

製剤特性

	 オンシオール®錠 5mg 10mg 20mg 40mg	 猫用オンシオール®錠 6mg	 オンシオール®2%注射液 20mL/バイアル																														
有効成分	ロベナコキシブ	ロベナコキシブ	ロベナコキシブ																														
製剤	フレーバー錠 (ピーフ風味)	フレーバー錠 (イースト風味)	注射液																														
対象	犬	猫	犬・猫																														
効能・効果	慢性骨関節疾患に伴う疼痛及び炎症の緩和	運動器疾患に伴う急性の疼痛及び炎症の緩和	整形外科及び軟部組織疾患に関する手術における術後の疼痛の緩和																														
包装単位	7錠×4シート 28錠/箱	6錠×5シート 30錠/箱	20mL/バイアル																														
用法・用量	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、食餌前後30分を避けて経口投与する。体重別には、次の投与量による。 <table border="1"><thead><tr><th>体重</th><th>用量</th></tr></thead><tbody><tr><td>2.5~5kg</td><td>5mg </td></tr><tr><td>5~10kg</td><td>10mg </td></tr><tr><td>10~20kg</td><td>20mg </td></tr><tr><td>20~40kg</td><td>40mg </td></tr></tbody></table>	体重	用量	2.5~5kg	5mg 	5~10kg	10mg 	10~20kg	20mg 	20~40kg	40mg 	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。 <table border="1"><thead><tr><th>体重</th><th>用量</th></tr></thead><tbody><tr><td>2.5~6kg</td><td>6mg </td></tr><tr><td>6~12kg</td><td>6mg ×2  </td></tr></tbody></table>	体重	用量	2.5~6kg	6mg 	6~12kg	6mg ×2  	術前に体重1kg当たりロベナコキシブとして2mg(製剤として0.1mL)を1回皮下投与する。 <table border="1"><thead><tr><th>体重</th><th>用量</th></tr></thead><tbody><tr><td>3kg</td><td>0.3mL</td></tr><tr><td>5kg</td><td>0.5mL</td></tr><tr><td>10kg</td><td>1mL</td></tr><tr><td>15kg</td><td>1.5mL</td></tr><tr><td>20kg</td><td>2mL</td></tr><tr><td>25kg</td><td>2.5mL</td></tr></tbody></table>	体重	用量	3kg	0.3mL	5kg	0.5mL	10kg	1mL	15kg	1.5mL	20kg	2mL	25kg	2.5mL
体重	用量																																
2.5~5kg	5mg 																																
5~10kg	10mg 																																
10~20kg	20mg 																																
20~40kg	40mg 																																
体重	用量																																
2.5~6kg	6mg 																																
6~12kg	6mg ×2  																																
体重	用量																																
3kg	0.3mL																																
5kg	0.5mL																																
10kg	1mL																																
15kg	1.5mL																																
20kg	2mL																																
25kg	2.5mL																																
有効期間と保管方法	30ヵ月 高温を避ける	36ヵ月 高温を避ける	36ヵ月 未開封の本剤は2~8°Cに保存する																														



痛いところに手が届く
オンシオール®の組織選択性



動物用医薬品 効薬 要指示医薬品 指定医薬品
新発売 犬用猫用非ステロイド性消炎鎮痛剤
オンシオール
ロベナコキシブ

オンシオール®は従来のNSAIDsと異なります。

組織選択性を有する唯一のコキシブ系NSAIDs

安全性^{3),8),9)}

	安全性試験	試験期間	結果
対象:犬 オンシオール®錠	10mg/kg/日 (臨床適用量の5倍量)	6ヵ月	良好な忍容性
対象:犬 オンシオール®注射剤	20mg/kg/日 (臨床適用量の10倍量)	5週間*	良好な忍容性
対象:猫 猫用オンシオール®錠	10mg/kg 1日2回 (臨床適用量の8倍量)	6週間	良好な忍容性

*3日間連続皮下投与を11日間の休薬を挟んで3クール(全身投与)

オンシオール®は組織選択性とCOX-2高選択性をもちあわせ、
犬と猫に適応のある唯一のコキシブ系NSAIDsです。



- オンシオール®は、COX-2高選択性のコキシブ系NSAIDsです。
- 生体機能(腎血流量の維持、血液凝固作用、胃粘膜保護作用など)にかかるCOX-1には影響を及ぼしにくく、痛みや炎症の発現にかかるCOX-2に対して選択性的に作用します^{10),11)}。

1) Pinakatt et al. 1967 Am. J. Physiology (203, No4)

2) King J.N. et al.: J. Vet. Pharmacol. Ther. 32(1):1-17, 2009

3) King J.N. et al.: J. Vet. Pharmacol. Ther. 34(3):298-311, 2011

4) 社内資料:犬におけるオンシオール®の経口、皮下及び静脈内投与時の吸収、分布、代謝及び排泄

5) 社内資料:猫におけるオンシオール®の経口、皮下及び静脈内投与時の吸収、分布、代謝及び排泄

6) 社内資料:猫の炎症誘発モデルを用いたオンシオール®の血中及び組織滲出液中濃度

7) Silber et al 2010 Pharm. Res. Oct 05

8) King J.N. et al.: J. Vet. Pharmacol. Ther. Jun 8, 2011

9) 社内資料:犬における5週間安全性試験

10) King J.H. et al.: Res. Vet. Sci. 88(3):497-506, 2010

11) Giraudeau J.M. et al.: J. Vet. Pharmacol. Ther. 32(1):31-40, 2009

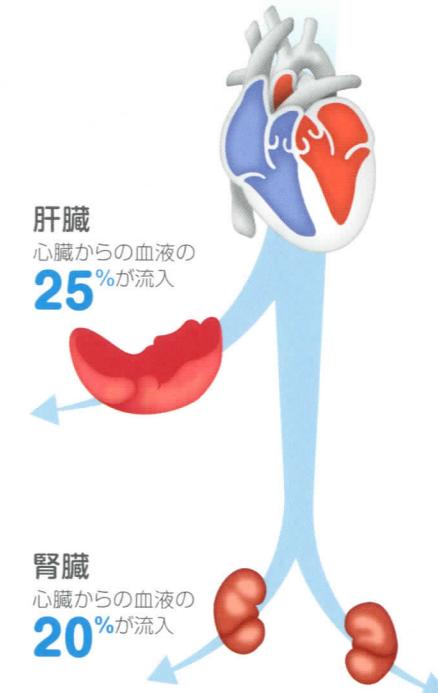
組織選択性の定義

- 「短い血中半減期」と、
- 「長い炎症部位の滲出液中滞留時間」を合わせ持つこと

Brune K. and Furst Rheumatology 2007 Jun 46(6), 911-9

組織選択性が重要な理由

- 生命維持に欠かせない臓器は大量の血液が流入しています。
- 腎臓と肝臓は心臓から排出される血液の45%が流入します¹⁾。
- 従来のNSAIDsは、血中、腎臓及び消化器系粘膜等の有効濃度で「消化器系傷害、腎不全、心血管系傷害等」を発症するリスクを有すると考えられています²⁾。



オンシオール®はCOX-1よりCOX-2高選択性であるため、これが消化器系への安全性に関すると考えられています。更に、「短い半減期」を有するため、早期に血中から消失し、「炎症部位に高い濃度、かつ長い時間留まります」(組織選択性)。このため、一般に大量の血液の流入を受ける臓器等に対する毒性を軽減する可能性を有します²⁾。

オンシオール®のこれら二つの特性は従来のNSAIDsに比べて改善された安全性プロファイルを示唆させます³⁾。



組織選択性を有するオンシオール®は
臓器等への毒性を軽減する可能性を有します

痛いところに手が届く



1. t_{max} が早い

約30分で最高血中濃度(t_{max})に到達します^{4),5)}。

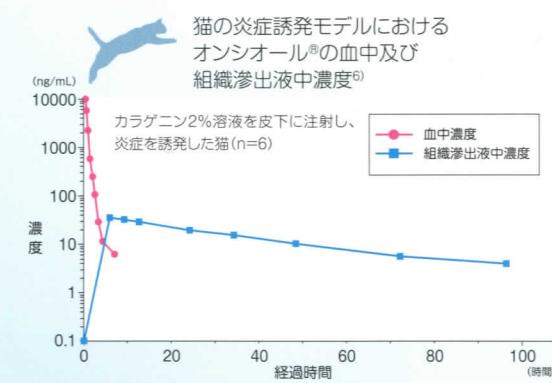
猫:約30分 犬:約30分



早期に最高血中濃度に
到達します。

4. 効果が24時間持続

オンシオール®は、早期に血中から消失し、組織に移行して24時間以上効果が持続します。



1日1回投与で24時間効果が
持続します。

2. 短かい血中半減期

血中半減期が短く、血中から早期に消失し、炎症部位に移行

猫:1.1-1.7時間

犬:0.9-1.2時間



半減期が短く、血中から早期に消失し、
炎症部位に移行します。

3. 炎症部位に長く留まる

全く新しいNSAIDsであるオンシオール®は、蛋白結合率が高く、弱酸性であるため、血中よりも炎症組織内に長くまた高い濃度で留まります⁷⁾。

オンシオール®は
必要なところにだけに長く効く



●=ロベナコキシブ

炎症部位	ロベナコキシブ
● 血管透過性の亢進	● ロベナコキシブのpH:弱酸性
● 滲出液のpH:弱酸性	● 炎症組織内にイオントラップされる
● 蛋白結合薬剤の遊離促進	● 高い蛋白結合率(>98%)

※血管透過性の亢進により薬剤分子が細胞内に入りやすくなる
※炎症組織の滲出液のpHと同じくロベナコキシブも弱酸性のためイオントラップされる
※ロベナコキシブの蛋白結合率が高い(>98%)ため炎症組織内で蛋白結合が遊離し、ロベナ
コキシブ濃度が高くなる

血液中よりも炎症部位に
高い濃度で長く留まります。