

劇薬
処方箋医薬品^{注)}

日本薬局方
タカルシトール軟膏

活性化VD₃角化症治療剤

*** **タカルシトール** 軟膏2 μ g/g「NIG」

*** **タカルシトール** クリーム2 μ g/g「NIG」

タカルシトール水和物製剤

Tacalcitol Ointment・Cream

貯法：遮光、室温保存

使用期限：3年(チューブ、外箱に表示)

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

	軟膏	クリーム
* 承認番号	30100AMX00103	30100AMX00104
*** 薬価収載	2022年 6月	
販売開始	2003年 7月	

【禁忌】(次の患者には使用しないこと)

本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

販売名	タカルシトール軟膏 2 μ g/g「NIG」	タカルシトールクリーム 2 μ g/g「NIG」
有効成分	日局 タカルシトール水和物	
含量 (1g中)	2.087 μ g (無水物として2 μ g：0.0002%)	
添加物	流動パラフィン、ワセリン、ジブチルヒドロキシトルエン、アジピン酸ジイソプロピル	プロピレングリコール、グリセリン、ステアリルアルコール、ポリソルベート60、セトステアリアルアルコール、ミリスチン酸イソプロピル、ジメチルポリシロキサン、パラベン、ジブチルヒドロキシトルエン、エタノール、pH調節剤
性状	白色～微黄白色の均一な軟膏で、においはない。	白色のクリーム
pH	—	6.0～8.0

【効能・効果】

乾癬、魚鱗癬、掌蹠膿疱症、掌蹠角化症、毛孔性紅色皰糠疹

【用法・用量】

通常1日2回適量を患部に塗布する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

本剤は活性化ビタミンD₃製剤であり、類薬(活性化ビタミンD₃外用剤)との併用又は大量投与により血清カルシウム値が上昇する可能性がある。また、高カルシウム血症に伴い、腎機能が低下する可能性がある。そのため、類薬との併用又は大量投与に際しては、血清カルシウムや尿中カルシウム及び腎機能(クレアチニン、BUN等)に注意し、観察を十分に行うこと。(「相互作用」の項参照)

2. 相互作用

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
ビタミンD ₃ 及びその誘導体 アルファカルシドール カルシトリオール カルシポトリオール マキサカルシトール 等	血清カルシウム値が上昇する可能性がある。その場合には直ちに本剤及び併用薬の使用を中止し、経過を観察すること。	相加作用

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

	頻度不明
精神神経系	頭痛
皮膚 ^{注)}	ヒリヒリ感、発赤、接触皮膚炎、そう痒、刺激感、腫脹
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、LDH上昇、ALP上昇
その他	白血球の増多、血清リンの低下、尿蛋白陽性

注) このような症状が強い場合には、使用を中止すること。

4. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、使用が過度にならないよう注意すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦に対する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人に対しては大量又は長期にわたる広範囲の使用を避けること。

6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

7. 適用上の注意

使用部位：

眼科用として角膜、結膜に使用しないこと。

【薬効薬理】

1. 作用機序

タカルシトールは、皮膚の表皮細胞の増殖を抑制し、また、角化に必要な細胞内不溶性膜の形成に必要なトランスグルタミナーゼ活性を増加させ表皮細胞を分化誘導することなどにより角化異常を改善する。

2. 生物学的同等性試験

表皮細胞増殖抑制作用及び表皮細胞分化誘導作用を評価指標とした動物試験を実施し、生物学的同等性を検討した結果、軟膏及びクリームはそれぞれの標準製剤との間に有意差を認めず、生物学的に同等であると判断された。

(1) 表皮細胞増殖抑制作用¹⁾

TPA(12-O-テトラデカノイルフォルボール-13-アセテート)を塗布したヘアレスマウスの表皮に本剤、標準製剤及び試験基剤(本剤から有効成分を除いたもの)を0.03mL(約30mg)塗布し、細胞増殖の指標であるオルニチンデカルボキシラーゼ活性(ODC活性)の抑制効果を検討した。

その結果、それぞれの抑制率は、軟膏では80.1%、79.6%、23.9%、クリームでは80.9%、81.3%、22.9%であり、本剤のODC活性抑制効果は、試験基剤より有意に強く、標準製剤との間に有意差は認められなかった。

(2) 表皮細胞分化誘導作用²⁾

本剤、標準製剤及び試験基剤(本剤から有効成分を除いたもの)を0.03mL(約30mg)塗布したヘアレスマウスの表皮を用いて、トランスグルタミナーゼ(TGase)活性を指標とした細胞分化誘導効果を検討した。

その結果、それぞれのTGase活性は、軟膏では26.40±13.70、27.20±12.01、13.10±2.19(平均±S.D.)、クリームでは25.78±9.57、26.16±7.44、13.13±1.44(平均±S.D.)であり、本剤の細胞分化誘導作用は、試験基剤との間に有意差を認め、標準製剤との間に有意差は認められなかった。

【有効成分に関する理化学的知見】

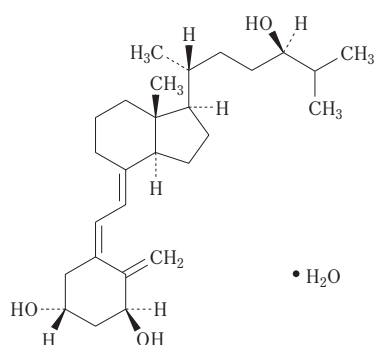
一般名：タカルシトール水和物、Tacalcitol Hydrate (JAN)

化学名：(1S, 3R, 5Z, 7E, 24R)-9, 10-Secosteroid-5, 7, 10(19)-triene-1, 3, 24-triol monohydrate

分子式：C₂₇H₄₄O₃・H₂O

分子量：434.65

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノール又はエタノール(99.5)に極めて溶けやすく、水にほとんど溶けない。

光によって分解する。

融点：約100℃

【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、タカルシトール軟膏2 μg/g[NIG]及びタカルシトールクリーム2 μg/g[NIG]は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

【包装】

タカルシトール軟膏2 μg/g[NIG] : 10g×10

タカルシトールクリーム2 μg/g[NIG] : 10g×10

【主要文献】

- 1) 日医工岐阜工場(株)：社内資料(マウス細胞増殖抑制作用による薬力学的同等性試験)
- 2) 日医工岐阜工場(株)：社内資料(マウス細胞分化誘導作用による薬力学的同等性試験)
- 3) 日医工岐阜工場(株)：社内資料(安定性試験)

**【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

TEL (0120) 517-215

FAX (076) 442-8948

販売

武田薬品工業株式会社

大阪市中央区道修町四丁目1番1号



発売元

日医工株式会社

富山市総曲輪1丁目6番21



製造販売元

日医工岐阜工場株式会社

富山市総曲輪1丁目6番21