

抗血漿質劑

“台灣第一三共” 斷血炎[®] 注射液

Transamin[®] Injection “Daiichi Sankyo”

本藥限由醫師使用

【禁忌 (請勿對以下患者給藥)】

1. 正接受凝血酶 (Thrombin) 給藥的患者 (請參照「交互作用」項目)
2. 過去曾對本產品成分有過敏症病史的患者

【組成·性狀】

銷售名稱	1支中Tranexamic acid的含量	pH	滲透壓比對生理食鹽水的比例	外觀
Transamin [®] 注射液	250mg/5mL (5w/v%)	7.0~8.0	約1	無色透明液體

賦形劑: water for injection

【適應症】

紫斑病、白血病、肺結核之咯血、血痰、手術時之異常出血、腎出血。

【用法·用量】

一般成人以 Transamin注射液一日250mg~500mg,分1~2次靜脈或肌肉注射。手術中、手術後,必要時可以1次500mg~1,000mg靜脈注射,或者500mg~2,500mg靜脈點滴注射。

通常成人,1日1~2針(5~10ml)分1~2次靜脈或肌肉注射,手術中、手術後如必要可一次2~10針(10~50ml)靜脈點滴注射。

【使用注意事項】

1. 謹慎給藥 (對下列患者應謹慎給藥)

- 1) 有血栓的患者 (腦血栓、心肌梗塞、血栓性靜脈炎等) 及可能出現血栓症的患者 [有血栓安定之處]
- 2) 消耗性凝固障礙的患者 (應與Heparin等併用) [有血栓安定之處]
- 3) 手術後臥床狀態下的患者及接受壓迫止血措施的患者 [因為處於容易產生靜脈血栓的狀態,施予本產品有血栓安定之處。報告顯示曾出現因下床、壓迫解除,而導致肺栓塞症發作的病例。]
- 4) 腎衰竭的患者 [可能會導致血中濃度上昇]

2. 交互作用

- 1) 併用禁忌 (不得併用)

藥劑名稱	臨床症狀·措施方法	機轉·危險因子
凝血酶 (Thrombin)	可能會形成血栓。	具有促進血栓形成的作用,併用時可能會增加血栓形成的機率。

2) 併用注意事項 (併用時應特別留意)

藥劑名稱	臨床症狀·措施方法	機轉·危險因子
凝血促進劑 (Hemocoagulase)	大量併用時可能會形成血栓。	因凝血促進劑所形成的纖維蛋白 (Fibrin) 塊,可能會因本產品的抗纖維蛋白溶解酶 (Plasmin) 作用而形成較長的殘存時間,並持續閉鎖狀態。
Batroxobin	可能會引發血栓、栓塞症。	將妨礙Batroxobin生成的desA纖維蛋白聚合物之分解。
凝固因子製劑 (Eptacog Alfa等)	在口腔等纖溶系統活性較強部位,可能會導致凝固系統更加亢進。	可能會因凝固因子製劑促進凝固系統活性化,而出現止血作用。另一方面,可能會因本產品妨礙纖溶系統作用而出現止血作用。

3. 副作用

副作用發生狀況概要

總病例數2,972例中,出現報告的副作用分別為噁心0.07% (2件)、嘔吐0.17% (5件)、食慾不振0.03% (1件)、腹瀉0.07% (2件)、嗜睡0.03% (1件)等。〔文獻統計 (排除於重新審查對象之外)〕

1) 重大副作用 (頻率不明^{*)})

休克

由於可能會引發休克,因此應充分觀察,發現異常時則應停止給藥,採取適當措施。

痙攣

當患者在心臟血管手術(cardiac macro-vascular surgery)中以體外循環輔助,並在手術期間投與Transamin,曾有術後痙攣的病例發生。此外,透析患者也曾發生痙攣的現象,因此應仔細觀察患者並採取適當的措施,譬如發現異常時則應停止給藥。

2) 其他副作用

由於可能會出現下列副作用,發現異常時應視情況停止給藥等,採取適當措施。

種類	副作用發生頻率		
	0.1~1%以下	0.1%以下	不明 ^{*)}
過敏症		搔癢感、出疹等	
消化器	噁心、嘔吐	食慾不振、腹瀉	
眼			暫時性色覺異常 (靜脈內注射時)
其他		嗜睡、頭痛	

^{*)} 由於屬於自發報告或海外發現的副作用,故頻率不明。

4. 對高齡者的給藥

一般而言因為高齡者生理功能衰退,應注意減少用量等事項。

5. 使用注意事項

- 1) 靜脈內注射時: 應緩慢進行靜脈內給藥 (急速給藥時,偶爾會出現噁心、胸部不適、心悸亢進、或血壓下降等)。
- 2) 肌肉內注射時: 為避免對組織、神經等產生影響,應注意以下事項。
 - (1) 注射時,應避開神經通過部位,謹慎注射。
 - (2) 反覆注射時,應左右輪流注射,避免同一部位。此外,對體重過輕新生兒、新生兒、嬰兒、幼兒、小孩應特別注意。
 - (3) 插入注射針時,患者若表示劇烈疼痛、或出現血液逆流,應立即拔出針頭,變更部位後重新注射。

3) 開封時(附加溶解液)：為避免切斷安瓿時混入異物，應以酒精消毒棉花等擦拭乾淨後，再切斷。

6. 其他注意事項

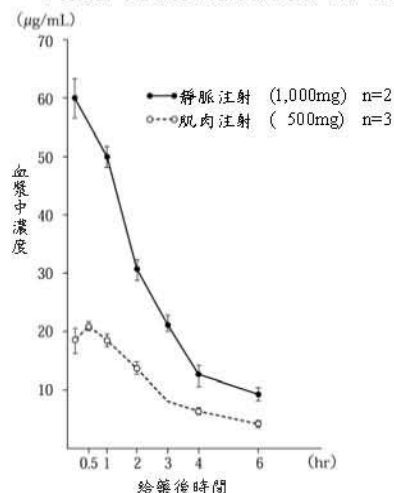
經報告顯示，對犬進行長期，大量給藥後，曾出現視網膜病變。

【藥物動態】

1. 血中濃度¹⁾

對健康成人進行Tranexamic acid 500mg單次肌肉內給藥、或1,000mg單次靜脈內給藥後，血漿中濃度變化如下所示。

Tranexamic acid單次靜脈內給藥及單次肌肉內給藥時的血漿中濃度變化



單次靜脈內給藥及單次肌肉內給藥後的Tranexamic acid藥物動態參數。

給藥量	給藥方式	Tmax (hr)	Cmax (µg/mL)	t _{1/2} (hr)	Vd (L)
500mg	肌肉注射	0.5	21.2	2.0	-
1,000mg	靜脈注射	-	60.0 ²⁾	1.9	42.4

²⁾ 給藥15分鐘

2. 分佈

參考(動物實驗)

對小鼠採用¹⁴C-Tranexamic acid進行單次靜脈內給藥、及單次肌肉內給藥後，組織內分佈以肝臟、腎臟、及肺部較高，其次為胰臟、腎上腺、脾臟、前列腺、結腸、子宮、心臟、及肌肉，腦部分佈最低。

3. 代謝，排泄¹⁾

對健康成人進行Tranexamic acid 500mg的單次肌肉內給藥、或1,000mg單次靜脈內給藥後，Tranexamic acid被迅速吸收，在給藥後24小時內，給藥量的80%及76%皆以未變化體的型態排泄至尿中。

【臨床研究】

1. 抗出血作用

對可能與全身性纖維溶亢進有關的白血病、再生不良性貧血、紫斑病的出血傾向，以及可能與局部纖維溶亢進有關的肺出血、鼻出血、性器官出血、腎出血、前列腺手術中、術後的異常出血之止血效果方面，以709例為對象的一般臨床試驗結果顯示，83.8% (594例) 發現有效。

2. 抗炎症作用

以濕疹及類似症狀、蕁麻疹等皮膚病患者283例為對象所實施的一般臨床試驗中，77.7% (220例) 發現獲得改善。

【藥效藥理】

纖維素溶解現象(纖維溶現象)在身體的生理狀態及疾病狀態中，與纖維蛋白分解等血管通透性亢進等有關，同時與纖維蛋白溶解酶所引發的身體反應等各種出血症狀及過敏症等發生進展、及痊癒皆有所關聯。Tranexamic acid可妨礙上述纖維蛋白溶解酶的作用，發揮抗出血、抗過敏、抗炎症效果。

1. 抗纖維蛋白溶解酶作用^{2)~6)}

Tranexamic acid係與纖維蛋白溶解酶及纖維蛋白酶原(Plasminogen)的纖維蛋白親和部位之離氨酸(Lysine)結合部位(LBS)強烈結合，可阻止纖維蛋白溶解酶及纖維蛋白酶原與纖維蛋白結合。因此，可強烈抑制纖維蛋白溶解酶所形成的纖維蛋白分解。再者，在 α_2 -macroglobuline等血漿中抗纖維蛋白溶解酶存在的狀況下，將更進一步強化

Tranexamic acid的抗纖維溶作用。

2. 止血作用²⁾

異常亢進的纖維蛋白溶解酶，將引發血小板凝結障礙、或凝固因子分解等，即使僅為輕度的亢進，仍將引發特異性的纖維蛋白分解。因此，一般出血時，Tranexamic acid可妨礙上述纖維蛋白分解，以達到止血目的。

3. 抗過敏·抗炎症作用^{7)~10)}

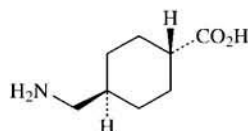
Tranexamic acid可抑制因纖維蛋白溶解酶(plasmin)所誘發的Kinin及其他活性肽(peptide)而造成的血管通透度亢進、過敏及炎症損傷。(如以天竺鼠、大鼠試驗證實)。

【有效成分的物理化學性質】

一般名：Tranexamic acid

化學名：trans-4-(Aminomethyl)cyclohexanecarboxylic acid

構造式：



分子式：C₈H₁₅NO₂

分子量：157.21

性狀：白色結晶或結晶性粉末。易溶於水，幾乎不溶於酒精(99.5%)。

【使用注意事項】

因為本產品使用「單點切割安瓿」，請將安瓿細部的記號朝上，朝反方向折斷。

【保存期限】

記載於容器及外盒

【儲存】

25°C保存

【包裝】

5毫升/安瓿，100支以下盒裝

【原文修定日期】

2013年4月

【主要文獻】

- 1) 佐野等人：臨床藥理 7 375 (1976)
- 2) 安孫子：Med.Pharm.10 (1) 7 (1976)
- 3) Iwamoto, M.: Thrombos.Diathes.Haemorrh.33 573 (1975)
- 4) Markus, G. et al.: J.Biol.Chem.254 1211 (1979)
- 5) Abiko, Y. et al.: Biochim.Biophys.Acta 185 424 (1969)
- 6) Abiko, Y. et al.: Biochim.Biophys.Acta 214 411 (1970)
- 7) 山田等人：纖維蛋白溶解酶研究會報告集 14 364 (1974)
- 8) 木村等人：過敏症 15 (9) 755 (1966)
- 9) 近藤：纖維蛋白溶解酶研究會報告集 6 36 (1966)
- 10) 山崎等人：日藥理誌 63 (6) 560 (1967)



台灣第一三共股份有限公司

製造廠：中國化學製藥股份有限公司新豐工廠

廠址：新竹縣新豐鄉坑子口182-1號

委託者：台灣第一三共股份有限公司

地址：台北市八德路二段308號7樓之1

電話：(02)8772-2250