2026 年 10 月改訂(第 7 版)

日本標準商品分類番号
873112

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のＩＦ記載要領 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

二次性副甲状腺機能亢進症治療剤
マキサカルシトールシリンジ

劇薬
処方箋医薬品

マキサカルシトール静注透析用シリンジ 2.5μg「イセイ」
マキサカルシトール静注透析用シリンジ 5μg「イセイ」
マキサカルシトール静注透析用シリンジ 10μg「イセイ」
Maxacalcitol Syringe 2.5μg,5μg&10μg "ISEI" for Dialysis

剤形	水性注射剤（シリンジ製剤）
製剤の規制区分	劇薬 処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	マキサカルシトール静注透析用シリンジ 2.5μg「イセイ」: 1 シリンジ（1mL）中 マキサカルシトール 2.5μg マキサカルシトール静注透析用シリンジ 5μg「イセイ」: 1 シリンジ（1mL）中 マキサカルシトール 5μg マキサカルシトール静注透析用シリンジ 10μg「イセイ」: 1 シリンジ（1mL）中 マキサカルシトール 10μg
一般名	和名：マキサカルシトール（JAN） 洋名：Maxacalcitol（JAN、INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2017 年 2 月 15 日 薬価基準収載年月日：2017 年 12 月 8 日 販売開始年月日：2018 年 1 月 15 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：コーアイセイ株式会社 販　売　元：扶桑薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	コーアイセイ株式会社　くすり相談窓口 TEL 023-666-5797　FAX 023-624-4717 医療関係者向けホームページ http://www.koaisei.com/medical/ 扶桑薬品工業株式会社　くすり相談室 TEL 0800-800-6363（フリーアクセス）　FAX 06-6969-2361 （9:00～17:30/土日祝日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.fuso-pharm.co.jp/med/ph/

本ＩＦは 2026 年 10 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。
最新の電子添文情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ https://www.pmda.go.jp/
にてご確認ください。

目　次

Ⅰ．概要に関する項目 …… 1
Ⅰ－1　開発の経緯 …… 1
Ⅰ－2　製品の治療学的特性 …… 1
Ⅰ－3　製品の製剤学的特性 …… 1
Ⅰ－4　適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
Ⅰ－5　承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
(1)承認条件 …… 1
(2)流通・使用上の制限事項 …… 1
Ⅰ－6　RMP の概要 …… 1

Ⅱ．名称に関する項目 …… 2
Ⅱ－1　販売名 …… 2
(1)和名 …… 2
(2)洋名 …… 2
(3)名称の由来 …… 2
Ⅱ－2　一般名 …… 2
(1)和名(命名法) …… 2
(2)洋名(命名法) …… 2
(3)ステム …… 2
Ⅱ－3　構造式又は示性式 …… 2
Ⅱ－4　分子式及び分子量 …… 2
Ⅱ－5　化学名(命名法)又は本質 …… 2
Ⅱ－6　慣用名，別名，略号，記号番号 …… 3

Ⅲ．有効成分に関する項目 …… 4
Ⅲ－1　物理化学的性質 …… 4
(1)外観・性状 …… 4
(2)溶解性 …… 4
(3)吸湿性 …… 4
(4)融点(分解点)，沸点，凝固点 …… 4
(5)酸塩基解離定数 …… 4
(6)分配係数 …… 4
(7)その他の主な示性値 …… 4
Ⅲ－2　有効成分の各種条件下における安定性 …… 4
Ⅲ－3　有効成分の確認試験法，定量法 …… 4

Ⅳ．製剤に関する項目 …… 5
Ⅳ－1　剤形 …… 5
(1)剤形の区別 …… 5
(2)製剤の外観及び性状 …… 5
(3)識別コード …… 5
(4)製剤の物性 …… 5
(5)その他 …… 5
Ⅳ－2　製剤の組成 …… 5
(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤 …… 5
(2)電解質等の濃度 …… 5
(3)熱量 …… 5
Ⅳ－3　添付溶解液の組成及び容量 …… 6
Ⅳ－4　力価 …… 6
Ⅳ－5　混入する可能性のある夾雑物 …… 6
Ⅳ－6　製剤の各種条件下における安定性 …… 6
Ⅳ－7　調製法及び溶解後の安定性 …… 6
Ⅳ－8　他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 6
Ⅳ－9　溶出性 …… 7
Ⅳ－10　容器・包装 …… 7
(1)注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報 …… 7
(2)包装 …… 7
(3)予備容量 …… 7
(4)容器の材質 …… 7
Ⅳ－11　別途提供される資材類 …… 7
Ⅳ－12　その他 …… 8

Ⅴ．治療に関する項目 …… 9
Ⅴ－1　効能又は効果 …… 9
Ⅴ－2　効能又は効果に関連する注意 …… 9
Ⅴ－3　用法及び用量 …… 9
(1)用法及び用量の解説 …… 9
(2)用法及び用量の設定経緯・根拠 …… 9
Ⅴ－4　用法及び用量に関連する注意 …… 9
Ⅴ－5　臨床成績 …… 9
(1)臨床データパッケージ …… 9
(2)臨床薬理試験 …… 9
(3)用量反応探索試験 …… 9
(4)検証的試験 …… 9
1)有効性検証試験 …… 9
2)安全性試験 …… 10
(5)患者・病態別試験 …… 10
(6)治療的使用 …… 10
1)使用成績調査（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容 …… 10
2)承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要 …… 10
(7)その他 …… 11

Ⅵ．薬効薬理に関する項目 …… 12
Ⅵ－1　薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 12
Ⅵ－2　薬理作用 …… 12
(1)作用部位・作用機序 …… 12
(2)薬効を裏付ける試験成績 …… 12
(3)作用発現時間・持続時間 …… 12

Ⅶ．薬物動態に関する項目 …… 13
Ⅶ－1　血中濃度の推移 …… 13
(1)治療上有効な血中濃度 …… 13
(2)臨床試験で確認された血中濃度 …… 13
(3)中毒域 …… 13
(4)食事・併用薬の影響 …… 13
Ⅶ－2　薬物速度論的パラメータ …… 13
(1)解析方法 …… 13
(2)吸収速度定数 …… 13
(3)消失速度定数 …… 13
(4)クリアランス …… 14
(5)分布容積 …… 14
(6)その他 …… 14
Ⅶ－3　母集団(ポピュレーション)解析 …… 14
(1)解析方法 …… 14
(2)パラメータ変動要因 …… 14
Ⅶ－4　吸収 …… 14

Ⅶ-5 分布 14
(1)血液－脳関門通過性 14
(2)血液－胎盤関門通過性 14
(3)乳汁への移行性 14
(4)髄液への移行性 14
(5)その他の組織への移行性 14
(6)血漿蛋白結合率 14
Ⅶ-6 代謝 15
(1)代謝部位及び代謝経路 15
(2)代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種，寄与率 15
(3)初回通過効果の有無及びその割合 15
(4)代謝物の活性の有無及び活性比，存在比率 15
Ⅶ-7 排泄 15
Ⅶ-8 トランスポーターに関する情報 15
Ⅶ-9 透析等による除去率 15
Ⅶ-10 特定の背景を有する患者 15
Ⅶ-11 その他 15

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 16
Ⅷ-1 警告内容とその理由 16
Ⅷ-2 禁忌内容とその理由 16
Ⅷ-3 効能又は効果に関連する注意とその理由 16
Ⅷ-4 用法及び用量に関連する注意とその理由 16
Ⅷ-5 重要な基本的注意とその理由 16
Ⅷ-6 特定の背景を有する患者に関する注意 17
(1)合併症・既往歴等のある患者 17
(2)腎機能障害患者 17
(3)肝機能障害患者 17
(4)生殖能を有する者 17
(5)妊婦 17
(6)授乳婦 17
(7)小児等 17
(8)高齢者 18
Ⅷ-7 相互作用 18
(1)併用禁忌とその理由 18
(2)併用注意とその理由 18
Ⅷ-8 副作用 18
(1)重大な副作用と初期症状 18
(2)その他の副作用 19
Ⅷ-9 臨床検査結果に及ぼす影響 19
Ⅷ-10 過量投与 19
Ⅷ-11 適用上の注意 19
Ⅷ-12 その他の注意 20
(1)臨床使用に基づく情報 20
(2)非臨床試験に基づく情報 20

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 21
Ⅸ-1 薬理試験 21
(1)薬効薬理試験 21
(2)安全性薬理試験 21
(3)その他の薬理試験 21
Ⅸ-2 毒性試験 21
(1)単回投与毒性試験 21
(2)反復投与毒性試験 21
(3)遺伝毒性試験 21
(4)がん原性試験 21
(5)生殖発生毒性試験 21
(6)局所刺激性試験 21
(7)その他の特殊毒性 21

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 22
Ⅹ-1 規制区分 22
Ⅹ-2 有効期間 22
Ⅹ-3 包装状態での貯法 22
Ⅹ-4 取扱い上の注意 22
Ⅹ-5 患者向け資材 22
Ⅹ-6 同一成分・同効薬 22
Ⅹ-7 国際誕生年月日 22
Ⅹ-8 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日 23
Ⅹ-9 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 23
Ⅹ-10 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 23
Ⅹ-11 再審査期間 23
Ⅹ-12 投薬期間制限に関する情報 23
Ⅹ-13 各種コード 23
Ⅹ-14 保険給付上の注意 23

Ⅺ. 文献 24
Ⅺ-1 引用文献 24
Ⅺ-2 その他の参考文献 24

Ⅻ. 参考資料 25
ⅫⅡ-1 主な外国での発売状況 25
ⅫⅡ-2 海外における臨床支援情報 25

ⅩⅢ. 備考 26
ⅩⅢ-1 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 26
(1)粉砕 26
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 26
ⅩⅢ-2 その他の関連資料 26

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

長期透析により発症する二次性副甲状腺機能亢進症に対し、経口活性型ビタミンD_3製剤に加え、静注製剤による積極的な治療が試みられるようになっている。マキサカルシトールは、副甲状腺ホルモン（PTH）合成・分泌抑制作用や細胞増殖抑制作用・分化誘導作用を血清Ca上昇作用と分離することを意図して合成された活性型ビタミンD_3の誘導体で、静注製剤として2000年9月に発売され、以後多く臨床で使用されている[1)]。

コーアイセイ株式会社では、医療現場での薬剤調製の迅速性や安全性（細菌汚染のリスク等）を考慮し、マキサカルシトールを含有する薬液をあらかじめ充填したプレフィルドシリンジ製剤を開発した。

マキサカルシトール静注透析用シリンジ2.5μg「イセイ」、マキサカルシトール静注透析用シリンジ5μg「イセイ」ならびにマキサカルシトール静注透析用シリンジ10μg「イセイ」は、後発医薬品として、コーアイセイ株式会社、扶桑薬品工業株式会社の2社で共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、2017年2月に承認を取得し、2018年1月に上市した。

２．製品の治療学的特性

PTH 分泌に対する作用、骨に対する作用により、維持透析下の二次性副甲状腺機能亢進症に効果を示す。

３．製品の製剤学的特性

本剤は、マキサカルシトールをシリンジ（ルアースリップ式）に充填したキット製品である。透析終了直前に、透析回路静脈側に注入（静注）する。ルアースリップ式の特長としては、接続部が差し込み式であり、着脱が簡便な事がある。

４．適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材，最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1)承認条件

特になし

(2)流通・使用上の制限事項

該当しない

６．RMP の概要

該当しない（RMP 策定対象外の事例）

Ⅱ．名称に関する項目

１．販売名

(1)和名

マキサカルシトール静注透析用シリンジ2.5μg「イセイ」

マキサカルシトール静注透析用シリンジ5μg「イセイ」

マキサカルシトール静注透析用シリンジ10μg「イセイ」

(2)洋名

Maxacalcitol Syringe 2.5μg "ISEI" for Dialysis

Maxacalcitol Syringe 5μg "ISEI" for Dialysis

Maxacalcitol Syringe 10μg "ISEI" for Dialysis

(3)名称の由来

特になし

２．一般名

(1)和名(命名法)

マキサカルシトール（JAN）

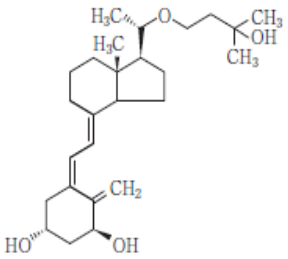
(2)洋名(命名法)

Maxacalcitol（JAN、INN）

(3)ステム

ビタミンD誘導体：calci-

３．構造式又は示性式



４．分子式及び分子量

分子式：$C_{26}H_{42}O_4$

分子量：418.61

５．化学名(命名法)又は本質

(＋)-(5*Z*,7*E*)-(1*S*,3*R*,20*S*)-20-(3-Hydroxy-3-methylbutyloxy)-9,10-secopregna-5,7,10(19)-triene-1,3-diol　(IUPAC)

６．慣用名，別名，略号，記号番号

22-oxacalcitriol

1α,25-dihydroxy-22-oxavitamin D_3

Ⅲ．有効成分に関する項目

１．物理化学的性質

(1)外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

(2)溶解性

メタノールに極めて溶けやすく、エタノール（99.5）に溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

(3)吸湿性

該当資料なし

(4)融点(分解点)，沸点，凝固点

該当資料なし

(5)酸塩基解離定数

該当資料なし

(6)分配係数

該当資料なし

(7)その他の主な示性値

旋光度〔α〕$^{20}_{D}$：＋42～＋51°（脱水物に換算したもの 10mg、エタノール（99.5）、10mL、100mm）

２．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

３．有効成分の確認試験法，定量法

確認試験法：

紫外可視吸光度測定法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

定量法：

液体クロマトグラフィー

Ⅳ. 製剤に関する項目

１．剤形

(1)剤形の区別

水性注射剤（シリンジ製剤）

(2)製剤の外観及び性状

シリンジ入りの無色澄明の液

(3)識別コード

該当しない

(4)製剤の物性

pH：7.0～7.4

浸透圧比（生理食塩液に対する比）：0.9～1.1

(5)その他

該当しない

２．製剤の組成

(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

有効成分：

マキサカルシトール静注透析用シリンジ2.5μg「イセイ」

1シリンジ（1mL）中 マキサカルシトール2.5μg

マキサカルシトール静注透析用シリンジ5μg「イセイ」

1シリンジ（1mL）中 マキサカルシトール5μg

マキサカルシトール静注透析用シリンジ10μg「イセイ」

1シリンジ（1mL）中 マキサカルシトール10μg

添加剤：

1シリンジ（1mL）中

溶解補助剤	ポリソルベート80	2.0mg
溶解剤	無水エタノール	2μL
安定剤	クエン酸ナトリウム水和物	
緩衝剤	リン酸二水素ナトリウム	
等張化剤	塩化ナトリウム	
pH調節剤		

(2)電解質等の濃度

該当資料なし

(3)熱量

該当しない

３．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

４．力価

該当しない

５．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

６．製剤の各種条件下における安定性[2)]

長期保存試験

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
2.5μg	10℃±2℃	3年	最終包装	変化なし
5μg				
10μg				

光安定性試験（ピロー包装）

	保存条件	保存形態	結果
2.5μg	照度 1500 lx 23℃±2℃	ピロー包装	24時間までは変化なし
5μg			
10μg			

光安定性試験（ピロー包装開封後）

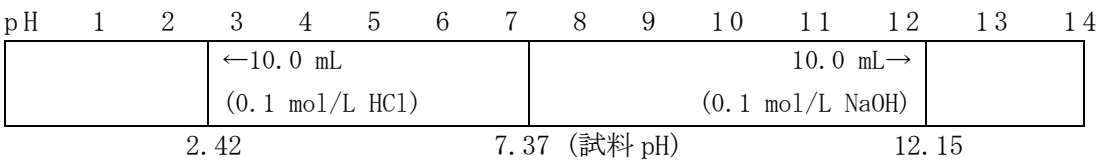
	保存条件	保存形態	結果
2.5μg	照度 1500 lx 23℃±2℃	直接容器 （ピロー包装開封後）	純度試験 24時間で変化あり（規格外）
5μg			純度試験 24時間で変化あり（規格外）
10μg			24時間までは変化なし

７．調製法及び溶解後の安定性

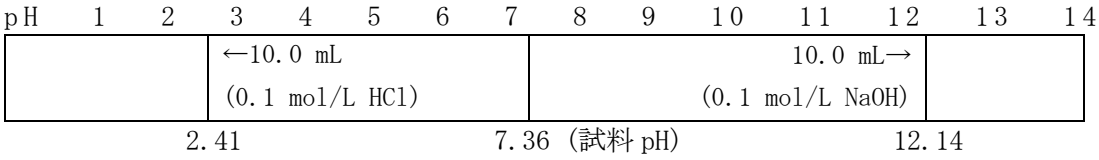
該当しない

８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

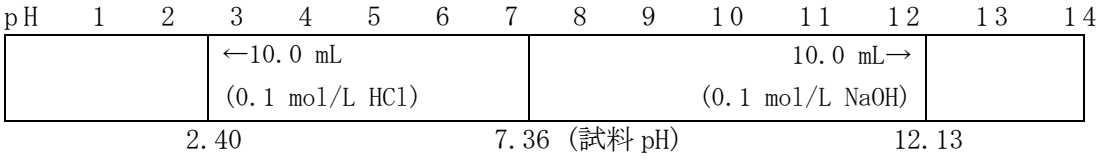
マキサカルシトール静注透析用シリンジ2.5μg「イセイ」



マキサカルシトール静注透析用シリンジ5μg「イセイ」



マキサカルシトール静注透析用シリンジ10μg「イセイ」



なお、本剤との配合が予想される薬剤との配合変化表についてはⅩⅢ-2.の項に記載。

９．溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1)注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報

Ⅷ-11.の項、Ⅹ-4.の項 参照

(2)包装

〈マキサカルシトール静注透析用シリンジ 2.5μg「イセイ」〉

1mL 10シリンジ　ルアースリップタイプ

〈マキサカルシトール静注透析用シリンジ 5μg「イセイ」〉

1mL 10シリンジ　ルアースリップタイプ

〈マキサカルシトール静注透析用シリンジ 10μg「イセイ」〉

1mL 10シリンジ　ルアースリップタイプ

(3)予備容量

該当しない

(4)容器の材質

バレル（外筒）　　：環状ポリオレフィン
キャップ／ガスケット：塩素化ブチルゴム
押子（プランジャー）：ポリプロピレン
フィンガーグリップ　：ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当しない

Ⅴ．治療に関する項目

１．効能又は効果

維持透析下の二次性副甲状腺機能亢進症

２．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

３．用法及び用量

(1)用法及び用量の解説

通常、成人には、透析終了直前にマキサカルシトールとして、1回2.5～10μgを週3回、透析回路静脈側に注入（静注）する。なお、血清副甲状腺ホルモン（PTH）の改善効果が得られない場合は、高カルシウム血症の発現等に注意しながら、1回20μgを上限に慎重に漸増する。

(2)用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

４．用法及び用量に関連する注意

7. 用法・用量に関連する注意

7.1 初回は血清インタクト副甲状腺ホルモン（intact-PTH）が500pg/mL未満［あるいは血清高感度副甲状腺ホルモン（HS-PTH）が40,000pg/mL未満］では、本剤を1回5μg、血清intact-PTHが500pg/mL以上（あるいはHS-PTHが40,000pg/mL以上）では、1回10μgから開始する。

7.2 血清intact-PTHが150pg/mL以下に低下した場合は本剤の投与を中止する。［8.2、8.5参照］

５．臨床成績

(1)臨床データパッケージ

該当しない

(2)臨床薬理試験

該当資料なし

(3)用量反応探索試験

該当資料なし

(4)検証的試験

1)有効性検証試験

国内第Ⅱ相試験

二次性副甲状腺機能亢進症を伴う慢性腎不全維持透析患者203例（プラセボ29例、マキサカルシトール5μg/回58例、10μg/回58例、15μg/回[注)] 58例）を対象とした後期第Ⅱ相二重盲検比較試験（プラセボ、マキサカルシトール5、10及び15μg/回を週3回透析回路静脈側より投与）において、intact-PTHの低下及びPTH改善度を中心とする臨床効果、有用度で有意な用量相関性が認められた。また、10μg/回のintact-PTH抑制効果は5μg/回よりも優れ15μg/回と同等であったが、その血清カルシウム上昇作用は15μg/回より小さく5μg/回と類似していた。

5μg/回の安全性評価対象例57例中14例（24.6%）に副作用が認められた。主な副作用は、高カルシウム血症8例（14.0%）、皮膚瘙痒感4例（7.0%）等であった。
10μg/回の安全性評価対象例55例中32例（58.2%）に副作用が認められた。主な副作用は、高カルシウム血症30例（54.5%）、皮膚瘙痒感4例（7.3%）等であった[3]。

国内第Ⅲ相試験

慢性腎不全維持透析患者34例（プラセボ12例、マキサカルシトール5μg/回5例、10μg/回17例）を対象とした第Ⅲ相二重盲検比較試験（プラセボ、マキサカルシトール5及び10μg/回を週3回透析回路静脈側より投与）において、PTH改善度、全般改善度、有用度でマキサカルシトール投与群はプラセボ投与群に比し有意に優れ、明らかな二次性副甲状腺機能亢進症改善効果が認められた。
5μg/回の安全性評価対象例5例では副作用は認められなかった。
10μg/回の安全性評価対象例17例中8例（47.1%）に副作用が認められた。主な副作用は、高カルシウム血症7例（31.8%）等であった[4]。
注）初回投与量は、マキサカルシトールとして、1回5あるいは10μgである。

2)安全性試験

国内一般臨床試験

二次性副甲状腺機能亢進症を伴う慢性腎不全維持透析患者161例を対象としたマキサカルシトール注射剤26週間投与の長期投与試験において、血清カルシウム上昇に留意しながらマキサカルシトールを投与することで、PTH抑制の維持効果が持続することが示された。
安全性評価対象例160例中87例（54.4%）に副作用が認められた。主な副作用は、高カルシウム血症77例（48.1%）、CPK上昇13例（8.1%）、瘙痒感9例（5.6%）等であった[5,6]。

(5)患者・病態別試験

該当資料なし

(6)治療的使用

1)使用成績調査（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2)承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7)その他

骨代謝への影響

臨床薬理試験での骨生検による骨組織形態計測において、骨代謝改善効果（線維組織の減少及び高代謝回転骨の低下、是正）が示された[7,8]。また、マキサカルシトール投与により、骨代謝回転を反映する骨代謝マーカーの改善が認められた[9]。

血清中intact-PTHとHS-PTHの相関

血清中intact-PTHと血清中HS-PTHが高い相関を示すことが報告されており[10]、また、マキサカルシトール注射剤の臨床試験成績からもこれらの指標の関連が強いことが確認された[11]。

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

ビタミンD

ビタミンD誘導体（アルファカルシドール、カルシトリオール、ファレカルシトリオール、エルデカルシトール等）

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

２．薬理作用

(1)作用部位・作用機序

作用機序

正常ラット[12]及び腎不全ラット[13]において、マキサカルシトールは副甲状腺pre-proPTH mRNAの発現を抑制した。また、マキサカルシトールは骨芽細胞様細胞に作用してオステオカルシン遺伝子の発現を促進した[14]（*in vitro*）。

PTH分泌に対する作用

マキサカルシトールは、正常ウシ副甲状腺細胞及び慢性腎不全に伴う二次性副甲状腺機能亢進症患者由来副甲状腺細胞に対してPTH分泌の抑制を示したが（*in vitro*）、その効果はカルシトリオールと同程度であった[15]。

腎不全モデル動物（5/6腎摘ラット[16]、腎動脈結紮イヌ[17]）において、マキサカルシトールは血清カルシウム値を上昇させない用量でPTH分泌抑制作用を示した。

骨に対する作用

柴田腎炎ラットにおいて惹起される二次性副甲状腺機能亢進症を伴う骨病変に対する効果を検討したところ、マキサカルシトールは高代謝回転骨を低下させた[18]。また、イヌ腎不全モデルに認められた骨病変に対して、増加した線維性類骨形成を抑制した[19]。

(2)薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3)作用発現時間・持続時間

Ⅶ-1.の項 参照

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1．血中濃度の推移

(1)治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2)臨床試験で確認された血中濃度

①単回投与

健康成人男子各6例における単回静脈内投与時の薬物動態パラメータを示す[20]。

パラメータ	3.3μg	6.6μg
AUC_{inf} (pg・h/mL)	354±135	795±192
$t_{1/2}$ (min)	108.1±45.9	138.7±39.9
CL (mL/h/kg)	237±70	174±50
V_{ss} (mL/kg)	259±48	362±32

平均値±標準誤差

②反復投与

〈健康成人〉

健康成人男子5例にマキサカルシトールとして3.3μgを1日1回、隔日4回[注)]反復静脈内投与したところ、初回と4回目投与時で血清中濃度は同様に推移した[20]。

〈二次性副甲状腺機能亢進症患者〉

維持透析下の二次性副甲状腺機能亢進症を伴う患者 11 例に、26 週間にわたり透析ごとに 1 回投与量 10～17.5μg の範囲で反復投与したところ、初回に比べ最終投与時で AUC の低下傾向、$t_{1/2}$の短縮傾向がみられた。また、健康成人に比べ消失は遅延しなかった[21]。

注) 承認用法は、週3回、透析回路静脈側に注入（静注）である。

(3)中毒域

該当資料なし

(4)食事・併用薬の影響

該当資料なし

2．薬物速度論的パラメータ

(1)解析方法

該当資料なし

(2)吸収速度定数

該当しない

(3)消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

Ⅶ-1.の項 参照

(5) 分布容積

Ⅶ-1.の項 参照

(6) その他

該当資料なし

３．母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

４．吸収

該当しない

５．分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

胎児移行性

妊娠ラットへ［^{3}H］マキサカルシトールを投与したときの胎児組織中の放射能濃度は母動物の血漿中濃度に比較して低く、胎児組織からの消失は母動物各組織と同様に速やかであった[22)]。

(6) 血漿蛋白結合率

臨床血中濃度での蛋白結合相互作用試験（*in vitro*）において、マキサカルシトールと種々の蛋白、結合部位に結合する薬物との間で、互いにヒト血漿蛋白結合率に影響を与えなかった[23)]。

６．代謝

(1)代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2)代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種,寄与率

ヒト肝ミクロゾームを用いた薬物代謝阻害試験（*in vitro*）において、マキサカルシトールは1μmol/L においても P450（CYP1A2、2A6、2C9、2C19、2D6、2E1、3A4）による薬物代謝反応に対して阻害作用を示さなかった[9]。

(3)初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4)代謝物の活性の有無及び活性比,存在比率

該当資料なし

７．排泄

尿中排泄

健康成人男子6例に6.6μgを単回静脈内投与した時、尿中濃度は定量限界未満であった[20]。

乳汁移行性

分娩後哺乳中のラットへ［^{3}H］マキサカルシトールを投与したとき、乳汁中に放射能が認められた[24]。

８．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

９．透析等による除去率

蛋白結合率が高いため除去されにくいと考えられる[25]。

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

特になし

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

１．警告内容とその理由

設定されていない

２．禁忌内容とその理由

設定されていない

３．効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

４．用法及び用量に関連する注意とその理由

「Ⅴ.4. 用法及び用量に関する注意」を参照すること。

５．重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 本剤は従来の経口活性型ビタミンD剤により効果が十分に得られない症例に対して経口活性型ビタミンD剤から切り換えて投与すること。また、本剤により改善、維持された場合には、経口活性型ビタミンD剤への切り換えも考慮すること。

8.2 本剤の投与量については、血清PTHレベル、血清カルシウム及び無機リン値に注意しながら、減量・休薬を考慮すること。［7.2、8.3-8.5、9.1.1、10.2、11.1.1参照］

8.3 本剤は血清カルシウム上昇作用を有するので、本剤投与中、血清カルシウム値を定期的（少なくとも2週に1回）に測定し、血清カルシウム値が11.5mg/dL（5.75mEq/L）を超えないよう投与量を調節し、超えた場合には投与を中止（休薬）すること。

また、目安として血清カルシウム値が11.0mg/dLを超えたときには、さらに測定頻度を高くし（週に1回以上）、減量あるいは中止すること。投与の再開については、血清カルシウム値が11.0mg/dL（5.5mEq/L）未満に回復したことを確認した後に投与量を減じて行うことが望ましい。

低アルブミン血症（血清アルブミン量が4.0g/dL未満）の場合には補正値を指標に用いることが望ましい。［8.2、9.1.1、10.2、11.1.1参照］

補正カルシウム値算出方法：

補正カルシウム値（mg/dL）＝血清カルシウム値（mg/dL）－血清アルブミン値（g/dL）＋4.0

8.4 慢性腎不全における二次性副甲状腺機能亢進症においては、しばしば高度の高リン血症を呈し、これが増悪因子のひとつとなることがあるので、定期的に血清無機リン値を測定し、そのコントロールを行うこと。［8.2参照］

8.5 本剤の長期投与により血清カルシウム値の上昇頻度が高くなることが認められている。これは、本剤の効果により血清PTHの低下に伴って骨代謝が正常化しやすくなることによると考えられる。［7.2、8.2、9.1.1、10.2、11.1.1参照］

６．特定の背景を有する患者に関する注意

(1)合併症・既往歴等のある患者

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 高カルシウム血症の患者

本剤の投与によりさらに血清カルシウムを上昇させるおそれがある。［8.2、8.3、8.5、10.2、11.1.1参照］

(2)腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 透析患者

本剤の投与に際しては心電図検査等の観察を十分に行うこと。心疾患の合併がみられることが多く、また、透析時には体外循環及び除水などによる心機能への影響が大きいことなどから、心電図異常を発現しやすい。［15.1参照］

(3)肝機能障害患者

設定されていない

(4)生殖能を有する者

設定されていない

(5)妊婦

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。［16.3.2参照］

(6)授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。周産期及び授乳期の静脈内投与試験（ラット）で、1.1μg/kg/日投与で出生児に体重増加抑制がみられた。また、分娩後哺乳中のラットに静脈内投与したとき、乳汁中への移行を示唆する報告がある[24)]。［16.5.2参照］

(7)小児等

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。

(8)高齢者

9.8 高齢者

9.8.1 用量に注意すること。一般に生理機能が低下している。

9.8.2 本剤を65歳以上の高齢者に投与したとき、副作用発現による投与中止は、96例中12例（12.5%）であり、64歳以下の成人の場合は881例中83例（9.4%）であった。

7．相互作用

(1)併用禁忌とその理由

設定されていない

(2)併用注意とその理由

10. 相互作用

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アルファカルシドール カルシトリオール [8.2、8.3、8.5、9.1.1、11.1.1参照]	高カルシウム血症があらわれるおそれがある。	両剤ともに血清カルシウム値を上昇させる可能性がある。
PTH製剤 テリパラチド [8.2、8.3、8.5、9.1.1、11.1.1参照]		相加作用による。
ジギタリス製剤 ジゴキシン等 [8.2、8.3、8.5、9.1.1、11.1.1参照]	不整脈があらわれるおそれがある。	本剤により高カルシウム血症が発症した場合、ジギタリス製剤の作用が増強することが考えられる。

8．副作用

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。

(1)重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 高カルシウム血症（22.2%）

本剤には血清カルシウム上昇作用が認められるので、高カルシウム血症によることが考えられる臨床症状（そう痒感、いらいら感など）の出現に注意すること。[8.2、8.3、8.5、9.1.1、10.2参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1%以上	0.1%未満
皮膚	そう痒症、発疹	脱毛症
精神神経系	いらいら感、不眠症、頭痛	不穏、興奮、焦躁感
消化器		胃・腹部不快感、食欲不振
肝臓	AST上昇	ALT上昇
代謝異常	CK上昇、血中リン増加、血中ミオグロビン上昇、LDH上昇、Al-P上昇	総蛋白減少、血中尿酸増加、血中アルミニウム上昇
呼吸器		胸部X線異常
心・血管系	高血圧	
血液	白血球分画異常（リンパ球、好酸球等)	白血球減少
その他	四肢不快感、倦怠感	

注）発現頻度は使用成績調査を含む

９．臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 全般的な注意

使用時には以下の点に注意すること。

・シリンジが破損するおそれがあるので、シリンジを鉗子等で叩くなど、強い衝撃を与えないこと。

・押子（プランジャー）を反時計回りに回転させると接続に緩みが生じ、ガスケットから押子が外れるおそれがあるので、押子を反時計回りに回転させないこと。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 シリンジ先端のキャップを外す際、外筒（バレル）部分をしっかりと持ち、キャップを外すこと。キャップを外した後は、筒先に触れないこと。

14.2.2 押子の緩みがないか確認すること。緩みが認められた場合は、押子を時計回りに回転させ締め直すこと。

14.2.3 投与前後とも押子を引かないこと。

14.3 薬剤投与後の注意

シリンジの再滅菌はしないこと。開封後の使用は1回限りとし、使用後の残液はシリンジとともに速やかに廃棄すること。

＜参考＞

調製時：本剤を投与する場合は他剤との混注を行わないこと。

12. その他の注意

(1)臨床使用に基づく情報

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

本剤の承認時までの臨床試験において投与された維持透析患者977例中、34例（3.5%）、38件に心電図異常が認められた。その主なものは左室肥大15件、I度AV Block、T波異常の各6件、心室性期外収縮、心房細動の各3件であった。［9.2.1参照］

(2)非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

がん原性について、ラット（F344/DuCrj）に週1回24カ月間静脈内投与した結果、副腎においてF344ラットに好発する良性の褐色細胞腫の発現頻度が増加した。ラットでは血清カルシウム値の上昇に伴って発生が増加すると考えられている。マウスでは週1回18カ月間投与で発がん性は認められなかった。

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

１．薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

２．毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

１．規制区分

製剤：劇薬、処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：毒薬

２．有効期間

3 年

３．包装状態での貯法

凍結を避け、10℃以下で保存

４．取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

20.1 本剤は光の影響を受けやすいので、ピロー包装は使用時まで開封しないこと。

20.2 以下の場合には使用しないこと。

・ピロー包装が破損している場合

・シリンジから薬液が漏れている場合

・性状その他薬液に異状が認められる場合

・シリンジに破損等の異状が認められる場合

・キャップが外れている場合

＜参考＞

ピロー包装には遮光機能がある。（黄色透明）

５．患者向け資材

くすりのしおり：あり

患者向医薬品ガイド：なし

６．同一成分・同効薬

同一成分薬：オキサロール注 2.5μg、5μg、10μg(LTL ファーマ)

同　効　薬：アルファカルシドール、カルシトリオール、ファレカルシトリオール、エルデカルシトール等

７．国際誕生年月日

2000 年 7 月 3 日

８．製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

製造販売承認年月日：2017 年 2 月 15 日

承認番号：

マキサカルシトール静注透析用シリンジ 2.5μg「イセイ」	22900AMX00245000
マキサカルシトール静注透析用シリンジ 5μg「イセイ」	22900AMX00246000
マキサカルシトール静注透析用シリンジ 10μg「イセイ」	22900AMX00247000

薬価基準収載年月日：2017 年 12 月 8 日

販売開始年月日：2018 年 1 月 15 日

９．効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10．再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11．再審査期間

該当しない

12．投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13．各種コード

	HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード(YJコード)	レセプト電算コード
2.5μg	126056401	3112401G1029	3112401G1029	622605601
5μg	126058801	3112401G2025	3112401G2025	622605801
10μg	126060101	3112401G3021	3112401G3021	622606001

14．保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

ＸⅠ．文　献

１．引用文献

1) 大竹喜雄 ほか：日本透析医学会雑誌. 2004；37(7)：1503-1508
2) コーアイセイ株式会社（安定性試験）社内資料
3) 後期第Ⅱ相二重盲検比較試験（オキサロール注:2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ト.4(3)）
4) 第Ⅲ相二重盲検比較試験（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ト.4 (4)）
5) 黒川清 ほか：腎と透析. 2000；48：875-97
6) 一般臨床試験（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ト.4 (5)）
7) Tsukamoto, Y, et al.：Am. J. Kidney Dis. 2000；35：458-64
8) 栗原怜 ほか：腎と透析. 1999；47：559-72
9) 代謝酵素阻害（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ヘ.2 (3)）
10) 福澤良彦 ほか：透析会誌. 1993；26：1585-91
11) 血清中 intact-PTH と HS-PTH の相関（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ト.5 (1) 2)）
12) Brown AJ, et al.：J. Clin. Invest. 1989；84：728-32
13) Ichikawa F, et al.：Nephrology. 1998；4：391-5
14) 薬理作用試験（骨芽細胞に対する作用）（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ホ.2-（7））
15) Sato K et al.：Nephrology. 1998；4：177-82
16) 薬理作用試験（ラット腎不全モデルにおける効果）（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ホ.1-（2）-1））
17) 薬理作用試験（イヌ腎不全モデルにおける効果）（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ホ.1-（2）-3））
18) Hirata M, et al.：Kidney Int. 1999；56：2040-7
19) Monier-Faugere MC, et al.：Kidney Int. 1999；55：821-32
20) 角尾道夫 ほか：臨牀透析. 1999；15：1193-217
21) 二次性副甲状腺機能亢進症患者における薬物動態（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ヘ.3 (1) 3)）
22) 胎盤、胎児移行性（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ヘ.2 (2)）
23) ヒト血漿蛋白結合率（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ヘ.2 (2)）
24) 乳汁移行性（オキサロール注：2000 年 7 月 3 日承認, 申請資料概要ヘ.2 (4)）
25) 平田純生 ほか：改訂 3 版 透析患者への投薬ガイドブック 慢性腎臓病(CKD)の薬物治療 じほう. 2017；640-641

２．その他の参考文献

該当資料なし

ⅩⅡ．参考資料

１．主な外国での発売状況

海外では発売されていない（2026 年 10 月時点）

２．海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備　考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉砕

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

配合変化試験

注射剤4品目との配合変化試験を実施した。マキサカルシトール静注透析用シリンジ2.5μg、5μg、10μg「イセイ」の1シリンジに対して、各注射剤(1シリンジ、1管または1バイアル)を混合した。配合直後、1、3、6、12、24時間後の外観およびpHを観察した(約500～700lx、室温)。

経時的に外観変化のあるものは、最初に変化が認められた時点を変化点とした。

表　マキサカルシトール静注透析用シリンジ2.5μg、5μg、10μg「イセイ」の配合変化試験

〈マキサカルシトール静注透析用シリンジ2.5μg〉

注射剤		開始時	1時間後	3時間後	6時間後	12時間後	24時間後	変化要約
エポジン注 シリンジ1500 (中外製薬)	外観 pH	無色澄明 7.37	無色澄明 7.34	無色澄明 7.35	無色澄明 7.35	無色澄明 7.35	無色澄明 7.35	外観変化なし
フェジン静注40mg (日医工)	外観 pH	暗褐色 9.41	暗褐色 9.36	暗褐色 9.40	暗褐色 9.59	暗褐色 9.60	暗褐色 9.43	外観変化なし
エルカルチンFF 静注1000mg (大塚製薬)	外観 pH	無色澄明 6.77	無色澄明 6.79	無色澄明 6.75	無色澄明 6.74	無色澄明 6.75	無色澄明 6.75	外観変化なし
パーサビブ静注 透析用5mg (小野薬品工業)	外観 pH	無色澄明 6.17	無色澄明 6.19	無色澄明 6.19	無色澄明 6.20	無色澄明 6.20	無色澄明 6.18	外観変化なし

XIII. 備考

〈マキサカルシトール静注透析用シリンジ5μg〉

注射剤		開始時	1時間後	3時間後	6時間後	12時間後	24時間後	変化要約
エポジン注 シリンジ1500 (中外製薬)	外観 pH	無色澄明 7.34	無色澄明 7.34	無色澄明 7.34	無色澄明 7.33	無色澄明 7.33	無色澄明 7.34	外観変化なし
フェジン静注40mg (日医工)	外観 pH	暗褐色 9.42	暗褐色 9.42	暗褐色 9.53	暗褐色 9.42	暗褐色 9.53	暗褐色 9.43	外観変化なし
エルカルチンFF 静注1000mg (大塚製薬)	外観 pH	無色澄明 6.79	無色澄明 6.70	無色澄明 6.73	無色澄明 6.72	無色澄明 6.73	無色澄明 6.75	外観変化なし
パーサビブ静注 透析用5mg (小野薬品工業)	外観 pH	無色澄明 6.20	無色澄明 6.18	無色澄明 6.15	無色澄明 6.13	無色澄明 6.18	無色澄明 6.21	外観変化なし

〈マキサカルシトール静注透析用シリンジ10μg〉

注射剤		開始時	1時間後	3時間後	6時間後	12時間後	24時間後	変化要約
エポジン注 シリンジ1500 (中外製薬)	外観 pH	無色澄明 7.33	無色澄明 7.33	無色澄明 7.34	無色澄明 7.35	無色澄明 7.34	無色澄明 7.34	外観変化なし
フェジン静注40mg (日医工)	外観 pH	暗褐色 9.44	暗褐色 9.47	暗褐色 9.60	暗褐色 9.50	暗褐色 9.50	暗褐色 9.42	外観変化なし
エルカルチンFF 静注1000mg (大塚製薬)	外観 pH	無色澄明 6.76	無色澄明 6.72	無色澄明 6.87	無色澄明 6.75	無色澄明 6.77	無色澄明 6.75	外観変化なし
パーサビブ静注 透析用5mg (小野薬品工業)	外観 pH	無色澄明 6.20	無色澄明 6.16	無色澄明 6.14	無色澄明 6.15	無色澄明 6.18	無色澄明 6.21	外観変化なし

注) 残存率による評価は行っていない。
配合変化の評価については、本試験以外にpH変動試験等を併せて考慮する必要がある。
また、試験条件により、今回と同一薬剤の組み合わせであっても、結果が異なる場合が考えられる。