

新強力抗プラスミン剤

トランサミン

カプセル・注

特 長

斯界の先端を行く第一製薬によって
治療界に提供された新しい抗プラス
ミン剤

- ★より徹底した治療ができる
- ★投薬しやすい
- ★効果の発現が早く，作用時間が長い
- ★副作用はほとんど認められない



DAIICHI SEIYAKU CO., LTD.

特 長

トランサミンは、非常に強い抗プラスミン作用を有し、臨床的に従来の抗プラスミン療法の問題点を解消し、他の薬剤——各種止血剤、副腎皮質ホルモン剤、抗ヒスタミン剤など——で無効な症例にもよくきき、より徹底した治療が行なえます。

★より徹底した治療ができる

——速やかに出血をとめ炎症を除く——

従来の抗プラスミン剤より少量で止血または抗炎症作用を示し、他の薬剤で無効な症例や従来の抗プラスミン療法で十分効果があげられなかった症例にもより徹底した治療が行なえます。

★投薬しやすい

大量投与の不便さや困難さが解消され、普通1回1～2カプセルで十分な効果が得られます。

★効果の発現が早く、作用時間が長い

吸収が早いので短時間で最高血中濃度に達し作用時間も長く、静注で約6時間以上、経口でそれ以上に作用は持続します。

★副作用はほとんど認められない

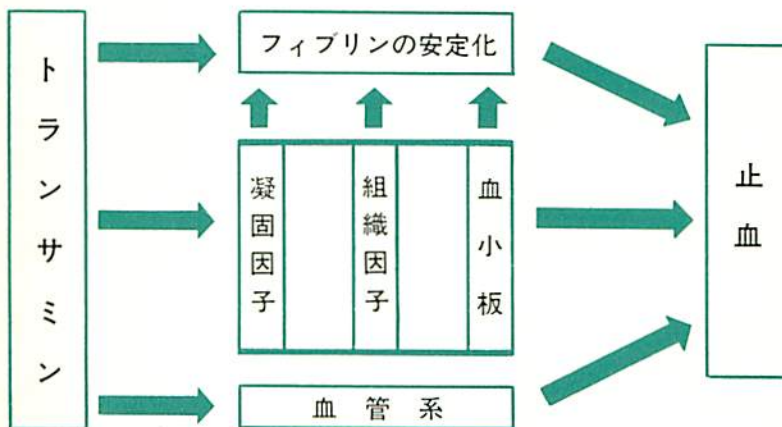
副作用はほとんどみられません、まれに軽度の胃腸障害（悪心・嘔気など）がおきるときがあります。

トランサミンの止血作用

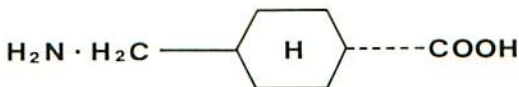
—— トランサミンは複雑な凝固系の中で、フィブリンを安定化して、確実な止血効果を示します ——

トランサミンは、血液凝固の中心となる **凝固因子** (フィブリノゲン、プロトロンビンなど)、**組織因子** (組織トロンボプラスチンなど)、**血小板**、**血管系** などすべてに関与して、凝固の終末点で **フィブリンを安定化** させます。

〈総合的止血効果〉



- 構造式 トランサミンの化学名はトランス-4-アミノメチルシクロヘキサンカルボン酸で、構造式はつぎの通りです。



trans-4-Aminomethyl cyclohexane carboxylic Acid

トランサミンの基礎

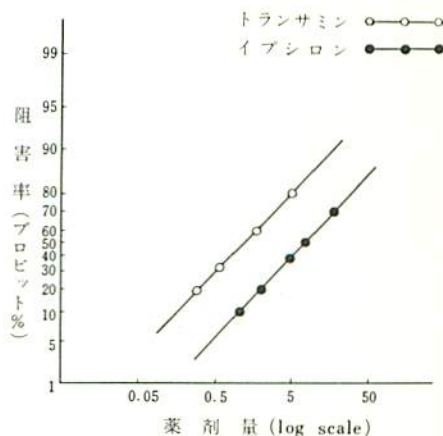
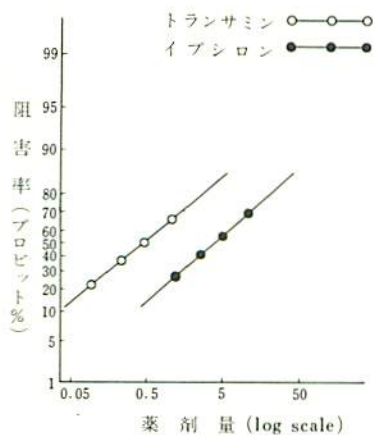
■抗プラスミン作用

トランサミンは *in vitro* におけるフィブリン分解法およびカゼイン分解法で、それぞれイブシロンの8倍、7倍の作用を、*in vivo* では5～10倍強い抗プラスミン作用を示します。

■ *in vitro* における抗プラスミン作用

★フィブリン分解法（吸光度法）

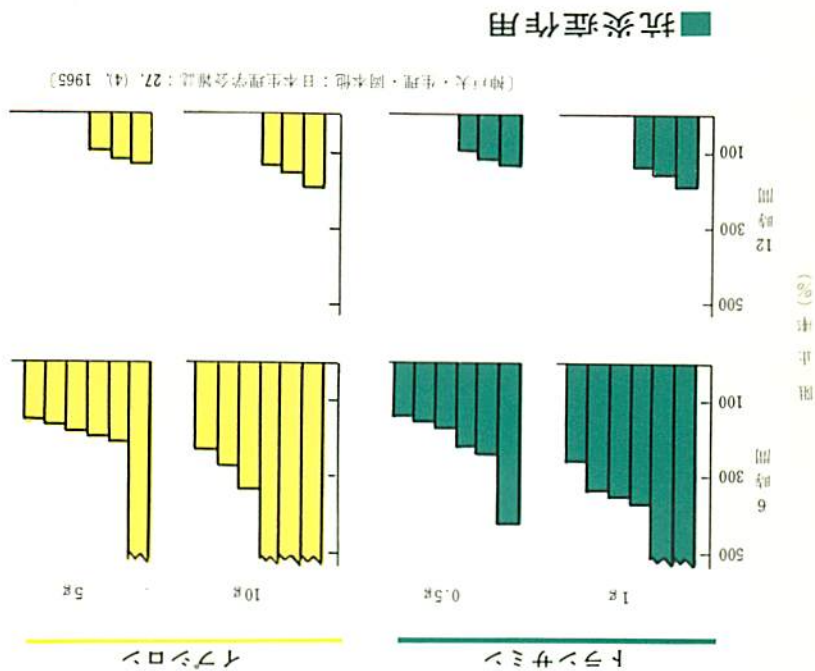
★カゼイン分解法（吸光度法）



[第一製薬 中央研究所・清水他：日本薬学会・関東地方会 2月例会 1964年発表]

■ in vivo における抗アラミン作用

健康人男女にトラスミン $1g, 0.5g, 5g, 10g, 5g$ の粉末を一度に経口投与し、経時的に、血清の抗-SK 活性化アラミン値を測定して、抗アラミン剤非投与時のアラミン平板法と比較すると、トラスミン $1g$ はアラミン $5 \sim 10g$ 、また $0.5g$ はアラミン $5g$ に匹敵しました。



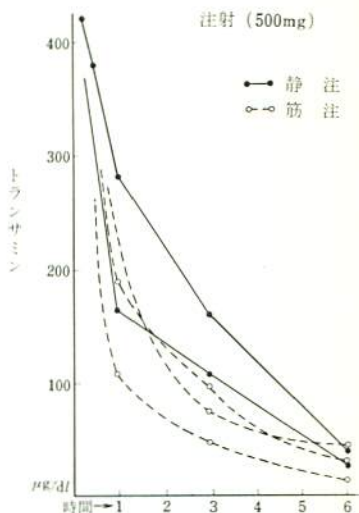
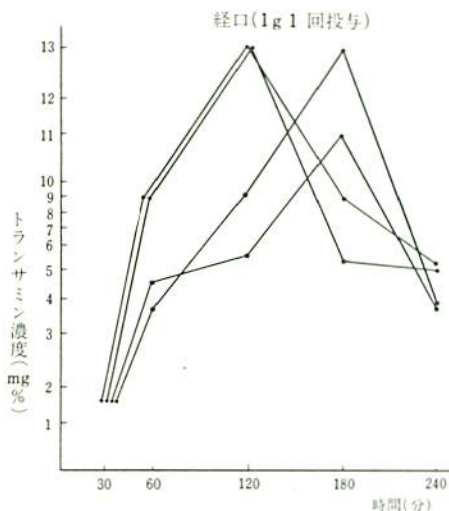
トラスミンの抗炎症作用は実験的炎症（ラットのホルマリン浮腫）および毛細血管透過性（ロイコタキシン）に対する抑制作用により明らか。抗炎症作用が確認されています。

■ 抗炎症作用

（神戸大・生理・岡本他：日本生理学雑誌；27, (4), 1965）

■血中濃度

トランサミン 1 g を経口投与した場合 2 ~ 3 時間で、500 mg を静注、筋注した場合直ちに、最高血中濃度に達します。

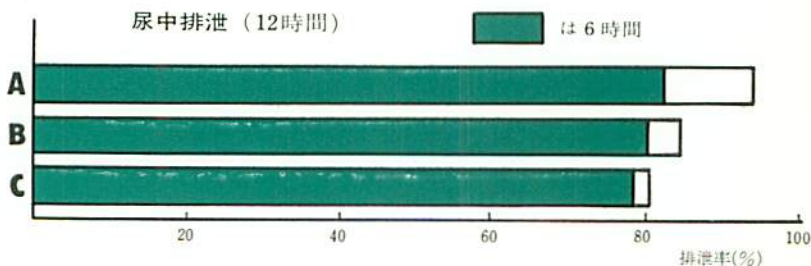


(東京医大・福武他：第27回日本血液学会総会・1965年発表)

(慶大・生理・岡本(歌), 東大・泌尿器科・米瀬他)

■尿中排泄

トランサミンの尿中排泄は極めて適度です。A, B, Cの3例について検討してみるとトランサミン500mg 静注の場合、12時間で約90%尿中へ排泄され、残りは徐々に尿中に排泄されます。



(慶大・生理・岡本(歌), 東大・泌尿器科・米瀬他)

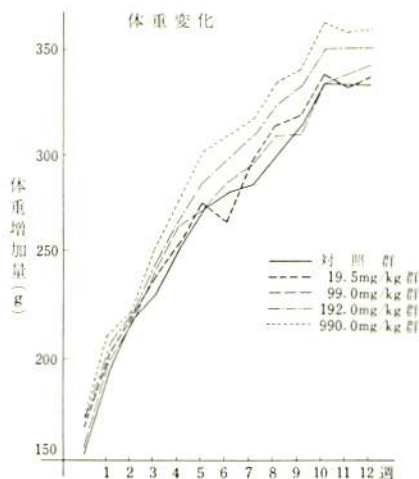
■ 毒 性

急性毒性 下表のように、毒性は極めて低い値を示します。

マウス(♂)におけるLD₅₀

投与方法	LD ₅₀ g/kg
経口	10以上
皮下注	6.00
腹腔内注	4.20
静注	1.40

慢性毒性 ラット13~14匹を1群とし、5群に（1群はコントロール）19.5、99.0、192.0、990.0 mg/kg/日 で3ヵ月連続投与したが、体重、血液像および行動、外観、剖検所見などに影響がみられません。



■ 催奇形作用はみられません

経口および腹腔内投与により、マウスおよびラットを用い、摘出胎仔、新生仔について検討した結果、催奇形作用は認められませんでした。

トランサミンの臨床

各種手術時の出血や出血性疾患に対する広範囲な治験により、極めてすぐれた止血効果を認めています。

また、炎症性疾患にも、同様に、明らかな抗炎症作用を確かめられています。

● 内科領域

再生不良性貧血、紫斑病、白血病などの血液疾患 81 例にトランサミンカプセル・注（1～2g/日）を投与し、紫斑、鼻出血、歯肉出血などの出血症状および全身倦怠感、眩暈、食欲不振などの全身症状を消失または改善します。

内科疾患（血友病、再生不良性貧血、紫斑病など）有効率：85.2%

治 験 先	例 数	有 効	やや有効	無 効
東京大学・吉利内科	10	6	3	1
慶応義塾大学・三方内科	3	3	0	0
東京医科大学・中 検	21	15	6	0
名古屋大学・日比野内科	11	8	1	2
大阪大学・山村内科	15	8	3	4
徳島大学・三好内科	10	6	0	4
金沢大学・村上内科	11	7	3	1
合 計	81	53	16	12

● 泌尿器科領域

前立腺組織および腎にはアクチベーターが多く存在し、手術により、しばしば大量出血がみられます。トランサミンの使用により大量出血の予防およびその術後の管理（カテーテル抜去期間の短縮など）に極めて有効です。

疾患別効果

有効率：94.1%

疾患名	例数	有効	やや有効	無効
前立腺切除術（肥大症・癌・結石）	31	31	0	0
尿道膀胱切除術（結石・癌）	3	3	0	0
腎手術（結石・癌・水腫）	10	10	0	0
特発性腎出血	16	15	0	1
膀胱炎	7	4	2	1
その他	1	1	0	0
合計	68	64	2	2

● 産婦人科領域

機能性子宮出血、分娩時出血など子宮出血に単独で、性ホルモン投与の際（黄体ホルモン混合ホルモンなど）と同等以上の止血効果がみられます。

子宮出血に対する効果

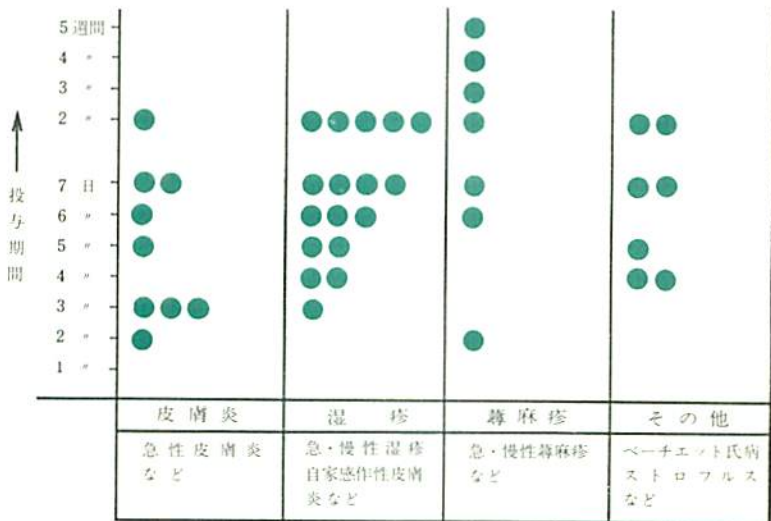
有効率：96.4%

疾患名	例数	有効	やや有効	無効
機能性子宮出血	68	59	5	4
子宮筋腫による出血	8	7	1	0
分娩時出血	20	20	0	0
その他の子宮出血	6	3	3	0
合計	102	89	9	4

● 皮膚科領域

皮膚炎、湿疹、その他の皮膚疾患に対して、ほとんど7日以内で極めて速やかに浸出傾向、カユミ、紅斑、落屑などの症状を治癒または軽快させます。

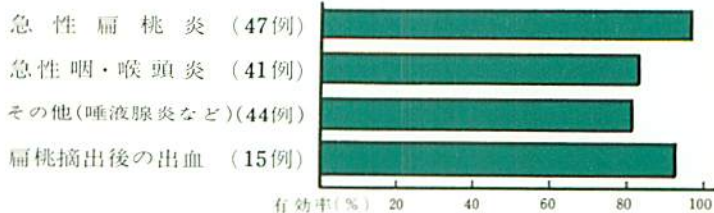
皮膚疾患に対する治療日数



● 耳鼻咽喉科領域

扁桃炎、咽喉頭炎など口腔疾患に対し、トランサミンは約70%以上4日以内に治癒します。また、特に著効例は静注併用例に多くみられます。

耳鼻咽喉科疾患に対する効果



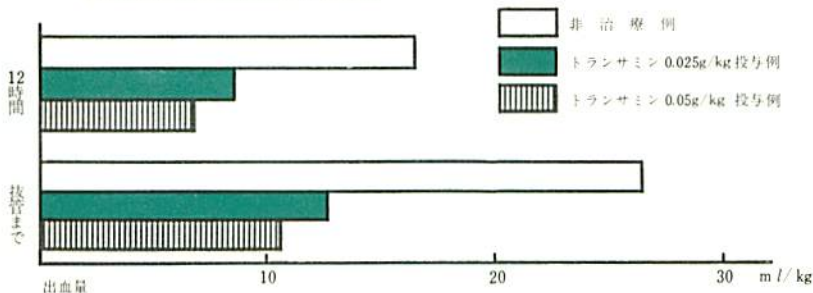
● 外科領域

★ 外科手術の出血量の減少に

外科手術時にしばしばみられる術中のジクジクした出血が手術操作を困難にします。

心臓外科の体外循環時の出血にトランサミンを投与し、対照群に比べ $\frac{1}{2}$ ～ $\frac{1}{3}$ の出血量の減少をみました。

心臓外科手術における出血



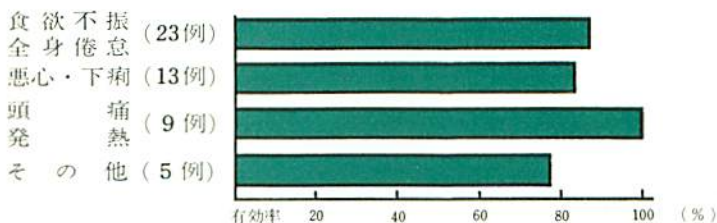
(岡山大, 外科, 砂田他)

● 放射線科領域

★ 放射線宿酔に対する効果

^{60}Co 照射を受け、全身倦怠、食欲不振など宿酔症状のある癌患者20名にトランサミン1日4カプセル投与し、平均80%以上宿酔症状を改善しています。

放射線宿酔症状に対する効果

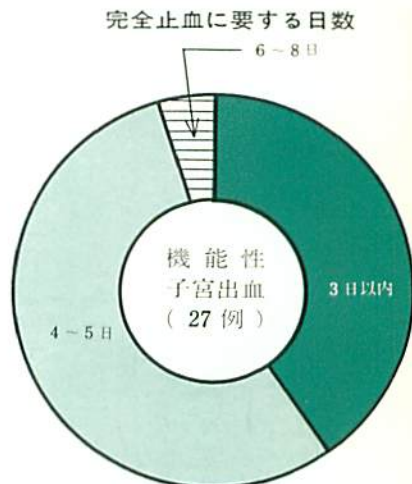


(北大・放射線科・菅原他；日本放射線学会雑誌 投稿中)

■ すみやかな効果発現

機能性子宮出血と診断された症例に、トランサミンを投与、完全止血するまでに要する日数は、3日以内に止血したものが40%にもみられました。他の疾患についても同様の結果を得ています。

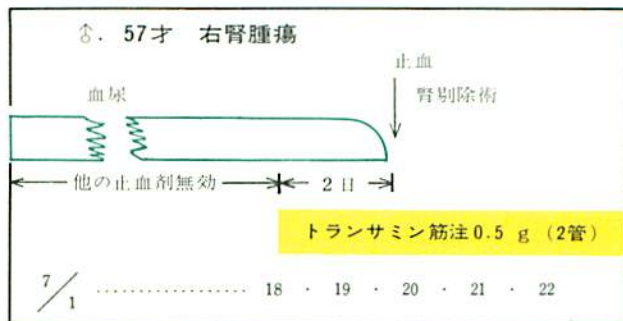
[東大・産婦人科・小林・杉浦他：産科と婦人科投稿中]



■ 他剤無効例にも有効

トランサミンは、他の薬剤(各種止血剤、副腎皮質ホルモン、抗ヒスタミン剤など)に無効な疾患に対しても著明な効果を認めます。

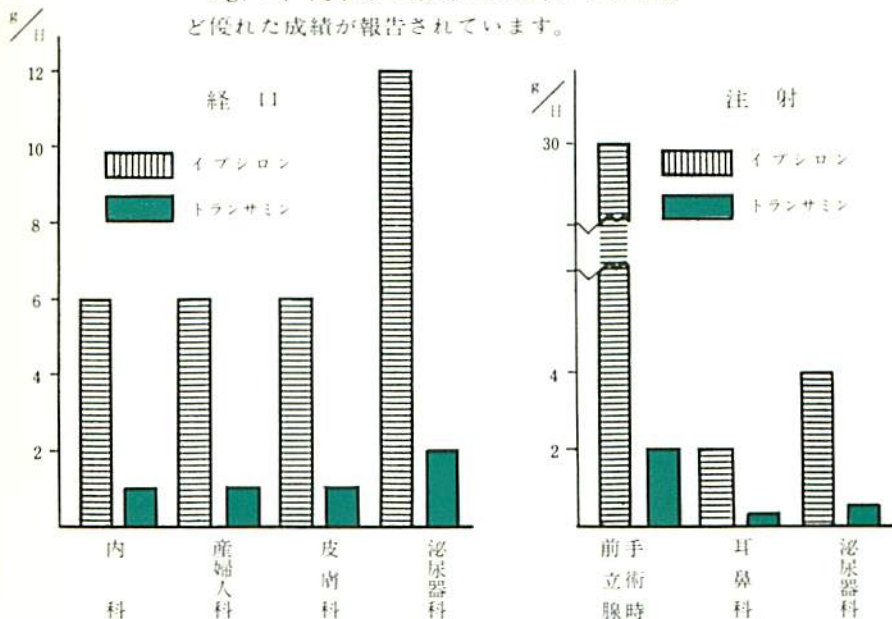
血尿があり他の種々の止血剤に抵抗した腎腫瘍患者に、トランサミン 2管(0.5g)/日を筋注し、2日間で尿は清澄となり止血。止血後、腎切除術を施行し、良好な経過を得ました。



[東大・泌尿器科・米瀬他：日本泌尿器科学会誌 投稿中]

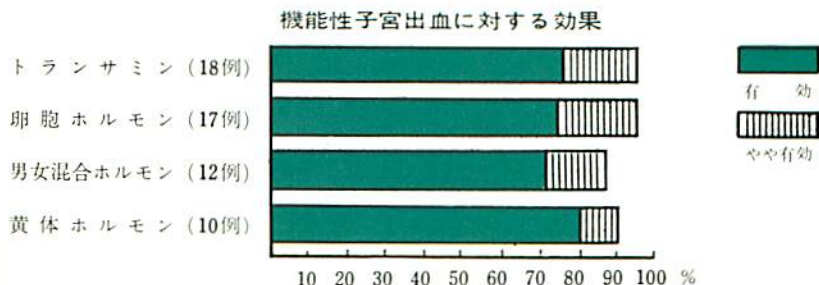
■ 大量投与など 問題点を解消

トランサミンの広範囲な臨床治験成績により従来の抗プラスミン剤でみられた大量投与の困難さが解消され、普通4～8カプセル（1～2g）で、従来より徹底した治療ができるなど優れた成績が報告されています。



■ 子宮出血に……性ホルモンと同等以上の効果

トランサミンは性ホルモンのように、消退出血、性周期に対する影響も全くなく、またその効果も優るとも劣らない成績が得られます。



[弘前大・産科婦人科・真木他：産婦人科の世界投稿中]

■ 適 応 症

内科・小児科：出血性疾患（紫斑病，再生不良性貧血，血友病，癌，白血病など）の異常出血および症状，肺結核などの咯血・血痰，腎出血。

外科：手術時の異常出血。

産婦人科：手術時の異常出血，性器出血。

泌尿器科：腎出血，手術時の異常出血。前立腺肥大症の出血。

以上の適応症のほか，トランサミンの広範囲な臨床報告により

皮膚科では湿疹，急性皮膚炎，蕁麻疹，日光皮膚炎，小児ストロフルス，薬物性皮膚炎，接触性皮膚炎など。

耳鼻咽喉科では急性扁桃炎，急性咽・喉頭炎，口内炎，歯肉炎など。

その他 輸血時の副作用，レ線宿酔，腎炎，関節リウマチなどに極めて有効であることが確認されています。

○用法・用量

成人には，一般に下記の量を投与しますが年令，症状により適宜増減します。

カプセル：1回1～2カプセルを1日3～4回服用します。

注：1日1～2管を1～2回静注または筋注します。

術中，術後など必要に応じて1回2～10管をそのまま，またはリンゲル，ブドウ糖液などに混ぜて点滴静注します。

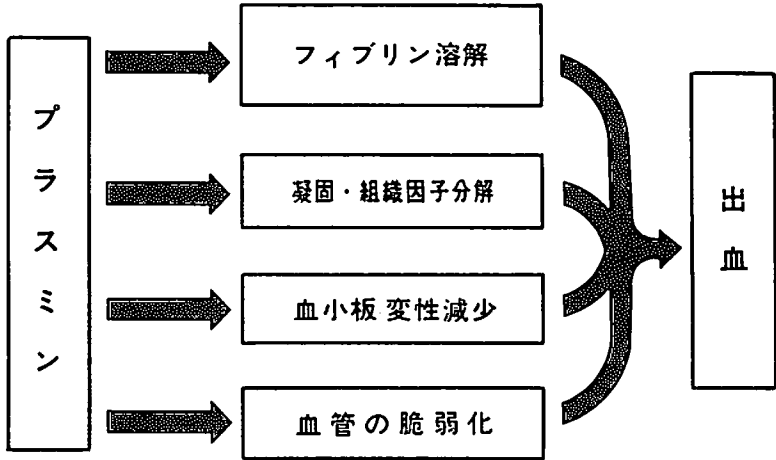
●注 意

静注の場合，注射速度はカルシウム剤に準じなるべくゆっくり行なって下さい。

○包 装 トランサミンカプセル(250mg) 100カプセル 500カプセル
トランサミン注(5%) 5ml 10管 50管

プラスミンと出血

プラスミンは次のような機序で出血を起こします。



プラスミン系とトランサミン

プラスミノゲン

アクチベータ

X

プラスミン

フィブリン
 フィブリノゲン
 プロトロンビン
 V, VII 因子
 AHG
 血小板
 血漿蛋白 etc.

X

分解産物

X トランサミンの作用点

■混注について

トランサミンの注射液はほとんど中性の水溶液で安定な化合物であり、つぎのような注射剤との混注ができます。

- | | |
|--------------------|--|
| 輸液剤関係 | 第一糖液、生理食塩液、リンゲル液、ミキスタミン注、ベレストンN注、グロンサン糖注など。 |
| 止血剤関係 | マネトール、アドナ、カチーフ(G)注、ナフチオン注、エルゴメトリン注など。 |
| ビタミン剤関係 | バンカル注、ビスコリン注、強力アペリー注、ニコデルミン注、チオクタン注など。 |
| 抗ヒスタミン剤 | アリメジン注、メチカル注、アナヒスト注、ビレチア注、ミノファーゲン注など。 |
| サルファ剤関係 | エリコン注、アブシード注、シノミン注など。 |
| その他 | メチロン、ボスミン、イルガピリン注、ズファジラン注、マーフィリン注、エンドキザン注など。 |
| つぎの薬剤は、
混注できません | アネルゲン注、プロゲステロン注、ボセルモン注、トロスチン注、ナイトロミン注など。 |



第一製薬株式会社

本社 東京都中央区日本橋江戸橋三丁目一番地
 東京支店 東京都中央区日本橋江戸橋三丁目一番地
 大阪支店 大阪市東区道修町一丁目七番地
 福岡支店 福岡市麴屋町十二番地
 札幌支店 札幌市北一条西九丁目三番地ノ四
 名古屋支店 名古屋市中区茶屋町三丁目六番地

営業所名	担当者名