

◎マーカイン注脊麻用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 プピバカイン 塩酸塩水和物 bupivacaine hydrochloride hydrate 【分類】 局所麻酔剤 [脊椎麻酔剤]

【単位】 ◎0.5%/A [4mL] (高比重), ○0.5%/A [4mL] (等比重)

【常用量】 脊麻用 : 1回 10~20mg (2~4mL), 1回最大 20mg (4mL)

【用法】 脊髄クモ膜下腔に注入

【透析患者への投与方法】 抗凝血薬投与中の患者は出血に注意して投与 (1)

【保存期腎不全患者への投与方法】 減量の必要なし (1)

【特徴】 保存剤を含有しない脊椎麻酔専用製剤。脂溶性はロドカインの約 10 倍, 麻酔力は 4 倍, 麻酔持続時間は 2~5 倍の作用時間の長い局所麻酔剤。麻酔発現はロドカインより少し遅い。血管収縮作用がありエピネフリンを添加しても麻酔時間は延長しない。高比重製剤にはブドウ糖が添加されている。作用発現時間は高比重製剤が早く, 作用持続時間は等比重製剤が長い。

【主な副作用・毒性】 ショック, 振戦, けいれん, 不安, 霧視, めまい, じんま疹, 浮腫ショック, 過度の血圧低下, 徐脈, 呼吸抑制, 心停止等があらわれることがある。脊髄麻酔時, 身長の高い患者では血圧低下の発現率が高くなる傾向がある。

【BA】 脊髄クモ膜下腔に投与後, 血中に 100%吸収される (1)

【Tmax】 硬膜外投与で 10.2~30min, 硬膜外に 100mg 投与後の Cmax は 0.8 μ g/mL (13) 脊麻後の血中 Tmax は, 等比重 2.2hr, 高比重 1.6hr (1)

【代謝】 CYP3A4 で代謝 (1) 肝代謝され脱ブチル化体および 4-水酸化体となるが, それらの濃度は未変化体の 1/5 (1) 代謝物に活性があるかはデータなし (1)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 2% (13) 6% [iv, 24hr まで] (1) 尿中に脱ブチル化体として 5%回収 [iv, 24hr まで] (1) 【CL】 583mL/min (10) 7.1mL/min/kg, 加齢により低下 (13) 0.58L/min (1) 高齢者の全身 CL は若年成人の 1/2 に低下 (1) 【非腎 CL/総 CL】 95% (10)

【t1/2】 2.7hr (10) 1~3hr (11) 2.4hr (13) 高比重 : 6.6 \pm 3.3hr (1)

【蛋白結合率】 96% (10) 95% (13) 92 \pm 0.6% (1) アルブミンと AAG に結合 (1)

【Vd】 1.0L/kg (10) 73L/man (11) 0.9L/kg (13) 73L (1) 硬膜外脂肪組織への移行性はロドカインより高い (1) 血球への分布は低い (1)

【MW】 342.90

【透析性】 蛋白結合率が高いため, 透析で除去されにくいと思われる (5) 資料なし (1)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない (5) 4 μ g/mL 以上が中毒域 (1) 【OW 係数】 高い (11) 27.5 [n-ヘプタン/buffer, pH7.4] (1) 【pKa】 8.2

【更新日】 20121224

※正確な情報を掲載するように努力していますが, その正確性, 完全性, 適切性についていかなる責任も負わず, いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし, それらを利用した結果, 直接または間接的に生じた一切の問題について, 当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は, 日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。