

貯 法：室温保存
有効期間：3年

経口脊髄小脳変性症治療剤

日本薬局方タルチレリン錠

タルチレリン錠 5 mg「アメル」

日本薬局方タルチレリン口腔内崩壊錠

タルチレリンOD錠 5 mg「アメル」

Taltirelin Tablets [AMEL]
Taltirelin OD Tablets [AMEL]

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋により使用すること

	錠5mg	OD錠5mg
承認番号	22400AMX00255	22500AMX00100
販売開始	2012年6月	2013年6月

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	タルチレリン錠 5mg「アメル」	タルチレリン OD 錠 5mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局タルチレリン水和物 5mg を含有する。	1錠中、日局タルチレリン水和物 5mg を含有する。
添加剤	D-マンニトール、トウモロコシデンプン、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ステアリン酸マグネシウム	無水リン酸水素カルシウム、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、軽質無水ケイ酸、スクラロース、ステアリン酸マグネシウム

3.2 製剤の性状

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
タルチレリン錠 5mg「アメル」	割線入り素錠		Kw324 /TAL5
	白色	直径：約 7.0mm 厚さ：約 3.0mm 質量：約 120.0mg	
タルチレリン OD 錠 5mg「アメル」	割線入り素錠		KW TAL /OD5
	白色	直径：約 7.0mm 厚さ：約 2.6mm 質量：約 110.0mg	

4. 効能又は効果

脊髄小脳変性症における運動失調の改善

5. 効能又は効果に関連する注意

5.1 運動失調を呈する類似疾患が他にも知られていることから、病歴の聴取及び全身の理学的所見に基づいた確定診断のうえ投与を行うこと。

6. 用法及び用量

通常、成人にはタルチレリン水和物として1回 5mg、1日2回（朝、夕）食後に経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 内分泌異常のある患者

臨床症状を観察し、必要に応じて血中ホルモン濃度（TSH、プロラクチン等）を測定することが望ましい。

9.2 腎機能障害患者

重度の腎機能障害患者1例で血漿中濃度が約4.2倍上昇した。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。動物実験（ラット）で乳汁への移行が認められている。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

用量に注意して投与すること。本剤は主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがある。

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 痙攣（1%未満）

11.1.2 悪性症候群（1%未満）

発熱、無動減黙、筋強剛、脱力、頻脈、血圧の変動等があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、体冷却、水分補給などの適切な処置を行うこと。また、本症発症時には、白血球の増加や血清CKの上昇があらわれることが多く、また、ミオグロビン尿を伴う腎機能の低下があらわれることがある。

11.1.3 肝機能障害、黄疸（いずれも1%未満）

AST、ALT、ALP、LDH、 γ -GTPの上昇等を伴う肝機能障害や黄疸があらわれることがある。

11.1.4 ショック様症状（頻度不明）

一過性の血圧低下、意識喪失等のショック様症状があらわれることがある。

11.1.5 血小板減少（頻度不明）

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
血液	赤血球減少、ヘモグロビン減少	
循環器	血圧及び脈拍数の変動、動悸	
消化器	悪心、嘔吐、下痢、食欲不振、胃部不快感、胃炎、腹痛、口渇、便秘	舌炎

	0.1~5%未満	0.1%未満
肝臓	AST、ALT、 γ -GTP、ALP、LDH、トリグリセリド、総コレステロールの上昇	
腎臓	BUNの上昇	
精神神経系	頭痛、めまい、ふらつき、振戦	しびれ、眠気、頭がぼーっとする、不眠
過敏症	発疹、そう痒	
内分泌	TSHの変動、甲状腺ホルモン(T ₃ 、T ₄)、プロラクチンの上昇	女性化乳房
その他	CKの上昇、血糖上昇、熱感、倦怠感、頻尿	脱毛

注) 発現頻度は、製造販売後調査の結果を含む。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

〈OD錠〉

14.1.1 自動分包機には適さない(通常の錠剤に比べてやわらかい)。

14.2 薬剤交付時の注意

〈製剤共通〉

14.2.1 PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

〈OD錠〉

14.2.2 吸湿性を有するため、服用直前にPTPシートから取り出すよう指導すること。

14.2.3 欠けや割れが生じた場合は全量服用するよう指導すること。

14.2.4 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

14.2.5 寝たままの状態では、水なしで服用しないこと。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

〈タルチレリン錠5mg「アメル」〉

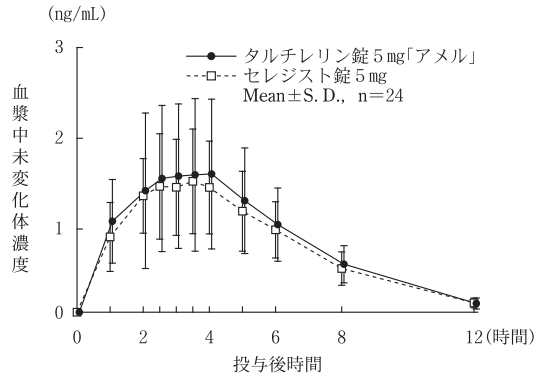
タルチレリン錠5mg「アメル」とセレジスト錠5mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(タルチレリン水和物として5mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

(注) 本剤の承認された用法は、食後投与である。

薬物動態パラメータ(生物学的同等性)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (0→12) (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
タルチレリン錠5mg「アメル」	10.13±4.14	1.88±0.96	3.00±1.08	1.99±0.71
セレジスト錠5mg	9.31±2.95	1.73±0.65	3.19±0.82	1.92±0.26

(Mean±S.D., n=24)



血漿中未変化体濃度(生物学的同等性)
〈タルチレリン OD錠5mg「アメル」〉

(1) 水なしで服用

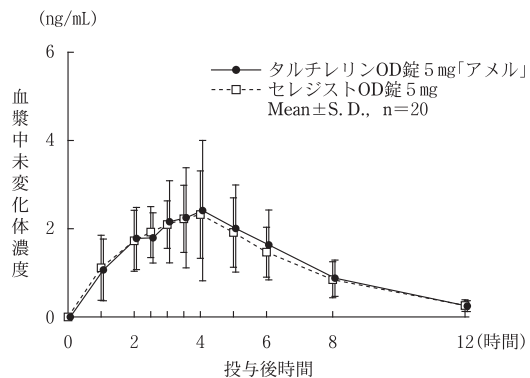
タルチレリン OD錠5mg「アメル」とセレジスト OD錠5mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(タルチレリン水和物として5mg)健康成人男子に水なしで絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

(注) 本剤の承認された用法は、食後投与である。

薬物動態パラメータ(生物学的同等性、水なし)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (0→12) (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
タルチレリン OD錠5mg「アメル」	14.88±6.00	2.75±1.51	3.30±1.26	2.27±0.38
セレジスト OD錠5mg	14.43±4.27	2.66±0.97	3.38±1.23	2.37±0.49

(Mean±S.D., n=20)



血漿中未変化体濃度(生物学的同等性、水なし)

(2) 水ありで服用

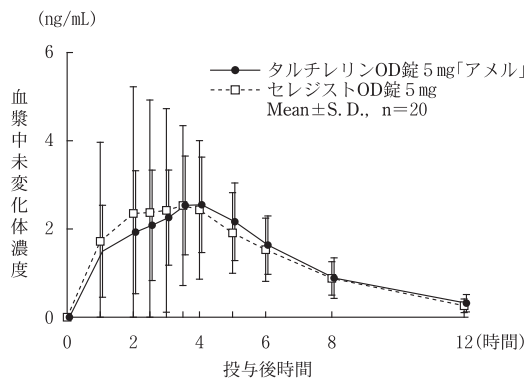
タルチレリン OD錠5mg「アメル」とセレジスト OD錠5mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(タルチレリン水和物として5mg)健康成人男子に水ありで絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、判定パラメータの対数値の平均値の差が $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ で、かつ、溶出試験で規定するすべての条件で溶出挙動が類似していたことから、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

(注) 本剤の承認された用法は、食後投与である。

薬物動態パラメータ(生物学的同等性、水あり)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (0→12) (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
タルチレリン OD錠5mg「アメル」	16.21±6.04	2.97±1.41	3.65±0.97	2.45±0.43
セレジスト OD錠5mg	16.34±11.37	3.01±2.76	3.60±1.10	2.37±0.60

(Mean±S.D., n=20)



血漿中未変化体濃度（生物学的同等性、水あり）
 血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

甲状腺刺激ホルモン放出ホルモン（TRH）の誘導体。中枢神経系に広く分布する TRH 受容体に結合後、アセチルコリン、ドーパミン、ノルアドレナリン及びセロトニン神経系を活性化させることにより、脊髄小脳変性症における運動失調を改善すると考えられている。また、脊髄反射増強作用、神経栄養因子様作用及び局所グルコース代謝促進作用も薬効に関与すると考えられている²⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名

タルチレリン水和物（Taltirelin Hydrate）

化学名

N- [(4*S*)-1-Methyl-2,6-dioxohexahydropyrimidine-4-carbonyl] -L-histidyl-L-prolinamide tetrahydrate

分子式

C₁₇H₂₃N₇O₅ · 4H₂O

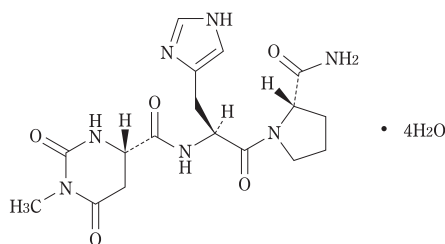
分子量

477.47

性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。
 水、エタノール（99.5）又は酢酸（100）に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすい。
 1mol/L 塩酸試液に溶ける。
 結晶多形が認められる。

構造式



20. 取扱い上の注意

〈錠〉

PTP 包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

〈OD 錠〉

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

22. 包装

〈タルチレリン錠 5mg 「アメル」〉

28 錠 [14 錠 (PTP) × 2]

〈タルチレリン OD 錠 5mg 「アメル」〉

28 錠 [14 錠 (PTP) × 2]

23. 主要文献

- 社内資料：生物学的同等性試験 [錠 5mg、OD 錠 5mg]
- 第十八改正日本薬局方解説書。廣川書店。2021；C-3110

24. 文献請求先及び問い合わせ先

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口

〒 530-0005 大阪市北区中之島 3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

共和薬品工業株式会社

大阪市北区中之島 3-2-4