2026年4月改訂（第7版）　　日本標準商品分類番号：873327・87449

# 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2018（2019年更新版）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 Capsules

| | |
|---|---|
| 剤形 | 硬カプセル剤 |
| 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250 mg含有 |
| 一般名 | 和名：トラネキサム酸（JAN）<br>洋名：Tranexamic Acid（JAN、INN） |
| 製造販売承認年月日・<br>薬価基準収載・<br>販売開始年月日 | 製造販売承認年月日：2019年12月24日（販売名変更による）<br>薬価基準収載年月日：2020年　6月19日（販売名変更による）<br>販売開始年月日：1973年8月 |
| 製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名 | 製造販売元：旭化成セラピューティクス株式会社 |
| 医薬情報担当者の連絡先 | |
| 問い合わせ窓口 | 旭化成セラピューティクス株式会社　くすり相談窓口<br>TEL：0120-114-936　FAX：03-6699-3697<br>受付時間：9:00～17:45　（土日祝、休業日を除く）<br>医療関係者向けホームページ<br>https://akp-pharma-digital.com |

本IFは2026年4月改訂の電子化された添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要　－日本病院薬剤師会－

（2020 年 4 月改訂）

### 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）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り，製薬企業の医薬情報担当者（以下，ＭＲ）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている．この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下，ＩＦと略す）が誕生した．

1988 年に日本病院薬剤師会（以下，日病薬）学術第２小委員会がＩＦの位置付け，ＩＦ記載様式，ＩＦ記載要領を策定し，その後 1998 年に日病薬学術第３小委員会が，2008 年，2013 年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた．

ＩＦ記載要領 2008 以降，ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった．これにより，添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった．最新版のＩＦは，医薬品医療機器総合機構（以下，ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ（https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている．日病薬では，2009 年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し，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・検討している．

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ，「ＩＦ記載要領 2018」が公表され，今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため，その更新版を策定した．

### ２．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し，医師・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造販売又は販売に携わる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．

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し，一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される．ただし，製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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，利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに，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の提供は電子データを基本とし，製薬企業での製本は必須ではない．

## ３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは，ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索の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ＩＦを作成・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利用者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，製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等，あるいは各種の医薬品情報提供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ＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある．

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「Ⅴ．５．臨床成績」や「XII. 参考資料」，「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり，その取り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いただきたい．ＩＦは日病薬の要請を受けて，当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する，医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが，記載・表現には医薬品，医療機器等の品質，有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン，製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは，未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について，製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており，ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより，利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない．製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し，その客観性を見抜き，医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり，ＩＦを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい．

# 目　次


**Ⅰ．概要に関する項目**…… 1
1．開発の経緯…… 1
2．製品の治療学的特性…… 1
3．製品の製剤学的特性…… 1
4．適正使用に関して周知すべき特性…… 1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項…… 1
6．ＲＭＰの概要…… 2

**Ⅱ．名称に関する項目**…… 3
1．販売名…… 3
2．一般名…… 3
3．構造式又は示性式…… 3
4．分子式及び分子量…… 3
5．化学名（命名法）又は本質…… 3
6．慣用名、別名、略号、記号番号…… 3

**Ⅲ．有効成分に関する項目**…… 4
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、定量法…… 4

**Ⅳ．製剤に関する項目**…… 5
1．剤形…… 5
2．製剤の組成…… 5
3．添付溶解液の組成及び容量…… 6
4．力価…… 6
5．混入する可能性のある夾雑物…… 6
6．製剤の各種条件下における安定性…… 6
7．調製法及び溶解後の安定性…… 6
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）…… 6
9．溶出性…… 7
10．容器・包装…… 9
11．別途提供される資材類…… 9
12．その他…… 9

**Ⅴ．治療に関する項目**…… 10
1．効能又は効果…… 10
2．効能又は効果に関連する注意…… 10
3．用法及び用量…… 10
4．用法及び用量に関連する注意…… 10
5．臨床成績…… 10

**Ⅵ．薬効薬理に関する項目**…… 13
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群… 13
2．薬理作用…… 13

**Ⅶ．薬物動態に関する項目**…… 14
1．血中濃度の推移…… 14
2．薬物速度論的パラメータ…… 14
3．母集団（ポピュレーション）解析…… 15
4．吸収…… 15
5．分布…… 15
6．代謝…… 16
7．排泄…… 16
8．トランスポーターに関する情報…… 16
9．透析等による除去率…… 16
10．特定の背景を有する患者…… 17
11．その他…… 17

**Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目**… 18
1．警告内容とその理由…… 18
2．禁忌内容とその理由…… 18
3．効能又は効果に関連する注意とその理由… 18
4．用法及び用量に関連する注意とその理由… 18
5．重要な基本的注意とその理由…… 18
6．特定の背景を有する患者に関する注意…… 18
7．相互作用…… 19
8．副作用…… 20
9．臨床検査結果に及ぼす影響…… 20
10．過量投与…… 21
11．適用上の注意…… 21
12．その他の注意…… 21

**Ⅸ．非臨床試験に関する項目**…… 22
1．薬理試験…… 22
2．毒性試験…… 22

**Ⅹ．管理的事項に関する項目**…… 24
1. 規制区分…… 24
2. 有効期間…… 24
3. 包装状態での貯法…… 24
4. 取扱い上の注意…… 24
5. 患者向け資材…… 24
6. 同一成分・同効薬…… 24
7. 国際誕生年月日…… 24
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日…… 24
9. 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…… 25
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容…… 25
11. 再審査期間…… 25
12. 投薬期間制限に関する情報…… 25
13. 各種コード…… 25
14. 保険給付上の注意…… 25

**ⅩⅠ．文献**…… 26
1. 引用文献…… 26
2. その他の参考文献…… 26

**ⅩⅡ．参考資料**…… 27
1. 主な外国での発売状況…… 27
2. 海外における臨床支援情報…… 27

**ⅩⅢ．備考**…… 28
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報…… 28
2. その他の関連資料…… 28

## 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。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. 製品の治療学的特性

(1) 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。[「Ⅵ.2.薬理作用」の項参照]

(2) 重大な副作用として痙攣があらわれることがある。[「Ⅷ.8.副作用」の項参照]

### 3. 製品の製剤学的特性

該当しない。

### 4. 適正使用に関して周知すべき特性

| 適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等 | 有無 |
|---|---|
| ＲＭＰ | 無 |
| 追加のリスク最小化活動として作成されている資材 | 無 |
| 最適使用推進ガイドライン | 無 |
| 保険適用上の留意事項通知 | 無 |

### 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

#### (1) 承認条件

該当しない。

#### (2) 流通・使用上の制限事項

該当しない。

## 6. ＲＭＰの概要

該当しない。

## 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 Capsules

#### (3) 名称の由来

特になし。

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

トラネキサム酸（JAN）

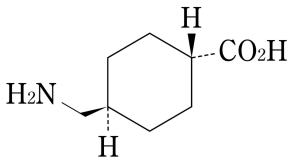
#### (2) 洋名（命名法）

Tranexamic Acid（JAN、INN）

#### (3) ステム（ｓｔｅｍ）

不明

### 3. 構造式又は示性式




### 4. 分子式及び分子量

分子式：$C_8H_{15}NO_2$

分子量：157.21

### 5. 化学名（命名法）又は本質

*trans*-4-(Aminomethyl)cyclohexanecarboxylic acid

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

AMCHA

## 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 1.0 g を水 20 mL 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, 3)]

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、定量法 [1)]

(1) 確認試験

日局「トラネキサム酸」の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

参照スペクトル又は標準品のスペクトルと同一波数に同様の強度の吸収を認める。

(2) 定量法

日局「トラネキサム酸」の定量法

液体クロマトグラフィー

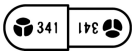
## Ⅳ. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

橙色／淡黄色の硬カプセル剤

#### (2) 製剤の外観及び性状

| 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 |
| 質　量 | 358 mg |

#### (3) 識別コード

341

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし。

#### (5) その他

該当しない。

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

| 販売名 | トラネキサム酸カプセル 250mg「旭化成」 |
|---|---|
| 有効成分 | 1 カプセル中<br>日局 トラネキサム酸　250 mg |
| 添加剤 | 内容物：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<br>カプセル本体：酸化チタン、黄色 5 号、ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチン |

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない。

#### (3) 熱量

該当しない。

## 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない。

## 4. 力価

該当しない。

## 5. 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

## 6. 製剤の各種条件下における安定性[4, 5)]

(1) 苛酷試験

| 保存条件 | 保存形態 | 保存期間 | 結果 |
|---|---|---|---|
| 40℃ | 無包装<br>（遮光、気密） | 3 ヵ月 | 規格内 |
| 30℃/75% | 無包装<br>（遮光、開放） | | |
| 1000 lx/hr | 無包装<br>（気密） | 60 万 lx・hr | |

測定項目：性状、含量、崩壊性

(2) 長期保存試験

| 保存条件 | 保存形態 | 保存期間 | 結果 |
|---|---|---|---|
| 室温 | 最終包装形態 | 5 年 | 規格内 |

測定項目：外観、確認試験、質量偏差試験、崩壊性、含量、溶出性

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない。

## 8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない。

## 9. 溶出性[6, 7)]

(1) 日局溶出規格への適合性

試験法：日本薬局方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 μm 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（$C_8H_{15}NO_2$）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 μL 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（$C_8H_{15}NO_2$）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（$C_8H_{15}NO_2$）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）

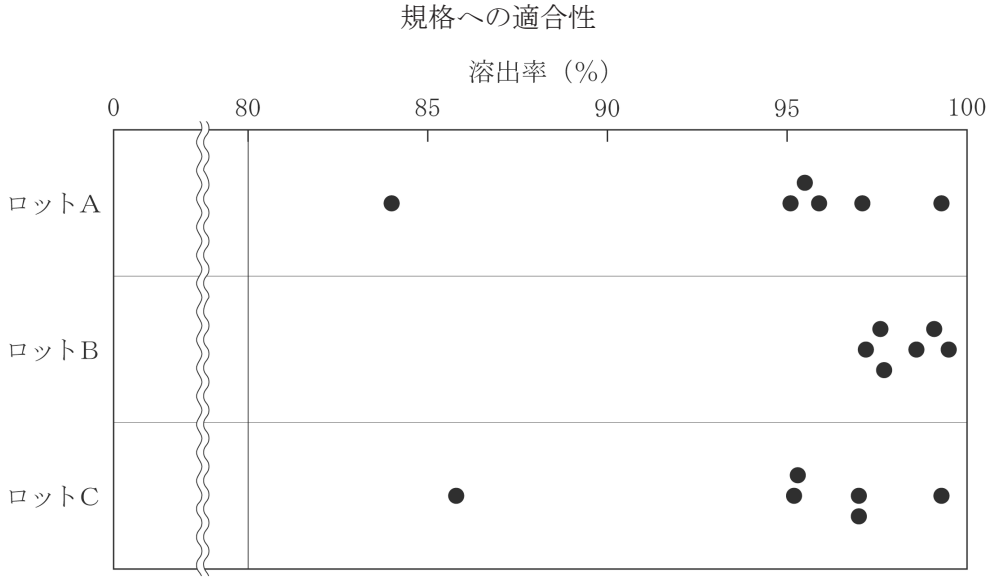
カ　ラ　ム：内径 4.6 mm、長さ 15 cm のステンレス管に 5 μm の液体クロマトグラフ用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度：25℃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℃）

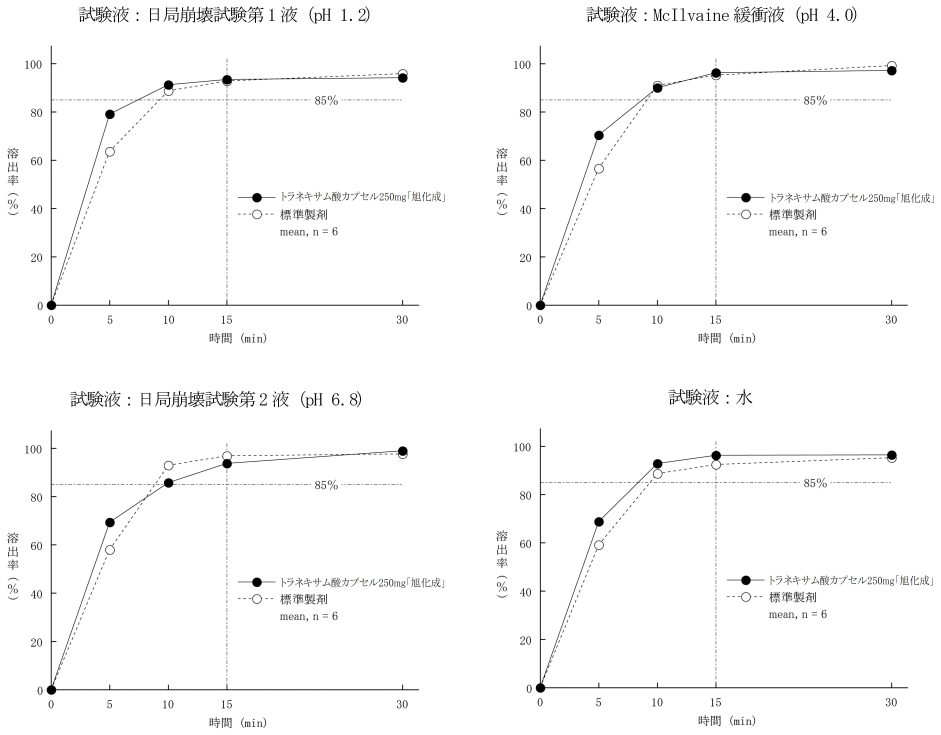
試 験 液：日局崩壊試験第 1 液（pH 1.2)、900 mL
McIlvaine 緩衝液（pH 4.0)、900 mL
日局崩壊試験第 2 液（pH 6.8)、900 mL
水、900 mL

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




## 10. 容器・包装

### (1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない。

### (2) 包装

500 カプセル［10 カプセル（PTP）×50］

### (3) 予備容量

該当しない。

### (4) 容器の材質

PTP：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

## 11. 別途提供される資材類

該当しない。

## 12. 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・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. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない。

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

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。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし。

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない。

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない。

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし。

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし。

### (4) 検証的試験

#### 1) 有効性検証試験

①皮膚疾患

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%（10/32 例）に対し本剤 62.9%（22/35 例）で、本剤が有意（$p < 0.05$）に優れていた[8]。

②耳鼻咽喉科疾患

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%（22/84 例）に対し本剤 52.4%（44/84 例）で、本剤が有意（$p < 0.05$）に優れていた[9]。

#### 2) 安全性試験

該当資料なし。

### (5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない。

### (7) その他

国内一般臨床試験

1) 抗出血作用

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 73.6%（2,063/2,802 例）に認められた。

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%（135/223 例）に認められた。

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%（119/168 例）に認められた。

## 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

ε-アミノカプロン酸

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序[1)]

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**[10~14)]

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、$\alpha_2$-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**[10)]

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**[15~18)]

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タイ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）。

#### (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

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし。

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人男性 5 例に本剤を単回経口投与したとき、薬物動態パラメータは次のとおりであった[19]。

単回経口投与時のトラネキサム酸の薬物動態パラメータ

| 投与量 | 例数 | Cmax（μg/mL） | Tmax（hr） | $T_{1/2}$（hr） |
|---|---|---|---|---|
| 500 mg | 5 | 5.5 | 2～3 | 3.3 |

#### (3) 中毒域

該当資料なし。

#### (4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし。

#### (4) クリアランス

該当資料なし。

＜参考：注射剤のデータ＞

健康成人男性 5 例における体内薬物動態を 2－コンパートメント･オープンモデルを用いて算出した[20]。

5 例による尿中平均総回収率は投与後 48 時間で 94.8%であった。生体表面積を 1.73 $m^2$ に設定した 2 例の腎クリアランスは各々 135 及び 132 mL/min/1.73 $m^2$ であり、これは、トラネキサム酸は糸球体ろ過により排出され、尿細管での排泄や吸収は起こっていないことを示している。

### (5) 分布容積

該当資料なし。

＜参考：注射剤のデータ＞

42.4 L（静脈内投与）[19)]

### (6) その他

該当資料なし。

## 3. 母集団（ポピュレーション）解析

### (1) 解析方法

該当資料なし。

### (2) パラメータ変動要因

該当資料なし。

## 4. 吸収

＜外国人データ＞

経口投与時の相対的バイオアベイラビリティは、絶食状態で 33.4%、食後で 34.9%であった[21)]。

## 5. 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。

＜参考：注射剤のデータ＞

トラネキサム酸は胎盤を通過する。妊婦にトラネキサム酸を 10 mg/kg 静脈内投与した場合の臍帯血中の濃度は約 30 μg/mL で、これは母体の血中濃度と同じである[22)]。

### (3) 乳汁への移行性

乳汁中の濃度は、血清中のピーク時の濃度の約 100 分の 1 である[23)]。

### (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。

＜参考＞

マウスに $^{14}$C-トラネキサム酸を 40 mg/kg の投与量で単回経口投与したところ、大部分の臓器において投与 1～2 時間後に最高濃度を示し、組織内分布は、肝、腎、肺、膵で高く、子宮、脾、心、筋肉がこれに次ぎ、脳では低かった[24)]。

### (6) 血漿蛋白結合率

3%以下[1)]。

## 6. 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 標識体を静脈内投与すると、24 時間以内に放射能の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-hexahydrotelephthalic acid 及び trans-4-hydroxymethylcyclohexanecarboxylic acid がわずかに認められる[1)]。

### (2) 代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし。

## 7. 排泄

1) 排泄部位及び経路

主に腎臓[1)]

2) 排泄率

健康成人男性 15 例にトラネキサム酸を 250 mg 又は 500 mg 単回経口投与したとき、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[19)]。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし。

## 9. 透析等による除去率

該当資料なし。

## 10. 特定の背景を有する患者

腎不全のある患者において、血中濃度が上昇することがある。[「Ⅷ.6.特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照]

## 11. その他

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

設定されていない。

### 2. 禁忌内容とその理由

2. 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［10.1 参照］

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない。

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない。

### 5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない。

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### (1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者
9.1.1 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。
9.1.2 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。
9.1.3 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。
9.1.4 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

#### (2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者
9.2.1 腎不全のある患者
血中濃度が上昇することがある。

9.2.2 人工透析患者
［11.1.1 参照］

(3) 肝機能障害患者

設定されていない。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない。

(5) 妊婦

9.5 妊婦
治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦
治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

設定されていない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者
減量するなど注意すること。一般に、生理機能が低下していることが多い。

## 7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

10.1 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<br>［2. 参照］ | 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

**10.2 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。 | ヘモコアグラー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<br>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

**11. 副作用**

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

### (1) 重大な副作用と初期症状

**11.1 重大な副作用**

**11.1.1 痙攣**（頻度不明）

人工透析患者において痙攣があらわれることがある。［9.2.2 参照］

### (2) その他の副作用

**11.2 その他の副作用**

| | 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 |

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない。

## 10. 過量投与

設定されていない。

## 11. 適用上の注意

> 14. 適用上の注意
>
> 14.1 薬剤交付時の注意
>
> 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ある。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない。

### (2) 非臨床試験に基づく情報

> 15.2 非臨床試験に基づく情報
>
> 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。

## 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」の項参照

#### (2) 安全性薬理試験

該当資料なし。

#### (3) 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 [25]

$LD_{50}$（g/kg）

| 投与経路＼動物 | マウス | ラット | イヌ |
|---|---|---|---|
| 静脈内 | 1.35（♂） | 1.41（♂） | 1.11 |
| | 1.49（♀） | 1.33（♀） | |
| 皮下 | 5.31（♂） | 4.62（♂） | − |
| | 6.44（♀） | 4.65（♀） | |
| 経口 | ＞10 | ＞10 | ＞5.0 |

#### (2) 反復投与毒性試験

ラットに 0.75、1.5、3.0 及び 4.0 g/kg を 6 ヵ月間経口投与した結果、高用量投与群で下痢等がみられた以外に顕著な異常所見は認められなかった [26]。

#### (3) 遺伝毒性試験

Rec-assay、Ames 試験、染色体異常試験（チャイニーズハムスター培養細胞、マウス、ラット）、優性致死試験（マウス）では、いずれの試験においても変異原性は認められなかった [27]。

#### (4) がん原性試験

該当資料なし。

#### (5) 生殖発生毒性試験

妊娠マウス及びラットに 0.3 又は 1.5 g/kg を 6 日間経口投与した器官形成期投与試験で、胎児並びに新生児に対する致死、発育抑制及び催奇形作用は認められなかった [28]。

### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし。

### (7) 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：該当しない
有効成分：該当しない

### 2. 有効期間

5年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり　　：あり

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：トランサミンカプセル250mg
同　効　薬：なし

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

| 販売名 | 製造販売承認年月日 | 承認番号 | 薬価基準収載年月日 | 販売開始年月日 |
|---|---|---|---|---|
| 旧販売名<br>リカバリン | 1973年 3月30日 | （48AM）394 | 1974年 3月 1日 | 1973年8月 |
| 旧販売名<br>リカバリンカプセル250mg | 2007年 9月10日 | 21900AMX01343000 | 2007年12月21日 | — |
| 販売名変更<br>トラネキサム酸カプセル250mg「旭化成」 | 2019年12月24日 | 30100AMX00325000 | 2020年 6月19日 | — |

## 9. 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。

## 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない。

## 11. 再審査期間

該当しない。

## 12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

## 13. 各種コード

| 販売名 | 厚生労働省<br>薬価基準収載<br>医薬品コード | 個別医薬品コード<br>(YJ コード) | HOT 番号（9 桁） | レセプト電算処理<br>システム用コード |
|---|---|---|---|---|
| トラネキサム酸カプセル<br>250mg「旭化成」 | 3327002M1010 | 3327002M1320 | 108079701 | 620807901 |

## 14. 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) 日本薬局方解説書、財団法人 日本公定書協会（廣川書店）
2) 社内資料：トラネキサム酸の長期安定性試験
3) 社内資料：「トラネキサム酸」長期保存試験結果（2016）
4) 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）
5) 社内資料：リカバリン無包装状態での安定性試験
6) 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）
7) 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）
8) 宗像醇：西日本皮膚科. 1969；31（2）：141-146
9) 宮城平：臨床と研究. 1969；46（1）：243-245
10) 安孫子雍史：Med pharm. 1976；10（1）：7-11
11) Iwamoto M：Thrombos Diathes Haemorrh. 1975；33（3）：573-585
12) Markus G, et al.：J Biol Chem. 1979；254（4）：1211-1216
13) Abiko Y, et al.：Biochim Biophys Acta. 1969；185（2）：424-431
14) Abiko Y, et al.：Biochim Biophys Acta. 1970；214（3）：411-418
15) 山田外春他：プラスミン研究会報告集. 1974；14：364-366
16) 木村義民他：アレルギー. 1966；15（9）：755-763
17) 近藤元治：プラスミン研究会報告集. 1966；6：36-37
18) 山崎英正他：日本薬理学雑誌. 1967；63（6）：560-571
19) 佐野光司他：臨床薬理. 1976；7（4）：375-382
20) Eriksson O, et al.: Eur J Clin Pharmacol 1974；7（5）：375-380
21) Pilbrant A, et al.: Eur J Clin Pharmacol 1981；20（1）：65-72
22) Kullander S and Nilsson I M: Acta Obstet Gynecol Scand 1970;49（3）：241-242
23) Verstraete M: Drugs 1985；29（3）：236-261
24) 豊島滋他：基礎と臨床. 1971；5（4）：740-748
25) 高山敏他：応用薬理. 1971；5（3）：389-393
26) 高山敏他：応用薬理. 1971；5（3）：395-413
27) Shimada H, et al.：応用薬理 1979；18（1）：165-172
28) 森田遙他：応用薬理. 1971；5（3）：415-420


### 2. その他の参考文献

なし

## ⅩⅡ. 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

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

#### (1) 粉砕

該当資料なし。

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

試験方法は「内服薬 経管投与ハンドブック第 2 版」（執筆 倉田なおみ、（株）じほう、2006）を参考にした。

(1) 崩壊懸濁試験

- 20 mL 注射筒のディスペンサーのピストン部を引き抜き、ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れた後、ピストンを戻す。
- 55℃の温湯 20 mL を吸い取り、筒先に蓋をして 5 分間放置する。
- 5 分後にディスペンサーを手で 90 度 15 回往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。
- この操作で崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後、同様の操作を行う。

(2) 通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をディスペンサーに吸い取り、経管チューブの注入端より、約 2～3 mL/秒の速度で注入する。また、チューブはベッドの上の患者を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端（注入端）を 30 cm の高さにセットする。

試験結果

| 試験製剤 | 試験条件 | 放置時間 | 崩壊懸濁試験 | 通過試験 | |
|---|---|---|---|---|---|
| | | | 観察結果 | チューブサイズ | 通過性 |
| トラネキサム酸カプセル | 水（約 55℃） | 5 分 | 崩壊しない | | |
| | | 10 分 | 崩壊・懸濁した | 8Fr. | 通過した |

### 2. その他の関連資料

なし

旭化成セラピューティクス株式会社
IFTRP200800001007