

※※印：2016年10月改訂(第13版、社名変更等に伴う改訂)
※印：2015年 7月改訂

日本標準商品分類番号
873327 87449

貯 法：室温保存
使用期限：アンプル及び外装に表示の使用期限内に使用すること。
規制区分：処方箋医薬品
(注意－医師等の処方箋により使用すること)

※ 承認番号	22700AMX00012000
※ 薬価収載	2015年12月
販売開始	1976年 9月
再評価結果	1977年10月
効能追加	2005年 8月

日本薬局方

トラネキサム酸注射液

抗プラスミン剤

※**トラネキサム酸注射液 1000mg「テバ」** Tranexamic Acid Injection 1000mg “TEVA”

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1) トロンビンを投与中の患者(「相互作用」の項参照)
- (2) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

組 成	1管(10mL)中：トラネキサム酸……………1,000mg (添加物) pH調節剤
性 状	無色澄明の注射液
pH	7.0～8.0
浸透圧比	2.1～2.5(日局生理食塩液に対する比)

【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・そう痒などの症状
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・腫脹などの症状
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250～500mgを1～2回に分けて静脈内又は筋肉内注射する。
術中・術後などには必要に応じ1回500～1,000mgを静脈内注射するか又は500～2,500mgを点滴静注する。
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)およ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およ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〕

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維持させるおそれがあると考えられている。
バトロキソビン	血栓・塞栓症を起こすおそれがある。	バトロキソビ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)

- 1) **ショック** ショックを起こす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) **痙攣** 人工心肺を用いた心臓大血管手術の周術期に本剤を投与した患者において、術後に痙攣があらわれることがある。また、人工透析患者において痙攣があらわれたとの報告がある。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	悪心、嘔吐、食欲不振、下痢
眼	一過性の色覚異常(静脈内注射時)
その他	眠気、頭痛

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

- (1) 静脈内注射時：ゆっくり静脈内に投与すること。(急速に投与すると、まれに悪心、胸内不快感、心悸亢進、血圧低下等があらわれることがある)
- (2) 筋肉内注射時：筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響を避けるため下記の点に注意すること。
 - 1) 注射部位については、神経走行部位を避けて慎重に投与すること。

- くりかえし注射する場合には、左右交互に注射するなど、同一部位を避けること。なお、低出生体重児・新生児・乳児・幼児・小児には特に注意すること。
- 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
- アンプルカット時：アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭してから、ヤスリを用いしないで、アンプル頭部のマークの反対方向に折ること。

6. その他の注意

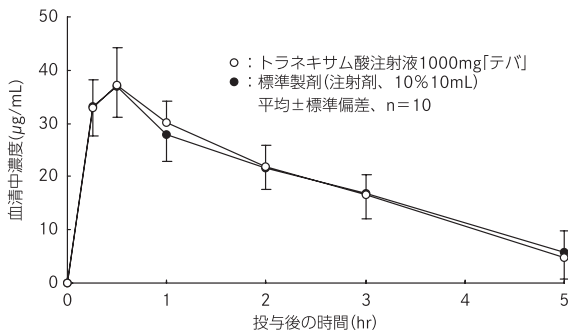
イヌに長期・大量投与したところ網膜変性があらわれたとの報告がある。

【薬物動態】¹⁾

1. 生物学的同等性試験

○筋肉内投与

トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ5mL(トラネキサム酸として500mg)健康成人男子に単回筋肉内投与して血清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)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=10)

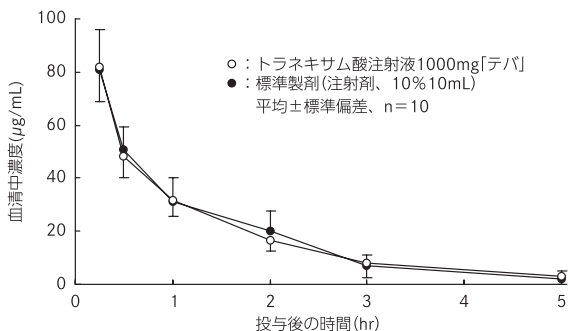
	投与量 (mg)	AUC ₀₋₅ (μg·hr/mL)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」	500	96.2 ± 19.3	37.7 ± 6.9	0.5 ± 0.1	1.7 ± 0.8
標準製剤 (注射剤、10%10mL)	500	96.0 ± 15.3	37.1 ± 5.8	0.5 ± 0.1	1.6 ± 0.7

血清中濃度並びに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. 血中濃度

○静脈内投与

トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ5mL(トラネキサム酸として500mg)健康成人男子に単回静脈内投与して血清中トラネキサム酸濃度を測定した。



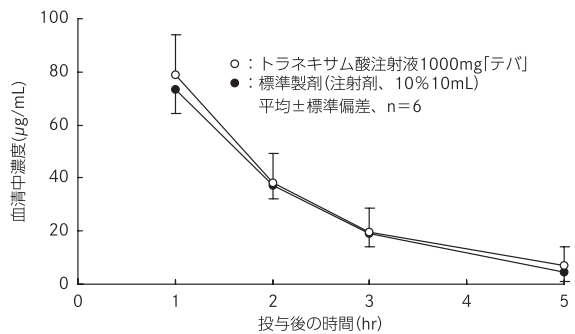
薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=10)

	投与量 (mg)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」	500	82.0 ± 14.0	—	1.2 ± 0.5
標準製剤 (注射剤、10%10mL)	500	81.0 ± 12.3	—	0.9 ± 0.3

血清中濃度並びに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。

○点滴静脈内投与

トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ25mL(トラネキサム酸として2500mg)健康成人男子に30分間にわたり点滴静脈内投与して血清中トラネキサム酸濃度を測定した。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=6)

	投与量 (mg)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」	2500	78.7 ± 15.4	—	1.2 ± 0.5
標準製剤 (注射剤、10%10mL)	2500	73.2 ± 8.6	—	1.0 ± 0.3

血清中濃度並びに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。

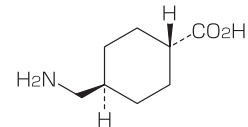
【薬効薬理】²⁾

トラネキサム酸は、抗線溶薬である。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。

【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：C₈H₁₅NO₂
 分子量：157.21
 性状：トラネキサム酸は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。

構造式：



【取扱い上の注意】³⁾

安定性試験結果の概要

長期保存試験(3年)の結果、トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

【包装】

トラネキサム酸注射液1000mg「テバ」(1管10mL中1,000mg) 50管

【主要文献】

- 武田テバファーマ(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 第十六改正日本薬局方解説書
- 武田テバファーマ(株)社内資料(安定性試験)

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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。
 武田テバファーマ株式会社 武田テバDIセンター
 〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
 TEL 0120-923-093
 受付時間 9:00~17:30(土日祝日・弊社休業日を除く)

※※販売

武田薬品工業株式会社
 大阪市中央区道修町四丁目1番1号

※※製造販売元

武田テバファーマ株式会社
 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

PQMB4001