

馬用寄生虫駆除剤

EQVALAN®

劇 動物用医薬品 指定

馬の線虫・条虫・馬蠅幼虫の駆除に
エクイバラン®シリーズ。

円虫、小円虫、馬回虫、馬蠅幼虫の駆除

EQVALAN®



大円虫、小円虫、馬回虫・条虫の駆除

EQVALAN®
GOLD



エクイバラン®ペースト

有効成分であるイベルメクチンを含有する経口ペースト剤で
馬の大円虫、小円虫、馬回虫、馬蠅幼虫を駆除することができる



作用機序

有効成分であるイベルメクチンは、無脊椎動物の神経・筋細胞に存在するグルタミン酸を介した塩素イオンチャネルに選択的かつ高い親和性を持って結合し、細胞膜の塩素イオン透過性を増加させることによって神経伝達を阻害し、感受性のある寄生虫を麻痺させ、殺滅する。

薬物動態

雌馬にエクイバラン®ペースト（イベルメクチンとして200 μ g/kg）を1回経口投与した場合の最高血中濃度到達時間（Tmax）は投薬後9時間で、消失半減期（T1/2）は投薬後45時間であった。主として胆汁に排泄される。

国内承認申請資料より

安全性



1 成馬および子馬への2回連続10倍量経口投薬試験

5～12歳齢サラブレッド種をはじめとする各種の雌雄の成馬または子馬22頭を11頭ずつ2群に分け、1群にエクイバラン®ペーストをイベルメクチンとして2000 μ g/kg/日を2日間連続経口投薬した。検査項目は一般臨床所見、体重、飼料摂取量であった。その結果、飼料摂取量の低下、体温の上昇、視力障害、抑うつなどが認められたが、1回目投薬後5日には治療処置することなく全て回復した。

2 妊娠馬における安全性試験

ウエルシュ種ポニー32頭、雄2頭および雑種を主とした各種の雌32頭、雄2頭を供試した。それぞれ雌の半数に対し、胎子器官形成期にエクイバラン®ペーストをイベルメクチンとして600 μ g/kgを2週間毎1回、計6回経口投与した。その結果、ウエルシュ種ではイベルメクチン投薬群で10頭、対照群で9頭の生存子馬が出産された。雑種を主とする試験では、イベルメクチン投薬群で15頭、対照群で11頭の生存子馬が出産された。両群の子馬の比較から、いずれの試験においても、イベルメクチンの投薬は胎子の発育に対し、全く影響を及ぼさなかった。

国内承認申請資料より

有効性

国内臨床試験

供試馬： 内部寄生虫の感染が確認され、その他の感染がみられず（細菌、ウイルス）、臨床的に健康とみなしうる個体

投薬方法・用量： エクイバラン®ペースト（イベルメクチンとして200 μ g/kg）を強制的に経口投与する。

観察項目： 一般症状、飼料摂取状況、糞便性状などを個体別に観察する。

観察期間： 薬剤投薬後14日間

効果判定： 薬剤投薬前と投薬後14日の糞便中に排泄された虫卵数および虫体数により有効性を判定する。

結果：

寄生虫種	供試頭数	糞便中虫卵陰転頭数	平均陰転率
円虫	186	182	97.8%
馬回虫	61	60	98.4%

（試験実施時期：1984～1985年）

供試された馬では排泄虫体検査、瓶培養虫体検査から糞便中に各種円虫、馬回虫、馬蟯虫幼虫および馬蠅幼虫が認められた。上記の結果からイベルメクチンは円虫、馬回虫、馬蠅幼虫に確実な駆虫効果を示すことが示唆された。

また、この試験を通して後肢浮腫、臀部発疹、眼瞼浮腫、下腿部発疹、下痢の臨床所見が観察されている。このうち、後肢浮腫については薬剤投薬後に数日が経過していること、同一馬への再投薬で再発をみていないこと、および対照馬への投薬で発現をみていないことから、イベルメクチン投薬との関係は明らかではなかった。また、臀部発疹および眼瞼浮腫は同一馬への再投薬で再現しなかったことなどから、これらもイベルメクチン投薬との関係は明らかではなかった。下腿部発疹も他に発生がないところから投薬との関わりは明確ではなかった。下痢は経過日数からみて、軟便は投薬以前から認められていたことから、投薬によるものではないと考えられた。

国内承認申請資料より

エクイバラン® ゴールド

有効成分であるイベルメクチンとプラジクアンテルの経口ペースト合剤で馬の大円虫、小円虫、馬回虫及び条虫を駆除することができる



作用機序

有効成分の1つであるプラジクアンテルは合成イソキノリンーピラジン誘導体で馬、犬、猫および人に寄生する条虫と吸虫に対して有効性を示すことが知られている。プラジクアンテルは寄生虫に接触後、外皮に空洞化を起こし外皮を破壊することによる内容物の体外への放出、無機イオンの能動的な移動を阻害しカルシウムイオンやナトリウムイオンの過度の蓄積による痙攣や収縮の発生、さらに寄生虫のグルコース吸収の抑制と乳酸塩の排泄量の増加による栄養素の代謝阻害により感受性のある寄生虫を殺滅する。

薬物動態

エクイバラン®ゴールド(イベルメクチン200 μ g/kg・プラジクアンテル1.0mg/kg)を1回経口投与した際のイベルメクチンの最高血中濃度(Tmax)は投薬後約9時間で、エクイバラン®ペーストとほぼ等しかった。プラジクアンテルは速やかに吸収された後、肝臓において迅速に代謝される。イベルメクチンとプラジクアンテルの合剤を投薬した後、プラジクアンテルの血漿濃度は速やかにピークに達し、投薬7.5時間後には検出限界未満の濃度に減少した。

国内承認申請資料より

安全性



1 子馬での2週間間隔3回反復経口投薬試験

7~10週齢の子馬21頭を無作為に7頭ずつ3群に区分し、それぞれ無投薬対照群とエクイバラン®ゴールド推奨用量投薬群および3倍量投薬群とし、2週間間隔で3回経口投薬した。投薬後に臨床観察、口腔検査、血液検査および血漿生化学検査を実施した。投薬に起因すると考えられる異常所見は認められなかった。

2 10倍量経口投薬試験

3歳齢の馬6頭を無作為に2頭ずつ3群に区分し、それぞれ無投薬対照群とエクイバラン®ゴールド推奨用量投薬群および10倍量投薬群に割り付け経口投与した。投薬後に臨床観察、血液検査、血漿生化学検査および尿検査を実施した。推奨用量の10倍量投薬直後に一過性の流涎が認められた以外は投薬に起因すると考えられる異常所見は認められなかった。

3 繁殖雌馬における安全性試験

直腸検査により妊娠を確認した雌馬40頭を無作為に20頭ずつ、エクイバラン®ゴールド投薬群と偽薬投薬群に無作為に振り分けた。投薬群にはエクイバラン®ゴールドの推奨用量に換算するとイベルメクチン3倍量、プラジクアンテル4.5倍量を妊娠期間中2週間間隔で反復投薬し、偽薬対照群は基剤のみのペースト剤を投薬群と同一の容量で同じ時期に投薬した。投薬後、母馬に対する臨床観察、身体検査、血液検査および血清生化学検査を実施し、子馬に対する臨床観察、身体検査を実施した。試験期間中、投薬群の母馬に有害事象は認められなかった。投薬群および対照群のすべての母馬から健康な子馬が出生した。投薬群の子馬は出生90日後までの間に4回の身体検査を受けた結果、薬剤に関連する異常な臨床徴候、あるいは有害事象は認められなかった。

国内承認申請資料より

有効性

プラジクアンテルの用量設定試験

プラジクアンテルの用量を設定する為に、3つの用量で、馬に自然寄生した条虫に対する有効性について評価した。

試験方法

試験群 1 : 無投薬対照 供試頭数8頭

試験群 2 : イベルメクチン200 μ g/kg・プラジクアンテル0.5mg/kg 供試頭数8頭

試験群 3 : イベルメクチン200 μ g/kg・プラジクアンテル1.0mg/kg 供試頭数8頭

試験群 4 : イベルメクチン200 μ g/kg・プラジクアンテル2.0mg/kg 供試頭数8頭

投薬群にはエクイバラン®ペーストのシリンジを用いて、それぞれ1回投薬した。

投薬5日後剖検を行い、小腸、盲腸、あるいは腹側結腸の粘膜に付着している条虫の頭節を計測した。

試験結果

全ての投薬群は、対照群と比較して葉状条虫の成虫が少なかった。プラジクアンテル1.0mg/kgおよび2.0mg/kg投薬群間に、葉状条虫の成虫数に関する有意差は認められなかった。以上の結果から、プラジクアンテルの葉状条虫に対する有効量を1.0mg/kgに設定した。

寄生虫種	評価項目	プラジクアンテル投与量(mg/kg)		
		0.5	1.0	2.0
葉状条虫成虫	駆除率	92.1%	>99%	100%
統計学的有意差		有意差有り (P<0.01 ^{a)})	有意差無し (P=1.00 ^{b)})	

(無投薬対照群幾何平均値 − 投薬群幾何平均値)

駆除率 =

無投薬対照群幾何平均値

 × 100

a) P<0.01: 1.0mg/kg投与群と2.0mg/kg投与群を合わせた群と0.5mg/kg投与群との間の有意差検定値

b) P=1.00: 1.0mg/kg投与群と2.0mg/kg投与群との間の有意差検定値

国内承認申請資料より

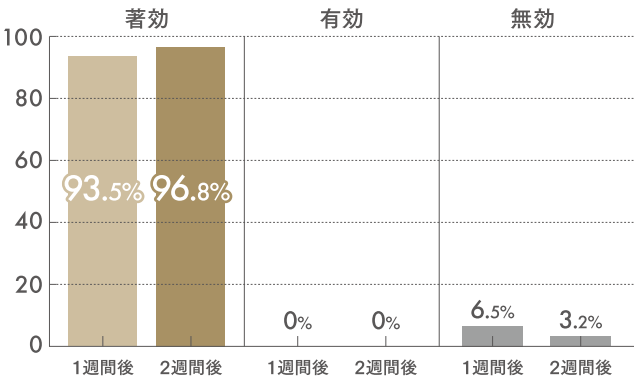
国内臨床試験

体重105～1084kg、3ヵ月～17歳齢の健康で妊娠していない、投薬日前7日以内の糞便検査で、糞便1gあたりの虫卵数(EPG)が10以上の回虫卵および円虫卵(小円虫、大円虫)が認められる馬48頭(雄馬29頭、騾馬4頭、雌馬15頭)で実施した。条虫の寄生は必須ではなかった。エクイバラン®ゴールド投薬群36頭、無投薬対照群12頭で有効性を総合判定した。有効性の総合判定は試験1と同様に行った。投薬に起因する有害事象は認められなかった。

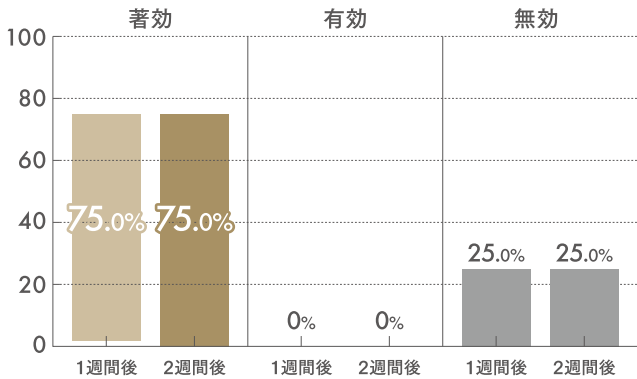
(試験実施時期：2004年)

個体別有効性

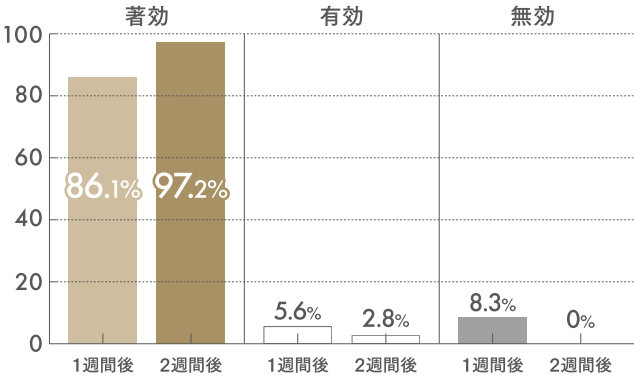
・ 小円虫 供試頭数 n=31



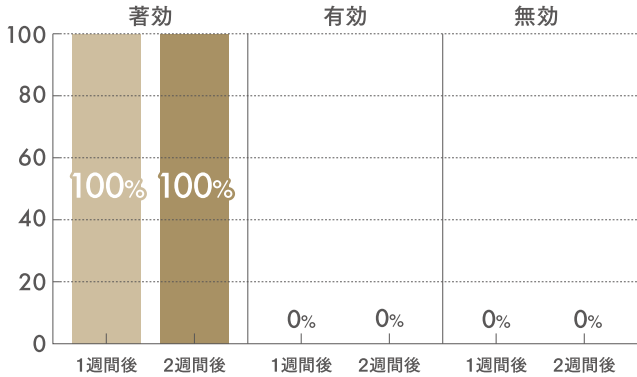
・ 大円虫 供試頭数 n=4



・ 回虫 供試頭数 n=36



・ 条虫 供試頭数 n=11



※個体別有効性 著効: 個体別虫卵数減少率=100% 有効: 100%>個体別虫卵減少率≥90% 無効: 個体別虫卵数減少率<90%
個体別虫卵数減少率=(投薬前虫卵数-投薬後虫卵数)÷投薬前虫卵数×100

成分及び分量	100g中 イベルメクチン 1.87g
効能又は効果	馬：大円虫、小円虫、馬回虫、馬縄幼虫の駆除
用法及び用量	1回体重1kg当たりイベルメクチンとして下記の量を強制的に経口投与する 馬：200 μg（製品として10.7mg）

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	- 本剤は効能・効果において定められた目的にのみ使用すること。 - 馬以外の動物には投与しないこと。 - 本剤は「使用基準」の定めるところにより使用すること。 - 本剤は定められた用法・用量を厳守すること。 - 本剤は獣医師の指導の下で使用すること。
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、使用対象動物（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21日間
取扱い及び 廃棄のための注意	- 本剤は劇薬であるので、取扱いには十分注意し、他の医薬品、食品、飼料等と区別し、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。 - 本剤は魚及びある種の水棲生物に影響を与えることがあるので、容器及び残りの薬剤は、地方公共団体条例等に従い処分すること。
2. 使用に際して気を付けること	
使用者に対する注意	- 誤って薬剤を飲み込んだ場合は、本剤のパッケージを提示し、直ちに医師の診察を受けること。 - 飲食又は喫煙をしながら投与しないこと。 - 使用後は手を洗うこと。 - 目に入らないよう注意すること。万一目に入った場合は水洗いすること。
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。
専門的事項	
3. 副作用	本剤の投与により、後肢浮腫、また、時に発疹をおこすことがある。

使用期限：外箱・ラベルに記載 包装：エクイバラン®ペースト6.42g入り

成分及び分量	100g中 イベルメクチン 1.55g ブラジクアンテル 7.75g
効能又は効果	馬：大円虫、小円虫、馬回虫及び条虫の駆除
用法及び用量	1回体重1kg当たりイベルメクチンとして200 μg、ブラジクアンテルとして1.0mg（ペースト製剤として12.9mg）を経口投与する。本剤は25kg単位で目盛りが設定されたシリンジ容器により、体重100kgから600kg迄の馬に対して、イベルメクチン及びブラジクアンテルをそれぞれ5mg及び25mgの単位で投薬できるように設計されている。体重が600kgを超える馬に対しては2本のシリンジを適切に組み合わせる使用する。

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	- 本剤は効能・効果において定められた目的にのみ使用すること。 - 馬以外の動物には投与しないこと。 - 本剤は「使用基準」の定めるところにより使用すること。 - 本剤は定められた用法・用量を厳守すること。 - 本剤は獣医師の指導の下で使用すること。
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、使用対象動物（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27日間
馬に関する注意	- 本剤は生後2ヵ月齢未満の子馬には投与しないこと。 - 本剤は繁殖種馬の生殖能力に及ぼす安全性が確認されていないため繁殖種馬には投与しないこと。
取扱いおよび 廃棄のための注意	- 本剤は劇薬であるので、取扱いには十分注意し、他の医薬品、食品、飼料等と区別し、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。 - 本剤開封後に残余の薬剤を再使用する場合には、使用後シリンジキャップを再装着し、24ヵ月以内に使い切ること。 - 本剤は魚及びある種の水棲生物に影響を与えることがあるので、容器及び残りの薬剤は、地方公共団体条例等に従い処分すること。
2. 使用に際して気を付けること	
使用者に対する注意	- 誤って薬剤を飲み込んだ場合は、本剤のパッケージを提示し、直ちに医師の診察を受けること。 - 飲食又は喫煙をしながら投与しないこと。 - 使用後は手を洗うこと。 - 目に入らないよう注意すること。万一目に入った場合は水洗いすること。
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。 - オンコセルカ幼虫に重度感染した馬に投与した場合、幼虫の大量死の結果として本剤投与後に浮腫又はそう痒がみられることがある。本症状は数日以内に治まるが、その間対処療法を行うことが望ましい。 - 本剤が口腔内に滞留することにより、一過性の口腔、口唇及び舌の浮腫及び刺激による流涎や食欲不振が見られることがあるので、本剤は舌の奥側に正確に投与し、投与後は直ちに馬の頭を数秒持ち上げ薬剤が速やかに嚥下されたことを確認すること。 - 不必要な投薬による馬回虫の薬剤抵抗性の発現を避けるため、投薬前に虫卵検査を行うなど必要性に応じた効果的な寄生虫駆除を行うこと。
取扱い上の注意	本剤投与時に、体重が25kgの倍数にならない場合には、体重1kg当たりイベルメクチンとして200 μg、ブラジクアンテル1.0mgを超えないように適宜投与量を調節すること。

使用期限：外箱・ラベルに記載 包装：エクイバラン®ゴールド7.74g入り

馬の寄生虫

大円虫

馬に寄生する大円虫は無歯円虫、普通円虫、馬円虫が知られている。この中で、無歯円虫、普通円虫が国内に広く分布している。大円虫の宿主体外におけるライフサイクルはすべての種でほぼ同様であるが、宿主体内でのライフサイクルは種によって異なる。特に普通円虫の感染幼虫は、小動脈に侵入し内膜下を移行するため血栓や動脈瘤を形成して血栓症や突然死の原因となっている。大円虫の少数寄生では無症状の場合が多いが無歯円虫あるいは普通円虫が多数寄生した場合には、食欲不振、栄養障害、発育不良、貧血、下痢、疝痛などの症状がみられる。特に子馬では出血性大腸炎を発症して死亡することがある。

小円虫

馬に寄生する円虫科線虫の中で、大円虫を除いたCyathostominae亜科に属する小型の円虫を小円虫と総称している。小円虫は産地、品種、年齢、性にかかわらず、馬に最も普通に寄生しているが、多くの場合は不顕性感染である。臨床症状として幼虫による腸壁の結節形成が原因と考えられる下痢、血便、貧血、疝痛症状が認められることがある。



写真提供: 佐伯英治先生
(サエキベテリナリサイエンス)

馬回虫

馬回虫は固有宿主において、加齢とともに寄生がみられなくなる傾向があるため、若齢の子馬で寄生が確認されることが多い。馬回虫症は体内移行中の幼虫によるものと、小腸に寄生する成虫に起因するものに大別できる。幼虫寄生に起因する症状は肺炎や発熱等の感冒性で持続性はない。成虫寄生に起因する症状は、食欲不振、発育不良、被毛粗剛、下痢、貧血、疝痛等である。また子馬において、運動麻痺や痙攣等の神経症状がみられる場合があり、回虫寄生によるアレルギーの関与が指摘されている。

条虫

馬に寄生する条虫は葉状条虫、大条虫、乳頭条虫が知られている。この中で葉状条虫が国内に広く分布し、少数寄生では無症状のことが多いが、盲腸粘膜に多数寄生した場合には寄生部位にびらんや潰瘍を形成することにより、食欲不振、消化障害、消瘦、栄養不良、疝痛が認められる。また、潰瘍が重度になると盲腸穿孔を生じ腹膜炎により死亡することがある。



写真提供: 佐伯英治先生
(サエキベテリナリサイエンス)

投薬方法

1. プランジャーを持ち、プランジャーに付属するリングを反時計方向に4分の1回してスライドさせることによってリングのシリンジに近い側を馬の体重の目盛りに合わせてる。
2. リングを時計方向に4分の1回して固定する。
3. 馬の口腔内に飼料がないことを確認し、シリンジキャップを外した後にシリンジの先端を馬の歯間から口腔内に挿入する。
4. プランジャーが止まるまでシリンジ内筒を押し、ペーストを舌の奥側に押し出す。
5. 投薬後は直ちに馬の頭を数秒持ち上げる。

