

抗プラスミン剤

日本薬局方 トラネキサム酸カプセル

リカバリン®カプセル250mg

Rikavarin® Capsules 250mg

承認番号	21900AMX01343000
薬価収載	2007年12月
販売開始	2007年12月
再評価結果	1977年10月


貯法：室温保存

使用期限：外箱等に表示（5年）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

トロンピンを投与中の患者（「使用上の注意 2. 相互作用」の項参照）

【組成・性状】

販売名	リカバリンカプセル250mg
成分・含量	トラネキサム酸 250mg（1カプセル中）
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
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
識別コード	 341

【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

【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

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
トロンピン	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。
バトロキソピン	血栓・塞栓症を起こすおそれがある。	バトロキ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。

頻度分類	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. 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。

【主要文献】

- 1) 星野 保夫：社内資料(薬物動態：血中濃度、排泄)
- 2) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料(溶出挙動)
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書：(廣川書店)C-2743(2006)
- 4) 旭化成ファーマ株式会社：社内資料(安定性試験)

【文献請求先】

「主要文献」の項に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。
* 旭化成ファーマ株式会社 医薬情報部くすり相談窓口
〒101-8101 東京都千代田区神田神保町一丁目105番地
☎0120-114-936 (9:00~17:45/土日祝、休業日を除く)

【薬物動態】

1. 血中濃度¹⁾

健康成人10例にトラネキサム酸1,000mg⁽²⁾を経口投与した場合、投与後2～3時間でピークに達し、その平均血中濃度は16.1μg/mLであった。

血中濃度パラメータ

Tmax (hr)	Cmax (μg/mL)	T _{1/2} (hr)
2.70	16.33	2.55

2. 排泄¹⁾

健康成人10例にトラネキサム酸1,000mg⁽²⁾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) 本剤の承認された用法・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. 溶出挙動

リカバリンカプセル250mgは、日本薬局方医薬品各条に定められたトラネキサム酸カプセル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】

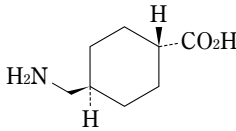
プラスミンによる種々の出血症状やアレルギー等の発生の進展や治癒と関連するが、トラネキサム酸はこのプラスミンの働きを阻止し、抗出血・抗アレルギー・抗炎症反応効果を示す。すなわち、トラネキサム酸はプラスミンやプラスミノゲンのリジン結合部位と強く結合し、プラスミンやプラスミノゲンとフィブリンとの結合を阻止する。このため、プラスミンによるフィブリン分解は強く抑制され、更に、α₂-マクログロブリンなど血漿中アンチプラスミンの存在下では抗線溶作用は一段と強化される。また、異常に亢進したプラスミンは血小板の凝集阻止、凝固因子の分解等を起こすが、軽度の亢進でもフィブリン分解がまず特異的に起こる。したがって一般の出血の場合、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：C₈H₁₅NO₂

分子量：157.21

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。

本品は水に溶けやすく、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

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⁴⁾。

【包装】

リカバリンカプセル250mg：PTP500カプセル(10カプセル×50)

製造販売元

旭化成ファーマ株式会社

* 東京都千代田区神田神保町一丁目105番地

TRP