

2025年4月改訂 Z003

アベルメクチン系・イソオキサゾリン系混合駆虫剤

貯法 気密容器、室温保存

要指示医薬品 指定医薬品

レボリューションプラス

レボリューションプラスは、ゾエティスが開発したアベルメクチン系のセラメクチンおよびイソオキサゾリン系のサロラネルを有効成分とする猫の経皮投与剤である。本剤は、ノミ、マダニ、犬糸状虫、ミミヒゼンダニ、回虫および鉤虫に対し効能を有する。

【成分及び分量】

品名		レボリューションプラス
有効成分	セラメクチン	サロラネル
含量(本剤1mL中)	60.0mg	10.0mg

【効能又は効果】

猫：犬糸状虫の寄生予防、ノミ成虫の駆除、ノミ卵の孵化阻害及び殺幼虫作用によるノミ寄生予防、ミミヒゼンダニの駆除、回虫及び鉤虫の駆除、マダニの駆除

【用法及び用量】

体重1kgあたりセラメクチン6mg及びサロラネル1mgを基準量とした以下の投与量を肩甲骨前方の背面部皮膚に滴下する。複数の効能に対し同時期に本剤を適用する場合、投与頻度が月1回を超えないよう注意すること。

体重	用法及び用量	
1.3kg以上2.5kg未満	0.25mLピペット 1個全量	犬糸状虫の寄生予防：毎月1回、1ヵ月間隔で蚊の活動開始後1ヵ月以内から活動終了後1ヵ月以内まで投与する。
2.5kg以上5.0kg未満	0.50mLピペット 1個全量	ノミ成虫、ミミヒゼンダニ、回虫、鉤虫及びマダニの駆除：1回投与する。
5.0kg以上10.0kg未満	1.0mLピペット 1個全量	ノミ卵の孵化阻害及び殺幼虫作用によるノミ寄生予防：ノミの発生状況に応じて毎月1回、1ヵ月間隔で投与する。
10.0kg以上	適切なピペットの組み合わせ	

【使用上の注意】

(基本的事項)

<p>1. 守らなければならないこと (一般的注意)</p> <ul style="list-style-type: none">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。 <p>(使用者に対する注意)</p> <ul style="list-style-type: none">本剤投与後、完全に乾くまで投与部位に触れないこと。また、投与したことを知らない人も触れないように注意すること。特に小児が、投与した猫に触れないように注意すること。 <p>(猫に関する注意)</p> <ul style="list-style-type: none">ミミヒゼンダニの駆除を目的とする場合であっても、寄生部位である耳等には投与しないこと。投与部位の皮膚に異常が無く、被毛及び皮膚がぬれていないことを確認した後、投与すること。本剤投与後は乾燥するまで投与部位を猫に舐めさせないように注意すること。 <p>(取扱い及び廃棄のための注意)</p> <ul style="list-style-type: none">本剤を火気に近づけないこと。小児の手の届かないところに保管すること。食品と区別し保管すること。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。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。
<p>2. 使用に際して気を付けること (使用者に対する注意)</p> <ul style="list-style-type: none">本剤が人の皮膚に付着した場合は石鹸及び水で洗浄すること。万一、目に入った場合は、水で十分洗浄すること。皮膚又は目に刺激が残る場合は、医師の診察を受けること。本剤を誤飲した場合は、直ちに医師の診察を受けること。 <p>(猫に関する注意)</p> <ul style="list-style-type: none">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。 <p>(取扱いに関する注意)</p> <ul style="list-style-type: none">開封後は速やかに使い切ること。

(専門的事項)

①対象動物の使用制限等

- ・次の動物には投与しないこと。
 - 8週齢未満の猫[8週齢未満の猫に対する安全性は確立されていない]
 - 体重1.3kg未満の猫[用量が過剰となる]
 - 交配予定の猫及び妊娠・授乳中の猫[交配予定及び妊娠・授乳中の猫に対する安全性は確立されていない]

②重要な基本的注意

- ・本剤投与前に犬糸状虫寄生の有無を検査等により判定すること。犬糸状虫寄生が疑われる猫には、健康状態を確認のうえ慎重に投与すること。
- ・ミミヒゼンダニについては、投与1ヵ月後に十分な効果が得られない場合は再投与することが望ましい。
- ・複数飼育の環境下にある猫に対しノミ又はミミヒゼンダニの駆除を目的とする場合、全頭に投与することが望ましい。
- ・本剤は犬糸状虫の成虫に対し駆虫効果はない。
- ・本剤投与後の猫の水浴あるいはシャンプーの影響については検討されていない。投与後1ヵ月以内に猫が少し濡れた場合でも、本剤の有効性に著しい影響は無いものと予想される。本剤投与後24時間は、水浴あるいはシャンプーを控えることが望ましい。

③副作用

- ・猫において本剤投与後、投与部位における搔痒及び脱毛、紅斑、並びに流涎が一過性にみられることがある。

④その他の注意

- ・本剤は、マダニの寄生又は寄生リスクがある場合であって、これ以外の効能(犬糸状虫及びノミの寄生予防、ノミ成虫、ミミヒゼンダニ、回虫及び鉤虫の駆除)のいずれか1つ以上を必要とする猫への使用が推奨される。
- ・本剤のノミに対する効果は1ヵ月間持続する。
- ・本剤は、ノミに対する殺効果を投与後12時間以内に発現し始め、24時間で駆除する。
- ・本剤は、投与後少なくとも1ヵ月間はノミの産卵を抑制する。
- ・本剤のマダニに対する効果は*Amblyomma maculatum*及び*Dermacentor reticulatus*に対して4週間、*Haemaphysalis longicornis*、*Ixodes hexagonus*、*Ixodes ricinus*、*Ixodes scapularis*及び*Rhipicephalus sanguineus*に対して5週間持続することが確認されている。
- ・本剤は、マダニ(*I. ricinus*)に対する殺効果について、投与後24時間以内に発現し始め、24時間で駆除することが確認されている。
- ・本剤投与後、投与部位において被毛のもつれや毛束、脂性又は乾性の白色沈着物等が一時的にみられることがあるが、本剤の有効性及び安全性に影響は無く、通常、投与後24時間以内に消失する。
- ・本剤1用量を誤って経口的に摂取した場合、流涎、軟便、嘔吐、摂餌量減少等の一過性の消化器症状がみられることがあるが、通常、無処置で回復する。
- ・本剤は、猫に寄生したノミ及びマダニの駆除等を目的とする動物用医薬品であり、これらの寄生虫が媒介する疾病の伝播を阻止できるかについての検討は行っていない。
- ・本剤をセラメクチン12mg/kg及びサララネル2mg/kg(最大実投与量)で8頭の猫に単回経口投与した対象動物安全性試験において、摂餌量減少、嘔吐、軟便、流涎、自発運動低下及び振戦が一過性に認められた。これらはいずれも無処置で回復した。

【薬理学的情報等】

[薬物動態]

1. 吸収・分布

猫12頭に本剤を常用量で単回経皮投与したとき、血漿中セラメクチンおよびサララネル濃度の C_{max} は1200ng/mLおよび118ng/mL、 t_{max} は1.2日および7.1日、 $t_{1/2}$ は12.5日および41.5日であった。また、経皮投与時の生物学的利用率は、それぞれ40.5%および57.9%であった。

猫8頭に本剤を常用量で1ヵ月に1回、計6回反復経皮投与したとき、血漿中セラメクチンおよびサララネル濃度は、それぞれ投与2および4回で定常状態に達した。

2. 代謝・排泄

猫において、セラメクチンおよびサララネルの主要排泄経路は糞中であり、いずれも未変化体および代謝物として排泄される。

[臨床成績]

国内の動物病院(供試頭数292頭)において、ノミ、マダニ、回虫および鉤虫の駆除、犬糸状虫の寄生予防に対する本剤の有効性及び安全性が確認された。なお、ノミの駆除の評価とあわせてノミアレルギー性皮膚炎症例の症状についても評価が行われ、改善傾向が認められている。

また、米国の動物病院(供試頭数187頭)において、ミミヒゼンダニの駆除に対する本剤の有効性及び安全性が確認された。

[薬効薬理]

作用機序

セラメクチンは、無脊椎動物のグルタミン酸受容体の塩素イオンチャネルに結合し、細胞内への塩素イオンの透過性を亢進することにより、神経活動を抑制する。

サララネルは、昆虫およびダニのGABA受容体の塩素イオンチャネルに結合し、細胞内への塩素イオンの透過性を抑制することにより、神経活動を亢進させる。さらに、グルタミン酸受容体の機能を抑制することも確認されている。サララネルのGABA受容体およびその他の蛋白活性に対する作用を*in vitro*で評価した結果、ヒトよりも節足動物のGABA受容体に対する選択性が非常に高いことが確認されている。

薬理作用

1. ノミに対する効果

(1)駆除効果の持続性[1]

ノミ(*Ctenocephalides felis*)成虫を猫1頭あたりに100匹、1週間毎に人工感染させ、効果の持続性を確認した試験において、投与後24時間以内に駆除効果は100%に達し、ノミ再感染後の駆除効果については投与後35日(再感染後24時間)においても100%を維持することが確認された。

(2)駆除効果の即効性[1]

ノミ(*C. felis*)成虫を猫1頭あたりに100匹、約1週間毎に人工感染させて即効性を確認した試験において、投与後12時間以内に殺効果が発現し、24時間以内に98%以上駆除した。また、投与後7、14、21、28日のいずれにおいてもノミ感染後6時間以内に殺効果が発現し、12時間以内に93%以上、24時間以内に100%駆除することが確認された。

(3)ライフサイクルへの影響

ノミ(*C. felis*)成虫を猫1頭あたりに100匹、約1週間毎に人工感染させた試験において、ノミの産卵抑制が観察され、その効果は33日間持続することが確認された[2]。

また、ノミ(*C. felis*)の糞にセラメクチンを添加し、ノミ幼虫に給餌した*in vitro*試験において、ノミ幼虫への殺効果が認められている[3]。

2. マダニに対する効果

(1)駆除効果の持続性

マダニ(*Haemaphysalis longicornis*)を猫1頭あたり50匹、1週間毎に人工感染させて持続性を確認した試験において、投与後48時間以内に駆除効果は96.9%に達し、マダニ再感染後の駆除効果については投与後35日(再感染後48時間)まで92%以上を維持することが確認された。

(2)駆除効果の即効性[4]

マダニ(*Ixodes ricinus*)を猫1頭あたり50匹、約1週間毎に人工感染させて即効性を確認した試験において、投与後24時間以内に殺効果を発現し、駆除効果は99%以上に達した。また、投与後7、14、21、28日のいずれにおいてもマダニ感染後12時間以内に殺効果が発現し、24時間以内に93%以上駆除することが確認された。

参考：下記のマダニについて本剤の有効性が確認されている。

Dermacentor reticulatus, Ixodes hexagonus, I. ricinus and Rhipicephalus sanguineus [5] ; *Amblyomma maculatum, H. longicornis, Ixodes scapularis*

3. 犬糸状虫に対する効果

犬糸状虫(*Dirofilaria immitis*)の感染幼虫(L₃)を猫1頭あたり100匹人工感染させた試験において、感染幼虫は成虫に成長することがなく、寄生予防効果が確認された。

4. ミミヒゼンダニに対する効果[6]

ミミヒゼンダニ(*Otodectes cynotis*)が寄生している猫を用いた試験において、投与後30日には99%以上駆除することが確認された。

5. 回虫および鉤虫に対する効果[7]

猫1頭あたり猫回虫(*Toxocara cati*)の成熟卵400個および猫鉤虫(*Ancylostoma tubaeforme*)の感染幼虫150匹を感染させた試験¹⁾において、虫卵および虫体は検出されず、駆除効果が確認された。

1)セラメクチン6mg/kgおよびサロラネル2mg/kgで単回経皮投与

[対象動物安全性]

1. 経皮投与安全性

8週齢の猫8頭を1群とし、本剤をセラメクチン12mg/kgおよびサロラネル2mg/kg(最大実投与量)から5倍量で1ヵ月に1回、計8回経皮投与した試験、および9~10ヵ月齢の猫8頭を1群とし、同様の用量範囲で1ヵ月に1回、計6回経皮投与した試験において、試験期間中に死亡を含め、投与に関連すると考えられる有害事象は認められなかった。

2. 経口投与安全性

12週齢の猫8頭に、本剤を臨床用法(経皮)での最大実投与量で1ヵ月に1回、単回経口投与した試験において、試験期間中に死亡例は認められなかった。投与に関連すると考えられる有害事象として、一過性の摂餌量減少、嘔吐、軟便、流涎、自発運動低下および軽度の振戦が認められたが、いずれも無処置で回復した。

【有効成分に関する理化学的知見】

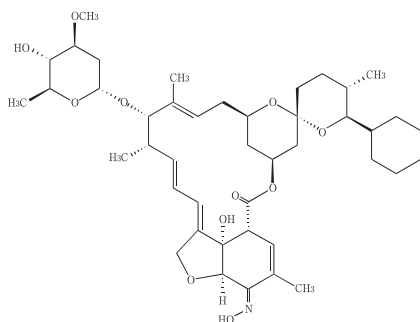
一般名：セラメクチン(Selamectin)

化学名：(5Z, 25S)-25-cyclohexyl-4'-O-de (2,6-dideoxy-3-O-methyl- α -L-arabino-hexopyranosyl)-5-demethoxy-25-de (1-methylpropyl)-22,23-dihydro-5-hydroxyiminoavermectin A_{1a}.

分子式：C₄₃H₆₃O₁₁

分子量：769.97

構造式：



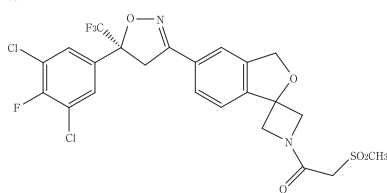
一般名：サロラネル(Sarolaner)

化学名：1-(5'-(5S)-5-(3,5-dichloro-4-fluorophenyl)-5-(trifluoromethyl)-4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-3'-H-spiro(azetidine-3,1'-(2) benzofuran)-1-yl)-2-(methylsulfonyl) ethanone

分子式：C₂₃H₁₈Cl₂F₄N₂O₅S

分子量：581.36

構造式：



【主要文献】

- [1] Becskei C, et al. : Vet Parasitol, 238, S18-S21, 2017
- [2] Vatta AF, et al. : Vet Parasitol, 238, S22-S26, 2017
- [3] McTier TL, et al. : Vet Parasitol, 116, 45-50, 2003
- [4] Becskei C, et al. : Vet Parasitol, 238, S8-S11, 2017
- [5] Geurden T, et al. : Vet Parasitol, 238, S3-S7, 2017
- [6] Becskei C, et al. : Vet Parasitol, 238, S27-S30, 2017
- [7] Geurden T, et al. : Vet Parasitol, 238, S31-S35, 2017

【有効期間】

3年

【包装】

レボリユーシオンプラス 0.25mL×6ピペット

レボリユーシオンプラス 0.50mL×6ピペット

レボリユーシオンプラス 1.0mL×6ピペット

【製品情報お問い合わせ先】

ゾエティス・ジャパン株式会社

〒151-0053 東京都渋谷区代々木3-22-7

TEL：0120-317-955 FAX：0120-317-965

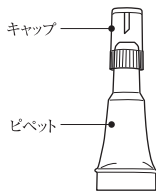
月曜日～金曜日 9：00～12：30、13：30～18：00受付

※土日祝祭日および弊社休業日は除く。

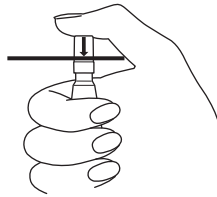
【投与方法】



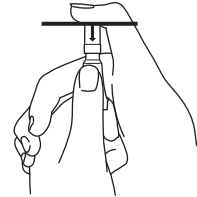
【ピペットの開け方】



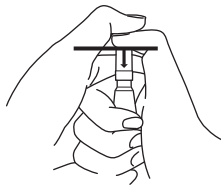
①ピペットをブリスターから取り出します。



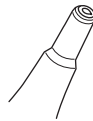
②ピペットを上向きに持ち、キャップを垂直にしっかりと押し込んで、ピペットの先端に穴を開けます。



もう片方の手でピペットを固定すると、キャップを垂直に押し込みやすくなります。



③開かない場合は両手で、キャップを垂直にしっかりと押し込みます。



④キャップを取り外し、ピペットの先端に穴が開いていることを確認します。

お子様が開封しにくいチャイルドレジスタンス機能を有するピペットです。

【製造販売(輸入)】

ゾエティス・ジャパン株式会社

〒151-0053 東京都渋谷区代々木3-22-7

獣医師、薬剤師等の医薬関係者は、本剤による副作用などによると疑われる疾病、障害若しくは死亡の発生又は本剤の使用によるものと疑われる感染症の発症に関する事項を知った場合において、保健衛生上の危害の発生又は拡大を防止するために必要があると認めるときは、上記【製品情報お問い合わせ先】に連絡するとともに、農林水産省動物医薬品検査所 (<http://www.maff.go.jp/nval/iyakutou/fukusayo/sousa/index.html>) にも報告をお願いします。