



貯 法：室温保存

使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること

承認番号	23100AMX00247000
薬価収載	2019年6月
販売開始	2019年6月

抗プラスミン剤

日本薬局方 **トラネキサム酸錠****トラネキサム酸錠250mg「日医工」****Tranexamic Acid Tablets**

【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

トロンビンを投与中の患者 (「相互作用」の項参照)

【組成・性状】

販売名	トラネキサム酸錠250mg「日医工」	
剤形・色調	白色の素錠	
有効成分の名称	トラネキサム酸	
含量 (1錠中)	250mg	
添加物	トウモロコシデンプン, 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, フマル酸ステアリルナトリウム	
外形	表面	 質量: 289mg
	裏面	 直径: 10.1mm
	側面	 厚さ: 3.2mm
本体表示	トラネキサム 250 日医工	
包装コード	②227	

【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, および手術中・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
湿疹およびその類症, 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およ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。

【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生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
トロンビン	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
ヘモコアグラゼ	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。	ヘモコアグラゼ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継続させるおそれがあると考えられている。
バトロクソピン	血栓・塞栓症を起こすおそれがある。	バトロク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

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1)重大な副作用 (頻度不明)

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。

	頻度不明
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

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, 更には穿孔を起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。

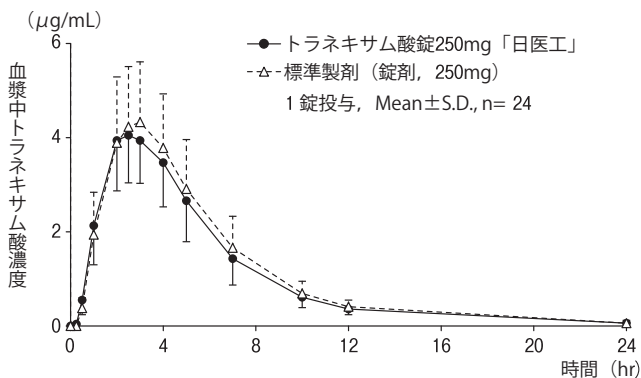
【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験

トラネキサム酸錠250mg「日医工」及び標準製剤を、クロソオーバー法によりそれぞれ1錠（トラネキサム酸として250mg）健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中トラネキサム酸濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC, 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¹⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₂₄ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
トラネキサム酸錠 250mg「日医工」	25.16 ± 6.78	4.23 ± 1.09	2.54 ± 0.41	4.08 ± 1.84
標準製剤 (錠剤, 250mg)	27.07 ± 7.74	4.60 ± 1.31	2.65 ± 0.58	3.93 ± 1.55

(1錠投与, Mean ± S.D., n=24)



血漿中濃度並びにAUC, 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。

2. 溶出挙動

トラネキサム酸錠250mg「日医工」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたトラネキサム酸250mg錠の溶出規格に適合していることが確認されている²⁾。

【薬効薬理】

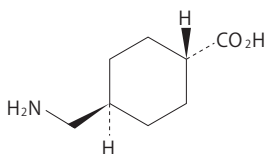
抗線溶薬。凝固した血液（フィブリン塊）は繊維素溶解（線溶）系により徐々に溶解されるが、フィブリンを分解するのはプラスミンである。本薬はプラスミンの前駆物質であるプラスミノゲンからプラスミンへの変換を阻害すると共に、プラスミンのフィブリンへの結合を阻害してフィブリンの溶解を防ぐ。臨床的には、線溶系亢進による異常出血に用いられる³⁾。

【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

構造式：



分子式： $\text{C}_8\text{H}_{15}\text{NO}_2$

分子量：157.21

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。

【取扱い上の注意】

安定性試験

本品につき加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）を行った結果、トラネキサム酸錠250mg「日医工」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された⁴⁾。

【包装】

トラネキサム酸錠250mg「日医工」

100錠（10錠×10；PTP）

1000錠（10錠×100；PTP）

【主要文献】

- 1) 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 第十七改正日本薬局方解説書 C-3457-C-3462, 廣川書店, 東京 (2016)
- 4) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

フリーダイヤル (0120) 517-215

Fax (076) 442-8948