

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

抗プラスミン剤

日本薬局方 トラネキサム酸カプセル

トラネキサム酸カプセル250mg「旭化成」

Tranexamic acid

剤形	カプセル剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1カプセル中日局トラネキサム酸250mg含有
一般名	和名：トラネキサム酸（JAN） 洋名：Tranexamic Acid（JAN、INN）
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：2019年12月24日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2020年6月19日（販売名変更による） 発売年月日：2007年12月21日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：旭化成ファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	旭化成ファーマ株式会社 医薬情報部 くすり相談窓口 TEL：0120-114-936 FAX：03-6699-3697 受付時間：9:00～17:45（土日祝、休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.asahikasei-pharma.co.jp

本IFは2020年6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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>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。この変更に合わせて、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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」（<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>）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. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS 登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
4. 製剤の各種条件下における安定性	6
5. 調製法及び溶解後の安定性	6
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	6
7. 溶出性	6
8. 生物学的試験法	9
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	9
10. 製剤中の有効成分の定量法	9
11. 力価	9
12. 混入する可能性のある夾雑物	9
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な 容器に関する情報	9
14. その他	9
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	10
2. 用法及び用量	10
3. 臨床成績	10
VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12
2. 薬理作用	12
VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	13
2. 薬物速度論的パラメータ	14
3. 吸収	14
4. 分布	14
5. 代謝	15
6. 排泄	15
7. トランスポーターに関する情報	16
8. 透析等による除去率	16
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	17
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17
3. 効能又は効果に関連する使用上の 注意とその理由	17
4. 用法及び用量に関連する使用上の 注意とその理由	17
5. 慎重投与内容とその理由	17
6. 重要な基本的注意とその理由及び 処置方法	17
7. 相互作用	18
8. 副作用	18
9. 高齢者への投与	19
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
11. 小児等への投与	19
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
13. 過量投与	19
14. 適用上の注意	20
15. その他の注意	20
16. その他	20

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目	
1. 薬理試験	21
2. 毒性試験	21
X. 管理的事項に関する項目	
1. 規制区分	22
2. 有効期間又は使用期限	22
3. 貯法・保存条件	22
4. 薬剤取扱い上の注意点	22
5. 承認条件等	22
6. 包装	22
7. 容器の材質	22
8. 同一成分・同効薬	22
9. 国際誕生年月日	23
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
11. 薬価基準収載年月日	23
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	23
13. 再審査結果、再評価結果公表年月 日及びその内容	23
14. 再審査期間	23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
16. 各種コード	23
17. 保険給付上の注意	24
X I. 文献	
1. 引用文献	25
2. その他の参考文献	25
X II. 参考資料	
1. 主な外国での発売状況	26
2. 海外における臨床支援情報	26
X III. 備考	
その他の関連資料	27

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1946年線維素溶解現象が特殊な蛋白分解酵素の活性化によることが明らかにされ、血清グロブリン分画中にプラスミンの存在が確認された。

その後日本においてプラスミン阻害物質の研究が進み、1953年、 ϵ -アミノカプロン酸（EACA）が最強の抗プラスミン作用を有することが発見された。更に、1954年にEACA関連物質の4-アミノメチルシクロヘキサンカルボン酸（AMCHA）が岡本、横井らにより発見された。1963年本作用の本体がトランス体（トラネキサム酸）と究明され1965年に販売が開始された。弊社では1973年に後発品「リカバリン」の販売を開始した。2004年に品質（溶出性）に関する再評価が終了し、2007年には医療事故防止のため販売名を「リカバリンカプセル 250mg」に変更した。なお、一般的名称への変更のため、2020年6月に販売名を『トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」』に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤の止血作用は血中線維素溶解系の異常亢進の抑制、すなわち、抗プラスミン作用による。
- (2) 本剤の抗炎症作用は特異的な機序で、プラスミン系への抑制により、血漿蛋白分解産物の産生を抑制し、キニンやその他の活性ペプチド等の起炎物質の産生抑制に基づくものと考えられている。
- (3) 重大な副作用（頻度不明）として痙攣、その他の副作用（頻度不明）として、癢痒感、発疹、食欲不振、悪心、嘔吐、下痢、胸やけ、眠気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：

トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」

(2) 洋名：

Tranexamic acid

(3) 名称の由来：

通知「薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）：

トラネキサム酸（JAN）

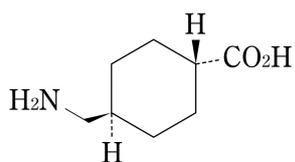
(2) 洋名（命名法）：

Tranexamic Acid（JAN、INN）

(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。

(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。

(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：

該当資料なし。

(6) 分配係数：

該当資料なし。

(7) その他の主な示性値¹⁾：

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²⁾

トラネキサム酸（原薬）の長期安定性試験を実施した。試験項目は、性状、含量、類縁物質、pH、乾燥減量、確認試験であり、気密容器、温度：25℃、湿度：60%の保存条件下で3年間試験したところ、いずれの試験項目も規格値を逸脱する変動はなかった。

3. 有効成分の確認試験法¹⁾

日局「トラネキサム酸」の確認試験法による。

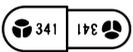
4. 有効成分の定量法¹⁾

日局「トラネキサム酸」の定量法による。

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	トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」
色・剤形	橙色／淡黄色の硬カプセル剤
外形	
大きさ	2号カプセル
重量	358mg

(2) 製剤の物性：

該当資料なし。

(3) 識別コード：

 341

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等：

該当しない。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量：

1カプセル中、日局トラネキサム酸 250mg を含有する。

(2) 添加物：

カルメロースカルシウム、ソルビタン脂肪酸エステル、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、黄色 5 号、ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチン

(3) その他：

該当資料なし。

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない。

4. 製剤の各種条件下における安定性^{3,4)}

(1) 最終包装形態での安定性

保存条件	保存期間	保存形態	試験項目	結果
室温	5年	最終包装形態	外観 確認試験 重量偏差試験 崩壊試験 含量 溶出試験	いずれの試験項目も規格に適合した

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、5年間）の結果、通常の市場流通下において5年間安定であることが確認された。

(2) 無包装状態での安定性

保存条件	保存期間	保存形態	試験項目	結果
40℃	3ヵ月	無包装	外観 崩壊試験 含量	いずれの試験項目にも、変化は認められなかった
30℃、湿度 75%				
光 1000 lux/hr				

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない。

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない。

7. 溶出性^{5,6)}

(1) 日局溶出規格への適合性

試験法：日本薬局法トラネキサム酸カプセル溶出性

本品1個をとり、試験液に水900 mLを用い、溶出試験法第2法（ただし、シンカーを用いる）により、毎分50回転で試験を行う。溶出試験を開始15分後、溶出液20 mL以上をとり、孔径0.45 μ m以下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液10 mLを除き、次のろ液V mLを正確に量り、表示量に従い1 mL中にトラネキサム酸（C₈H₁₅NO₂）約0.28 mgを含む液となるように水を加えて正確にV' mLとし、試料溶液とする。別にトラネキサム酸標準品を105℃で2時間乾燥し、その約28 mgを精密に量り、水に溶かし、正確に100 mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液10 μ Lずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフ法により試験を行い、それぞれの液のトラネキサム酸のピーク面積A_T及びA_Sを測定するとき、本品の15分間の溶出率は80%以上である。

トラネキサム酸（C₈H₁₅NO₂）の表示量に対する溶出率（%）

$$= W_s \times \frac{A_T}{A_S} \times \frac{V'}{V} \times \frac{1}{C} \times 900$$

W_s：トラネキサム酸標準品の秤取量（mg）

C：1カプセル中のトラネキサム酸（C₈H₁₅NO₂）の表示量（mg）

試験条件

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：220 nm）

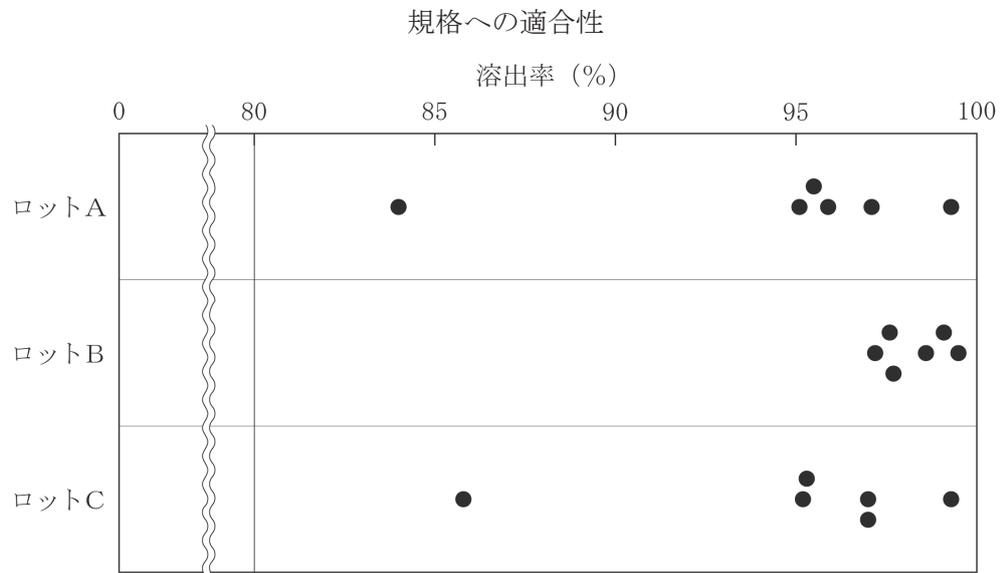
カラム：内径 4.6 mm、長さ 15 cm のステンレス管に 5 μ m の液体クロマトグラフ用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度：25 $^{\circ}$ C付近の一定温度

移動相：無水リン酸二水素ナトリウム 11.0 g を水 500 mL に溶かし、トリエチルアミン 10 mL 及びラウリル硫酸ナトリウム 1.4 g を加える。この液にリン酸を加え、pH 2.5 に調整し、水を加えて 600 mL とする。この液にメタノール 400 mL を加える。

流量：トラネキサム酸の保持時間が約 8 分になるように調整する。

試験結果：トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」の 15 分間の溶出率は 84.0%～99.5%で、規格に適合した。



(2) 溶出挙動における標準製剤との同等性

本試験は「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（1997年12月22日付 医薬審第487号）」に従って計画・実施した。

試験薬剤：トラネキサム酸カプセル 250mg「旭化成」及び標準製剤（いずれも1カプセル中にトラネキサム酸 250 mg を含有）

試験装置：パドル法（毎分50回転、37°C）

試験液：日局崩壊試験第1液（pH 1.2）、900 mL

McIlvaine 緩衝液（pH 4.0）、900 mL

日局崩壊試験第2液（pH 6.8）、900 mL

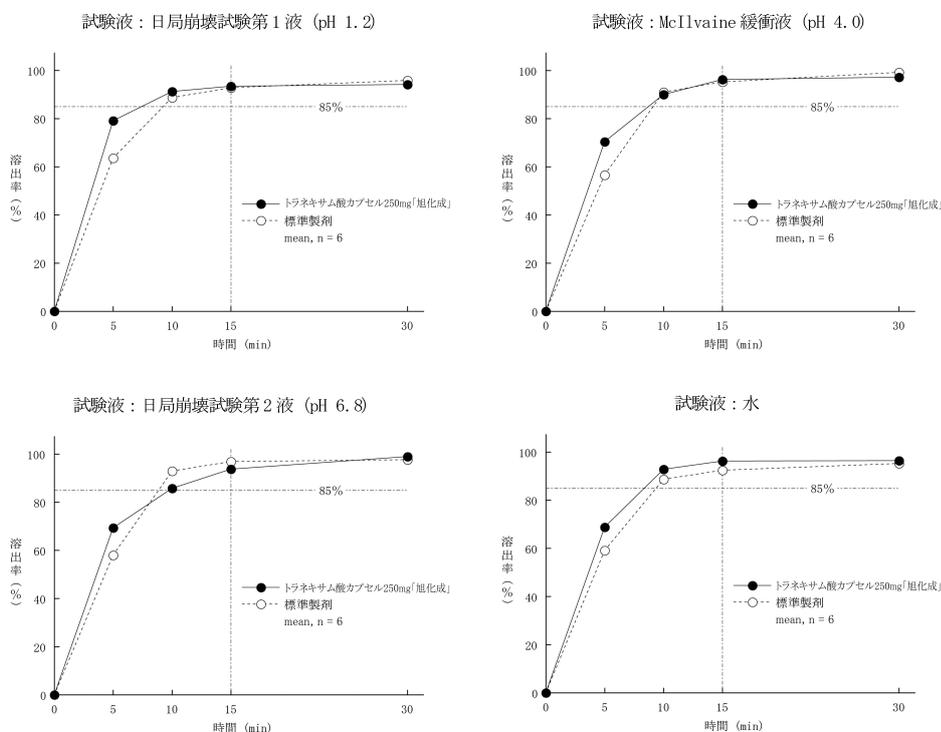
水、900 mL

判定及び結果：「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の「溶出挙動の同等性の判定」に従った。

標準製剤の溶出はいずれの試験液の場合でも「明確なラグ時間が無く、15分以内に平均85%以上溶出する」に該当した。この場合、トラネキサム酸カプセル 250mg「旭化成」は「15分以内に平均85%以上溶出する」なら、同等と判定される。

トラネキサム酸カプセル 250mg「旭化成」はいずれの試験液の場合でも、15分以内に平均85%以上溶出したことから、溶出挙動は同等と判定された。

溶出挙動



8. 生物学的試験法

該当資料なし。

9. 製剤中の有効成分の確認試験法¹⁾

日局「トラネキサム酸カプセル」の確認試験法による。

10. 製剤中の有効成分の定量法¹⁾

日局「トラネキサム酸カプセル」の定量法による。

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

該当しない。

14. その他

該当資料なし。

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、紫斑病など及び手術中・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・痒疹などの症状
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 750 ～ 2,000 mg 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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ：

該当しない。

(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：

該当しない。

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

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾：

プラスミンは種々の出血症状やアレルギー等の発生の進展や治癒と関連するが、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・抗炎症反応効果を示す。すなわち、トラネキサム酸はプラスミンやプラスミノーゲンのリジン結合部位と強く結合し、プラスミンやプラスミノーゲンとフィブリンとの結合を阻止する。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、更に、 α_2 -マクログロブリンなど血漿中アンチプラスミンの存在下では抗線溶作用は一段と強化される。また、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作用を示すと考えられる。更に血管透過性の亢進、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し、抗アレルギー・抗炎症作用を現す。

(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⁷⁾：

VII.1. 「(3)臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

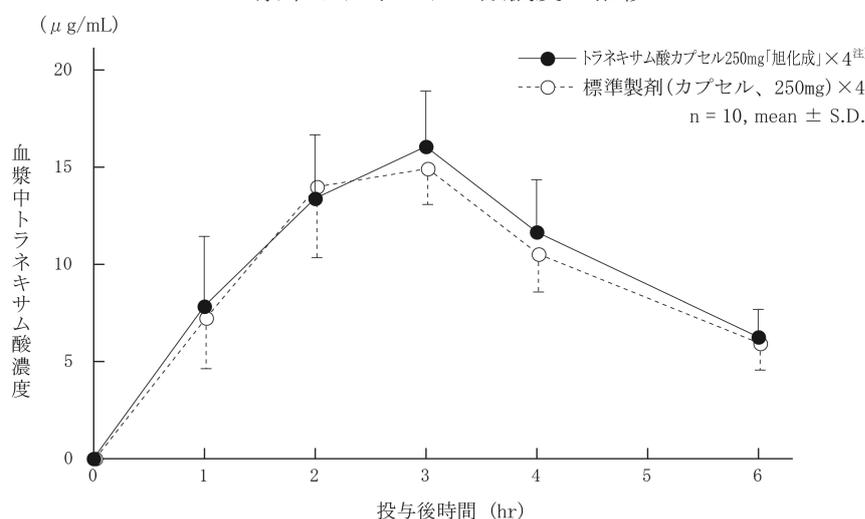
(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁷⁾：

健康成人 10 例に、トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」および標準製剤をトラネキサム酸として 1,000mg^{注)}を経口投与した場合、投与後 2～3 時間でピークに達し、その平均最高血中濃度 (Cmax) はトラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」で 16.3 μ g/mL であった。

トラネキサム酸の血中薬物動態パラメータと尿中排泄率 (n = 10、平均値 \pm S.D.)

	Cmax (μ g/ml)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	尿中排泄率 ₀₋₂₄ (%)	AUC ₀₋₆ (μ g \cdot hr/ml)
トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」	16.33 \pm 2.87	2.70 \pm 0.48	2.55 \pm 0.64	35.3 \pm 7.6	61.00 \pm 12.55
標準製剤	15.60 \pm 2.58	2.70 \pm 0.48	2.54 \pm 0.64	34.5 \pm 5.7	57.84 \pm 9.62

血漿中トラネキサム酸濃度の推移



注) 本剤の用法・用量は、「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。」である。

(4) 中毒域：

該当資料なし。

(5) 食事・併用薬の影響：

該当資料なし。

(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⁾：

3%以下。

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。

<参考>

ラットに ^{14}C 標識体を静注すると、24 時間以内にほぼ全量が尿中に排泄されるが、その 95% は未変化体であり、ほかに trans-4-hexahydrophthalic acid 及び trans-4-hydroxymethylcyclohexanecarboxylic acid がわずかに認められる¹⁾。

(2) 代謝に關与する酵素 (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⁷⁾ :

健康成人 10 例にトラネキサム酸 1,000 mg^{注)} を経口投与した場合、投与後 24 時間までの尿中排泄率の平均は 35.3% であった。

注) 本剤の用法・用量は、「トラネキサム酸として、通常成人 1 日 750 ~ 2,000 mg 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。」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）

トロンビンを投与中の患者（「使用上の注意 2. 相互作用」の項参照）

<参考>

VIII.7. 「(1)併用禁忌とその理由」の項参照

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）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。]
- (5) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

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持続させるおそれがあると考えられている。
バトロキシピン	血栓・塞栓症を起こすおそれがある。	バトロキシ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。

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）

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。

(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。

分類	頻度	頻度不明
過敏症	痒痒感、発疹	
消化器	食欲不振、悪心、嘔吐、下痢、胸やけ	
その他	眠気	

(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：

関連事項として、以下の記載あり。

VIII.5.「慎重投与内容とその理由」の項参照。

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

(5) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

VIII.8.「(3)その他の副作用」の項参照。

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 分類	頻度不明
過敏症	痒痒感、発疹

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。

ただし、添付文書に次の記載あり（VIII.15.「その他の注意」の項参照）。

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。

14. 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)

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

該当資料なし。

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）：
- (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：トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」 該当しない

有効成分：トラネキサム酸 該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：外箱等に表示（5年）

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：

該当資料なし。

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）：

くすりのしおり：有り

VIII.14. 「適用上の注意」の項参照。

(3) 調剤時の留意点について：

該当しない。

5. 承認条件等

該当しない。

6. 包装

トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」 (1カプセル中、トラネキサム酸 250mg)
： PTP 500 カプセル (10カプセル×50)

7. 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：トランサミン（第一三共）

同 効 薬：なし

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

トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」

承認年月日：2019年12月24日（販売名変更による）

承認番号：30100AMX00325000（販売名変更による）

注)旧販売名：リカバリンカプセル 250mg 承認年月日：2007年9月10日 承認番号：21900AMX01343000

旧販売名：リカバリン 承認年月日：1973年3月30日 承認番号：(48AM)394

11. 薬価基準収載年月日

トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」

2020年6月19日（販売名変更による）

注)旧販売名：リカバリンカプセル 250mg 2007年12月21日 経過措置期間終了見込み：2021年3月31日

旧販売名：リカバリン 1974年3月1日 経過措置期間終了：2008年8月31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

該当しない。

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

リカバリン

再評価結果公表年月日 1977年10月28日

2005年1月20日（品質（溶出性）に関する再評価）

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	包装	HOT 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
トラネキサム酸カプセル 250mg 「旭化成」	PTP500 カプセル	1080797010301	3327002M1320	620807901
リカバリン カプセル 250mg	PTP500 カプセル	1080797010202	3327002M1290	620006157

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書、財団法人 日本公定書協会（廣川書店）
- 2) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 トラネキサム酸（原薬）の長期安定性に関する資料（2012）
- 3) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 リカバリンカプセル 250mg の長期安定性に関する資料（2008）
- 4) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 リカバリン無包装状態での安定性試験
- 5) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 リカバリンカプセル 250mg の溶出規格への適合性に関する資料（概要）（2008）
- 6) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 リカバリンカプセル 250mg の溶出挙動における標準製剤との同等性に関する資料（概要）（2008）
- 7) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料 リカバリンカプセル 250mg の薬物動態に関する資料（概要）（2008）

2. その他の参考文献

なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし。

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
なし

