

◎アナペイン注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】ロピバカイン塩酸塩水和物 ropivacaine hydrochloride hydrate 【分類】長時間作用性局所麻酔剤

【単位】◎0.2% [100mL]・◎0.75% [10mL]

【常用量】■0.2%：6mL/hr（硬膜外持続）■0.75%：1回20mLまで（硬膜外）・40mLまで（ブロック）

【用法】■0.2%：術後鎮痛には手術終了時に、6mL/hを硬膜外腔に持続投与（4～10mL/hr）■0.75%：硬膜外麻酔、伝達麻酔には硬膜外麻酔には1回20mLまでを硬膜外に投与、伝達麻酔には1回40mLまで

【透析患者への投与方法】総クリアランスに対する腎クリアランスの割合が非常に小さいため、減量の必要はないと考えられる（5）

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし（5）

【特徴】長時間作用性アミド型局所麻酔薬で、脂質親和性が比較的 low、ピペコロキシリジド構造を有するが、S(-)-エナンチオマーのみからなる最初の局所麻酔薬で、ラセミ体である塩酸ロピバカインに比べ神経膜ナトリウムチャンネルに対する作用選択性が高く、心筋ナトリウムチャンネルへの作用が弱い。

【主な副作用・毒性】ショック、意識障害、振戦、痙攣、異常感覚、知覚・運動障害、血圧低下、徐脈、嘔気、発熱、呼吸困難、めまい、下肢知覚異常、頭痛、昏迷、運動障害、言語障害、しびれ感、耳鳴り、頻脈、心室性不整脈、洞性不整脈、排尿困難、尿閉、戦慄、低体温、悪寒など

【F】硬膜外投与時約90%（1）

【tmax】約0.5hr（1）

【代謝】肝で投与量の86%がCYP3A4、1A2によって代謝される（1,11）主にCYP1A2により3-OH体になり、主に3A4により2', 6'-pipecoloxylidide（PPX）に代謝される（Clin Pharmacol Ther 70: 344-350, 2001）代謝物に局所麻酔作用はない（11）

【排泄】尿中未変化体排泄率約1%（1,11）3-OH体は37%、PPXは3%が尿中に排泄される（Clin Pharmacol Ther 70: 344-350, 2001）

【CL】約500mL/min（11）【腎CL】1mL/min（11）

【t1/2】約4.5～5.5h（1）硬膜外5.3hr、静注1.7hr、腋窩神経7.1hr（11）

【蛋白結合率】94%がα1酸性糖蛋白に結合（1,11）

【Vd】外国人における静脈内注入終了時の定常状態分布容積は約40L/man（1）定常状態のVdは41L/manであるが遊離型ロピバカインの定常状態のVdは742L/man（11）

【MW】328.88

【透析性】蛋白結合率が高く、遊離型Vdが大きいため、透析では除去されにくいと考えられる（5）

【TDMのポイント】TDMの対象にならない【O/W係数】141（1,11）【pKa】8.07（1）

【相互作用】喫煙者ではCYP1A2の誘導による3-水酸化体の尿中排泄量が増加し、PPXは減少する。リファンピシンは喫煙、非喫煙に関係なくPPXを増加、3-水酸化体を減少させる。喫煙によるAUCの低下はわずかであるが、リファンピシンによるAUCの低下度は40～50%と大きい（Clin Pharmacol Ther 70: 344-350, 2001）

【更新日】20151209

※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、当院では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。