血性脳血管障害(一過性脳虚血発作(TIA)、脳梗塞)における血栓・塞栓形成の抑制、冠動脈バイパス術(CABG)あるいは経皮経管冠動脈形成術(PTCA)施行後における血栓・塞栓形成の抑制に使用する場合〉

通常、成人にはアスピリンとして100mgを1日1回経口投与する。

なお、症状により1回300mgまで増量できる。

〈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〉

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。

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

7. 用法及び用量に関連する注意

- 7.1 急性心筋梗塞ならびに脳梗塞急性期の初期治療において、抗血小板作用の発現を急ぐ場合には、初回投与時には本剤をすりつぶしたり、かみ砕いて服用すること。[17.1.1 参照]
- 7.2 心筋梗塞患者及び経皮経管冠動脈形成術(PTCA)施行患者の初期治療においては、常用量の数倍を投与することが望ましい⁵⁾。
- 7.3 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。
- 7.4 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ので、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。
- 7.5 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。

5. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

2) 臨床薬理試験

17.1.1 臨床薬理

(1) 健康成人に対しアスピリン腸溶錠 (650mg)^{注)}を単回投与した時、血小板シクロオキシゲナーゼ活性の阻害作用は投与後 4 時間目から発現し、投与後10時間目に最大となった⁶⁾ (外国人データ)。

(2) 健康成人に対しアスピリン腸溶錠 (325mg)^{注)}をかみ砕いて服用させた場合、血小板凝集抑制作用は早期に発現し、服用後15分目よりADP及びエピネフリンによる血小板凝集の阻害並びに血清中トロンボキサンB₂ (TXB₂)の低下が認められた⁷⁾ (外国人データ)。^[7.1 参照]

注) 本剤の成人における承認用量は、「通常、成人にはアスピリンとして100mgを 1 日 1 回経口投与する。なお、症状により 1 回300mgまで増量できる。」である。

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

該当しない

V. 治療に関する項目

7) その他

17.1.2 臨床効果

- (1) 不安定狭心症患者及び慢性安定狭心症患者に対しアスピリン75～1500mg/日^{注)}を投与した二重盲検比較試験等において、心筋梗塞発生率及び血管系死亡率の有意な低下が認められている^{8～14)} (外国人データ)。
- (2) 急性心筋梗塞患者に対しアスピリン75～325mg/日^{注)}を投与した二重盲検比較試験等において、再梗塞発生率、脳卒中発生率及び血管系死亡率の有意な低下が認められている^{14～18)} (外国人データ)。
- (3) 心筋梗塞生存者に対しアスピリン75～1500mg/日^{注)}を投与した二重盲検比較試験等において、再梗塞発生率、脳卒中発生率及び血管系死亡率の有意な低下が認められている^{14, 19～25)} (外国人データ)。
- (4) 一過性脳虚血発作(TIA)、脳卒中後の患者及び脳アテローム硬化症患者に対しアスピリン30～1500mg/日^{注)}を投与した二重盲検比較試験等において、一過性脳虚血発作発生率、脳卒中発生率及び死亡率の有意な低下が認められている^{14, 26～34)} (外国人データ)。
- (5) 冠動脈バイパス術(CABG)及び経皮経管冠動脈形成術(PTCA)後患者に対しアスピリン50～1500mg/日^{注)}を投与した二重盲検比較試験等において、それぞれ、移植片の閉塞発生率及び再狭窄発生率の有意な低下が認められている^{14, 35～43)} (外国人データ)。
- (6) 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^{44, 45)}。

上記(1)～(5)のアスピリンの臨床効果には明らかな用量相関性が認められないこと並びに有害事象の発現を軽減するために、これらの疾患にはアスピリンの低用量療法(75～325mg/日)が推奨されている¹⁴⁾。

注) 本剤の成人における承認用量は、「通常、成人にはアスピリンとして100mgを1日1回経口投与する。なお、症状により1回300mgまで増量できる。」である。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群……………

シクロオキシゲナーゼ阻害作用：アスピリン以外の化合物はない⁴⁶⁾

2. 薬理作用……………

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

低用量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₂ (TXA₂) 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^{47, 48)}。一方、血管組織ではCOX-1 の再合成が行われるため、プロスタサイクリン (PGI₂) 合成阻害作用は可逆的で比較的速やかに回復する⁴⁹⁾。なお、代謝物であるサリチル酸はCOX-1 を阻害せず、血小板凝集抑制作用を有しない。アスピリンのその他の作用(解熱、鎮痛、抗炎症)については成書⁵⁰⁾を参照のこと。

2) 薬効を裏付ける試験成績

V. -5. -2) 参照

3) 作用発現時間・持続時間

V. -5. -2) 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

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男性にアスピリン腸溶錠100mgを空腹時単回経口投与した際の薬物動態パラメータは以下のとおりである⁵¹⁾。

	C _{max} (μ g/L)	T _{max} (h)	AUC (μ g·h/L)	t _{1/2} (h)
アスピリン	455.3	4.00	542.2	0.44

C_{max}：最高血中濃度 T_{max}：最高血中濃度到達時間

AUC：血中濃度時間曲線下面積 t_{1/2}：半減期

(C_{max}、AUC、t_{1/2}：幾何平均値、T_{max}：中央値、n=6)

なお、アスピリン腸溶錠は、他製剤(アスピリン普通錠等)と比較して吸収が遅延するので、血中アスピリン及びサリチル酸のT_{max}が長く、C_{max}は低い⁵²⁾(外国人データ)。

<生物学的同等性試験>⁵³⁾

【先発医薬品との比較】

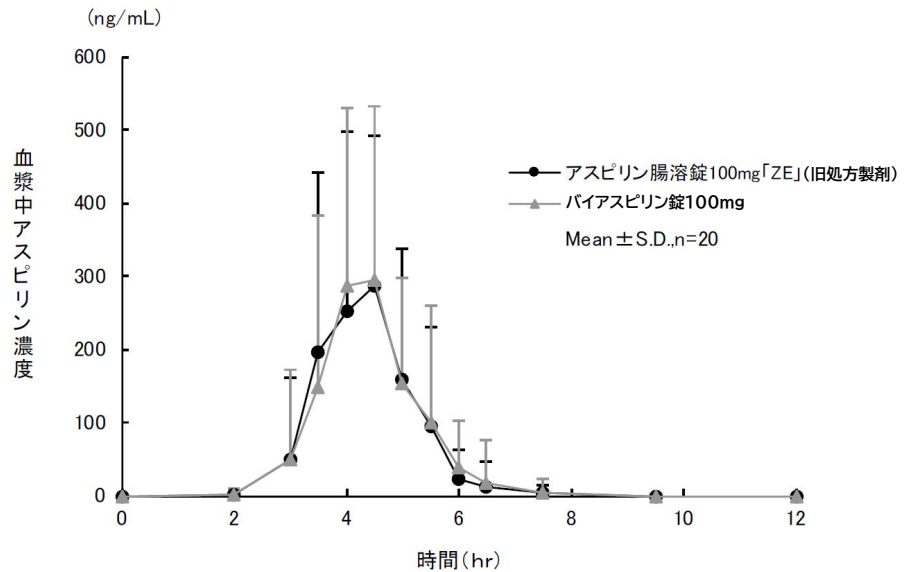
採血時点	0、2、3、3.5、4、4.5、5、5.5、6、6.5、7.5、9.5、12hr
休薬期間	7日間
測定方法	HPLC-UV法
試験製剤	アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(旧処方製剤)
標準製剤	バイアスピリン錠100mg

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成9年12月22日 医薬審第487号)に準じ、アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(旧処方製剤)とバイアスピリン錠100mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(アスピリンとして100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC_t、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-12hr} (ng·hr/mL)
アスピリン腸溶錠100mg 「ZE」(旧処方製剤)	521.9±195.7	4.3±0.7	0.5±0.3	561.7±198.9
バイアスピリン錠100mg	526.8±211.6	4.3±0.6	0.5±0.3	570.8±200.2

(Mean±S.D., n=20)



血漿中濃度並びにAUCt、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【処方変更前後の比較】

採血時点	0、1、2、3、3.5、4、4.5、5、5.5、6、7、9、12hr
休薬期間	8日間
測定方法	LC/MS/MS法
試験製剤	アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(現処方製剤)
標準製剤	アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(旧処方製剤)

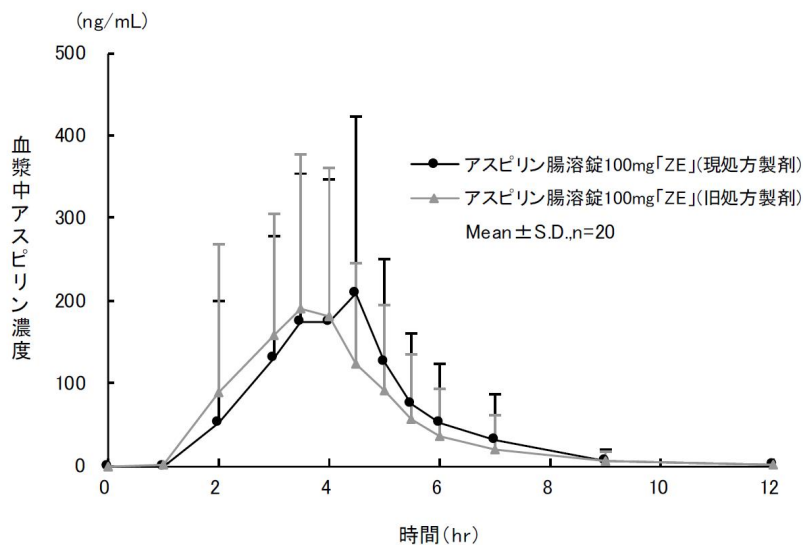
「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドラインについて」(平成18年11月24日薬食審査発第1124004号)に準じ、アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(現処方製剤)とアスピリン腸溶錠100mg「ZE」(旧処方製剤)を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(アスピリンとして100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-12hr} (ng・hr/mL)
アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(現処方製剤)	392.8 ± 184.5	4.1 ± 1.3	1.1 ± 1.6	628.4 ± 181.8
アスピリン腸溶錠100mg「ZE」(旧処方製剤)	366.4 ± 162.8	3.8 ± 1.3	0.9 ± 1.3	597.9 ± 160.7

(Mean ± S.D., n=20)

VII. 薬物動態に関する項目



血漿中濃度並びにAUCt、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

3) 中毒域

VII. -5. -5) 参照

4) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 参照

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

該当資料なし

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

VII. - 6. -5) 参照

3) 乳汁への移行性

VII. - 6. -6) 参照

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

16.3 分布

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。サリチル酸のタンパク結合率は血中濃度依存性を示し、低濃度域 (<100 μ g/mL) では約90%であるのに対し、高濃度域 (>400 μ 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 μ g/mLに達すると認められる。重度の毒性作用は400 μ g/mLを超えると発現する⁵⁴⁾ (外国人データ)。[13.1 参照]

6) 血漿蛋白結合率

VII. - 5. -5) 参照

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

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^{54, 55)} (外国人データ)。

VII. 薬物動態に関する項目

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

該当資料なし

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

16.5 排泄

アスピリン腸溶錠100mgを空腹時単回経口投与したとき、投与後24時間までに投与量の大部分がサリシレートとして尿中に排出され、投与24時間の尿中累積排泄率は約90%であった。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^{51, 54)} (外国人データ)。[13.2 参照]

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

VIII. -10. 参照

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

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)
- 2.1 本剤の成分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
 - 2.2 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。][9.1.1、11.1.7 参照]
 - 2.3 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。][9.1.3、11.1.2 参照]
 - 2.4 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。][9.1.4、11.1.5 参照]
 - 2.5 出産予定日12週以内の妊婦[9.5.1 参照]
 - 2.6 低出生体重児、新生児又は乳児[9.7.1 参照]

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……………
V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由……………

8. 重要な基本的注意
- 8.1 脳梗塞患者への投与にあたっては、他の血小板凝集を抑制する薬剤等との相互作用に注意するとともに、高血圧が持続する患者への投与は慎重に行い、投与中は十分な血圧のコントロールを行うこと。[10.2、11.1.2 参照]
 - 8.2 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。[9.7.3、11.1.6 参照]
 - 8.3 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。[9.7.3、11.1.6 参照]

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 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。[2.2、11.1.7 参照]
 - 9.1.2 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。[11.1.4 参照]
 - 9.1.3 出血傾向の素因のある患者
出血を増強させるおそれがある。[2.3、11.1.2 参照]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

9.1.4 気管支喘息のある患者(アスピリン喘息を有する場合を除く)

アスピリン喘息でないことを十分に確認すること。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いる可能性があり、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。[2.4、11.1.5 参照]

9.1.5 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。[10.2、11.1.2 参照]

9.1.6 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量を増加させるおそれがある。

9.1.7 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

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。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。

2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 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。

3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 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。[11.1.6 参照]

4) 生殖能を有する者

設定されていない

5) 妊婦

9.5 妊婦

9.5.1 出産予定日12週以内の妊婦

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。[2.5 参照]

9.5.2 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女性

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。シクロオキシゲナーゼ阻害剤(経口剤、坐剤)を妊婦に使用し、胎児の腎機能障害及び尿量減少、それに伴う羊水過少症が起きたとの報告がある。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。

6) 授乳婦

9.6 授乳婦

授乳中の女性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

9.7 小児等

9.7.1 低出生体重児、新生児又は乳児には投与しないこと。錠剤である本剤の嚥下が不能である。[2.6 参照]

9.7.2 幼児には本剤の嚥下が可能なことを確認して、慎重に投与すること。

9.7.3 患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。小児等では、副作用があらわれやすい。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。[8.2、8.3 参照]

9.7.4 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⁵⁶⁾。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・ALT・LDH・CK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。

9.7.5 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。

8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に腎機能、肝機能などの生理機能が低下しているため、副作用があらわれやすい。

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

10.2 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 [8.1、11.1.2 参照]	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。	本剤は血漿タンパク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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
抗凝固剤 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 リバーロキサバン等 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 [8.1、11.1.2 参照]	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阻害剤 オザグレルナトリウム プロスタグランジンE ₁ 製剤、E ₁ 及びI ₂ 誘導体制剤 ベラプロストナトリウム等 サルポグレラート塩酸塩 イコサペント酸エチル等 [8.1、11.1.2 参照]	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 [8.1、11.1.2 参照]	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。
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(高用量投与時)は血漿タンパク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(高用量投与時)は血漿タンパク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(高用量投与時)は血漿タンパクに結合したバルプロ酸ナトリウムと置換し、遊離させる。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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(高用量投与時)は血漿タンパクに結合したフェニトインと置換し、遊離させる。
副腎皮質ホルモン剤 ベタメタゾン プレドニゾロン メチルプレドニゾロン等	本剤(高用量投与時)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(高用量投与時)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 ベンズブロマロン	これらの薬剤の作用を減弱させることがある。	本剤(高用量投与時)はこれらの薬剤の尿酸排泄に拮抗する。
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 [8.1、11.1.2 参照]	出血及び腎機能の低下を起こすことがある。	機序は不明。
イブプロフェン ナプロキセン ピロキシカム スルピリン	本剤の血小板凝集抑制作用を減弱するとの報告がある。	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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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こすことが報告されている。	本剤は血漿タンパクに結合したアセタゾラミドと置換し、遊離させる。
ドネペジル塩酸塩 [11.1.7 参照]	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。
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 ₂ 、トロンボキサンA ₂ 受容体拮抗剤 ラマトロバン、セラトロダスト	ヒト血漿タンパク結合に対する相互作用の検討(<i>in vitro</i>)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タンパク結合部位で置換し、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 [8.1、11.1.2 参照]	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 [9.1.5、11.1.2 参照]	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。

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

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

ショックやアナフィラキシー(呼吸困難、全身潮紅、血管性浮腫、じん麻疹等)があらわれることがある。

11.1.2 出血(頻度不明)

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)、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。[2.3、8.1、9.1.3、9.1.5、10.2 参照]

11.1.3 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)、はく脱性皮膚炎(いずれも頻度不明)

11.1.4 再生不良性貧血、血小板減少、白血球減少(いずれも頻度不明)

[9.1.2 参照]

11.1.5 喘息発作(頻度不明)

[2.4、9.1.4 参照]

11.1.6 肝機能障害、黄疸(いずれも頻度不明)

AST、ALT、 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。
[8.2、8.3、9.3.1 参照]

11.1.7 消化性潰瘍、小腸・大腸潰瘍(いずれも頻度不明)

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、狭窄・閉塞を伴う小腸・大腸潰瘍があらわれることがある。
[2.2、9.1.1、10.2 参照]

11.1.8 アレルギー反応に伴う急性冠症候群(頻度不明)**2) その他の副作用****11.2 その他の副作用**

	頻度不明
消化器	胃腸障害、嘔吐、腹痛、胸やけ、便秘、下痢、食道炎、口唇腫脹、吐血、吐き気、悪心、食欲不振、胃部不快感
過敏症	じん麻疹、発疹、浮腫
血液	貧血、血小板機能低下(出血時間延長)
皮膚	そう痒、皮疹、膨疹、発汗
精神神経系	めまい、興奮、頭痛
肝臓	AST上昇、ALT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、鼻炎
感覚器	角膜炎、結膜炎、耳鳴、難聴
その他	過呼吸、代謝性アシドーシス、倦怠感、低血糖

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

13. 過量投与**13.1 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。[16.3 参照]

13.2 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は正、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。[16.5 参照]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 本剤は腸溶錠であるので、急性心筋梗塞ならびに脳梗塞急性期の初期治療に用いる場合以外は、割ったり、砕いたり、すりつぶしたりしないで、そのままかまずに服用させること。

14.1.2 本剤は空腹時の服用を避けることが望ましい。

14.2 薬剤交付時の注意

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

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

15.1.1 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。

2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 *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⁵⁷⁾。

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」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
該当資料なし
 - 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
VIII. - 6. -5) 参照
 - 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

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

	規制区分
製剤	該当しない
有効成分	該当しない

2. 有効期間

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

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資料

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分：バイアスピリン錠100mg

同効薬：シクロオキシゲナーゼ阻害作用

アスピリン以外の化合物はない⁴⁶⁾

7. 国際誕生年月日

該当しない

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

製品名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
旧販売名 ゼンアスピリン錠100	2003年3月14日	21500AMZ00341000	2003年7月4日	2003年7月4日
販売名変更 アスピリン腸溶錠100mg 「ZE」	2019年7月1日	30100AMX00076000	2019年12月13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

承認年月日：2007年2月23日

効能又は効果内容：「川崎病(川崎病による心血管後遺症を含む)」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容
該当しない

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

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
アスピリン腸溶錠100mg 「ZE」	3399007H1013	3399007H1137	115252403	621525202

14. 保険給付上の注意
本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI . 文 献

1. 引用文献

- 1) 医療用医薬品最新品質情報集(ブルーブック) <<https://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>> (2026/5/7 アクセス)
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] アスピリン腸溶錠100mg「ZE」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] アスピリン腸溶錠100mg「ZE」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] アスピリン腸溶錠100mg「ZE」
- 5) Ryan TJ, et al. : J Am Coll Cardiol. 1996 ; 28 : 1328-1419
- 6) Ali M, et al. : Stroke. 1980 ; 11 : 9-13
- 7) Jimenez AH, et al. : Am J Cardiol. 1992 ; 69 : 258-262
- 8) Lewis Jr HD, et al. : N Engl J Med. 1983 ; 309 : 396-403
- 9) Cairns JA, et al. : N Engl J Med. 1985 ; 313 : 1369-1375
- 10) The RISC Group : Lancet. 1990 ; 336 : 827-830
- 11) Ridker PM, et al. : Ann Int Med. 1991 ; 114 : 835-839
- 12) Nyman I, et al. : Lancet. 1992 ; 340 : 497-501
- 13) Juul Möller S, et al. : Lancet. 1992 ; 340 : 1421-1425
- 14) 臨床試験結果(バイアスピリン錠：2000年9月22日承認、審査報告書)
- 15) ISIS-2 Collaborative Group : Lancet. 1988 ; II : 349-360
- 16) Baigent C, et al. : Circulation. 1993 ; 88. I -291
- 17) ISIS-3 Collaborative Group : Lancet. 1992 ; 339 : 753-770
- 18) ISIS-4 Collaborative Group : Lancet. 1995 ; 345 : 669-685
- 19) Elwood PC, et al. : Br Med J. 1974 ; I : 436-440
- 20) The CDPR Group : J Chron Dis. 1976 ; 29 : 625-642
- 21) Elwood PC, et al. : Lancet. 1979 ; II : 1313-1315
- 22) Elwood PC, et al. : J R Coll Gen Pract. 1979 ; 29 : 413-416
- 23) Breddin K, et al. : Haemostasis. 1980 ; 9 : 325-344
- 24) The AMIS Research Group : Circulation. 1980 ; 62 : V79-V84
- 25) The PARIS Research Group : Circulation. 1980 ; 62 : 449-461
- 26) Fields WS, et al. : Stroke. 1977 ; 8 : 301-314
- 27) Bousser MG, et al. : Stroke. 1983 ; 14 : 5-14
- 28) The ESPS Group : Lancet. 1987 ; II : 1351-1354
- 29) UK-TIA Study Group : Br Med J. 1988 ; 296 : 316-320
- 30) The SALT Collaborative Group : Lancet. 1991 ; 338 : 1345-1349
- 31) The Dutch TIA Trial Study Group : N Engl J Med. 1991 ; 325 : 1261-1266
- 32) Karepov VG, et al. : Neurology. 1994 ; 44 : 579S
- 33) IST Collaborative Group : Lancet. 1997 ; 349 : 1569-1581
- 34) CAST Collaborative Group : Lancet. 1997 ; 349 : 1641-1649
- 35) McEnany MT, et al. : J Thorac Cardiovasc Surg. 1982 ; 83 : 81-89
- 36) Chesebro JH, et al. : N Engl J Med. 1984 ; 310 : 209-214
- 37) Lorenz RL, et al. : Lancet. 1984 ; I : 1261-1264
- 38) Goldman S, et al. : Circulation. 1988 ; 77 : 1324-1332

- 39)Goldman S, et al. : Circulation. 1989 ; 80 : 1190-1197
- 40)Henderson WG, et al. : Controlled Clinical Trials. 1995 ; 16 : 331-341
- 41)Thornton MA, et al. : Circulation. 1984 ; 69 : 721-727
- 42)Schwartz L, et al. : N Engl J Med. 1988 ; 318 : 1714-1719
- 43)Taylor RR, et al. : Am J Cardiol. 1991 ; 68 : 874-878
- 44)Sato N, et al. : Pediatr Int. 1999 ; 41 : 1-7
- 45)草川三治 他 : 日小児会誌. 1983 ; 87 : 2486-2491
- 46)薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>
(2026/5/7 アクセス)
- 47)Lecomte M, et al. : J Biol Chem. 1994 ; 269 : 13207-13215
- 48)Smith WL, et al. : Curr Opin Invest Drugs. 1994 ; 3 : 1-11
- 49)Gordon JL, et al. : Brit J Pharmac. 1978 ; 64 : 481-483
- 50)鎮痛・下熱・抗炎症薬および痛風の治療に用いる薬物. グッドマン・ギルマン薬理書. 第10版. 廣川書店, 2003 : 872-934
- 51)アスピリン腸溶錠の単回投与試験(バイアスピリン錠 : 2000年9月22日承認、審査報告書)
- 52)アスピリン腸溶錠(100mg、300mg)とアスピリン普通錠(100mg、300mg)との比較による相対的バイオアベイラビリティ試験(バイアスピリン錠 : 2005年10月31日承認、審査報告書)
- 53)沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] アスピリン腸溶錠100mg「ZE」
- 54)Fed Regist. 1998 Oct 23 ; 63 : 56802-56818
- 55)Wilson JT, et al. : Clin Pharmacol Ther. 1978 ; 23 : 635-643
- 56)厚生省医薬安全局 : 医薬品等安全性情報. 1998 ; 151 : 2-7
- 57)Sim SM, et al. : Br J Clin Pharmacol. 1991 ; 32 : 17-21
- 58)沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] アスピリン腸溶錠100mg「ZE」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
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……………

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

1) 粉砕

＜粉砕後の安定性試験＞⁵⁸⁾

目的

本製剤の粉砕後の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

本製剤を粉砕し、下記条件で保存する。保存した製剤について以下の試験を実施、結果について「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日(社)日本病院薬剤師会)を参考に作成した評価分類基準^{B)}に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
102P	湿度	25℃/75%RH、遮光、開放

試験項目

試験項目
性状・純度試験・定量試験

結果

試験項目 保存条件・期間	性状	純度試験	定量試験※
イニシャル	白色の粉末	適合	100.0
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし	変化なし 98.6

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

V. -5. -2) 及びVIII. -11. 参照

B) 評価分類基準

【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
変化あり	形状変化や色調変化が認められる場合

【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

<崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>

【製剤上の注意】

本剤は主成分による胃粘膜の局所刺激を緩和するよう工夫した腸溶錠となっている。崩壊懸濁、あるいは粉碎による経管投与法を用いる場合は、本剤の放出制御の特性が失われる。

上記の理由から、弊社では本剤において簡易懸濁法に関する試験データを取得しておりません。

2. その他の関連資料・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・

患者向け資材

- ・脳梗塞を再び起こさないために

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

