

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2013に準拠して作成

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”

剤形	水性注射剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品 (注意－医師等の処方箋により使用すること)
規格・含量	1管(10mL)中：トラネキサム酸…………… 1,000mg
一般名	和名：トラネキサム酸 (JAN) 洋名：Tranexamic Acid (JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日：2015年1月9日(販売名変更による) 薬価基準収載年月日：2015年12月11日(販売名変更による) 発売年月日：1976年9月1日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	販 売：武田薬品工業株式会社 製造販売元：武田テバファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	武田テバファーマ株式会社 武田テバDIセンター TEL 0120-923-093 受付時間 9:00～17:30(土日祝日・弊社休業日を除く) 医療関係者向けホームページ https://www.med.takeda-teva.com

本IFは2016年10月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

IF 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。
(2013 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	14
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	14
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	14
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	14
5. 化学名（命名法）	2	8. 副作用	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	16
7. CAS登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	16
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	16
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	16
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	16
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	16
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	17
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	17
3. 注射剤の調製法	4	2. 毒性試験	17
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	X. 管理的事項に関する項目	18
5. 製剤の各種条件下における安定性	5	1. 規制区分	18
6. 溶解後の安定性	5	2. 有効期間又は使用期限	18
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	3. 貯法・保存条件	18
8. 生物学的試験法	6	4. 薬剤取扱い上の注意点	18
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	6	5. 承認条件等	18
10. 製剤中の有効成分の定量法	6	6. 包装	18
11. 力価	6	7. 容器の材質	18
12. 混入する可能性のある夾雑物	6	8. 同一成分・同効薬	18
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	9. 国際誕生年月日	18
14. その他	6	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	18
V. 治療に関する項目	7	11. 薬価基準収載年月日	18
1. 効能又は効果	7	12. 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	19
2. 用法及び用量	7	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
3. 臨床成績	7	14. 再審査期間	19
VI. 薬効薬理に関する項目	8	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	8	16. 各種コード	19
2. 薬理作用	8	17. 保険給付上の注意	19
VII. 薬物動態に関する項目	9	XI. 文献	20
1. 血中濃度の推移・測定法	9	1. 引用文献	20
2. 薬物速度論的パラメータ	11	2. その他の参考文献	20
3. 吸収	12	XII. 参考資料	21
4. 分布	12	1. 主な外国での発売状況	21
5. 代謝	12	2. 海外における臨床支援情報	21
6. 排泄	13	XIII. 備考	22
7. トランスポーターに関する情報	13	その他の関連資料	22
8. 透析等による除去率	13		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

トラネキサム酸は、プラスミンの働きをおさえ、止血作用及び抗アレルギー・抗炎症作用を現す抗プラスミン剤である。

弊社は、後発医薬品としてトラネキサム S 注射液の開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1975 年 7 月に承認を取得した。

また、2005 年 8 月、「湿疹およびその類症、蕁麻疹、薬疹・中毒疹における腫脹症状」、「咽喉頭炎における咽頭痛・発赤・充血・腫脹などの症状」の効能・効果が追加された。

その後、有効成分・含有量を表示した、トラネキサム酸注射液 1000mg 「タイヨー」に名称変更した後、「商標権抵触等により医薬品の販売名のみを変更するものの取扱いについて」（平成 4 年 2 月 14 日付薬審第 37 号）に基づき、販売名をトラネキサム酸注射液 1000mg 「テバ」と変更し、2015 年 1 月に承認を取得し、2015 年 12 月に薬価基準収載された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 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）、○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、咽喉頭炎における）、○口内炎における口内痛および口内粘膜アフター、に適応を有している。

（「V－1. 効能又は効果」の項参照）

2. 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のでいずれも頻度は不明であるが、重大な副作用として、ショック、痙攣があらわれることがある。

（「VIII－8. 副作用」の項参照）

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

トラネキサム酸注射液 1000mg 「テバ」

(2) 洋名

Tranexamic Acid Injection 1000mg “TEVA”

(3) 名称の由来

主成分「トラネキサム酸」より命名

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

トラネキサム酸（JAN）

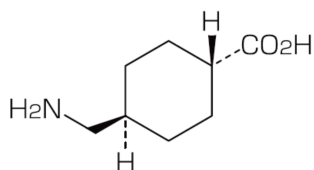
(2) 洋名（命名法）

Tranexamic Acid（JAN）

(3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₈H₁₅NO₂

分子量：157.21

5. 化学名（命名法）

trans-4-(Aminomethyl)cyclohexanecarboxylic acid

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

1197-18-8

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。
無臭で、味は苦い¹⁾。

(2) 溶解性

水に溶けやすく、エタノール (99.5) にほとんど溶けない。
酢酸 (100) に溶けやすく、エタノール (95) に極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない¹⁾。

各種 pH における溶解度²⁾

溶液	溶解度 (37℃)
pH1.2	142 mg/mL
pH4.0	130 mg/mL
pH6.8	127 mg/mL
水	125 mg/mL

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数²⁾

pK_{a1} : 4.33 (カルボキシル基、滴定法)
 pK_{a2} : 10.65 (アミノ基、滴定法)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値¹⁾

pH : 本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 7.0~8.0 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

日局「トラネキサム酸」の確認試験法による
赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

4. 有効成分の定量法

日局「トラネキサム酸」の定量法による
液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	剤形の区別	規格	性状
トラネキサム酸 注射液 1000mg 「テバ」	水性注射剤	1 管 (10mL) 中： トラネキサム酸を 1,000mg 含有	無色澄明の 注射液

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH	浸透圧比
7.0~8.0	2.1~2.5 (日局生理食塩液に対する比)

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

特になし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1 管 (10mL) 中：トラネキサム酸を 1,000mg 含有

(2) 添加物

pH 調節剤

(3) 電解質の濃度

該当資料なし

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

特になし

3. 注射剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

<加速試験> ³⁾

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。

試験条件

保存条件	包装形態
40±1℃	無色透明ガラスアンプル

試験結果

試験項目	試験開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	無色澄明の液であった	無色澄明の液であった	無色澄明の液であった	無色澄明の液であった
pH	7.14	7.12	7.13	7.13
定量 *1 (%)	99.9±0.3	99.9±0.2	99.9±0.3	99.7±0.3

*1 平均値±S. D.

[3ロット]

<長期保存試験>

長期保存試験（3年）の結果、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。

<光安定性試験> ⁴⁾

全ての試験項目において、顕著な変化は認められなかった。

試験条件

保存条件	保存容器
60万 lx・hr	無色透明ガラスアンプル

試験結果

試験項目	性状	pH	定量 *1 (%)
試験開始時	無色澄明の液であった	7.34	100
光 60万 lx・hr	無色澄明の液であった	7.33	99.7

*1 試験開始時を100とした残存率

[平均値, n=3]

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）⁵⁾

<pH変動試験>

試験製剤	規格 pH	試料 pH	0.1mol/L (A) HCl (B) NaOH	最終pH 又は 変化点pH	移動 指数	変化 所見
トラネキサム酸注射液 1000mg「テバ」	7.0~8.0	7.30	(A) 10mL	5.10	2.20	なし
			(B) 10mL	10.06	2.76	なし

<配合変化試験>

「XIII. 備考」の項参照

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「トラネキサム酸注射液」の確認試験法による
ニンヒドリン試液による呈色反応

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「トラネキサム酸注射液」の定量法による
液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物¹⁾

シス-4-アミノメチルシクロヘキサン-1-カルボン酸
ジ (トランス-4-カルボキシシクロヘキシル) アミン
4- (アミノメチル) -1-シクロヘキセンカルボン酸
p-アミノメチル安息香酸

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

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

2. 用法及び用量

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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

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試験の概要

該当資料なし

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

ε-アミノカプロン酸、アプロチニン製剤など

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

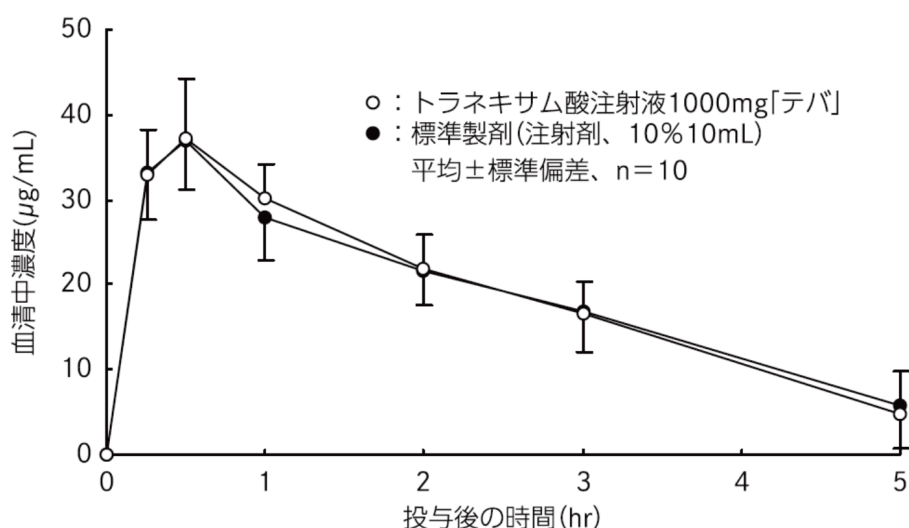
「VII-1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁶⁾

○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。

被験者数	10 名		
投与方法	2 剤 2 期のクロスオーバー法	単回筋肉内投与	
投与量	製剤 5mL (トラネキサム酸として 500mg)		
採血時間	7 時点 (投与前、投与後 0.25、0.5、1、2、3、5 時間)		
休薬期間	1 ヶ月	分析法	抗プラスミン活性測定法



<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

<判定結果>

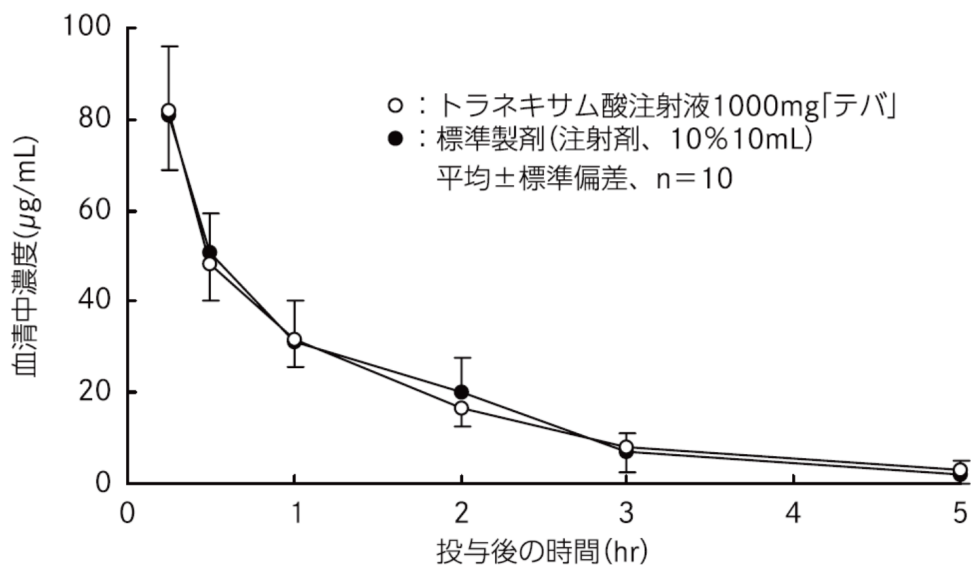
	AUC ₀₋₅	Cmax
母平均の比	0.99	1.01
90%信頼区間	log(0.82)~log(1.21)	log(0.87)~log(1.18)

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。

○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。

被験者数	10名		
投与方法	2剤2期のクロスオーバー法	緩徐に単回静脈内投与	
投与量	製剤 5mL（トラネキサム酸として 500mg）		
採血時間	7時点（投与前、投与後 0.25、0.5、1、2、3、5時間）		
休薬期間	1ヵ月	分析法	抗プラスミン活性測定法



<薬物動態パラメータ>

(平均±標準偏差、n=10)

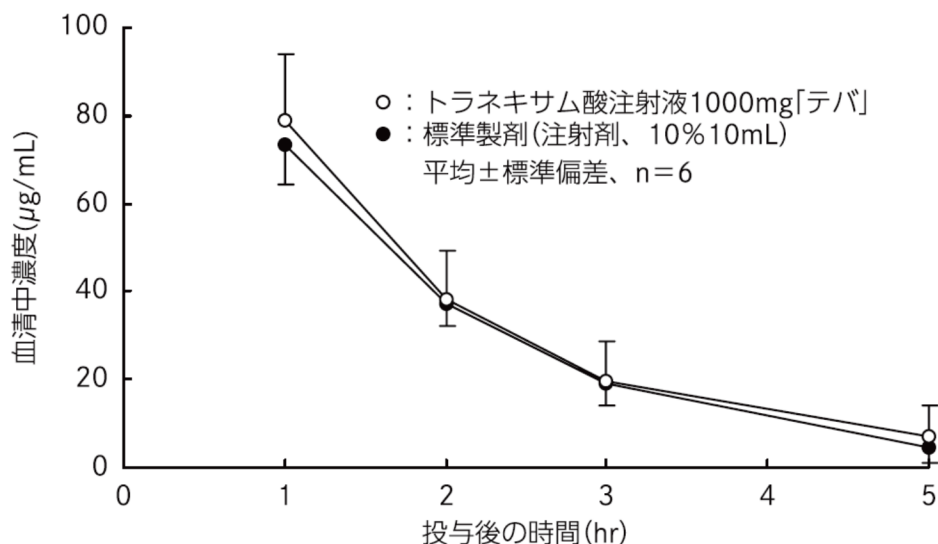
	投与量 (mg)	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
トラネキサム酸注射液 1000mg「テバ」	500	82.0 ± 14.0	—	1.2 ± 0.5
標準製剤（注射剤、10%10mL）	500	81.0 ± 12.3	—	0.9 ± 0.3

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。

被験者数	6名		
投与方法	2剤2期のクロスオーバー法	30分間にわたり点滴静脈内投与	
投与量	製剤 25mL (トラネキサム酸として 2500mg)		
採血時間	5時点 (投与前、投与後 1、2、3、5時間)		
休薬期間	1ヵ月	分析法	抗プラスミン活性測定法



<薬物動態パラメータ>

(平均±標準偏差、n=6)

	投与量 (mg)	C _{max} (µg/mL)	T _{max} (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 C_{max} 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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ-7. 相互作用」の項参照

(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率¹⁾

血漿たん白結合率は約3%である。

血漿成分のうち主に結合に参与するのはプラスミノゲンである。血清アルブミンとは結合しない。

3. 吸収

該当資料なし

4. 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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路¹⁾

主に腎臓

(2) 排泄率¹⁾

尿中排泄率は約 76% (静注)、80% (筋注) である。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

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 [血栓を安定化するおそれがある]
- (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） [血栓を安定化するおそれがある]
- (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するおそれがある。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]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

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) 併用注意とその理由

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持続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。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

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。

(3) 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) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

下記の項目参照

VIII-2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）(2)

VIII-8. (2) 重大な副作用と初期症状 1)、(3) その他の副作用：過敏症

9. 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。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

該当資料なし

11. 小児等への投与

該当資料なし

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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。
 - 2) 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。
 - 3) 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。
- (3) 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
ないで、アンプル頭部のマークの反対方向に折ること。

15. 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。

16. その他

該当しない

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）

該当資料なし

- (2) 副次的薬理試験

該当資料なし

- (3) 安全性薬理試験

該当資料なし

- (4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

- (4) 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

1. 規制区分

製 剤：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果（加速及び長期保存）に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

特になし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ－14. 適用上の注意」の項参照

(3) 調剤時の留意点について

特になし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

50管

7. 容器の材質

無色透明ガラスアンプル

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：トランサミン注10%

同 効 薬：－

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
トラネキサム酸注射液 1000mg「テバ」	2015年1月9日	22700AMX00012000

<旧販売名>

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
トラネキサム酸注射液 1000mg「タイヨー」	2007年3月5日	21900AMX00218000

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
トラネキサムS注射液	1975年7月15日	15000AMZ00339000

製造販売一部変更承認年月日：2005年8月24日（効能効果追加による）

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
トラネキサム酸注射液 1000mg 「テバ」	2015年12月11日

<旧販売名>

製品名	薬価基準収載年月日
トラネキサム酸注射液 1000mg 「タイヨー」	2007年6月15日

製品名	薬価基準収載年月日
トラネキサム S 注射液	1976年9月1日

12. 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

<2005年8月24日 効能・効果追加>

湿疹およびその類症、蕁麻疹、薬疹・中毒疹における腫脹症状
咽喉頭炎における咽頭痛・発赤・充血・腫脹などの症状

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

薬効再評価結果公示日：1977年10月28日

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

16. 各種コード

製品名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
トラネキサム酸注射液 1000mg 「テバ」	108099503	3327401A4282	620809902

<旧販売名>

製品名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
トラネキサム酸注射液 1000mg 「タイヨー」	108099502	3327401A4231	620005191

17. 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) 第十六改正日本薬局方解説書 (2011)
- 2) 医療用医薬品 品質情報集 No. 22, 日本公定書協会 (2005)
- 3) 武田テバファーマ(株)社内資料 (加速試験)
- 4) 武田テバファーマ(株)社内資料 (光安定性試験)
- 5) 武田テバファーマ(株)社内資料 (pH変動・配合変化試験)
- 6) 武田テバファーマ(株)社内資料 (生物学的同等性試験)

2. その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況
該当しない
2. 海外における臨床支援情報
該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

< 配合変化試験 > ⁵⁾

○配合方法

- I. 本剤1アンプルを各種輸液と混合した。
- II. 生理食塩液 100mL に本剤1アンプルを配合し、配合薬剤と混合した。
- III. 生理食塩液 500mL に本剤1アンプルを配合し、配合薬剤と混合した。
- IV. 5%ブドウ糖液 500mL に本剤1アンプルを配合し、配合薬剤と混合した。
- V. 本剤1アンプルを配合薬剤と直接混合した。

○試験結果

※含量は配合直後を100とした残存率で示した。

(保存条件：室温、1000lx 室内散乱光下)

薬効分類	配合薬剤		配合方法	試験項目	配合後の時間			
	製品名	配合量			配合直後	3時間	6時間	24時間
糖類剤	キリット注5% 【大塚工場】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.95	7.02	6.97	7.01
				含量(%)	100	—	—	100.0
	ブドウ糖注射液5% 「マイラン」 【マイラン】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.79	6.78	6.78	6.79
				含量(%)	100	—	—	102.6
	ハイカリック液-1号 【テルモ】	700mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	4.56	4.56	4.56	4.57
				含量(%)	100	—	—	100.6
	ハイカリック液-2号 【テルモ】	700mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	4.55	4.53	4.54	4.54
				含量(%)	100	—	—	99.9
血液代用剤	KN3号輸液 【大塚工場】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	5.97	5.97	5.97	5.98
				含量(%)	100	—	—	100.6
	生理食塩液「マイラン」 【マイラン】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.70	6.70	6.76	6.70
				含量(%)	100	—	—	99.9
	ソリター-T3号輸液 【エイワイファーマ】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	5.66	5.66	5.70	5.68
				含量(%)	100	—	—	100.5
	低分子デキストランL注 【大塚工場】	250mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.15	6.16	6.16	6.17
				含量(%)	100	—	—	99.8
	ハルトマン輸液pH8「NP」 【ニプロ】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	8.00	8.00	8.05	8.00
				含量(%)	100	—	—	99.4
	ラクテック注 【大塚工場】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.94	6.98	7.00	6.92
				含量(%)	100	—	—	100.1

(保存条件：室温、1000lx 室内散乱光下)

配合薬剤			配合方法	試験項目	配合後の時間			
薬効分類	製品名	配合量			配合直後	3時間	6時間	24時間
血液代用剤	ラクテックG輸液 【大塚工場】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.88	6.86	6.91	6.85
				含量(%)	100	—	—	100.0
	リンゲル液「オーツカ」 【大塚工場】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.01	7.03	6.97	6.97
				含量(%)	100	—	—	100.7
溶解剤	大塚蒸留水 【大塚工場】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.07	6.96	6.94	6.93
				含量(%)	100	—	—	100.5
強心剤	イノバン注100mg 【協和発酵キリン】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.84	6.83	6.82	6.82
				含量(%)	100	—	—	100.9
	ドパミン塩酸塩点滴静注液100mg「タイヨー」 【武田テバファーマ】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.54	6.51	6.52	6.42
				含量(%)	100	—	—	99.7
	ネオフィリン注250mg 【エーザイ】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	8.73	8.74	8.73	8.72
				含量(%)	100	—	—	100.3
利尿剤	フロセミド注20mg 「テバ」 【武田テバファーマ】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.32	7.32	7.33	7.26
				含量(%)	100	—	—	99.2
	ラシックス注20mg 【サノフィ】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.29	7.30	7.31	7.26
				含量(%)	100	—	—	98.9
血圧降下剤	ペルジピン注射液10mg 【アステラス】	2A	II	外観	白濁	—	—	—
		pH		6.58	—	—	—	
		1A	V	外観	微黄白濁	—	—	—
		pH		6.79	—	—	—	
	ニカルジピン塩酸塩注10mg「タイヨー」 【武田テバファーマ】	2A	II	外観	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	黄色析出物
		pH		5.83	5.86	5.85	5.83	
	1A	V	外観	微黄白濁	—	—	—	
	pH		6.10	—	—	—		
血管拡張剤	ペルサンチン静注10mg 【日本ベーリンガー】	1A	IV	外観	蛍光緑色澄明	蛍光緑色澄明	蛍光緑色澄明	蛍光緑色澄明
				pH	6.31	6.33	6.32	6.30
				含量(%)	100	—	—	99.8
	ヘルベッサー注射用50 【田辺三菱】	1V	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.02	7.01	6.99	6.96
				含量(%)	100	—	—	100.1

(保存条件：室温、1000lx 室内散乱光下)

配合薬剤			配合方法	試験項目	配合後の時間			
薬効分類	製品名	配合量			配合直後	3時間	6時間	24時間
循環器官用薬	グリセオール注 【中外】	200mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.52	6.51	6.52	6.48
				含量(%)	100	—	—	100.1
	ニコリン注射液250mg 【武田テバ薬品】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.16	7.16	7.15	7.15
				含量(%)	100	—	—	99.3
	20%マンニトール注 射液「YD」 【陽進堂】	500mL	I	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.03	7.00	7.03	6.99
				含量(%)	100	—	—	100.6
呼吸器官用薬	ビソルボン注4mg 【日本ベーリンガー】	1A	V	外観	白濁	—	—	—
				pH	6.62	—	—	—
	ブロムヘキシシン塩酸塩 注射液4mg「タイヨー」 【武田テバファーマ】	1A	V	外観	白濁	—	—	—
				pH	6.63	—	—	—
消化器官用薬	ガスター注射液 20mg 【アステラス】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.72	6.73	6.72	6.73
				含量(%)	100	—	—	99.1
	ファモチジン注射用 20mg「テバ」 【武田テバファーマ】	1A	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.71	6.73	6.73	6.71
				含量(%)	100	—	—	99.9
ホル モン 剤	ソル・コーテフ注射用 100mg 【ファイザー】	1V 添付 溶解液	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.31	7.28	7.28	7.15
				含量(%)	100	—	—	100.2
ビタ ミン 剤	アリナミンF50注 【武田テバ薬品】	1A	II	外観	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明
				pH	6.17	6.18	6.18	6.18
				含量(%)	100	—	—	101.3
	オーツカ MV 注 【大塚工場】	1set	II	外観	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明
				pH	6.79	6.79	6.79	6.72
				含量(%)	100	—	—	99.4
ビタメジン静注用 【第一三共】	1V	II	外観	淡紅色澄明	淡紅色澄明	淡紅色澄明	淡紅色澄明	
			pH	5.69	5.68	5.68	5.68	
			含量(%)	100	—	—	101.5	
無機 質製 剤	アスパラカリウム注 10mEq 【田辺三菱】	1A	III	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.08	7.11	7.07	7.03
				含量(%)	100	—	—	100.1
	L-アスパラギン酸K点滴 静注液10mEq「タイヨー」 【武田テバファーマ】	1A	III	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.92	6.92	6.92	6.92
				含量(%)	100	—	—	100.0

(保存条件：室温、1000lx 室内散乱光下)

配合薬剤			配合方法	試験項目	配合後の時間			
薬効分類	製品名	配合量			配合直後	3時間	6時間	24時間
無機質製剤	エレメンミック注 【エイワイファーマ】	1A	II	外観	淡赤褐色澄明	淡赤褐色澄明	淡赤褐色澄明	淡赤褐色澄明
				pH	6.68	6.72	6.70	6.66
				含量(%)	100	—	—	100.1
	メドレニック注 【武田テバファーマ】	1A	II	外観	淡赤褐色澄明	淡赤褐色澄明	淡赤褐色澄明	淡赤褐色澄明
				pH	6.69	6.71	6.71	6.64
				含量(%)	100	—	—	100.2
医薬品 代謝性	注射用エフオーワイ500 【小野】	1V	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	7.00	6.39	6.28	5.94
				含量(%)	100	—	—	96.5
腫瘍用薬	フトラフル注400mg 【大鵬薬品】	3A	III	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	9.74	9.71	9.73	9.78
				含量(%)	100	—	—	99.5
抗生物質製剤	セファメジンα注射用 1g 【アステラス】	1V	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.98	6.88	6.77	6.60
				含量(%)	100	—	—	99.4
	セファゾリンNa注射用 1g「タイヨー」 【武田テバファーマ】	1V	II	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明
				pH	6.76	6.73	6.71	6.54
				含量(%)	100	—	—	99.1
	塩酸バンコマイシン点 滴静注用0.5g 【塩野義】	1V	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.47	6.48	6.49	6.47
				含量(%)	100	—	—	99.6
	バンコマイシン塩酸塩 点滴静注用0.5g「タイ ヨー」 【武田テバファーマ】	1V	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.40	6.40	6.41	6.38
				含量(%)	100	—	—	100.7
	フルマリン静注用0.5g 【塩野義】	1V	II	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				pH	6.87	6.53	6.46	6.33
				含量(%)	100	—	—	98.7
	ミノサイクリン塩酸塩 点滴静注用100mg「タイ ヨー」 【武田テバファーマ】	1V	II	外観	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明
				pH	5.67	5.68	5.69	5.68
				含量(%)	100	—	—	99.2
ミノマイシン点滴静注 用100mg 【ファイザー】	1V	II	外観	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	黄色澄明	
			pH	5.66	5.68	5.66	5.67	
			含量(%)	100	—	—	100.0	
メロペネム点滴静注用 0.5g「タイヨー」 【武田テバファーマ】	1V	II	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	
			pH	7.88	7.88	7.86	7.76	
			含量(%)	100	—	—	99.4	
メロペン点滴用バイア ル0.5g 【大日本住友】	1V	II	外観	無色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	微黄色澄明	
			pH	7.89	7.86	7.85	7.73	
			含量(%)	100	—	—	99.2	

(製品名は2016年10月現在)