NOVARTIS
ANIMAL HEALTH

＊平成23年11月10日改訂（第２版）
平成23年11月１日作成

劇薬 | 要指示医薬品 | 指定医薬品

猫用非ステロイド性消炎鎮痛剤

動物用医薬品

猫用オンシオール® 錠 6mg

猫用オンシオール錠6mgはノバルティス アニマルヘルス社により開発され、その主成分はロベナコキシブでコキシブ系のCOX-2高選択性NSAIDsである。また特長として、早期にC_{max}に到達し、選択的に炎症部位に移行して長く留まるため、効果の発現が早くまた炎症部位における持続的な抗炎症作用がある。

組成・性状

1錠中にロベナコキシブ6mgを含有する。
錠剤は明るい灰黄色～褐色の円形の素錠であり、片面に「NA」、他の面には「AK」が刻印されている。
猫用オンシオール錠6mgは投与が容易なフレーバー錠である。

効能又は効果

猫：運動器疾患に伴う急性の疼痛及び炎症の緩和

用法及び用量

猫：1日1回、体重1kg当たりロベナコキシブとして1mgを基準量として、6日間を限度に食餌前後30分を避けて経口投与する。ただし、必要であれば少量の食餌と共に投与してもよい。体重別には、次の投与量による。

体重	投与量（錠数）
2.5kg以上6kg未満	1錠
6.0kg以上12kg以下	2錠

使用上の注意

【一般的注意】

(1) 本剤は要指示医薬品であるので獣医師等の処方せん・指示により使用すること。
(2) 本剤は効能・効果において定められた目的にのみ使用すること。
(3) 本剤は定められた用法・用量を厳守すること。

【使用者に対する注意】

(1) 投与後に手を洗うこと。
(2) 誤って薬剤を飲み込んだ場合は、直ちに医師の診察を受けること。

【猫に対する注意】

1 制限事項
(1) 本剤は体重2.5kg未満及び4ヵ月齢未満の幼若猫には投与しないこと。
(2) 妊娠あるいは授乳中の猫に対する安全性は確認されていないため、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。
(3) 本剤を消化性潰瘍のある猫には投与しないこと。
(4) 本剤に対し過敏症の猫には投与しないこと。
(5) 心疾患、肝障害、腎障害、消化器障害、出血性傾向、血液異常、脱水症状、貧血及び低血圧の猫には、安全性及び有効性が確認されていないため、本剤を使用しないこと。

2 副作用
(1) 本剤の投与により一過性の嘔吐、軟便又は下痢が見られることがある。
(2) 副作用が認められた場合は、速やかに獣医師の診察を受けること。

3 相互作用
(1) 他の非ステロイド系抗炎症剤及びステロイド系抗炎症剤と併用しないこと。
(2) 本剤は血漿蛋白結合能が高く（結合率98%以上）、クマリン系抗凝固剤及び一部のACE阻害剤等の高い蛋白結合率を有する物質と併用すると血漿蛋白との結合において競合し、毒性作用を引き起こす可能性があるので、これらの薬剤との併用は避けることが望ましい。
(3) 非ステロイド系抗炎症剤は、プロスタグランジン合成阻害作用により、利尿剤のナトリウム排泄作用の低下や、ACE阻害剤等の血管拡張作用に影響を及ぼす可能性があるので、これらの薬物と併用するときには慎重に投与すること。
(4) アミノグリコシド系抗生物質等の腎毒性のある薬剤との併用は避けることが望ましい。
(5) 抗炎症剤を前投与している場合、副作用の発現或いは増強が生じることがあるので、前投与した薬剤の特性に基づき本剤の投与前に最低24時間は間隔を空けること。

4 適用上の注意
(1) 本剤を誤って過量投与した場合は、適切な処置を施すこと。
(2) 本剤は対症療法であるため、適当な併用療法あるいは原疾患の治療を行うこと。

【取扱い上の注意】

(1) 使用済みの容器は、地方公共団体条例等に従い処分すること。

【保管上の注意】

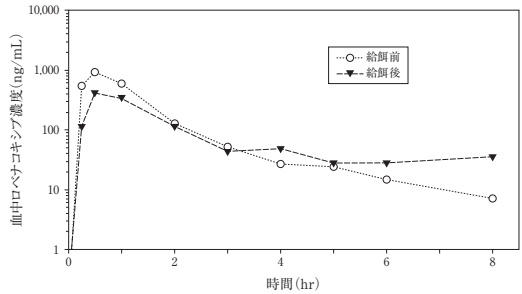
(1) 小児の手の届かないところに保管すること。
(2) 本剤の保管は高温を避けること。

【その他の注意】

(1) ラットにおける亜急性毒性及び慢性毒性試験において、高用量群（60mg/kg/day以上）で肝毒性を示唆する所見が認められた。

体内薬物動態[1)]

ヨーロッピアンショートヘアー種猫12頭（雌雄各6頭、体重2.5～5.1kg）にロベナコキシブ6mg錠剤を（給餌前及び後）6mg錠剤を猫の咽頭に載せ、確実な投与を確認した。
図1のように速やかに吸収された。給餌前及び給餌後のt_{max}はそれぞれ0.5h及び1hであった。排泄速度も比較的速く、$t_{1/2}$は、給餌前で1.71hであった。最高血中濃度（C_{max}）は、給餌前及び給餌後でそれぞれ773及び125ng/mLであった。
生物学的利用率は給餌前及び給餌後でそれぞれ、0.49及び0.10であり、給餌後より給餌前の方が高かった。



（図1）猫にロベナコキシブ錠剤を2mg/kgの用量で給餌前及び給餌後に経口投与したときの血漿中のロベナコキシブ濃度

また、ロベナコキシブの猫の血漿蛋白結合率は98％以上であり、代謝は主に肝臓で行われ、総排泄量の約3分の2が糞中に、約3分の1が尿中に排泄される。

臨床成績[2)]

猫の運動器疾患に伴う急性疼痛及び炎症に対する臨床試験

猫の運動器疾患に伴う急性の疼痛及び炎症に対するロベナコキシブの有効性及び安全性を評価するために、対照薬をケトプロフェンとしてロベナコキシブ群（n=47）、ケトプロフェン群（n=21）をそれぞれ割付けて盲検比較試験を実施した。ロベナコキシブ群は1日1回、ロベナコキシブとして1～2mg/kgの用量（ただし､2.5～3kgの猫では2～2.4mg/kg）、ケトプロフェン群は1日1回、ケトプロフェンとして1mg/kgの用量（基準量）でそれぞれ5日間投与した。
結果として、治験開始時の検査･観察者による臨床評価の項目別（疼痛、炎症の程度及び動作）のスコア及び合計スコアに、いずれも群間で有意差はみられなかった。ロベナコキシブ群では、開始後2日及び4日の項目別及び合計スコアは、いずれも開始時より有意に減少した。開始後の項目別及び合計スコアのいずれにも､群間で有意差はみられなかった。
ロベナコキシブは猫の運動器疾患による疼痛及び炎症に対し、対照薬のケトプロフェンと同等の有効性を有することが確認された。
安全性は、ロベナコキシブ群の一部で消化器症状の発現がみられたが、特に問題はないものと考えられた。ロベナコキシブは一部で一過性で軽度の嘔吐がみられたが、安全性に特に問題はないものと考えられた。
従って、ロベナコキシブは猫の運動器疾患による急性疼痛及び炎症の緩和に対し、対照薬のケトプロフェンと同等の有効性及び安全性を有すると考えられた。

薬効薬理

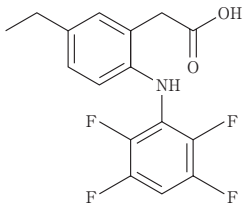
NSAIDsの消化器への副作用には、シクロオキシゲナーゼ（COX）の関与が知られている。2つのアイソザイムが存在するCOXのうち、COX-1は多くの組織で恒常的に産生され、胃粘膜の保護などの生体維持機能に関与している。一方、COX-2は炎症性サイトカインなどの刺激を受けて誘導産生される酵素であり、本酵素の活性を阻害することにより抗炎症作用が発揮される。インドメタシンをはじめとする従来のNSAIDsはCOX-1及びCOX-2の両酵素の活性を阻害する非選択的阻害剤であるので、COX-1の阻害により胃腸への副作用が発現しやすい[3)]。
ロベナコキシブは、選択的COX-2阻害剤としてCOX-1に比べCOX-2に対してより高い阻害活性を示し、消化器への副作用を軽減しつつ抗炎症効果を有するNSAIDsである。従来のNSAIDsに比べ高いCOX-2選択性を示し、*in vitro*試験においてCOX-1に対する阻害より、犬で約140倍、猫で約40倍の阻害活性を示した。

有効成分の物理化学的知見

一般名：ロベナコキシブ（和名）、Robenacoxib（英名）

IUPAC名：[5-Ethyl-2-(2,3,5,6-tetrafluorophenylamino)phenyl]acetic acid
[5-エチル-2-(2,3,5,6-テトラフルオロフェニルアミノ)フェニル]酢酸

構造式：



分子式及び分子量：$C_{16}H_{13}F_4NO_2$　327.28

参考文献

1）オンシオール錠5mg、10mg、20mg、40mg、猫用オンシオール錠6mg動物用医薬品製造販売承認申請書添付資料：吸収等試験に関する資料（未公表）
2）オンシオール錠5mg、10mg、20mg、40mg、猫用オンシオール錠6mg動物用医薬品製造販売承認申請書添付資料：臨床試験に関する資料（未公表）
3）Sarah MS and Budsberg SC：The Coxib NSAIDs：Potential Clinical and Pharmacologic Importance in Veterinary Medicine. J Vet Intern Med 2005；19：633-643

＊製造販売業者（輸入発売元）
ノバルティス アニマルヘルス株式会社
東京都港区西麻布4丁目12番24号

ノバルティスカスタマーサービス　0120-162-419
月～金／9:00～12:00、13:00～17:00（祝祭日除く）

059T1102