ロ　物理的化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料　目次

1　トラネキサム酸セチル塩酸塩の製造方法 9

2　トラネキサム酸セチル塩酸塩の構造決定 10

3　トラネキサム酸セチル塩酸塩の物理的化学的性質 13

4　トラネキサム酸セチル塩酸塩の規格及び試験方法の設定に
関する資料 15

5　クリーム TX の規格及び試験方法の設定に関する資料..... 37

1　トラネキサム酸セチル塩酸塩の製造方法

トラネキサム酸セチル塩酸塩の製造方法を以下に示す（図 2）。

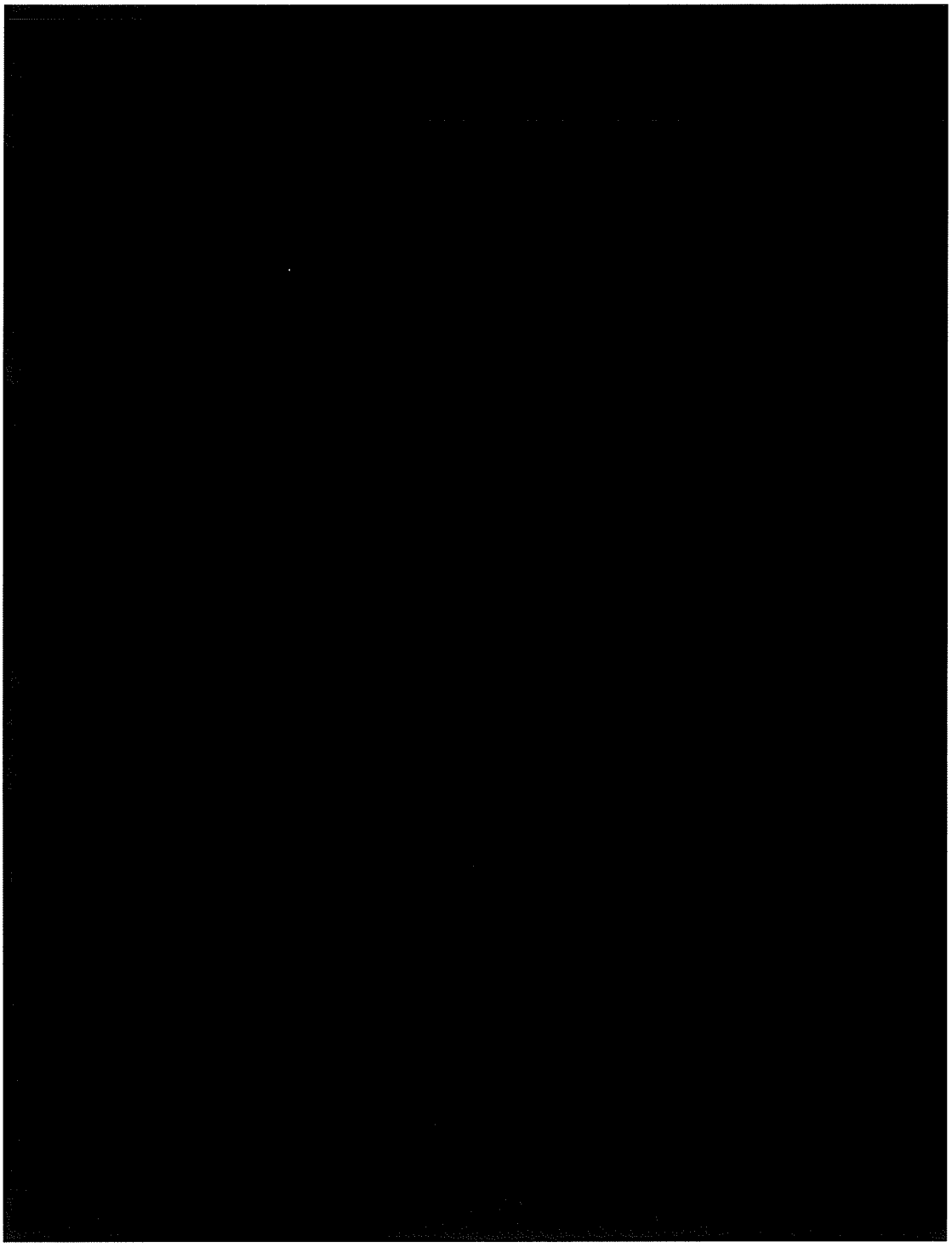


図 2　製造方法のフローチャート

2　トラネキサム酸セチル塩酸塩の構造決定

本法により得られたトラネキサム酸セチル塩酸塩は、質量分析法、元素分析法、赤外分光法、^{1}H-NMR 分光法、および ^{13}C-NMR 分光法を用いて、図 3 に示すように、セチルアルコール（図 4）をエステル結合したトラネキサム酸（図 5）のアミン塩酸塩であることを確認した。

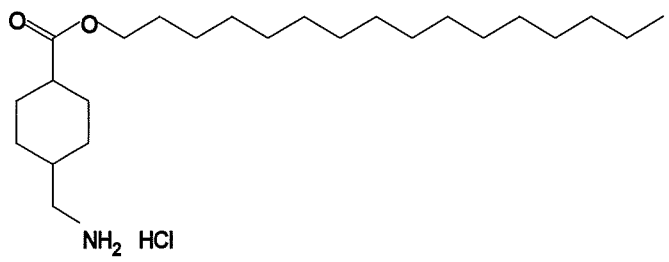


図 3　トラネキサム酸セチル塩酸塩の構造式

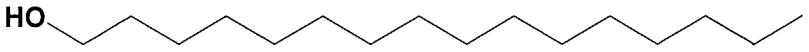


図 4　セチルアルコールの構造式

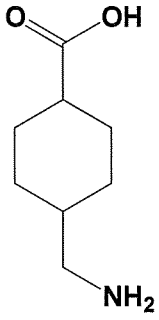
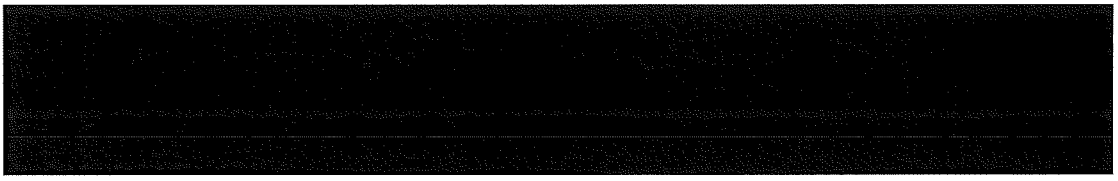


図 5　　トラネキサム酸の構造式

2-1 質量分析



[redacted]

2-2 元素分析

[redacted]

2-3 赤外分光分析

[redacted]

2-4 NMR 分光分析

^{1}H-NMR スペクトルの測定結果

[redacted]

図 6　トラネキサム酸セチル塩酸塩の構造[redacted]

表 2

^{13}C－NMR スペクトルの測定結果

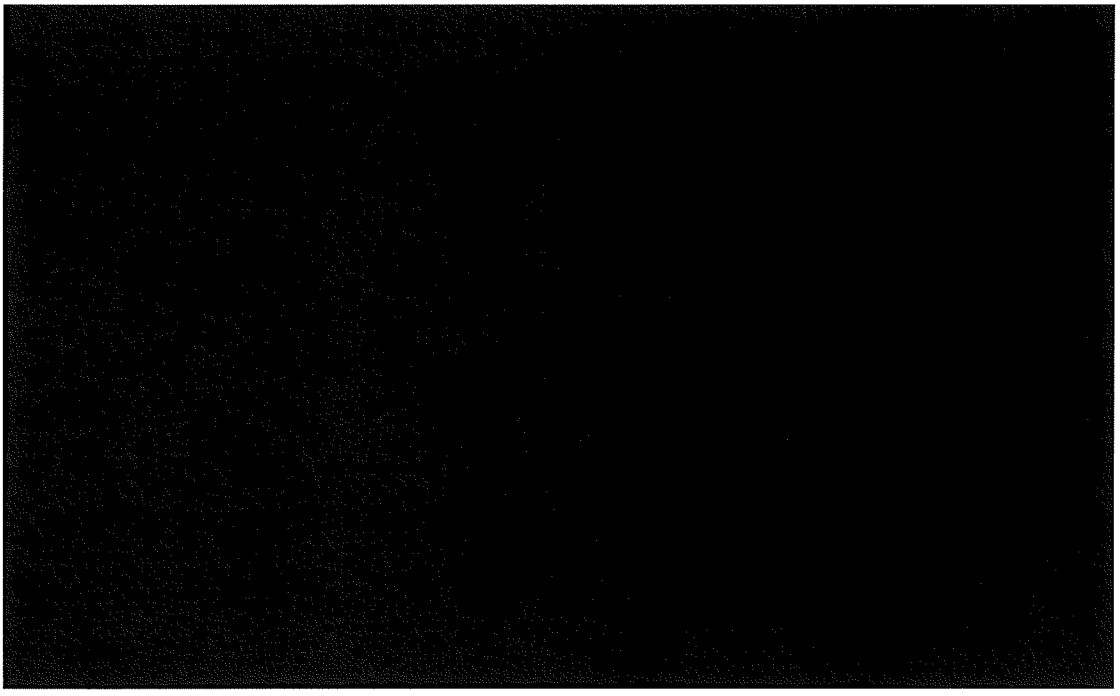


図 7　トラネキサム酸セチル塩酸塩の構造

表 3 [redacted]

[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]

3　トラネキサム酸セチル塩酸塩の物理的化学的性質

3-1 融点

[redacted]

表 4　トラネキサム酸セチル塩酸塩[redacted]

[redacted]			

3-2 紫外吸収スペクトル

[redacted]

[redacted]

3-3 溶解性

[redacted]20±5℃で5分間ごとに強く30秒間振り混ぜたとき、30分以内に溶ける度合を、第15改正日本薬局方通則29に従い判断した。

[redacted]

4　トラネキサム酸セチル塩酸塩の規格及び試験方法の設定に関する資料

本品の規格設定にあたり、次の試験を行い、規格と試験方法を設定した。

1．試料

製造業者である[redacted]で製造したトラネキサム酸セチル塩酸塩の[redacted]の5ロットについて3回ずつ試験を行った。

以下、トラネキサム酸セチル塩酸塩を試料と記載し、本試験での試料番号を表5のように定める。

表 5　原体のロット番号

ロット番号	試料番号
[redacted]	Ⅰ
[redacted]	Ⅱ
[redacted]	Ⅲ
[redacted]	Ⅳ
[redacted]	Ⅴ

2．規格、試験方法、設定理由、実測値

2－1．性状

[redacted]

設定理由

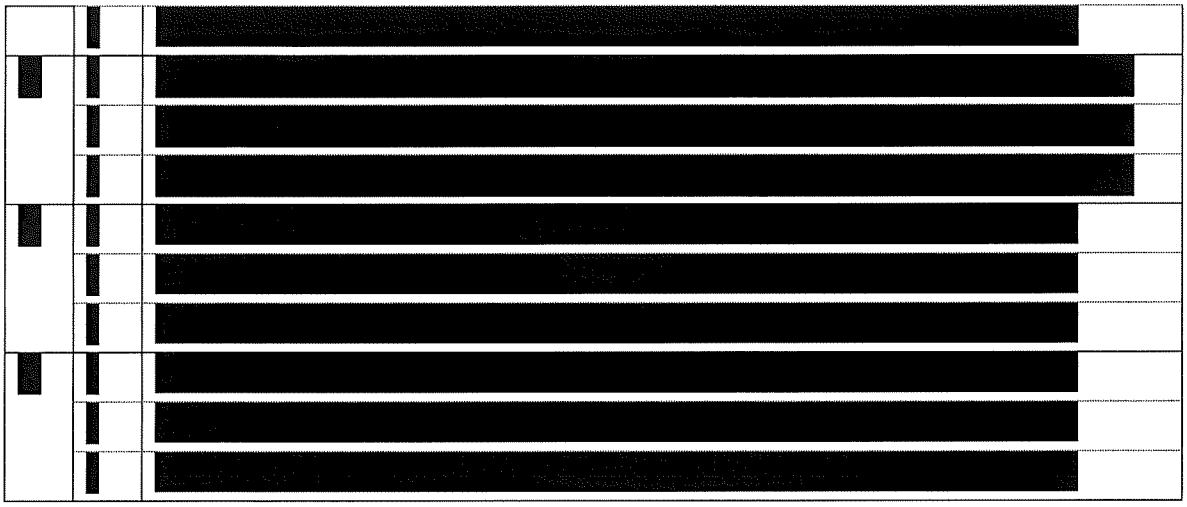
[redacted]

実測値

表6に結果を示す。

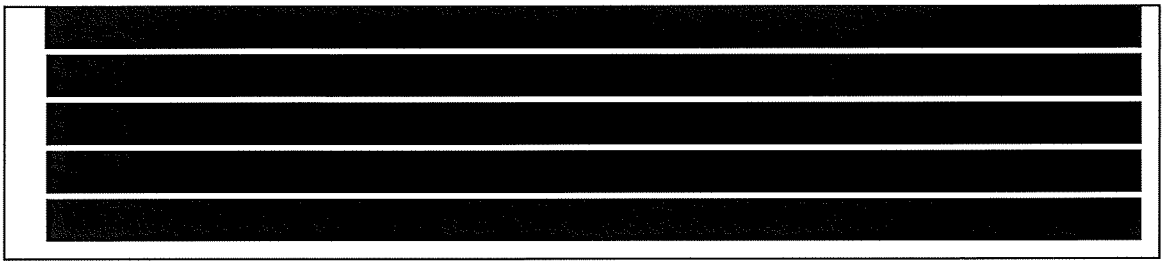
表 6 [redacted]

[redacted]		[redacted]
[redacted]	[redacted]	[redacted]
	[redacted]	[redacted]
	[redacted]	[redacted]
[redacted]	[redacted]	[redacted]
	[redacted]	[redacted]



2－2. 確認試験

2－2－1. 確認試験(1)－トラネキサム酸骨格の確認

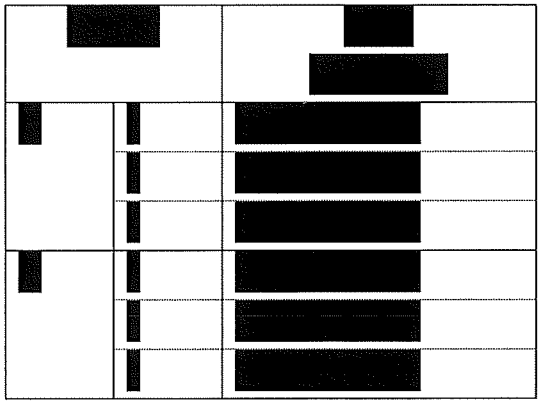


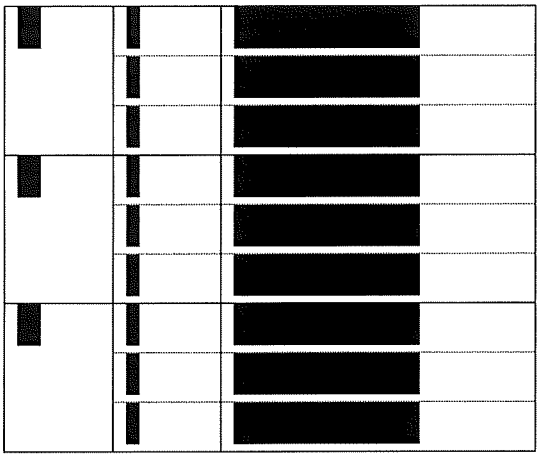
設定理由

実測値

表 7 に結果を示す。

表 7





2－2－2. 確認試験(2)－セチルエステルの確認

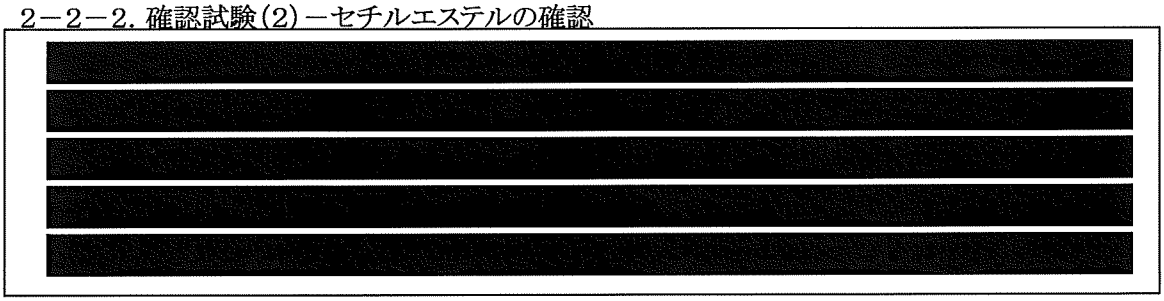


表 8

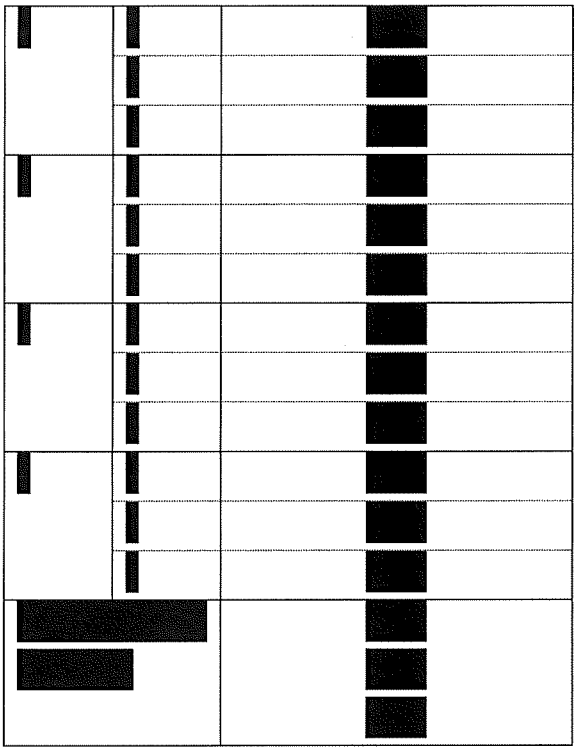
表 9

設定理由

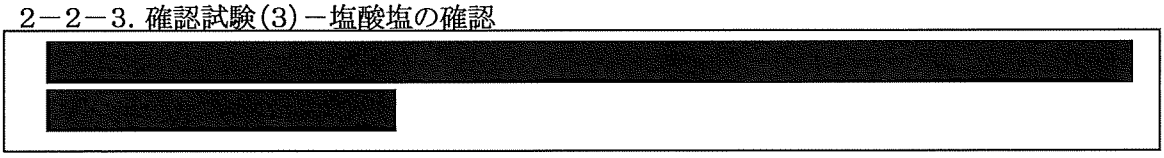
実測値

表 10 に結果を示す。

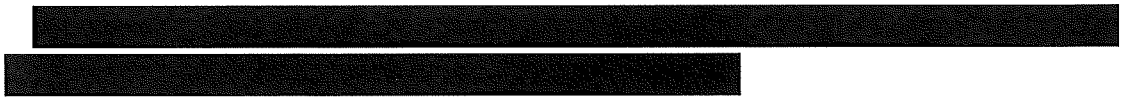
表 10



2－2－3. 確認試験(3)－塩酸塩の確認



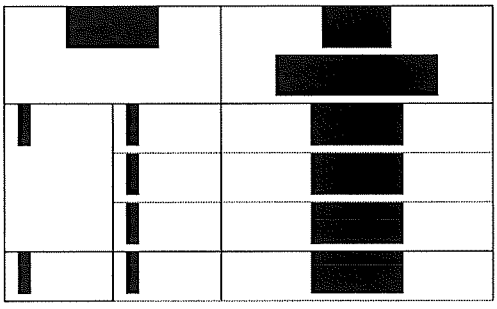
設定理由

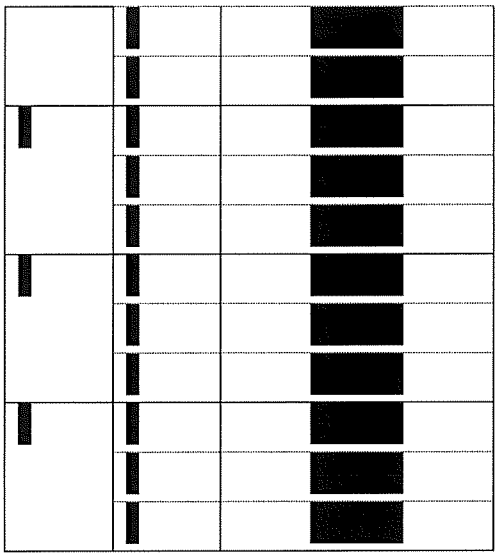


実測値

表 11 に結果を示す。

表 11





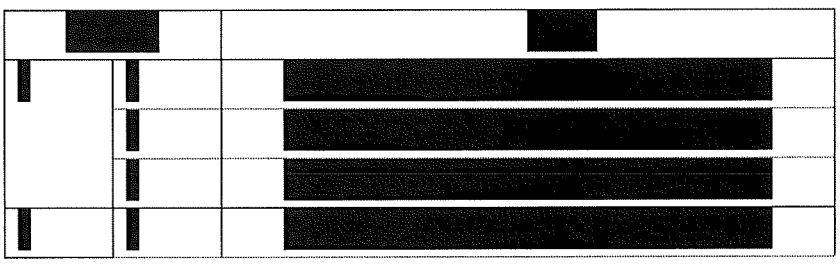
2－2－4. 確認試験(4)－赤外吸収スペクトルによる確認

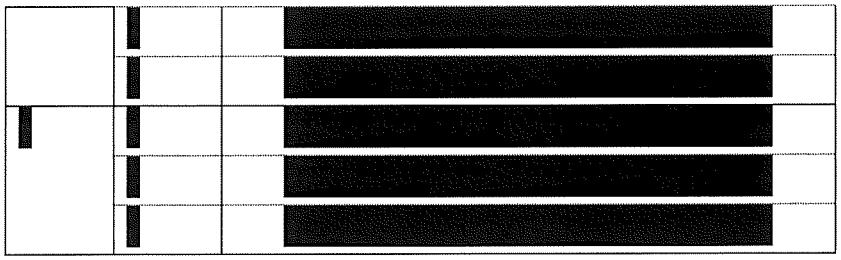
設定理由

実測値

表 12 に結果を示す。

表 12





2－3. 融点

設定理由

実測値

表 13 に結果を示す。

表 13

[redacted]

2－4. 純度試験

2－4－1. 重金属

[redacted]

設定理由

[redacted]

実測値

表 14 に結果を示す。

表 14 [redacted]

[redacted]

[redacted]

2－4－2. 遊離トラネキサム酸の含有量

[redacted]

[redacted]

[redacted]

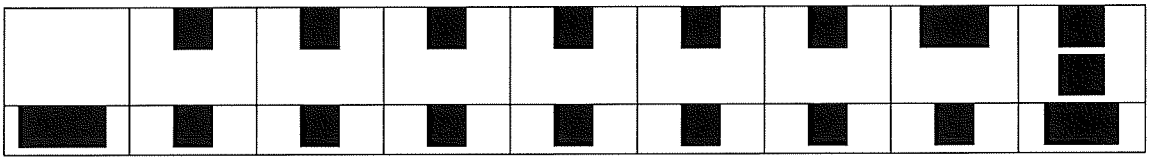
表 15 [redacted]

[redacted]

[redacted]

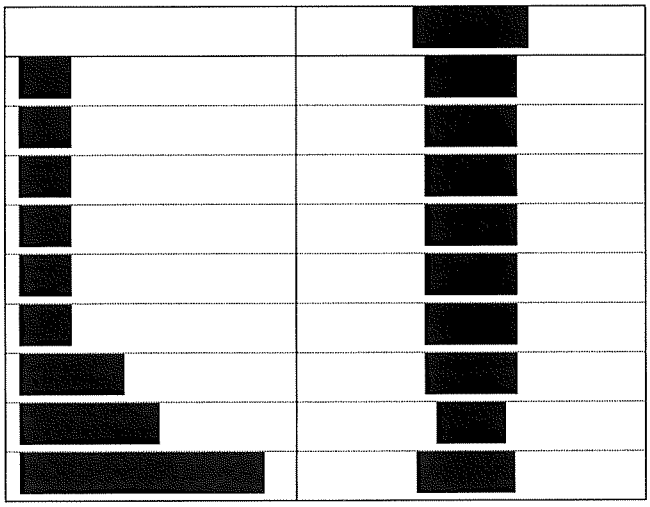
[redacted]

表 16 [redacted]



[redacted]

表 17 [redacted]



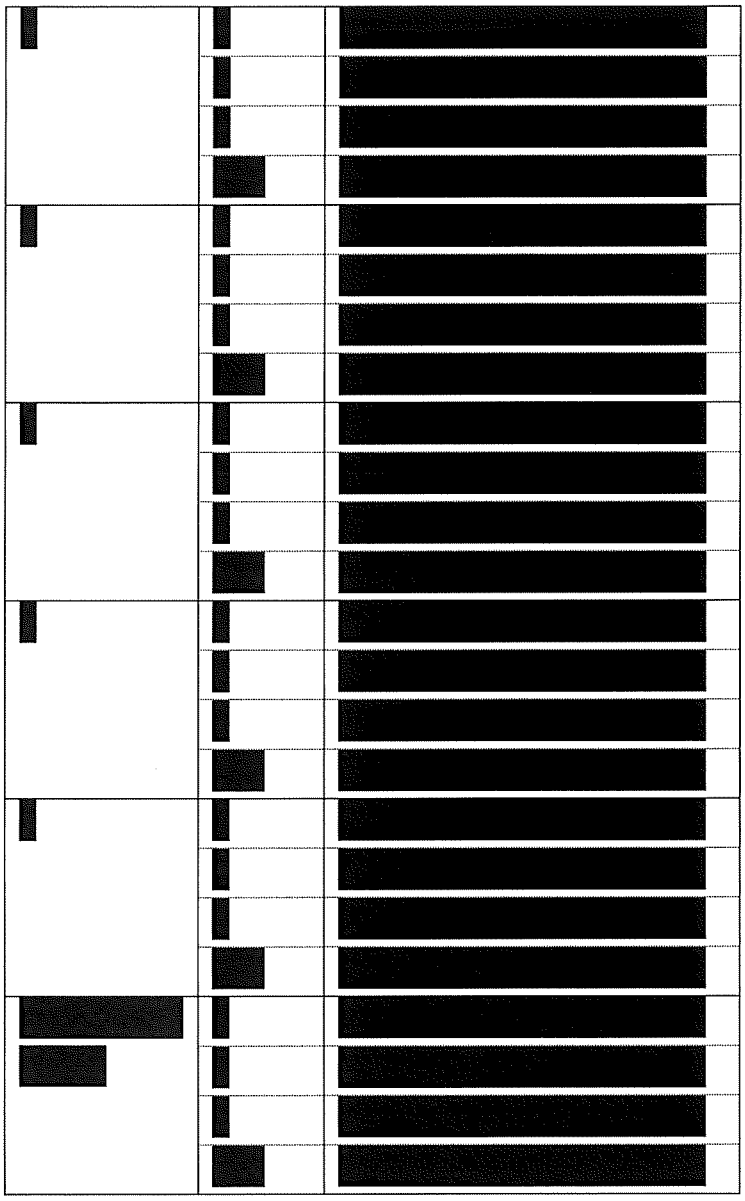
設定理由

[redacted]

実測値

表 18 に結果示す。

表 18 [redacted]



2－5. 乾燥減量

設定理由

実測値

表 19 に結果を示す。

表 19 [redacted]

[redacted]

2−6. 定量

[redacted]

[redacted]

[redacted]

表 20 [redacted]

[redacted]

[redacted]

表 21 [redacted]

[redacted]

[redacted]

[redacted]

表 22 [redacted]

[redacted]

[redacted]

表 23 [redacted]

[redacted]

設定理由

[redacted]

実測値

[redacted]

表 24 [redacted]

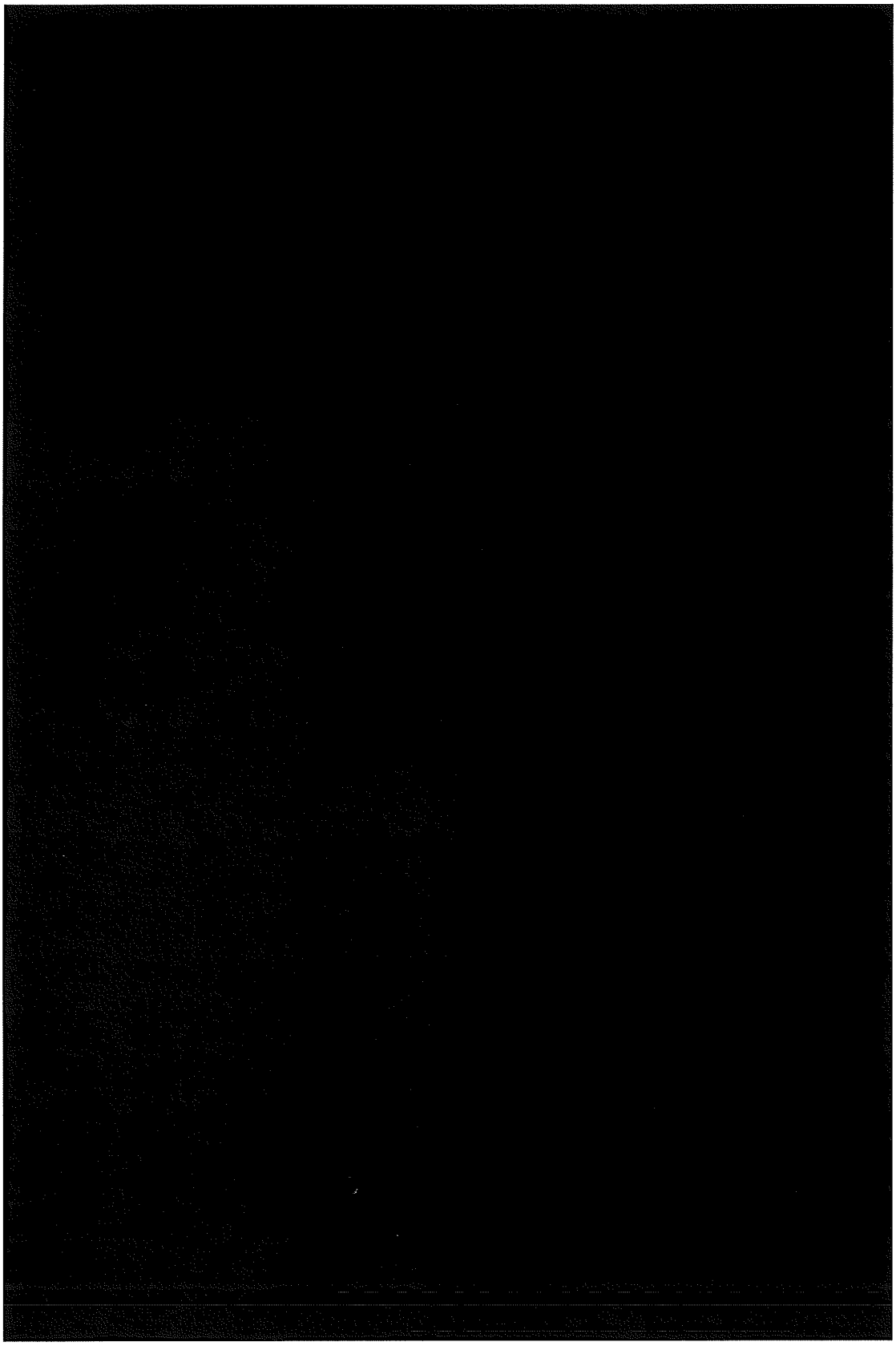
[redacted]

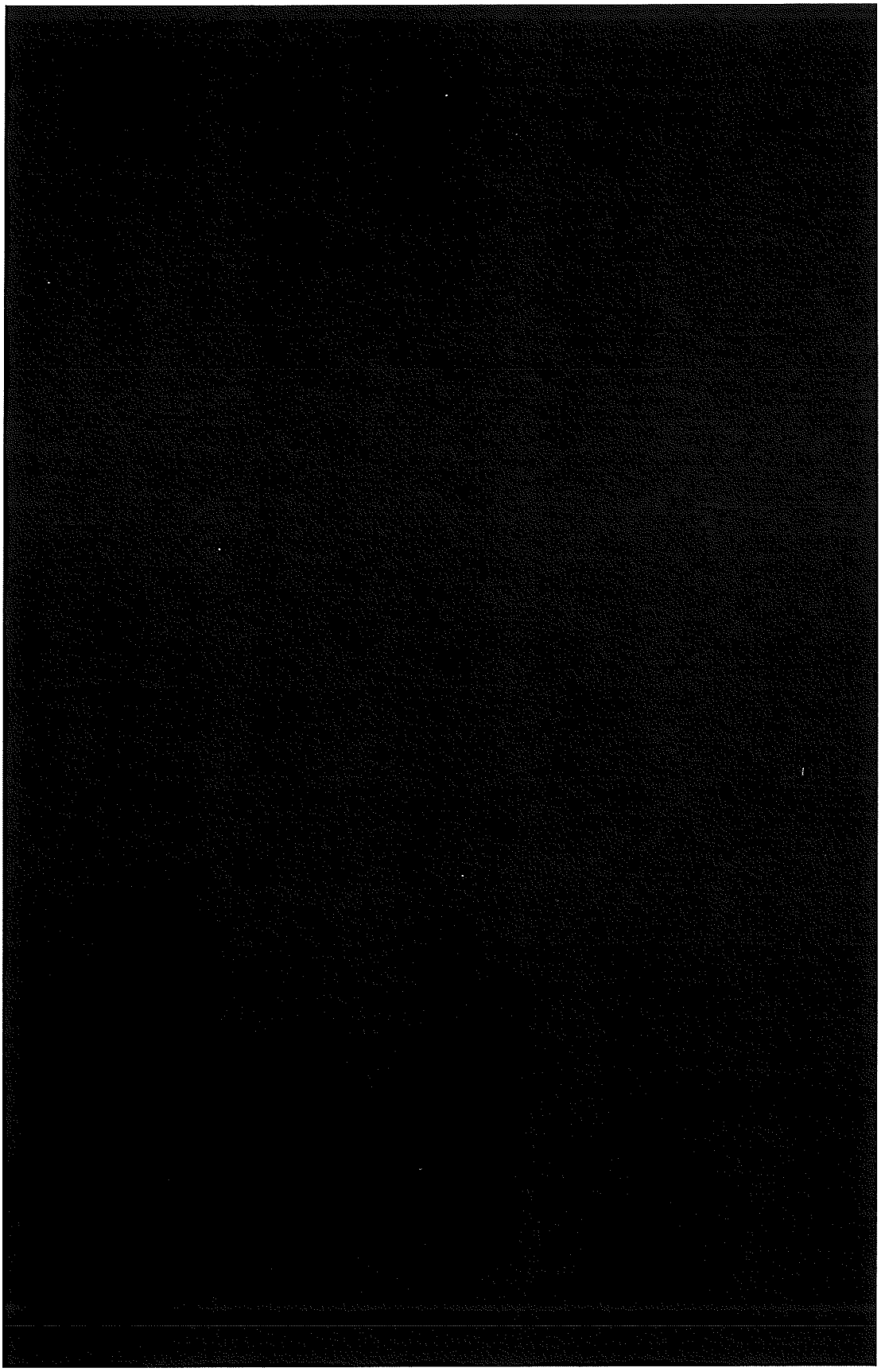
[redacted]

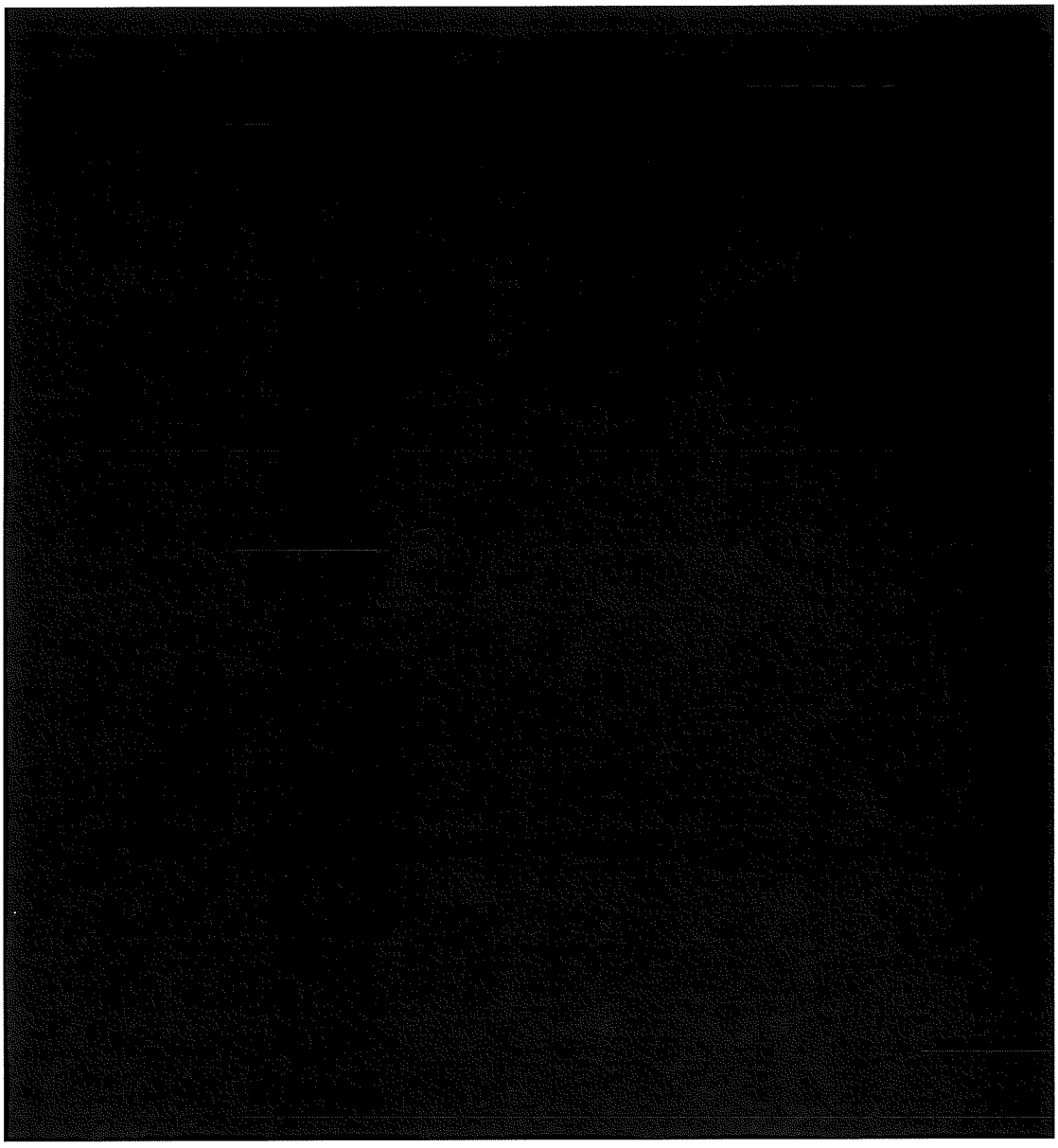
表 25 [redacted]

[redacted]

3. トラネキサム酸セチル塩酸塩標準品の規格

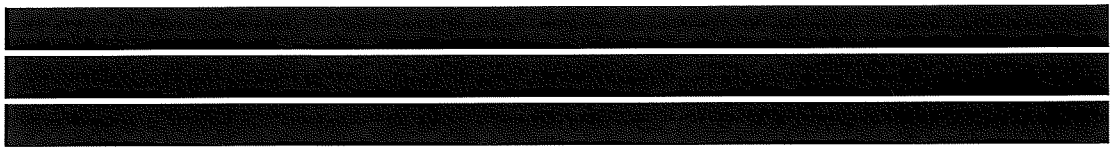






4. 備　考

本規格及び試験方法は、別に規定するもののほか、日本薬局方の通則及び一般試験法を準用する。



5　クリーム TX の規格及び試験方法の設定に関する資料

クリーム TX の規格設定にあたり、次の試験を行い、規格と試験方法を設定した。以下、クリーム TXを製剤と記載する。

1. 測定試料

製剤の[redacted]5 ロットについて 3 回ずつ試験を行った。本試験での製剤番号を表 32 のように定める。

表 32　製剤のロット番号

ロット番号	製剤番号
[redacted]	I
[redacted]	II
[redacted]	III
[redacted]	IV
[redacted]	V

2.　規格、試験方法、設定理由、実測値

2-1. 性状

[redacted]

設定理由

[redacted]

実測値

[redacted]

[redacted]

[redacted]

2-2. トラネキサム酸セチル塩酸塩の確認試験

[redacted]薄層クロマトグラフィーにより試験を行う. [redacted]

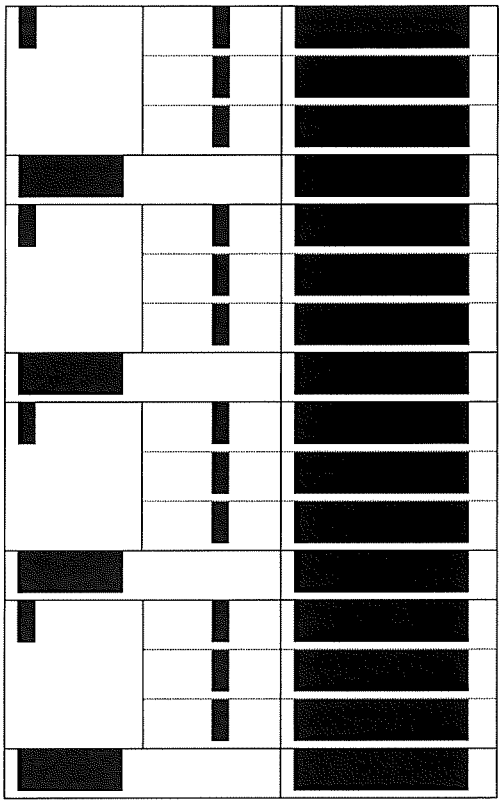
設定理由

[redacted]

実測値

[redacted]

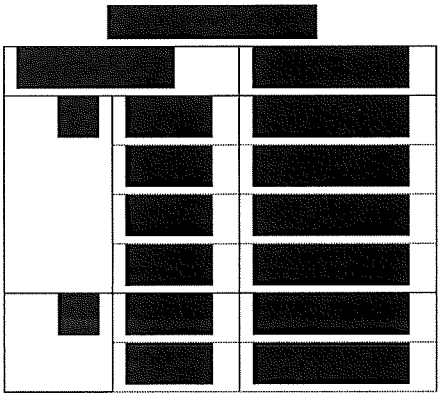
[redacted]

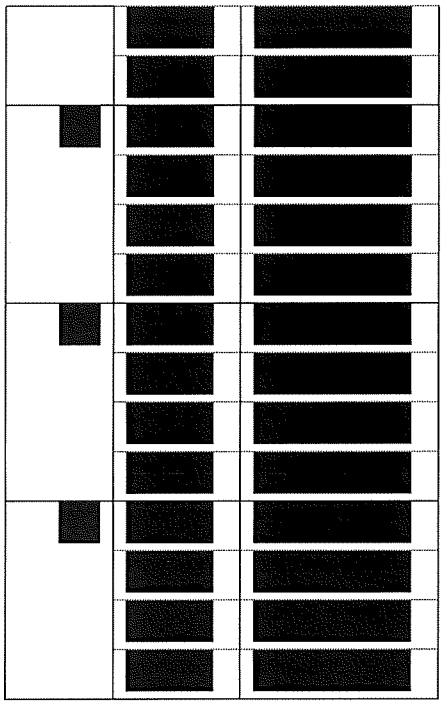


2-3. pH

設定理由

実測値



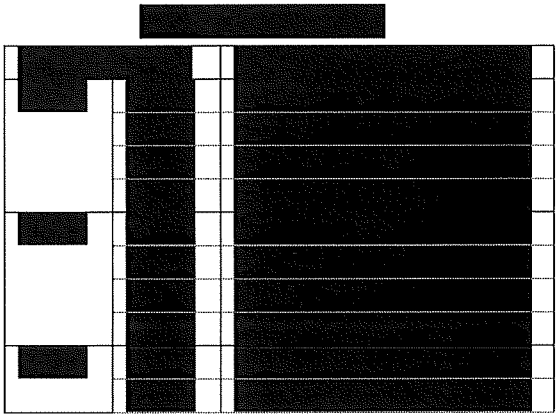


2-4. 純度試験

2-4-1. 重金属

設定理由

実測値



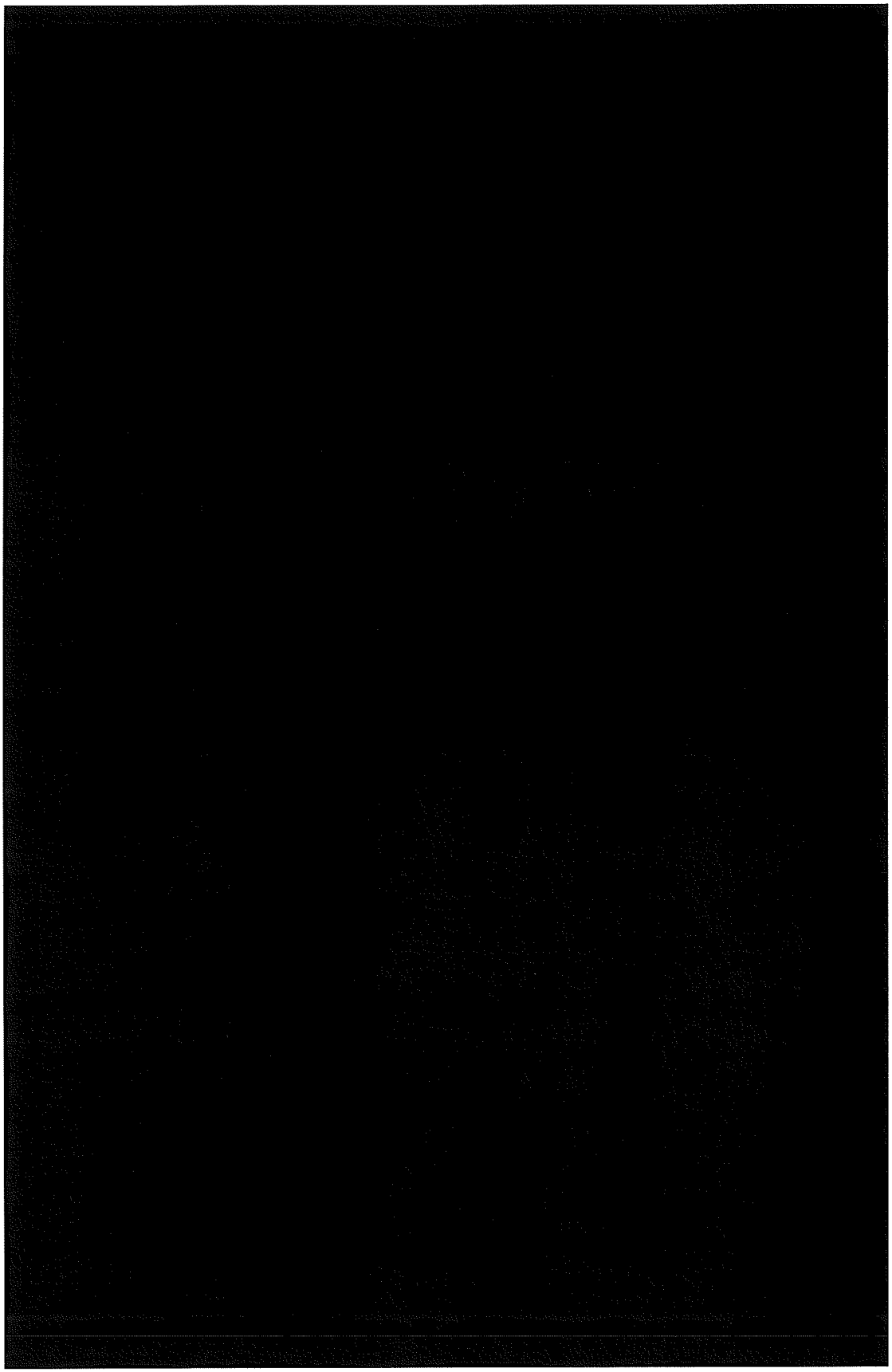
[redacted]

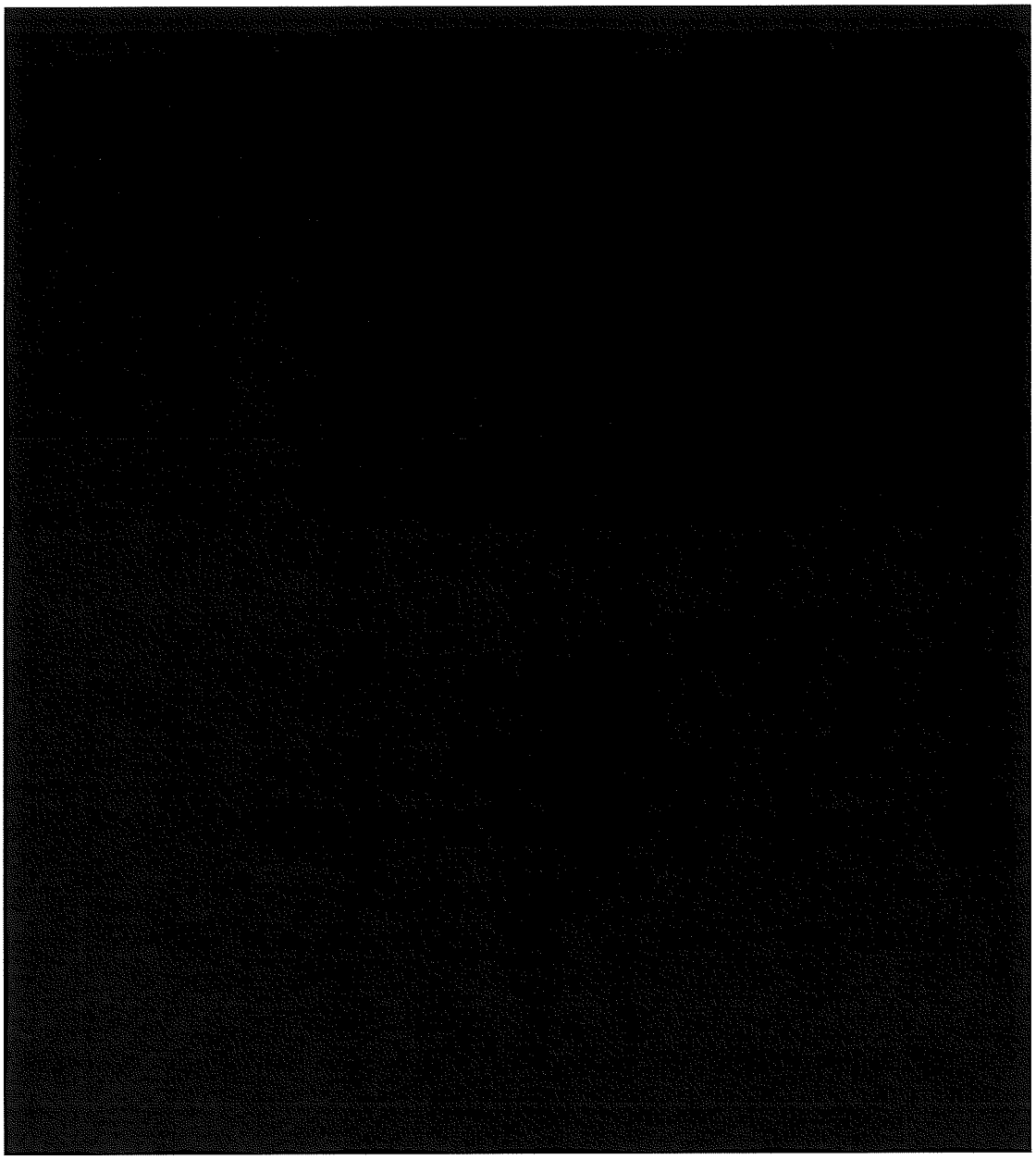
2-5. トラネキサム酸セチル塩酸塩の定量

[redacted]

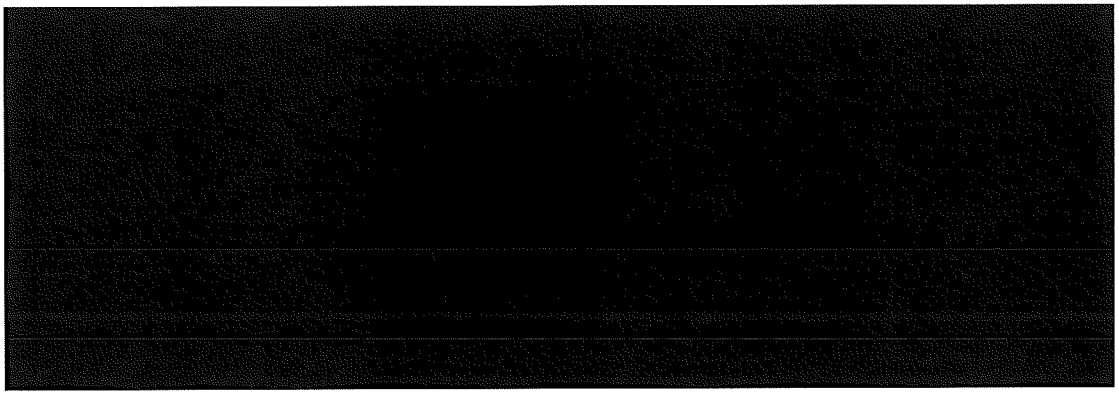
液体クロマトグラフィーにより試験を行う。[redacted]

[redacted]

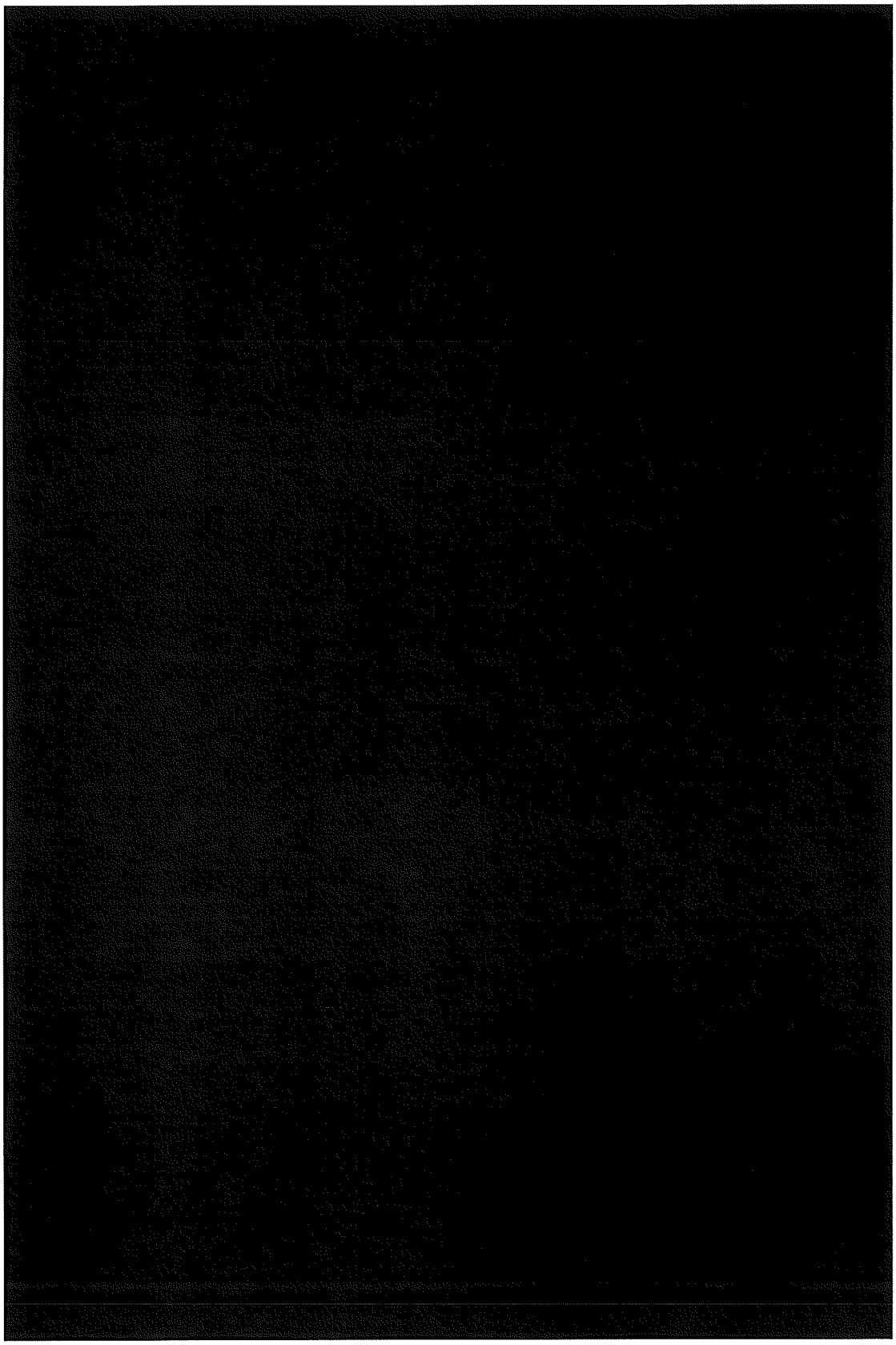


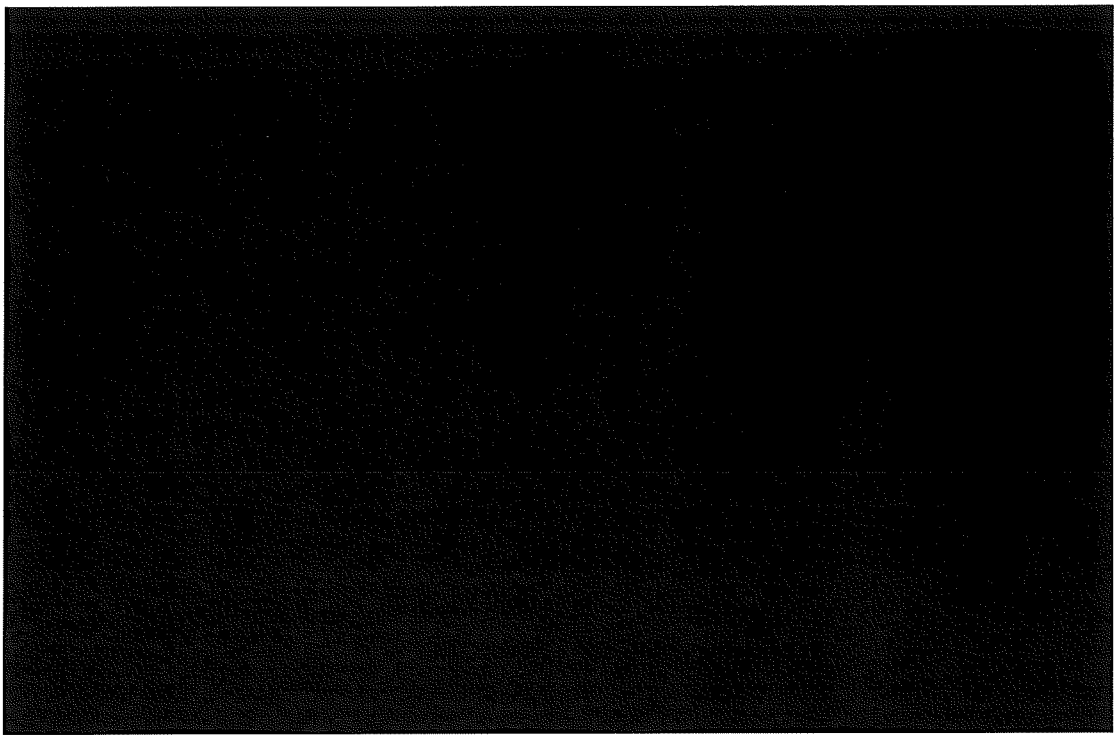


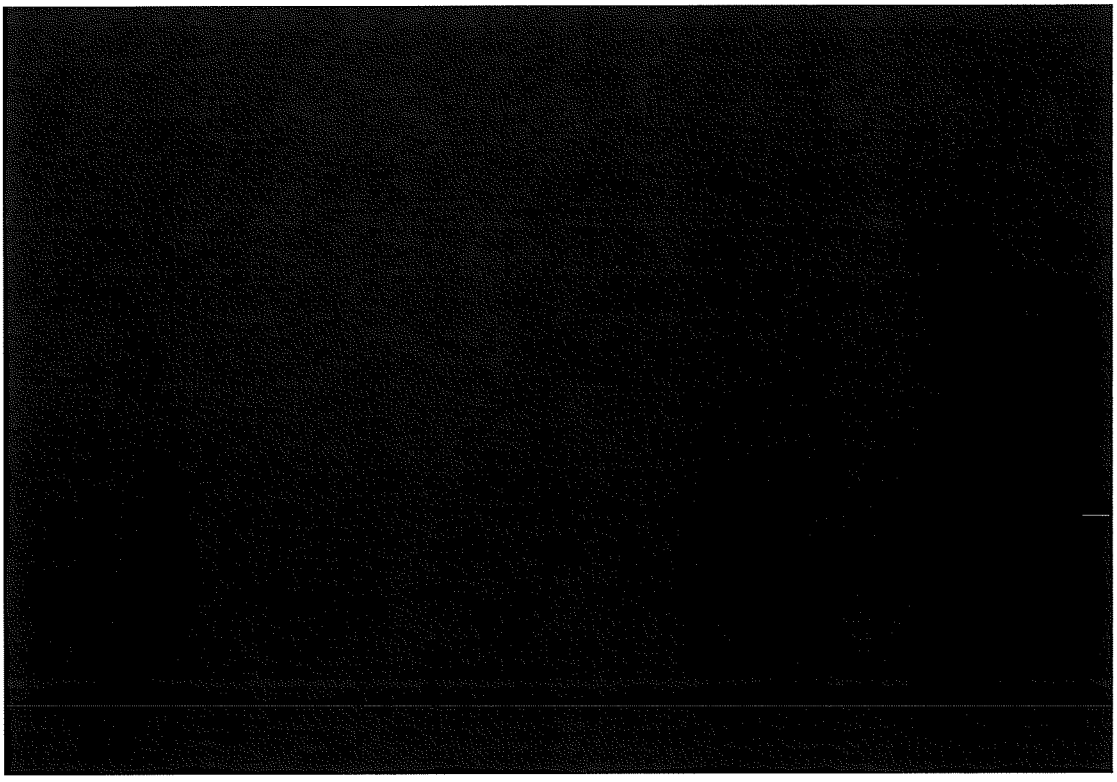
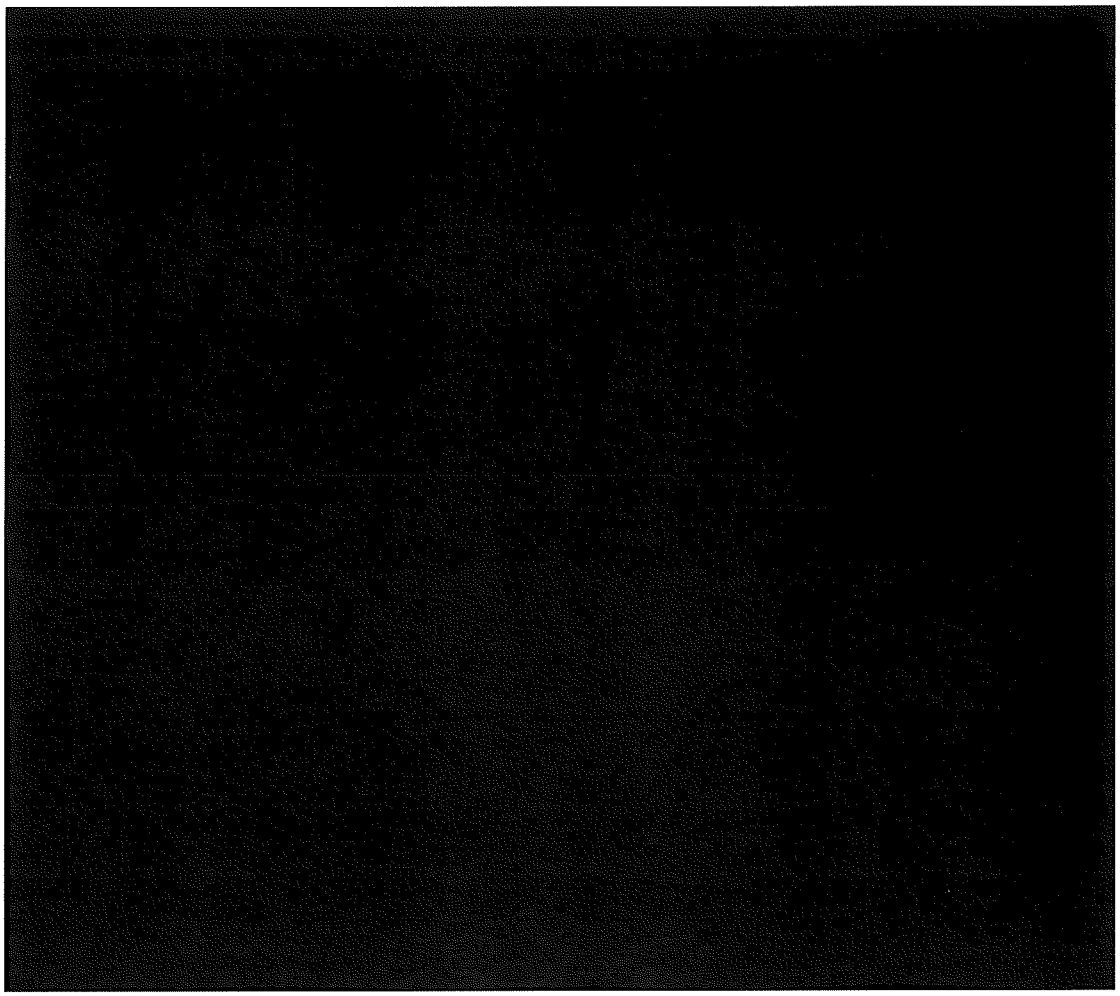
設定理由



実測値





3. 備　考

本規格及び試験方法は、別に規定するもののほか、日本薬局方の通則及び一般試験法を準用する。