

1 タルチレリン口腔内崩壊錠

2 Taltirelin Orally Disintegrating Tablets

3 本品は定量するとき、表示量の95.0~105.0%に対応する
4 タルチレリン水和物(C₁₇H₂₃N₇O₅・4H₂O: 477.47)を含む。

5 **製法** 本品は「タルチレリン水和物」をとり、錠剤の製法により
6 製する。

7 **確認試験** 本品を粉末とし、「タルチレリン水和物」30 mgに
8 対応する量を取り、水10 mLを加えて5分間振り混ぜた後、
9 ろ過する。ろ液0.5 mLに4-ニトロベンゼンジアゾニウムフ
10 ルオロポレート溶液(1→2000)2 mL及びpH9.0のホウ酸・塩
11 化カリウム・水酸化ナトリウム緩衝液3 mLを加えるとき、
12 液は赤色を呈する。

13 **純度試験** 類縁物質 本品を粉末とし、「タルチレリン水和
14 物」5 mgに対応する量を取り、移動相20 mLを加えて5分間
15 激しく振り混ぜた後、孔径0.45 μm以下のメンブランフィル
16 ターでろ過する。初めのろ液2 mLを除き、次のろ液を試料
17 溶液とする。試料溶液20 μLにつき、次の条件で液体クロマ
18 トグラフィー (2.01) により試験を行う。各々のピーク面積
19 を自動積分法により測定し、面積百分率法によりそれらの量
20 を求めるとき、タルチレリンに対する相対保持時間約0.7の
21 ピークの量は0.7%以下、相対保持時間約0.8及び約0.9のピ
22 ークの量はそれぞれ0.3%以下であり、タルチレリン及び上
23 記以外のピークの量はそれぞれ0.1%以下である。また、タ
24 ルチレリン以外のピークの合計量は1.0%以下である。

試験条件

25 検出器、カラム及びカラム温度は定量法の試験条件を準
26 用する。

27 移動相：リン酸二水素カリウム3.4 gを水1000 mLに溶
28 かし、リン酸を加えてpH2.5に調整した後、1-オク
29 タンスルホン酸ナトリウム1.7 gを加えて溶かす。こ
30 の液900 mLにアセトニトリル100 mLを加える。

31 流量：タルチレリンの保持時間が約15分になるように
32 調整する。

33 面積測定範囲：タルチレリンの保持時間の1/3からタ
34 ルチレリンの保持時間の約1.5倍の範囲

システム適合性

35 検出の確認：試料溶液1 mLに移動相を加えて100 mLと
36 し、システム適合性試験用溶液とする。この液1 mL
37 を正確に量り、移動相を加えて正確に20 mLとする。
38 この液20 μLから得たタルチレリンのピーク面積が、
39 システム適合性試験用溶液のタルチレリンのピーク面
40 積の3.5~6.5%になることを確認する。

41 システムの性能：システム適合性試験用溶液20 μLにつ
42 き、上記の条件で操作するとき、タルチレリンのピー
43 クの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ
44 7000段以上、1.5以下である。

45 システムの再現性：システム適合性試験用溶液20 μLに
46 つき、上記の条件で試験を6回繰り返すとき、タルチ
47 レリンのピーク面積の相対標準偏差は2.0%以下であ
48 る。

49 **製剤均一性** (6.02) 次の方法により含量均一性試験を行うと
50 き、適合する。

51 本品1個をとり、移動相V/2 mLを加え、内標準溶液V
52 /10 mLを正確に加え、5分間激しく振り混ぜた後、1 mL中
53 にタルチレリン水和物(C₁₇H₂₃N₇O₅・4H₂O)約0.1 mgを含む
54 液になるように移動相を加えてV mLとし、孔径0.45 μm以
55 下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液2 mLを
56 除き、次のろ液を試料溶液とする。以下定量法を準用する。

57 59 タルチレリン水和物(C₁₇H₂₃N₇O₅・4H₂O)の量(mg)
60
$$= M_S \times Q_T / Q_S \times V / 500 \times 1.178$$

61 M_S: 脱水物に換算した定量用タルチレリン水和物の秤取
62 量(mg)

63 内標準溶液 o-アセトアニシジド溶液(1→2500)

64 **崩壊性** 別に規定する。

65 **溶出性** (6.10) 試験液に水900 mLを用い、パドル法により、
66 毎分50回転で試験を行うとき、本品の15分間の溶出率は
67 85%以上である。

68 本品1個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液
69 20 mL以上をとり、孔径0.45 μm以下のメンブランフィルタ
70 ーでろ過する。初めのろ液10 mLを除き、次のろ液V mLを
71 正確に量り、1 mL中にタルチレリン水和物(C₁₇H₂₃N₇O₅・
72 4H₂O)約5.6 μgを含む液となるように水を加えて正確にV'
73 mLとし、試料溶液とする。別に定量用タルチレリン水和物
74 (別途「タルチレリン水和物」と同様の方法で水分(2.48)を
75 測定しておく)約28 mgを精密に量り、水に溶かし、正確に
76 100 mLとする。この液2 mLを正確に量り、水を加えて正確
77 に100 mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液20
78 μLずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフィー
79 (2.01) により試験を行い、それぞれの液のタルチレリンの
80 ピーク面積A_T及びA_Sを測定する。

81 タルチレリン水和物(C₁₇H₂₃N₇O₅・4H₂O)の表示量に対する
82 溶出率(%)

83
$$= M_S \times A_T / A_S \times V' / V \times 1 / C \times 18 \times 1.178$$

84 M_S: 脱水物に換算した定量用タルチレリン水和物の秤取
85 量(mg)

86 C: 1錠中のタルチレリン水和物(C₁₇H₂₃N₇O₅・4H₂O)の表
87 示量(mg)

試験条件

88 定量法の試験条件を準用する。

システム適合性

89 システムの性能：標準溶液20 μLにつき、上記の条件で
90 操作するとき、タルチレリンのピークの理論段数及び
91 シンメトリー係数は、それぞれ3000段以上、2.0以下
92 である。

93 システムの再現性：標準溶液20 μLにつき、上記の条件
94 で試験を6回繰り返すとき、タルチレリンのピーク面
95 積の相対標準偏差は2.0%以下である。

96 **定量法** 本品20個以上をとり、その質量を精密に量り、粉末
97 とする。タルチレリン水和物(C₁₇H₂₃N₇O₅・4H₂O)約5 mgに
98 対応する量を精密に量り、移動相25 mLを加え、内標準溶液
99 5 mLを正確に加え、20分間振り混ぜる。これに移動相を加
100 えて50 mLとし、孔径0.45 μm以下のメンブランフィルター
101
102

103 でのろ過する。初めのろ液2 mLを除き、次のろ液を試料溶液
 104 とする。別に定量用タルチレリン水和物(別途「タルチレリ
 105 ン水和物」と同様の方法で水分(2.48)を測定しておく)約50
 106 mgを精密に量り、移動相に溶かし、正確に50 mLとする。
 107 この液5 mLを正確に量り、内標準溶液5 mLを正確に加え、
 108 移動相を加えて50 mLとし、標準溶液とする。試料溶液及び
 109 標準溶液20 µLにつき、次の条件で液体クロマトグラフィー
 110 (2.01)により試験を行い、内標準物質のピーク面積に対す
 111 るタルチレリンのピーク面積の比 Q_T 及び Q_S を求める。

112 タルチレリン水和物($C_{17}H_{23}N_7O_5 \cdot 4H_2O$)の量(mg)
 113 $=M_S \times Q_T / Q_S \times 1/10 \times 1.178$

114 M_S : 脱水物に換算した定量用タルチレリン水和物の秤取
 115 量(mg)

116 内標準溶液 o-アセトアニシジド溶液(1→2500)

117 試験条件

118 検出器: 紫外吸光度計(測定波長: 210 nm)

119 カラム: 内径4.6 mm, 長さ15 cmのステンレス管に5
 120 µmの液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル
 121 化シリカゲルを充填する。

122 カラム温度: 40°C付近の一定温度

123 移動相: リン酸二水素カリウム3.4 gを水1000 mLに溶
 124 かし、リン酸を加えてpH2.5に調整した後、1-オク
 125 タンスルホン酸ナトリウム1.7 gを加えて溶かす。こ
 126 の液850 mLにアセトニトリル150 mLを加える。

127 流量: タルチレリンの保持時間が約5分になるように調
 128 整する。

129 システム適合性

130 システムの性能: 標準溶液20 µLにつき、上記の条件で
 131 操作するとき、タルチレリン、内標準物質の順に溶出
 132 し、その分離度は10以上である。

133 システムの再現性: 標準溶液20 µLにつき、上記の条件
 134 で試験を6回繰り返すとき、内標準物質のピーク面積
 135 に対するタルチレリンのピーク面積の比の相対標準偏
 136 差は1.0%以下である。

137 貯法 容器 気密容器。

138 -----

139 **9. 41 試薬・試液の項に次を追加する。**

140

141 タルチレリン水和物, 定量用 $C_{17}H_{23}N_7O_5 \cdot 4H_2O$ [医薬品
 142 各条, 「タルチレリン水和物」ただし, 定量するとき, 換算
 143 した脱水物に対し, タルチレリン($C_{17}H_{23}N_7O_5$)99.0%以上を
 144 含むもの]

145 o-アセトアニシジド $C_9H_{11}NO_2$ 白色～淡褐色の結晶又は
 146 結晶性の粉末である。エタノール(99.5)又はアセトニトリル
 147 に溶けやすく, 水に溶けにくい。

148 融点: 86～89°C