

\*\*2019年 1月改訂 (第6版)

\*2018年10月改訂

|      |             |
|------|-------------|
| 貯 法  | 室温保存        |
| 使用期限 | 容器、外箱に表示    |
| 注 意  | 取扱い上の注意の項参照 |

|                   |               |
|-------------------|---------------|
| 日本標準商品分類番号 871141 |               |
| アセリオ静注液1000mgバッグ  |               |
| 承認番号              | 22800AMX00674 |
| 薬価収載              | 2016年11月      |
| 販売開始              | 2017年 2月      |
| 国際誕生              | 2001年 6月      |

## 解熱鎮痛剤 アセトアミノフェン静注液

劇薬  
処方箋医薬品<sup>注)</sup>

# アセリオ 静注液 1000mgバッグ

acelio Bag for Intravenous Injection 1000mg

### 【警告】

- (1) 本剤により重篤な肝障害が発現するおそれがあることに注意し、1日総量1500mgを超過する高用量で長期投与する場合には、定期的に肝機能等を確認するなど慎重に投与すること（「2.重要な基本的注意(9)」の項参照）。
- (2) 本剤とアセトアミノフェンを含む他の薬剤（一般用医薬品を含む）との併用により、アセトアミノフェンの過量投与による重篤な肝障害が発現するおそれがあることから、これらの薬剤との併用を避けること（「2.重要な基本的注意(7)」及び「8.過量投与」の項参照）。

### 【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- (1) 重篤な肝障害のある患者〔重篤な転帰をとるおそれがある。〕
- (2) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (3) 消化性潰瘍のある患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
- (4) 重篤な血液の異常のある患者〔重篤な転帰をとるおそれがある。〕
- (5) 重篤な腎障害のある患者〔重篤な転帰をとるおそれがある。〕
- (6) 重篤な心機能不全のある患者〔循環系のバランスが損なわれ、心不全が増悪するおそれがある。〕
- (7) アスピリン喘息（非ステロイド性消炎鎮痛剤による喘息発作の誘発）又はその既往歴のある患者〔アスピリン喘息の発症にプロスタグランジン合成阻害作用が関与していると考えられる。〕

### 【組成・性状】

#### 〈成分・分量〉

|      |               | 1袋100mL中 |
|------|---------------|----------|
| 有効成分 | 日局 アセトアミノフェン  | 1000mg   |
|      | D-マンニトール      | 3850mg   |
| 添加物  | L-システイン塩酸塩水和物 | 25mg     |
|      | リン酸水素ナトリウム水和物 | 26mg     |
|      | 水酸化ナトリウム      | 適量       |
|      | 希塩酸           | 適量       |

#### 〈性状〉

|      |                |
|------|----------------|
| 性状   | 無色～微黄色澄明の液である。 |
| pH   | 5.0～6.0        |
| 濃透圧比 | 約1（生理食塩液に対する比） |

### 【効能又は効果】

経口製剤及び坐剤の投与が困難な場合における疼痛及び発熱

#### 〈効能又は効果に関連する使用上の注意〉

経口製剤及び坐剤の投与が困難で、静注剤による緊急の治療が必要である場合等、静注剤の投与が臨床的に妥当である場合に本剤の使用を考慮すること。経口製剤又は坐剤の投与が可能になれば速やかに投与を中止し、経口製剤又は坐剤の投与に切り替えること。

### 【用法及び用量】

下記のとおり本剤を15分かけて静脈内投与すること。

#### ＜成人における疼痛＞

通常、成人にはアセトアミノフェンとして、1回300～1000mgを15分かけて静脈内投与し、投与間隔は4～6時間以上とする。なお、年齢、症状により適宜増減するが、1日総量として4000mgを限度とする。

ただし、体重50kg未満の成人にはアセトアミノフェンとして、体重1kgあたり1回15mgを上限として静脈内投与し、投与間隔は4～6時間以上とする。1日総量として60mg/kgを限度とする。

#### ＜成人における発熱＞

通常、成人にはアセトアミノフェンとして、1回300～500mgを15分かけて静脈内投与し、投与間隔は4～6時間以上とする。なお、年齢、症状により適宜増減するが、原則として1日2回までとし、1日最大1500mgを限度とする。

#### ＜2歳以上の幼児及び小児における疼痛及び発熱＞

通常、2歳以上の幼児及び小児にはアセトアミノフェンとして、体重1kgあたり1回10～15mgを15分かけて静脈内投与し、投与間隔は4～6時間以上とする。なお、年齢、症状により適宜増減するが、1日総量として60mg/kgを限度とする。ただし、成人の用量を超えない。

#### ＜乳児及び2歳未満の幼児における疼痛及び発熱＞

通常、乳児及び2歳未満の幼児にはアセトアミノフェンとして、体重1kgあたり1回7.5mgを15分かけて静脈内投与し、投与間隔は4～6時間以上とする。なお、年齢、症状により適宜増減するが、1日総量として30mg/kgを限度とする。

### 〈用法及び用量に関連する使用上の注意〉

1. 本剤の投与に際しては、投与速度を厳守すること（本剤の有効性及び安全性は本剤を15分かけて静脈内投与した臨床試験において確認されている。【臨床成績】の項参照）。なお、本剤の投与速度及び投与量により、循環動態に影響を及ぼすことが明らかに予想される患者には投与しないこと。

2. 乳児、幼児及び小児の1回投与量の目安は下記のとおり。（「1.慎重投与」及び「2.重要な基本的注意」の項参照）

| 体重   | 1回投与量の目安  |
|------|-----------|
| 5kg  | 3.75 mL   |
| 10kg | 7.5～15 mL |
| 20kg | 20～30 mL  |
| 30kg | 30～45 mL  |

3. 乳児、幼児及び小児に対する1回あたりの最大用量はアセトアミノフェンとして500mg、1日あたりの最大用量はアセトアミノフェンとして1500mgである。

### 【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) アルコール多量常飲者〔肝障害があらわれやすくなる（「3.相互作用」の項参照）。〕
- (2) 絶食・低栄養状態・摂食障害等によるグルタチオン欠乏、脱水症状のある患者〔肝障害があらわれやすくなる。〕

注) 処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること

- (3) 肝障害又はその既往歴のある患者 [肝機能が悪化するおそれがある.]
- (4) 消化性潰瘍の既往歴のある患者 [消化性潰瘍の再発を促すおそれがある.]
- (5) 血液の異常又はその既往歴のある患者 [血液障害を起こすおそれがある.]
- (6) 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.]
- (7) 腎障害又はその既往歴のある患者 [腎機能が悪化するおそれがある.]
- (8) 心機能異常のある患者 [症状が悪化するおそれがある.]
- (9) 過敏症の既往歴のある患者
- (10) 気管支喘息のある患者 [症状が悪化するおそれがある.]
- (11) 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〕
- (12) 小児等〔「2. 重要な基本的注意」及び「7. 小児等への投与」の項参照〕

## 2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤の使用は、発熱、痛みの程度を考慮し、最小限の投与量及び期間にとどめること。
- (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。原因療法があればこれを行うこと。
- (3) 投与中は患者の状態を十分観察し、副作用の発現に留意すること。本剤の投与直後には経口製剤及び坐剤に比べて血中濃度が高くなることから、過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等の発現に特に留意すること。特に高熱を伴う高齢者及び小児等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。
- (4) 高齢者及び小児等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。
- (5) 感染症を不顕性化するおそれがあるので、感染症を合併している患者に対して用いる場合には適切な抗菌剤を併用し、観察を十分行い慎重に投与すること。
- (6) 他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。
- (7) 本剤とアセトアミノフェンを含む他の薬剤（一般用医薬品を含む）との併用により、アセトアミノフェンの過量投与による重篤な肝障害が発現するおそれがあることから、特に総合感冒剤や解熱鎮痛剤等の配合剤を併用する場合は、アセトアミノフェンが含まれていないか確認し、含まれている場合は併用を避けること。また、アセトアミノフェンを含む他の薬剤と併用しないよう患者に指導すること〔「警告(2)」及び「8. 過量投与」の項参照〕。
- (8) アセトアミノフェンの高用量投与により副作用として腹痛・下痢がみられることがある。本剤においても同様の副作用があらわれるおそれがあり、疼痛又は発熱の原疾患に伴う消化器症状と区別できないおそれがあるので、観察を十分行い慎重に投与すること。
- (9) 重篤な肝障害が発現するおそれがあるので注意すること。1日総量1500mgを超す高用量で長期投与する場合には定期的に肝機能検査を行い、患者の状態を十分に観察すること。高用量でなくとも長期投与する場合にあっては定期的に肝機能検査を行うことが望ましい。また、高用量で投与する場合などは特に患者の状態を十分に観察するとともに、異常が認められた場合には、減量、休業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   |
|--|---|---|
| アルコール（飲酒）  | アルコール多量常飲者がアセトアミノフェンを服用したところ肝不全を起こしたとの報告がある。      | アルコール常飲によるCYP2E1の誘導により、アセトアミノフェンから肝毒性を持つN-アセチル-p-ベンゾキノンイミンへの代謝が促進される。 |
| クマリン系抗凝血剤<br>ワルファリン                                | クマリン系抗凝血剤の作用を増強することがあるので、減量するなど慎重に投与すること。         | 作用機序については、ワルファリンの酸化経路又はビタミンK依存性凝固因子合成関連酵素への作用が考えられている。                |
| イソニアジド   | イソニアジドの長期連用者において、肝薬物代謝酵素が誘導され、肝障害を生じやすくなるとの報告がある。 | イソニアジドはCYP2E1を誘導する。そのためアセトアミノフェンから肝毒性を持つN-アセチル-p-ベンゾキノンイミンへの代謝が促進される。 |
| カルバマゼピン<br>フェノバルビタール<br>フェニトイン<br>プリミドン<br>リファンピシン | これらの薬剤の長期連用者において、アセトアミノフェンの血中濃度が低下するとの報告がある。      | これらの薬剤の肝薬物代謝酵素誘導作用により、アセトアミノフェンの代謝が促進され血中濃度が低下する。                     |

## 4. 副作用

国内において、本剤の有効性、安全性を検証する臨床試験は行われていない。

### (1) 重大な副作用

- 1) ショック（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）：ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、全身紅潮、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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）、急性汎発性発疹性膿疱症（頻度不明）：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群、急性汎発性発疹性膿疱症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。
- 3) 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。
- 4) 劇症肝炎（頻度不明）、肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）：劇症肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、 $\gamma$ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害、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し、適切な処置を行うこと。
- 5) 顆粒球減少症（頻度不明）：顆粒球減少症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。
- 6) 間質性肺炎（頻度不明）：間質性肺炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、咳嗽、呼吸困難、発熱、肺音の異常等が認められた場合には、速やかに胸部X線、胸部CT、血清マーカー等の検査を実施すること。異常が認められた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- 7) 間質性腎炎（頻度不明）、急性腎不全（頻度不明）：間質性腎炎、急性腎不全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                            |
|-----|---------------------------------|
| 血液  | チアノーゼ、血小板減少、血小板機能低下（出血時間の延長）等注) |
| 消化器 | 悪心・嘔吐、食欲不振等                     |
| 循環器 | 血圧低下                            |
| その他 | 過敏症注)                           |

注) このような症状（異常）があらわれた場合には、投与を中止すること。

## 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) 妊娠中及び授乳中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳婦への本剤の投与は、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とすること。
- (2) 妊娠後期の婦人への投与により胎児に動脈管収縮を起こすことがある。
- (3) 妊娠後期のラットに投与した実験で、弱い胎仔の動脈管収縮が報告されている<sup>1)</sup>。

## 7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児及び3カ月未満の乳児に対する使用経験が少なく、安全性は確立していない。

## 8. 過量投与

- (1) 肝臓・腎臓・心筋の壊死が起こったとの報告がある。
- (2) 総合感冒剤や解熱鎮痛剤等の配合剤には、アセトアミノフェンを含むものがあり、本剤とこれら配合剤との偶発的な併用により、アセトアミノフェンの過量投与による重篤な肝障害が発現するおそれがある。
- (3) アセトアミノフェン過量投与時の解毒（肝障害の軽減等）には、アセチルシステインの投与を考慮すること。

## 9. 適用上の注意

投与に際し、本剤への他剤の混注は行わないこと。

## 10. その他の注意

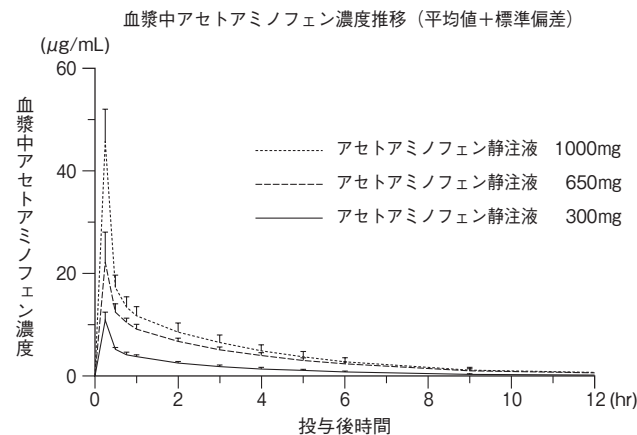
- (1) 類似化合物（フェナセチン）の長期投与により、血色素異常を起こすことがある。
- (2) 腎孟及び膀胱腫瘍の患者を調査したところ、類似化合物（フェナセチン）製剤を長期・大量に使用（例：総服用量1.5～27kg、服用期間4～30年）していた人が多いとの報告がある。また、類似化合物（フェナセチン）を長期・大量投与した動物実験で、腫瘍発生が認められたとの報告がある。
- (3) 非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。

### 【薬物動態】

#### 1. 血漿中濃度

##### (1) 本剤の単回投与（国内臨床試験）<sup>2)</sup>

日本人健康成人男性に本剤30, 65, 100mL（アセトアミノフェンとして300, 650, 1000mg）をいずれも15分かけて静脈内投与したとき、血漿中アセトアミノフェン濃度推移及び薬物動態パラメータは以下に示すとおりであった。用量にかかわらず、血漿中濃度は投与終了直後にC<sub>max</sub>に達した後、約2.5時間のt<sub>1/2</sub>で低下した。300mgから1000mgの用量範囲で、血漿中アセトアミノフェン濃度のC<sub>max</sub>及びAUCは用量に比例して増加し、線形性が認められた。



血漿中アセトアミノフェンの薬物動態パラメータ

| 用量     | 平均値（標準偏差），例数=8                   |                             |                          |                 |                          |
|--------|----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|-----------------|--------------------------|
|        | AUC <sub>0-t</sub><br>(µg·hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(µg/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) | CL<br>(L/hr/kg) | t <sub>max</sub><br>(hr) |
| 300mg  | 17.38( 1.87)                     | 11.06(1.37)                 | 2.79(0.28)               | 0.238(0.033)    | 0.25(0.0)                |
| 650mg  | 44.29( 4.15)                     | 22.35(5.72)                 | 2.83(0.37)               | 0.212(0.029)    | 0.25(0.0)                |
| 1000mg | 59.72(10.83)                     | 46.17(5.93)                 | 2.59(0.20)               | 0.253(0.042)    | 0.25(0.0)                |

##### (2) 本剤の反復投与（国内臨床試験）<sup>2)</sup>

日本人健康成人男性に本剤65mL（アセトアミノフェンとして650mg）を1日6回（4時間毎）2日間反復静脈内投与（投与速度65mL/15分）又は本剤100mL（アセトアミノフェンとして1000mg）を1日4回（6時間毎）2日間反復静脈内投与（投与速度100mL/15分）したときの薬物動態パラメータは以下に示すとおりであった。いずれも反復投与開始後12時間までに定常状態に達し、蓄積性は認められなかった。

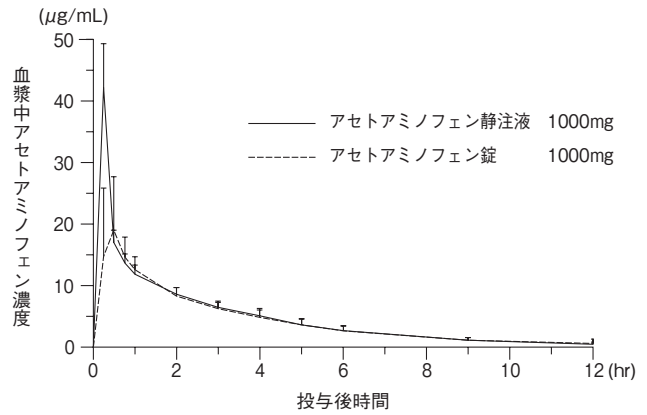
血漿中アセトアミノフェンの薬物動態パラメータ

| 用量     | 投与<br>(回) | 平均値（標準偏差），例数=8                 |                             |                          |                 |                          |
|--------|-----------|--------------------------------|-----------------------------|--------------------------|-----------------|--------------------------|
|        |           | AUC <sub>τ</sub><br>(µg·hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(µg/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) | CL<br>(L/hr/kg) | t <sub>max</sub><br>(hr) |
| 650mg  | 1         | 30.66( 4.62)                   | 31.22(1.95)                 | 2.53(0.32)               | 0.244(0.033)    | 0.25(0.0)                |
|        | 12        | 44.34( 6.42)                   | 32.47(3.47)                 | 2.61(0.21)               | 0.241(0.021)    | 0.25(0.0)                |
| 1000mg | 1         | 52.35( 5.77)                   | 42.05(7.13)                 | 2.39(0.14)               | 0.274(0.035)    | 0.25(0.0)                |
|        | 8         | 64.37(11.31)                   | 49.23(5.28)                 | 2.65(0.32)               | 0.268(0.038)    | 0.25(0.0)                |

##### (3) 本剤と経口製剤の薬物動態比較（国内臨床試験）<sup>3)</sup>

日本人健康成人男性に本剤100mLと経口製剤（いずれもアセトアミノフェンとして1000mg）をクロスオーバー法により単回投与（本剤の投与速度100mL/15分）したとき、血漿中アセトアミノフェン濃度推移及び薬物動態パラメータは以下に示すとおりであった。C<sub>max</sub>の増加、t<sub>max</sub>の短縮はあったが投与後30分以降の血漿中濃度は経口製剤と同様の推移を示し、AUCやt<sub>1/2</sub>、尿中代謝物プロファイル等その他薬物動態パラメータに投与経路による違いは認められなかった。

血漿中アセトアミノフェン濃度推移（平均値+標準偏差）



血漿中アセトアミノフェンの薬物動態パラメータ

| 投与薬剤                            | 例数 | 平均値（標準偏差）                        |                             |                          |                  |                          |
|---------------------------------|----|----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|------------------|--------------------------|
|                                 |    | AUC <sub>0-t</sub><br>(µg·hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(µg/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) | CL<br>(L/hr/kg)  | t <sub>max</sub><br>(hr) |
| アセトアミノフェン静注液<br>(1000mg, 1バイアル) | 19 | 60.01<br>(8.66)                  | 43.01<br>(6.62)             | 2.72<br>(0.38)           | 0.256<br>(0.037) | 0.25<br>(0.0)            |
| アセトアミノフェン錠<br>(200mg, 5錠)       | 20 | 53.62<br>(9.87)                  | 23.56<br>(8.51)             | 2.78<br>(0.47)           | 0.285<br>(0.051) | 0.49<br>(0.24)           |

##### (4) 小児（及び成人）における薬物動態パラメータ<sup>4)</sup>

本剤を小児集団（外国人）に1.5mL/kg（アセトアミノフェンとして15mg/kg）及び成人（外国人）に100mL（アセトアミノフェンとして1000mg）を単回静脈内投与した際の薬物動態パラメータの推定値を以下に要約する。

| サブ集団 | 平均値（標準偏差）         |                             |                          |                 |                           |
|------|-------------------|-----------------------------|--------------------------|-----------------|---------------------------|
|      | AUC<br>(µg·hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(µg/mL) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) | CL<br>(L/hr/kg) | V <sub>ss</sub><br>(L/kg) |
| 新生児  | 62(11)            | 25( 4)                      | 7.0(2.7)                 | 0.12(0.04)      | 1.1(0.2)                  |
| 乳児   | 57(54)            | 29(24)                      | 4.2(2.9)                 | 0.29(0.15)      | 1.1(0.3)                  |
| 幼児   | 38( 8)            | 29( 7)                      | 3.0(1.5)                 | 0.34(0.10)      | 1.2(0.3)                  |
| 青年   | 41( 7)            | 31( 9)                      | 2.9(0.7)                 | 0.29(0.08)      | 1.1(0.3)                  |
| 成人   | 43(11)            | 28(21)                      | 2.4(0.6)                 | 0.27(0.08)      | 0.8(0.2)                  |

幼児及び青年におけるAUCは成人と同程度であるが、新生児及び乳児では成人より大きい。生後1カ月以上2歳未満の乳児及び28日齢までの新生児においては、用量をそれぞれ33%及び50%減量し、投与間隔を6時間以上空けることにより、2歳以上の小児と同様のAUCが得られることが、乳児及び新生児の薬物動態データに基づいた用量シミュレーションにより示されている。

## 2. 分布

### (1) 血漿蛋白結合

アセトアミノフェンの血漿蛋白結合率は低く、血漿中濃度60µg/mLまでは結合はみられず、血漿中濃度280µg/mLにおいても約20%であった<sup>5)</sup>。

### (2) 組織への移行

妊娠した女性を対象とした試験で、アセトアミノフェンの経胎盤移行が示されている<sup>6)</sup>。

## 3. 代謝

アセトアミノフェンの代謝は主に肝臓で行われ、主な代謝経路には、グルクロン酸抱合、硫酸抱合、チトクロムP450を介した酸化的代謝経路の3つがある。チトクロムP450を介した酸化的代謝経路では、主としてCYP2E1により反応性中間代謝物 [N-アセチル-p-ベンゾキノニン (NAPQI)] が生成される。治療用量では、NAPQIは迅速にグルタチオン抱合を受け、その後さらに代謝されてシステイン及びメルカプツール酸との抱合体を形成する<sup>7)</sup>。

## 4. 排泄

アセトアミノフェン代謝物は主に尿中に排泄される。日本人成人男性に本剤100mL（アセトアミノフェンとして1000mg）を投与したとき、投与量の約80%が12時間以内に、90%以上が48時間以内に尿中に排泄された。また、アセトアミノフェン未変化体及び各代謝物の尿中累積排泄率は、経口製剤と同程度であった<sup>3)</sup>。



## 【臨床成績】

### 1. 本剤と経口製剤の薬物動態比較<sup>3)</sup>

日本人健康成人男性に本剤100mLと経口製剤（いずれもアセトアミノフェンとして1000mg）を単回投与（本剤の投与速度100mL/15分）したとき、本剤で経口製剤と比較し、C<sub>max</sub>の増加、t<sub>max</sub>の短縮が認められたが、投与後30分以降の血漿中濃度は同様の推移を示した（【薬物動態】の項参照）。

### 2. 海外臨床試験

海外において、歯科治療後の疼痛、術後疼痛及び小児発熱患者を対象に実施された臨床試験における有効性の主要な成績は以下のとおりであった。

（注）対照薬として用いられているプロパセタモールはアセトアミノフェンのプロドラッグであり、血漿エステラーゼによって速やかにアセトアミノフェンとジエチルグリシンに変換される（プロパセタモール2000mgは約1000mgのアセトアミノフェンに変換される）。国内未承認の医薬品である。

#### < 歯科治療後の疼痛 >

無作為化二重盲検単回投与試験（海外試験）<sup>8)</sup>

第三臼歯抜歯後に中等度以上の疼痛を認めた患者152例を対象として、本剤100mL（アセトアミノフェンとして1000mg）、プロパセタモール2000mg又はプラセボを単回投与（投与速度100mL/15分）した。投与後0.25～6時間までの各評価時点における本剤投与群の痛みの改善度は、いずれの時点においても、プラセボ投与群に比して有意な差が認められた（0.25～6時間の全時点でp<0.001）。

#### < 小児単径ヘルニア修復術後の疼痛 >

無作為化二重盲検単回投与試験（海外試験）<sup>9)</sup>

単径ヘルニア修復術を受け、術後に中等度以上の痛みを認めた小児患者185例を対象として、本剤1.5mL/kg（アセトアミノフェンとして15mg/kg）又はプロパセタモール30mg/kgを15分かけて単回投与した。投与後0.25～6時間までの各評価時点において疼痛強度をVASスケールで評価し、ベースラインからの疼痛強度の差により鎮痛効果を評価したところ、いずれの時点においても、本剤投与群とプロパセタモール投与群で同程度の疼痛強度差が認められた。

#### < 小児科領域における発熱 >

無作為化二重盲検実薬対照単回投与試験（海外試験）<sup>10)</sup>

感染症による急性発熱（直腸体温38.5～41℃）のある小児患者（1カ月～12歳）67例を対象として、本剤1.5mL/kg（アセトアミノフェンとして15mg/kg）又はプロパセタモール30mg/kgを15分かけて単回投与した。投与後6時間の体温変化を評価したところ、ベースライン時の体温39.4℃に対し、本剤投与群の平均最大体温低下は1.9℃であり、体温は投与後2時間で38℃以下になり、そのままの状態を3.5時間維持した。

## 【薬効薬理】

アセトアミノフェンの作用の正確な部位や機序は完全には解明されていないが、解熱剤としての有効性は視床下部の体温調節中枢への作用に起因するとされ、鎮痛作用は視床と大脳皮質に作用して痛覚閾値を上昇させることによると考えられている。作用機序としては、中枢神経系に作用し、プロスタグランジン（PG）合成、カンナビノイド受容体系又はセロトニン作動系などに影響を及ぼすと考えられている<sup>11)</sup>。アセトアミノフェンの静脈内単回投与は、雄マウスを用いたフェニルベンゾキノロン腹腔内投与による侵害受容反応に対して鎮痛作用を示した<sup>12)</sup>。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

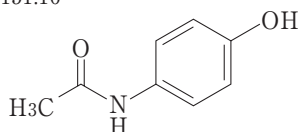
一般名：アセトアミノフェン (Acetaminophen)

化学名：N-(4-Hydroxyphenyl) acetamide

分子式：C<sub>8</sub>H<sub>9</sub>NO<sub>2</sub>

分子量：151.16

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。メタノール又はエタノール(95)に溶けやすく、水にやや溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくい。水酸化ナトリウム試液に溶ける。

## \*【取扱い上の注意】

- 本品は軟らかいプラスチックのバッグなので、鋭利なもの等で傷つけないこと。液漏れの原因となる。
- 凍結保存しないこと。
- 低温下では、結晶析出の可能性がある。結晶が析出した場合は、湯煎（60℃以下）にて加温溶解後、放冷して使用すること。
- 外袋開封後は速やかに使用すること。
- 外袋に破損がみられる場合や内容液が漏れている場合、あるいは内容液に混濁・浮遊物等の異常が認められるときは使用しないこと。
- 排出口をシールしているフィルムがはがれているときは使用しないこと。
- 使用時には排出口をシールしているフィルムをはがすこと。
- びん針又は注射針は、ゴム栓の刻印部にゆっくり、まっすぐ刺通すこと。〔斜めに刺したり、同一箇所を繰り返し刺すと、ゴム栓や排出口内壁の削り片が薬液中に混入したり、容器を刺通し液漏れの原因となる。〕
- 容器の目盛りは目安として使用すること。
- 残液は使用しないこと。

## 【包装】

100mL×20袋

## 【主要文献】

- 1) 門間和夫ほか：小児科の進歩、診断と治療社。1983；**2**：95-101.
- 2) 熊谷雄治：臨床医薬。2013；**29**（10）：875-887.
- 3) 熊谷雄治：臨床医薬。2013；**29**（10）：889-897.
- 4) OFIRMEV添付文書
- 5) Gazzard BG et al. : J Pharm Pharmacol. 1973；**25**：964-967.
- 6) Naga Rani MA et al. : J Indian Med Assoc. 1989；**87**（8）：182-183.
- 7) 福本真理子：中毒研究。2003；**16**：285-297.
- 8) Moller PL et al. : Anesthesia & Analgesia. 2005；**101**（1）：90-96.
- 9) Murat I et al. : Paediatr Anaesth. 2005；**15**（8）：663-670.
- 10) Duhamel JF et al. : Int J Clin Pharmacol Ther. 2007；**45**（4）：221-229.
- 11) 鈴木孝浩：ペインクリニック。2012；**33**（2）：218-226.
- 12) テルモ株式会社：マウス薬理試験（社内資料）

## 【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

テルモ株式会社 コールセンター  
〒151-0072 東京都渋谷区幡ヶ谷2丁目44番1号  
TEL 0120-12-8195

**TERUMO**

製造販売元：テルモ株式会社  
東京都渋谷区幡ヶ谷2丁目44番1号