

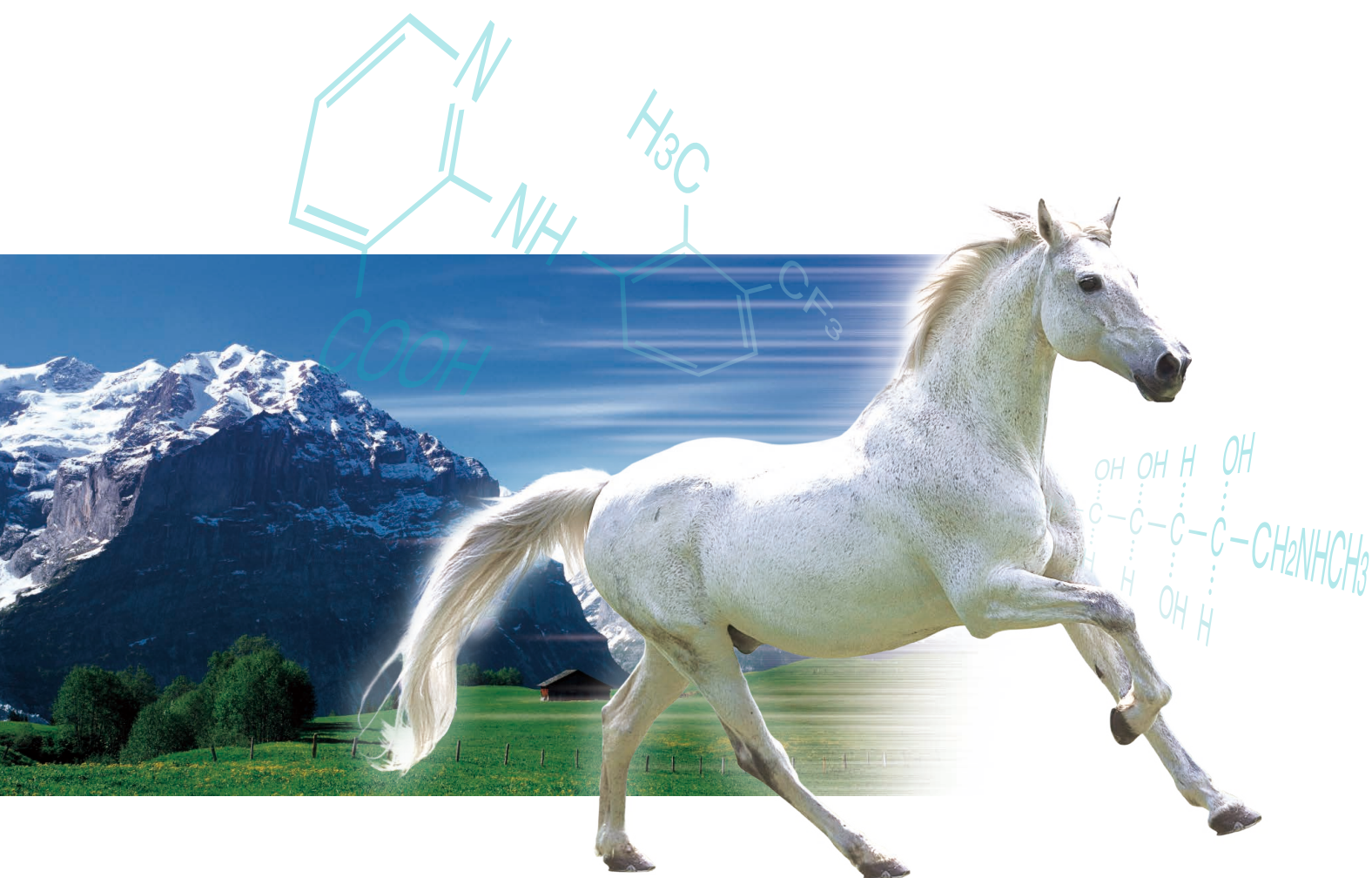
bah 物産アニマルヘルス

動物用
医薬品
(指定医薬品)

非ステロイド系鎮痛抗炎症剤〔要指示〕

バナミン[®] ペースト

〈フルニキシンメグルミン〉



鎮痛剤で国内唯一の経口ペースト剤

BANAMINE[®] paste

フルニキシンメグルミン(有効成分)の概要

1. 有効成分の一般名

和名：フルニキシンメグルミン

英名：flunixin meglumine

2. 化学名

1-deoxy-1-(methylammonio-D-glucitol salt of 2-[[2-methyl-3-(trifluoromethyl)-phenyl]amino]-3-pyridinecarboxylic acid

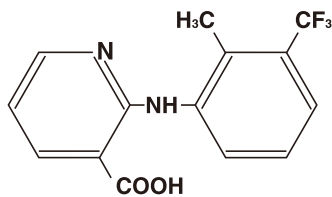
3. 分子式

$C_{14}H_{11}F_3N_2O_2 \cdot C_7H_{17}NO_5$

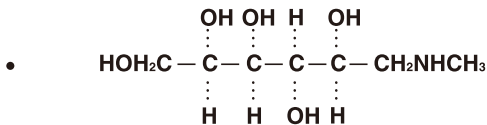
4. 分子量

491.46

5. 構造式



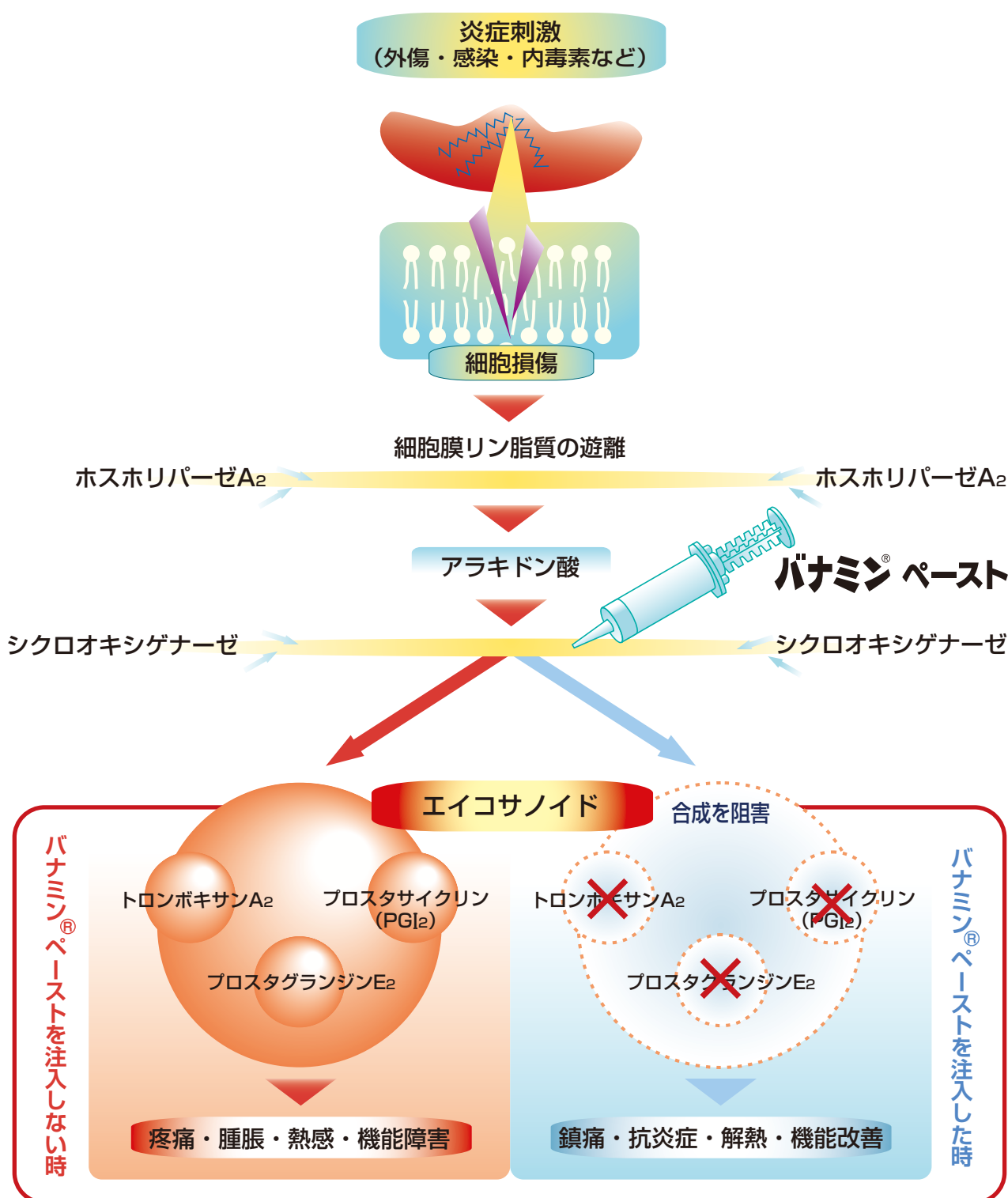
フルニキシン (Flunixin)



メグルミン (Meglumine)



バナミン[®]ペーストによる鎮痛・抗炎症作用機序



疼痛・腫脹・熱感などの炎症の諸症状は、細胞膜リン脂質のアラキドン酸からシクロオキシゲナーゼの作用により変換されたエイコサノイドが伝達物質になって生じるとされています。本剤は強力な非ステロイド系鎮痛抗炎症剤であり、シクロオキシゲナーゼを阻害し、エイコサノイドの合成を抑制することにより、疼痛の閾値を上昇させ（鎮痛）、細胞外への滲出液の漏出を阻止し（抗炎症）、発熱時の上昇したセットポイントを元に戻す（解熱）ことなどにより、各種作用を発揮します。

バナミン[®]ペーストの概要

臨床試験

国内の5施設において、運動器疾患（関節炎及び腱炎）と診断（触診、X線検査、超音波検査等）され、それに起因する跛行が認められる馬（計124頭）を用いて臨床試験が実施された。なお、84頭に本製剤を1～5日間強制経口投与（フルニキシンとして1mg/kg 体重/日）し、40頭には本製剤と同様の主剤を含む注射剤を1～5日間静脈内投与（フルニキシンとして1mg/kg 体重/日）した。有効性評価は跛行、受動試験（関節の可動性）、疼痛、熱感及び腫脹の5項目をスコア化し、その合計を総臨床スコアとして評価に用いた。

その結果、ペースト群における投与終了後の総臨床スコアは開始時より有意に減少し、注射群と同等であった。また、ペースト群から投与量を繰り上げた症例[※]を除いた場合においても注射群と同等であった。さらに、ペースト群における投与終了後の総臨床スコアの改善率は77.6%、有効率は69.6%であり、投与量を繰り上げた症例の有無にかかわらず注射群と同等であった。

試験期間中に有害事象は認められなかった。

血液学的検査及び血液生化学的検査において、投与に起因する影響は認められなかった。

以上の結果から、本剤を体重1kg当たりフルニキシンとして1mg（ペースト製剤として0.02g）を経口投与することは、馬の運動器疾患に伴う炎症及び疼痛の緩和に有効であることが確認された。

※）体重が50kgで割り切れず、投与量を繰り上げた症例

有効性評価基準

$$\text{改善率(\%)} = \frac{\text{投与開始前 総臨床スコア} - \text{投与終了後 総臨床スコア}}{\text{投与開始前 総臨床スコア}} \times 100$$

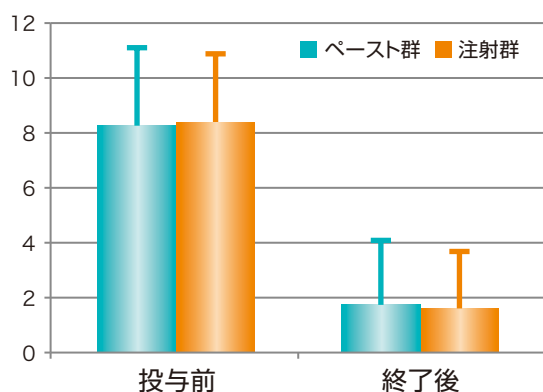
判定基準

判定	改善率
著効	85%以上
有効	70%以上、85%未満
やや有効	40%以上、70%未満
無効	40%未満

$$\text{有効率(\%)} = \frac{\text{著効例数} + \text{有効例数}}{\text{総例数}} \times 100$$

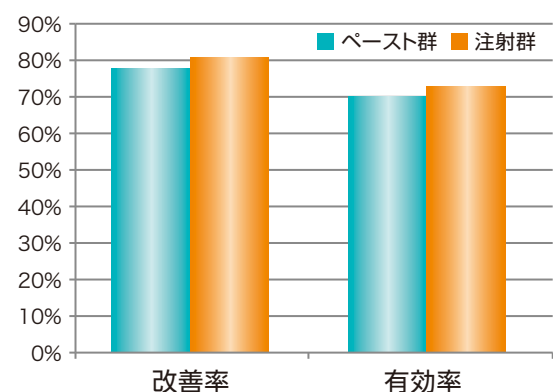
結果

総臨床スコアの変化



結果

バナミン[®]の総臨床スコアの改善率、有効率



安全性試験①

馬(交雑種、成馬、去勢雄及び雌 各2頭)に本製剤を15日間経口投与(フルニキシンとして4mg/kg/日(常用量の4倍量:4頭の平均投与量)、対照群は主剤を除いた添加剤のみを投与)し、一般状態の観察、血液学的検査、血液生化学的検査、尿検査、糞便潜血検査及びBSP(bromsulphalein)クリアランス検査を実施した。

一般状態、尿検査及び糞便潜血検査において投与に起因する影響は認められなかった。

血液学的検査では、投与群の4例中3例で白血球数が約20%減少したが、白血球減少症がより顕著にみられた1例を除き、正常の範囲内であった。その後、投与群の全例が反発して白血球増加を呈したが、試験終了までに3例は正常値に回復し、1例のみ試験前よりわずかに高値を示した。白血球百分率では、主として好中球からなる相対的白血球増加が認められ、リンパ球増加も散発的に認められた。

血液生化学的検査では、血清酵素の検査値の変化に有意差はみられず、その他の検査値も正常の範囲内であった。

BSPクリアランス検査では、投与群の4例中2例にBSPクリアランス時間の延長がみられたが、投与期間の後期には投与前の値に戻った。

安全性試験②

馬(軽種、3〜21歳、3頭)に本製剤を5日間経口投与(フルニキシンとして1(常用量)及び3(3倍量)mg/kg/日、対照群は無処置)し、最終投与15日後まで、一般状態の観察、体重及び摂餌量の測定、尿検査、糞便潜血検査、血液学的検査及び血液生化学的検査を実施し、観察期間終了後に剖検、臓器重量測定及び病理組織学的検査を実施した。

一般状態では、対照群及び常用量投与群に投与に起因する影響は認められなかったが、3倍量投与群では3例中1例に投与直後から1時間後まで流涎がみられた。

糞便潜血検査では、常用量投与群では投与に起因する影響は認められなかったが、3倍量投与では3例中1例に一過性の陽性反応がみられた。

その他の検査項目において投与に起因する影響はみられなかった。

残留試験

馬(サラブレッド種及びアングロアラブ種、5〜20歳、雄、去勢雄及び雌、3頭/投与群、1頭/対照群)に、本製剤を5日間強制経口投与(フルニキシンとして1mg/kg/日、対照群は無処置)し、最終投与1、2、3及び5日後の組織中(筋肉、脂肪、腎臓、肝臓及び小腸)残留を調べた。各組織中のフルニキシン及び代謝物(5-OH体、4'-OH体及び2'-MeOH体)はLC/MS/MSを用いて測定した(定量限界:0.004μg/g)。

フルニキシンの結果を表1に示した。フルニキシン残留濃度は最終投与5日後までに全例の全組織が定量限界未満となった。フルニキシン代謝物については、5-OH体が最終投与2日後まで腎臓中から検出(<0.004(1)〜0.0100μg/g)されたのみで、4'-OH体及び2'-MeOH体は全例において全組織のいずれの時点でも定量限界未満となった。

表1 馬における本製剤経口投与後のフルニキシンの組織中濃度(μg/g)

試料	最終投与後日数(日)			
	1	2	3	5
筋肉	<0.004(2)、0.008	<0.004(3)	<0.004(3)	<0.004(3)
肝臓	0.011、0.013、0.067	<0.004、0.007、0.009	<0.004(2)、0.005	<0.004(3)
腎臓	0.022、0.029、0.095	0.005、0.014、0.018	<0.004(2)、0.009	<0.004(3)
脂肪	<0.004、0.007、0.013	<0.004(3)	<0.004(3)	<0.004(3)
小腸	0.005、0.007、0.023	<0.004、0.004、0.005	<0.004(3)	<0.004(3)

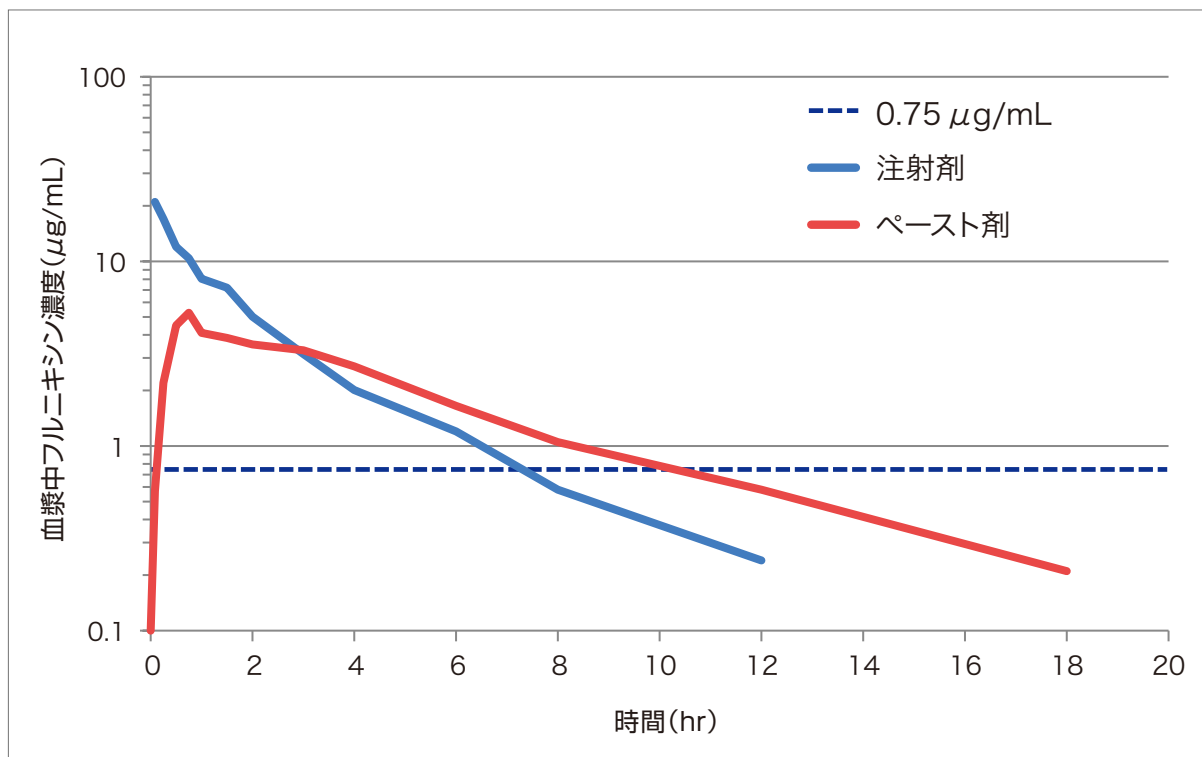
()内に例数を記載

定量限界:0.004μg/g

注射用製剤及び経口用製剤（ペースト剤）の血中濃度比較

薬物動態

フルニキシン：投与経路による血漿中濃度推移の比較



薬物動態パラメーター

製剤	Cmax (µg/mL)	Tmax (時間)	AUC (µg・時間/mL)
パナミン ペースト	7.14±1.38	0.48±0.14	20.8±6.02

n=16 (交差試験) の平均値±標準偏差

結果

- 馬に経口投与されたフルニキシンは投与後1時間以内に最高血中濃度に達し、血中濃度はその後漸減する。
- フルニキシン1.1mg/kgを経口投与した時の生物学的利用能(バイオアベイラビリティ)は71.9%であった。
- フルニキシン1.1mg/kgを経口投与した時、約10時間にわたり、有効血中濃度(0.75µg/mL)を維持した(静脈内投与では約8時間)。

結論

馬に経口投与されたフルニキシンは速やかに吸収され、長時間にわたり血中濃度が維持されることが示唆された。

DRUG INFORMATION

(使用前に必ず添付文書を読み、注意事項を守って使用して下さい。)

動物用
医薬品

非ステロイド系鎮痛抗炎症剤
要指示医薬品 指定医薬品 使用基準

バナミン® BANAMINE® paste

(専門的事項)

バナミン ペーストは、1g中、主剤としてフルニキシンメグルミンをフルニキシンとして50mg含有する経口ペースト剤である。フルニキシンは、1966年にシェリング・プラウ社により合成された非ステロイド系消炎鎮痛薬(NSAIDs)で、その主たる作用機序としてアラキドン酸代謝におけるシクロオキシゲナーゼ活性を阻害することによりプロスタグランジンの産生を抑制することが明らかにされており、主としてこの作用により解熱・消炎・鎮痛効果を示すと考えられている。

【成分及び分量】

本品1g中

成分		分量
主 剤	フルニキシンメグルミン (フルニキシンとして)	83.0mg (50mg)

【効能又は効果】

馬の運動器疾患に伴う炎症及び疼痛の緩和

【用法及び用量】

1日1回体重1kg当たりフルニキシンとして1mg(ペースト製剤として0.02g)を経口投与する。

【使用上の注意】

(基本的事項)

1. 守らなければならないこと

(一般的注意)

- ・本剤は、要指示医薬品であるので獣医師等の処方箋・指示により使用すること。
- ・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。
- ・本剤は、定められた用法・用量を厳守すること。
- ・本剤は、「使用基準」の定めるところにより使用すること。

注意：本剤は、医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第83条の4の規定に基づき上記の用法及び用量を含めて使用者が遵守すべき基準が定められた動物用医薬品ですので、馬について上記の用法及び用量並びに次の使用禁止期間を遵守して下さい。

馬：食用に供するためにと殺する前5日間

(取扱い及び廃棄のための注意)

- ・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。
- ・本剤を廃棄する際は、環境や水系を汚染しないように注意し、地方公共団体条例等に従い処分すること。
- ・小児の手の届かないところに保管すること。
- ・本剤の保管は直射日光、高温及び多湿を避けること。
- ・誤用を避け、品質を保持するため、他の容器に入れかえないこと。
- ・本剤は使い切りとし、再使用しないこと。

2. 使用に際して気を付けること

(使用者に対する注意)

- ・誤って本剤を飲み込んだ場合は、直ちに医師の診察を受けること。

(馬に関する注意)

- ・副作用が認められた場合には、速やかに獣医師の診察を受けること。

1. 対象動物の使用制限等

- ・本剤は妊娠動物には投与しないこと。
- ・胃・十二指腸潰瘍、血液凝固障害、肝不全、腎不全がある馬には投与しないこと。
- ・フルニキシンメグルミン又は添加剤にアレルギーのある馬には投与しないこと。本剤には添加剤としてトウモロコシ デンプン、プロピレングリコール及びカルメロースナトリウムを含む。

2. 重要な基本的注意

- ・本剤を反復投与する場合は5日間を限度とすること。
- ・本剤のシリンジ容器に設定されている切り欠き及び目盛りは、150kg未満の馬に有効量が正確に投与できるように設計されていない。
- ・100kg未満の馬には有効性及び安全性は確認されていない。
- ・出血傾向のある馬への投与に際しては、本剤の有効性及び安全性を十分に勘案した上で、投与の可否を慎重に判断すること。
- ・本剤は対症療法であるため、診断を正確に行うと共に、適当な併用療法あるいは原疾患の根本的治療を行うこと。
- ・本剤は、体重50kg単位で切り欠き及び100kg単位で目盛りが設定されたシリンジ容器により、体重150kgから550kg未満の馬に対して、フルニキシンを50mg単位で投薬できるように設計されている。体重が50kgの倍数にならない場合には、体重50kg単位で繰り下げた用量を、体重が550kg以上の馬に対しては2本のシリンジを適切に組み合わせて使用すること。

3. 相互作用

- ・他の非ステロイド系及びステロイド系抗炎症剤と併用した場合、消化器系の副作用を増強させるおそれがある。
- ・本剤は血漿蛋白結合率が高い非ステロイド系抗炎症薬であり、蛋白結合率の高い他の薬剤と併用すると血漿中の蛋白との結合において競合し、本剤又は競合する薬剤の血漿中遊離型濃度が変化し、それぞれの薬剤の有効性又は安全性に影響するおそれがあるので、併用する際は十分に注意すること。なお、蛋白結合率の高い薬剤としては、ループ利尿剤や炭酸脱水酵素阻害剤等の利尿剤、一部のACE阻害剤及び抗凝固剤等がある。
- ・ゲンタマイシンなどのアミノグリコシド系抗菌剤と併用した場合、腎機能障害のリスクが高くなることもある。
- ・ワルファリンなどの抗凝固剤と併用した場合、出血の危険性が増大するとの報告がある。

4. 副作用

- ・本剤の投与により、消化性潰瘍又は消化管出血があらわれることがあるので、観察を十分行い、症状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。
- ・本剤の投与により血液障害(溶血性貧血、白血球減少、血小板減少)があらわれることがあるので、異常が認められた場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- ・非ステロイド系抗炎症薬の一般的な副作用として、肝障害及び腎障害が報告されており、異常が認められた場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

【使用期限】

外箱及びラベルに表示

【包装】

10g入りシリンジ×6本

BANAMINE[®] paste

販売元

物産アニマルヘルス株式会社
大阪市中央区本町2-5-7

製造販売元（輸入発売元）

MSDアニマルヘルス株式会社
東京都千代田区九段北一丁目13番12号



MSD

Animal Health