

核准日期：2008 年 02 月 03 日

修改日期：2010 年 09 月 29 日

2011 年 07 月 23 日

2013 年 09 月 10 日

2014 年 08 月 21 日

2016 年 11 月 07 日

2019 年 02 月 02 日

2020 年 10 月 16 日

2021 年 03 月 11 日

氨甲环酸片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称：氨甲环酸片

商品名称：妥塞敏® (Transamin®)

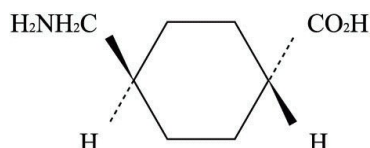
英文名称：Tranexamic Acid Tablets

汉语拼音：Anjiahuansuan Pian

【成份】

本品主要成份为氨甲环酸，其化学名称为：(E)-4-氨甲基环己烷甲酸。

化学结构式：



分子式：C₈H₁₅NO₂

分子量：157.21

【性状】

本品为白色薄膜衣片（异型片），除去薄膜衣后显白色。

【适应症】

1. 用于全身纤维蛋白溶解亢进所致的出血，如白血病、再生不良性贫血、紫癜等，以及手术中和手术后的异常出血。
2. 用于局部纤维蛋白溶解亢进所致的异常出血，如肺出血、鼻出血、生殖器出血、肾出血、前列腺手术中和术后的异常出血。

【规格】 0.5g。

【用法用量】

一般成人每日 1~2g (2~4 片) 分 2~4 次口服, 根据年龄和症状可适当增减剂量, 或遵医嘱。

【不良反应】

1. 严重的不良反应 (频率不详^注)

痉挛: 人工透析患者用药时可能出现痉挛, 因此应密切观察, 如情况异常时停止给药并进行适当处置。

2. 同品种上市后报告的不良反应

(1) 恶心、呕吐、腹泻。

(2) 皮肤过敏反应。

(3) 过敏性休克及类过敏反应。

(4) 血栓栓塞事件(例如, 深部静脉血栓形成、肺栓塞、脑血栓形成、急性肾皮质坏死、视网膜中央动脉、静脉梗塞); 上述情况与口服避孕药的联合使用有关。

(5) 色觉损害及其他视觉障碍。

(6) 头晕。

3. 其他不良反应

在一项 2954 例的报告中, 主要的不良反应为: 食欲不振 0.61% (18 例)、恶心 0.41% (12 例)、呕吐 0.20% (6 例)、胃灼热 0.17% (5 例)、瘙痒 0.07% (2 例)、皮疹 0.07% (2 例) 等。

当出现下述不良反应时, 应停止给药并进行适当处置。

种类	不良反应发生的频率	
	0.1~1%	低于 0.1%
过敏症		瘙痒、皮疹等
消化系统	食欲不振、恶心、呕吐、腹泻、胃灼热	
其他		倦意感

在使用本品期间, 如发生任何不良事件和/或不良反应, 应告知医生。

注) 由于是自发报告, 所以频率不详

【禁忌】

1. 对本品中任何成份过敏者禁用。

2. 存在以下血栓栓塞风险者禁用:

(1) 联合使用激素类避孕药的妇女；

(2) 已知有以下任何情况：

1) 活动性血栓栓塞性疾病（例如，深静脉血栓形成、肺栓塞、脑血栓形成）；

2) 血栓形成或血栓栓塞症病史，包括视网膜动脉或静脉闭塞；

3) 存在原发性血栓形成或血栓栓塞症的风险（例如，血栓形成性瓣膜疾病、血栓形成性心脏节律性疾病、血液高凝状态）。

有使用本品后发生动静脉血栓形成或血栓栓塞症以及视网膜动脉或静脉闭塞的报告。

3. 正在使用凝血酶的患者禁用。（请参照“药物相互作用”项）。

4. 弥散性血管内凝血（DIC）导致的纤维蛋白溶解增加的患者禁用。

5. 严重肾功能不全患者禁用。

【注意事项】

1. 以下患者应慎重给药：

(1) 有消耗性凝血障碍的患者。（与肝素等并用）[有使血栓稳定化的倾向]

(2) 术后处于卧床状态的患者以及正在接受压迫止血的患者。（上述情况易发生静脉血栓，给予本药后有使血栓稳定化的倾向。有在下床运动及解除压迫后发生肺栓塞症的报告。）

(3) 有肾功能不全的患者。（有时血药浓度升高，建议适当减量。）

2. 有报告显示，同品种用于上泌尿道出血的患者时由于血块形成而造成输尿管梗阻。

3. 严重过敏反应：同品种临床试验报告一例严重过敏反应，表现为呼吸困难、咽部紧绷感及面部潮红，并需急诊治疗。有文献报告同品种经静脉大剂量给药后发生过过敏性休克。

4. 蛛网膜下腔出血：蛛网膜下腔出血的妇女中使用同品种可能导致脑水肿和脑梗塞。

5. 有使用同品种后发生木样结膜炎的报告，停止给药后症状缓解。

6. 指导用药：告诉患者应从 PTP 板中取出药品，然后服用（有报道因误服了 PTP 板，硬锐角部分刺入了食道粘膜，更为严重的导致穿孔，并引发纵膈窦道炎等严重的合并症）

【孕妇及哺乳期妇女用药】

在怀孕期间使用氨甲环酸的少量数据显示本品对胎儿没有危害。尚无本品用于孕妇的临床试验数据。孕妇慎用本品。

尚无本品用于哺乳期妇女的临床试验数据。由于母乳中氨甲环酸的浓度很低（只有血中的百分之一），婴儿每日从母乳中吸收的药量很少。在确实需要时，哺

哺乳期妇女孕妇应遵医嘱使用本品。

【儿童用药】

尚无本品用于儿童的临床试验数据。在确实需要时，应遵医嘱使用本品。

【老年用药】

一般高龄患者因生理机能的减退，应注意减少用药量。

【药物相互作用】

1. 联合用药禁忌：

药物名称	临床症状及处置方法	作用机制・危险因素
凝血酶	有可能有血栓形成的倾向	有促进血栓形成的作用，如果联合用药有增加血栓形成的倾向

2. 联合用药时的注意事项：

药物名称	临床症状及处置方法	作用机制・危险因素
蛇毒凝血酶	大量合用时可引起血栓形成倾向。	本制剂具有的抗纤溶作用，有可能导致蛇毒凝血酶引起的纤维蛋白块存留较长时间，从而使栓塞的状态延续。
巴曲酶	有可能引起血栓或栓塞症。	由巴曲酶所生成的 desA，可阻碍纤维蛋白聚合体的分解。
凝血因子制剂 依他凝血素 α 等	在口腔等纤溶系统活性比较强的部位，有可能使凝血系统进一步亢进。	凝血因子制剂通过活化凝血系统出现止血作用，而本药物通过阻碍纤溶系统也出现止血作用。

【药物过量】

有报道长期大量给狗投药后可引起视网膜病变。

尚缺乏本品人用药物过量的研究和报道，一旦发生过量，应给予对症和支持治疗。

【药理毒理】

纤溶现象与机体在生理或病理状态下的纤维蛋白分解、血管通透性增加等有关，亦与纤溶引起的机体反应、各种出血症状及变态反应等的发生发展和治愈相关联。氨甲环酸可抑制这种纤溶酶的作用，显示止血、抗变态反应、抗炎效果。

1. 抗纤维蛋白溶酶作用：

氨甲环酸能与纤溶酶和纤溶酶原上的纤维蛋白亲和部位的赖氨酸结合部位

(LBS) 强烈吸附, 阻抑了纤溶酶、纤溶酶原与纤维蛋白结合, 从而强烈地抑制了由纤溶酶所致纤维蛋白分解。另外, 在血清中 α_2 巨球蛋白等抗纤溶酶的存在下, 氨甲环酸抗纤溶作用更加明显, 止血作用更加显著。

2. 止血作用:

异常亢进的纤溶酶将会引起血小板的凝集抑制及凝固因子的分解。轻度的亢进首先导致纤维蛋白的分解。因而考虑在一般出血时, 氨甲环酸可阻抑纤维蛋白分解而起到止血作用。

3. 抗变态反应、抗炎作用:

氨甲环酸可抑制引起血管渗透性增强、变态反应及炎症性病变的激肽及其它活性肽的产生 (豚鼠、大鼠)。

【药代动力学】

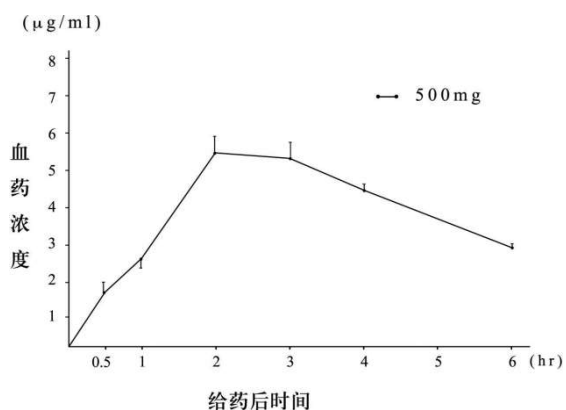
1. 血药浓度:

健康成年人单剂 (500mg 片) 口服本品的药代动力学参数如下所示:

单剂 (500mg) 口服给药时氨甲环酸的药代动力学参数 (n=5)

给药量	$t_{\max}$ (hr)	$C_{\max}$ ($\mu\text{g/mL}$)	$t_{1/2}$ (hr)
500mg 片	2~3	6.0	3.3

单剂 (500mg) 口服给药时的血药浓度曲线:



2. 分布:

大鼠单剂经口给 ^{14}C -氨甲环酸时, 大部分器官内的药物浓度与总血药浓度相同, 给药 2 小时后显示最高浓度; 肾、肝的药物浓度高于血液, 其它器官的药物浓度低于血液。

3. 代谢和排泄:

健康成年人单剂口服氨甲环酸片 500mg 或 250mg 后, 吸收迅速。给药后 24

小时，其给药量的 40-70%以原型经尿排出。

【贮藏】 室温保存

【包装】 铝塑包装，10 片/板，10 板/盒。

铝塑包装，10 片/板，2 板/盒。

【有效期】 36 个月。

【执行标准】 JX20150254 及 201902340、41。

【批准文号】 国药准字 HJ20160282

【上市许可持有人】

名称：DAIICHI SANKYO CO., LTD.

注册地址：3-5-1, Nihonbashi Honcho, Chuo-Ku, Tokyo, Japan

【生产企业】

生产厂名称：CMIC CMO CO., LTD. Shizuoka Plant

生产地址：1-588, Kanaya-azuma, Shimada, Shizuoka, Japan

热线电话：400 656 3228（工作时间：工作日 9:00-12:00；13:00-17:30）