

日本標準商品分類番号
873327,87449

貯法	室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

抗プラスミン剤

日本薬局方 トラネキサム酸錠

トランサミン[®]錠250mg
トランサミン[®]錠500mg

日本薬局方 トラネキサム酸カプセル

トランサミン[®]カプセル250mg
トランサミン[®]散50%

トラネキサム酸散

TRANSAMIN[®] TABLETS, CAPSULES, POWDER

	錠250mg	錠500mg
承認番号	21400AMZ00148	15300AMZ01211
薬価収載	2002年7月	1981年9月
販売開始	2002年9月	1981年9月
再評価結果	1977年10月	1977年10月

	*カプセル250mg	散50%
承認番号	22000AMX01511	21400AMZ00141
薬価収載	2008年6月	2002年7月
販売開始	2008年6月	2002年8月
再評価結果	1977年10月	1977年10月

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

トロンピンを投与中の患者(「相互作用」の項参照)

【組成・性状】

1. 組成

1錠又は1カプセル又は散1g中にそれぞれ次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
トランサミン錠250mg	トラネキサム酸(日局) 250mg	トウモロコシデンブ、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、硬化油
トランサミン錠500mg	トラネキサム酸(日局) 500mg	カルメロースカルシウム、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、タルク、酸化チタン、ジメチルポリシロキサン、二酸化ケイ素、カルナウバロウ
トランサミンカプセル250mg	トラネキサム酸(日局) 250mg	トウモロコシデンブ、ステアリン酸マグネシウム カプセル:ゼラチン、ラウリル硫酸ナトリウム、黄色5号
トランサミン散50%	トラネキサム酸(日局) 500mg	D-マンニトール、ポリビニルアルコール(部分けん化物)

2. 製剤の性状

販売名	剤形	色	外形		識別コード
			大きさ(mm)	重さ(mg)	
トランサミン錠250mg	素錠	白色		290	2606
			10.0(直径) 3.2(厚さ)		
トランサミン錠500mg	フィルムコーティング錠(キャレット型)	白色～淡黄白色		574	2608
			17.8(長径) 7.2(短径) 5.0(厚さ)		
トランサミンカプセル250mg	カプセル(2号)	キャップ: だいたい色不透明 ボディー: 白色不透明		348	2605
			17.8(全長)		
トランサミン散50%	散剤	白色	-	-	-

【効能・効果】

- 全身性線溶亢進が関与すると考えられる出血傾向(白血病、再生不良性貧血、紫斑病等、及び手術中・術後の異常出血)
- 局所線溶亢進が関与すると考えられる異常出血(肺出血、鼻出血、性器出血、腎出血、前立腺手術中・術後の異常出血)
- 下記疾患における紅斑・腫脹・そう痒等の症状(湿疹及びその類症、蕁麻疹、薬疹・中毒疹)
- 下記疾患における咽頭痛・発赤・充血・腫脹等の症状(扁桃炎、咽喉頭炎)
- 口内炎における口内痛及び口内粘膜アフター

【用法・用量】

トラネキサム酸として、通常成人1日750～2,000mgを3～4回に分割経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈参考〉

剤形別用量は次のとおり

剤形	1日量(3～4回分割投与)
トランサミン錠250mg	3～8錠
トランサミン錠500mg	2～4錠
トランサミンカプセル250mg	3～8カプセル
トランサミン散50%	1.5～4g

【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) 血栓のある患者(脳血栓、心筋梗塞、血栓性静脈炎等)及び血栓症があらわれるおそれのある患者[血栓を安定化させるおそれがある。]
- (2) 消費性凝固障害のある患者(ヘパリン等と併用すること)[血栓を安定化させるおそれがある。]
- (3) 術後の臥床状態にある患者及び圧迫止血の処置を受けている患者[静脈血栓を生じやすい状態であり、本剤投与により血栓を安定化させるおそれがある。離床、圧迫解除に伴い肺塞栓症を発症した例が報告されている。]
- (4) 腎不全のある患者[血中濃度が上昇することがある。]
- (5) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2. 相互作用

(1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
トロンピン	血栓形成傾向があらわれるおそれがある。	血栓形成を促進する作用があり、併用により血栓形成傾向が増大する。

(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
ヘモコアグラージェ	大量併用により血栓形成傾向があらわれるおそれがある。	ヘモコアグラージェによって形成されたフィブリン塊は、本剤の抗プラスミン作用によって比較的長く残存し閉塞状態を持続させるおそれがあると考えられている。
バトロキソピン	血栓・塞栓症を起こすおそれがある。	バトロキソピンによって生成するdesAフィブリンポリマーの分解を阻害する。
凝固因子製剤 エプタコグアルファ等	口腔等、線溶系活性が強い部位では凝固系がより亢進するおそれがある。	凝固因子製剤は凝固系を活性化させることにより止血作用を発現する。一方、本剤は線溶系を阻害することにより止血作用を発現する。

3. 副作用

総症例数2,954例中報告された主な副作用は食欲不振0.61%(18件)、悪心0.41%(12件)、嘔吐0.20%(6件)、胸やけ0.17%(5件)、そう痒感0.07%(2件)、発疹0.07%(2件)等であった。【文献集計による(再審査対象外)】

** (1) 重大な副作用(頻度不明^注)

痙攣：人工透析患者において痙攣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

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.1～1%未満	0.1%未満
過敏症		そう痒感、発疹等
消化器	食欲不振、悪心、嘔吐、下痢、胸やけ	
その他		眠気

**注) 自発報告において認められている副作用のため頻度不明。

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

5. 適用上の注意

薬剤交付時：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報告されている。)

6. その他の注意

イヌに長期・大量投与したところ網膜変性があらわれたとの報告がある。

【薬物動態】

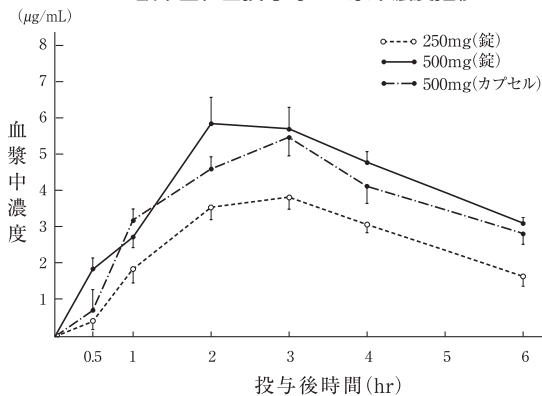
1. 血中濃度¹⁾

健康成人に本剤を単回経口投与した場合、薬物動態パラメータは次のとおりであった。

単回経口投与におけるトラネキサム酸の薬物動態パラメータ (n=5)

投与量	250mg(錠)	500mg(錠)	500mg(カプセル)
Tmax (hr)		2～3	
Cmax (μg/mL)	3.9	6.0	5.5
t _{1/2} (hr)	3.1	3.3	3.3

トラネキサム酸単回経口投与時の血漿中濃度推移



2. 分布

参考(動物実験)

ラットに¹⁴C-トラネキサム酸を単回経口投与したところ、大部分の臓器において全血中濃度と同様に投与2時間後に最高濃度を示し、腎、肝では血中より高濃度に、他の臓器では血中より低濃度に分布した。

3. 代謝、排泄¹⁾

健康成人にトラネキサム酸を250mg又は500mg単回経口投与した場合、トラネキサム酸は速やかに吸収され、投与後24時間以内に投与量の約40～70%が未変化体として尿中に排泄された。

【臨床成績】

1. 抗出血作用

一般臨床試験では、全身性線溶亢進が関与すると考えられる白血病、再生不良性貧血、紫斑病等の出血傾向及び肺出血、性器出血、腎出血、手術中・術後等の異常出血に対する止血効果は2,802例中73.6%(2,063例)に認められている。

2. 抗アレルギー・抗炎症作用

(1) 皮膚疾患

皮膚疾患(湿疹及びその類症、蕁麻疹、薬疹・中毒疹等)の患者223例を対象にした一般臨床試験では、そう痒、腫脹、紅斑等の症状に対する効果は60.5%(135例)に認められている。皮膚疾患(湿疹及びその類症、薬疹・中毒疹)の患者67例を対象に、そう痒、発赤、腫脹等の症状に対する効果を本剤(35例)とプラセボ(32例)との二重盲検比較試験により検討した結果、有効以上はプラセボ31.3%(10例)に対し本剤62.9%(22例)で、本剤が有意(p<0.05)に優れていた²⁾。

(2) 耳鼻咽喉科疾患

扁桃炎、咽喉頭炎、口内炎及び歯肉炎等の患者168例を対象にした一般臨床試験では、疼痛、腫脹及び発赤等に対する効果は70.8%(119例)に認められている。耳鼻咽喉科疾患(急性咽喉頭炎、急性扁桃炎、口内炎等)の患者168例を対象に疼痛、腫脹及び発赤に対する効果を本剤(84例)とプラセボ(84例)との二重盲検比較試験により検討した結果、有効以上はプラセボ26.2%(22例)に対し本剤52.4%(44例)で、本剤が有意(p<0.05)に優れていた³⁾。

【薬効薬理】

線維素溶解現象(線溶現象)は生体の生理的ならびに病的状態において、フィブリン分解をはじめ、血管の透過性亢進等に関与し、プラスミンによって惹起される生体反応を含め、種々の出血症状やアレルギー等の発生進展や治癒と関連している。

トラネキサム酸は、このプラスミンの働きを阻止し、抗出血・抗アレルギー・抗炎症効果を示す。

1. 抗プラスミン作用^{4)~8)}

トラネキサム酸は、プラスミンやプラスミノゲンのフィブリンアフィニティー部位であるリジン結合部位(LBS)と強く結合し、プラスミンやプラスミノゲンがフィブリンに結合するのを阻止する。このため、プラスミンによるフィブリン分解は強く抑制される。更に、α₂-マクログロブリン等血漿中アンチプラスミンの存在下では、トラネキサム酸の抗線溶作用は一段と強化される。

2. 止血作用⁴⁾

異常に亢進したプラスミンは、血小板の凝集阻止、凝固因子の分解等を起こすが、軽度の亢進でも、フィブリン分解がまず特異的に起こる。したがって一般の出血の場合、トラネキサム酸は、このフィブリン分解を阻害することによって止血すると考えられる。

3. 抗アレルギー・抗炎症作用^{9~12)}

トラネキサム酸は、血管透過性の亢進、アレルギーや炎症性病変の原因になっているキニンやその他の活性ペプチド等のプラスミンによる産生を抑制する(モルモット、ラット)。

【有効成分に関する理化学的知見】

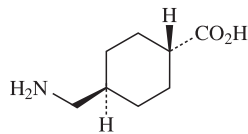
一般名：トラネキサム酸(Tranexamic Acid)

化学名：*trans*-4-(Aminomethyl) cyclohexanecarboxylic acid

分子式： $C_8H_{15}NO_2$

分子量：157.21

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。水に溶けやすく、エタノール(99.5)にほとんど溶けない。

【 包 装 】

トランサミン錠250mg
(プラスチックボトル) 500錠
(PTP) 100錠 500錠

トランサミン錠500mg
(PTP) 100錠 500錠
(日本薬局方トラネキサム酸錠)

トランサミンカプセル250mg
(PTP) 100cap. 500cap.
(日本薬局方トラネキサム酸カプセル)

トランサミン散50% 100g

【主 要 文 献】

- 1) 佐野光司ほか：臨床薬理 1976；7(4)：375-382
- 2) 宗像 醇：西日本皮膚科 1969；31(2)：141-146
- 3) 宮城 平：臨床と研究 1969；46(1)：243-245
- 4) 安孫子雅史：Med Pharm. 1976；10(1)：7-11
- 5) Iwamoto M：Thrombos Diathes Haemorrh. 1975；33(3)：573-585
- 6) Markus G, et al.：J Biol Chem. 1979；254(4)：1211-1216
- 7) Abiko Y, et al.：Biochim Biophys Acta. 1969；185(2)：424-431
- 8) Abiko Y, et al.：Biochim Biophys Acta. 1970；214(3)：411-418
- 9) 山田外春ほか：プラスミン研究会報告集 1974；14：364-366
- 10) 木村義民ほか：アレルギー 1966；15(9)：755-763
- 11) 近藤元治：プラスミン研究会報告集 1966；6：36-37
- 12) 山崎英正ほか：日本薬理学雑誌 1967；63(6)：560-571

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

第一三共株式会社 製品情報センター
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3-5-1
TEL：0120-189-132