**布比卡因**

文章版本号：2

最后发布时间：2014-4-15 9:47:50

**【特别警示】**

1.有本药0.75%注射液用于产妇硬膜外麻醉时导致难以复苏的心脏停搏或死亡的报道，故不推荐用于产科麻醉。(FDA药品说明书-盐酸布比卡因注射液)

2.0.75%注射液用于需肌肉高度松弛或作用维持时间较长的手术。(FDA药品说明书-盐酸布比卡因注射液)

**【药物名称】**

中文通用名称：布比卡因

英文通用名称：Bupivacaine

其他名称：勃比伏卡因、丁吡卡因、丁哌卡因、丁普卡因、麻卡因、雅布比卡因、Bupivacainum、Carbostesin、Exparel。

**【药理分类】**

麻醉用药及麻醉辅助药>>麻醉用药>>局部麻醉用药

镇痛药>>阿片类镇痛药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

用于局部浸润麻醉、周围神经阻滞和椎管内阻滞。

**其他临床应用参考**

1.用于局部镇痛。(FDA批准适应症)

2.用于区域镇痛。(FDA批准适应症)

3.用于牙科操作时麻醉。(FDA批准适应症)

4.用于眼科操作时麻醉。(FDA批准适应症)

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.臂丛神经阻滞  0.25%注射液，一次20-30ml(50-75mg)；0.375%注射液，一次20ml(75mg)。

2.骶管阻滞  0.25%的注射液，一次15-30ml(37.5-75mg)；0.5%注射液，一次15-20ml(75-l00mg)。

3.硬脊膜外间隙阻滞  (1)镇痛：0.25%-0.375%注射液。(2)一般的腹部手术：0.5%注射液。

4.蛛网膜下腔阻滞  常用量一次5-15mg，可加10%葡萄糖注射液配成高渗液或用脑脊液稀释成近似的等渗液。

5.局部浸润麻醉  (1)0.25%注射液，一次70-80ml，总用量以175-200mg为限，24小时内分次给药，一日极量为400mg。(2)0.125%-0.25%注射液，总用量以175-200mg为限。

6.交感神经节阻滞  0.25%注射液，一次20-50ml，总用量为50-125mg。

**儿童**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.局部浸润麻醉  0.1%注射液。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.局部浸润  使用本药0.25%注射液直至最大剂量(联用肾上腺素时为225mg，不联用肾上腺素时为175mg)。

2.骶管阻滞  中度至完全阻滞，可使用本药0.5%注射液15-30ml(75-150mg)或本药0.25%注射液15-30ml(37.5-75mg)，视需要可每3小时重复用药1次。

3.硬膜外给药  使用本药0.25%注射液，一次10-20ml(25-50mg)可致部分-中度运动神经元阻滞。使用本药0.5%注射液，一次10-20ml(50-100mg)可致中度-完全运动神经元阻滞。使用本药0.75%注射液，一次10-20ml(75-150mg)可致完全运动神经元阻滞。可视需要每3小时重复给药1次。

4.蛛网膜下腔阻滞  (1)用于产科，此时仅使用本药葡萄糖盐。正常阴道分娩者，使用本药0.75%葡萄糖注射液，一次0.8ml(6mg)；剖宫产手术者，使用本药0.75%葡萄糖注射液，一次1-1.4ml(7.5-10.5mg)。(2)用于下肢和会阴手术，使用本药0.75%葡萄糖注射液，一次1ml(7.5mg)。(3)用于下腹部手术，使用本药0.75%葡萄糖注射液，一次1.6ml(12mg)。(4)用于上腹部手术，使用本药0.75%葡萄糖注射液，一次2ml(15mg)。

5.周围神经阻滞  中度至完全运动神经元阻滞的推荐剂量为本药0.5%注射液5-37.5ml(25-175mg)或本药0.25%注射液5-70ml(12.5-175mg)。可视需要每3小时重复给药1次。

6.交感神经阻滞  本药0.25%注射液20-50ml(50-125mg)，可视需要每3小时重复给药1次。

·局部镇痛

1.胸膜内给药  使用本药0.25%、0.375%、0.5%注射液，弹丸式注射10-30ml，每4-8小时1次。再给予本药20ml负荷剂量后可持续滴注本药0.375%注射液并联用肾上腺素，滴注速率为每小时6ml。

·区域镇痛

1.硬膜外给药  使用本药0.0625%-0.125%注射液，持续滴注。滴注速率为每小时6.25-18.75mg。

·牙科操作时麻醉

1.局部给药  使用本药0.5%注射液，一次1.8-3.6ml(9-18mg)并联用肾上腺素。可能需要再次给药9mg，最大总剂量为90mg。

·眼科操作时麻醉

1.球后麻醉  使用本药0.75%注射液，一次2-4ml(15-30mg)。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全时无需调整剂量。

◆肝功能不全时剂量

本药主要经肝脏代谢，有严重肝脏疾病者需调整剂量。

◆老年人剂量

老年人用药需调整剂量。

◆其他疾病时剂量

过度疲劳、有急性疾病者、关节镜手术时，应减少用量。

**儿童**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.局部浸润  使用本药0.25%或0.5%注射液，一次0.5-2.5mg/kg，0.25%注射液的最大剂量为1ml/kg，0.5%注射液的最大剂量为0.5ml/kg。

2.骶管阻滞  用于体重大于10kg者，使用本药0.125%或0.25%注射液单次给药剂量为1-2.5mg/kg。持续滴注的剂量为使用本药0.1%、0.125%、0.25%注射液，滴注速率为每小时0.2-0.4mg/kg，最大滴注速率为每小时0.4mg/kg。

3.硬膜外给药  体重大于10kg者，使用本药0.125%-0.25%注射液单次给药剂量为1-2.5mg。持续滴注的剂量为使用本药0.1%、0.125%、0.25%注射液，滴注速率为每小时0.2-0.4mg/kg，最大滴注速率为每小时0.4mg/kg。

4.蛛网膜下腔阻滞  使用本药0.75%葡萄糖注射液，一次0.3-0.6mg/kg。

5.周围神经阻滞  使用本药0.25%或0.5%注射液，一次0.3-2.5mg/kg。0.25%注射液的最大剂量为1ml/kg，0.5%注射液的最大剂量为0.5ml/kg。

·局部镇痛

1.胸膜内给药  持续滴注本药0.25%注射液并联用肾上腺素，滴注速率为每小时0.5ml/kg。

·区域镇痛

1.骶管阻滞  (1)体重小于或等于10kg者：①使用本药0.125%或0.25%注射液单次给药剂量为1-1.25mg/kg。②使用本药0.1%、0.125%、0.25%注射液持续滴注，滴注速率为每小时0.1-0.2mg/kg，最大滴注速率为每小时0.2mg/kg。(2)体重大于10kg者：①使用本药0.125%或0.25%注射液单次给药剂量为1-2.5mg/kg。②使用本药0.1%、0.125%、0.25%注射液持续滴注，滴注速率为每小时0.2-0.4mg/kg，最大滴注速率为每小时0.4mg/kg。

2.硬膜外给药  体重小于或等于10kg者，①使用本药0.125%或0.25%注射液单次给药剂量为1-1.25mg/kg。②使用本药0.1%、0.125%、0.25%注射液持续滴注，滴注速率为每小时0.1-0.2mg/kg，最大滴注速率为每小时0.2mg/kg。

·牙科操作时麻醉

1.局部给药  用于12岁及12岁以上青少年，使用本药0.5%注射液，一次1.8-3.6ml(9-18mg)并联用肾上腺素。可能需要再次给药9mg，最大总剂量为90mg。

·眼科操作时麻醉

1.球后麻醉  用于12岁及12岁以上青少年，使用本药0.75%注射液，一次2-4ml(15-30mg)。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全者无需调整剂量。

◆肝功能不全时剂量

本药主要经肝脏代谢，有严重肝脏疾病者需调整剂量。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

注射给药  (1)应避免血管注射。(2)给药前应先进行抽吸，若有回血，必须重新定位针头直至抽吸时不再有回血，但注射器中无回血并不意味着未注入血管。(3)不推荐使用静脉局部麻醉(Bier阻滞)，已有使用本给药方法导致心跳骤停和死亡的病例发生。

**【禁忌症】**

1.对本药或其他酰胺类麻醉药过敏者。

2.产科宫颈旁阻滞(国外资料)。

**【慎用】**

1.心律失常、休克、心脏传导阻滞或有低血压病史者(国外资料)。

2.肝脏疾病患者尤其是严重肝脏疾病患者(国外资料)。

3.急性疾病者(国外资料)。

4.体弱者(国外资料)。

5.老年患者(国外资料)。

6. 12岁以下儿童。

**【特殊人群】**

**儿童**

12岁以下儿童慎用，不推荐18岁以下儿童使用本药葡萄糖注射液。

**老人**

老年患者用药可能升高血药浓度，故应慎用。

**妊娠期妇女**

1.本药可透过胎盘屏障，禁用于宫颈旁阻滞麻醉，因可导致胎儿心动过缓、缺氧、酸中毒、胎死宫内。不推荐使用0.75%注射液作产科硬膜外麻醉。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为C级。

**哺乳期妇女**

本药可随乳汁排泄，但哺乳期妇女用药对乳儿危害较小。

**【不良反应】**

1.心血管系统  少见心率减慢。还可出现心动过缓、心脏停搏、心源性休克、心脏毒性、心肌梗死、低血压、心肌负性肌力、室性心律失常。

2.代谢/内分泌系统  低血糖。

3.呼吸系统  呼吸暂停、呼吸停止、呼吸抑制、通气不足。

4.肌肉骨骼系统  背痛、肌无力，在关节内镜和其他外科手术后进行关节内注射还可能出现关节软骨溶解。

5.泌尿生殖系统  少见尿潴留。还可出现尿失禁、性功能障碍、第一产程延长。

6.免疫系统  出现超敏反应、细菌性脑膜炎、脑膜刺激。

7.神经系统  少见头痛。还出现中枢神经系统抑制(睡意、意识丧失)、兴奋(坐立不安、震颤、眩晕、癫痫、头晕、口周麻木、定向力障碍、肌肉颤搐、眼球震颤、言语不清)、截瘫、感觉异常、嗜睡、神经麻痹、神经根刺激症状，兴奋感较短暂或不出现，中枢神经系统抑制可能为毒性的第一反应。

8.精神  焦虑。

9.肝脏  肝毒性。

10.胃肠道  少见恶心、呕吐。还可出现胃排空延迟、功能性大便失禁。

11.血液  减少血小板聚集。

12.皮肤  注射部位疼痛、组织坏死。

13.眼  视物模糊、霍纳综合征。

14.耳  耳鸣。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.罗哌卡因：

结果：鞘内注射本药的同时硬膜外给予罗哌卡因，可使本药效应延长。

2.普萘洛尔：

结果：合用可使本药清除率下降，毒性反应的危险性增加。

处理：合用应谨慎。

3.圣约翰草：

结果：合用可增强本药的心血管系统毒性，并延迟其起效时间。

处理：使用本药前应停用圣约翰草至少5日。

4.玻璃酸酶：

结果：合用可增加本药的扩散，使本药起效加快，减少局部浸润引起的肿胀，但同时又可增加本药的吸收，增加发生全身毒性的危险。

5.顺阿曲库铵、瑞库溴铵：

结果：本药可增强以上药物的神经肌肉阻滞效应。

处理：合用时需调整以上药物的剂量。

6.丙泊酚：

结果：治疗前给予本药，丙泊酚的催眠作用增强，而用量减少。

7.血管紧张素转换酶抑制药(如阿拉普利、贝那普利、卡托普利、西拉普利、地拉普利、依那普利拉、马来酸依那普利、福辛普利、咪达普利、赖诺普利、莫昔普利、喷托普利、培哚普利、喹那普利、雷米普利、螺普利、替莫普利、群多普利、佐芬普利)：

结果：合用可导致血管紧张素Ⅱ活性下降，可能加重心动过缓、低血压以及意识丧失。

处理：对接受此类药物治疗的患者应监测并处理不稳定的血流动力学。

8.维拉帕米：

结果：合用可增加心脏传导阻滞的发生率，但这种相互作用的程度及临床意义还需进一步观察。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.建议在硬膜外给药前(初始剂量前)和使用持续导管插入技术增强剂量前使用试验剂量。

2.在血供较少的部位(手指、耳鼻和阴茎等)合用本药和血管收缩药时应谨慎。

3.硬膜外阻滞或骶管阻滞不应使用含有防腐剂的麻醉药。

4.本药与肾上腺素或其他血管收缩药合用时，应避免使用麦角类催产药。

5.正接受单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药治疗的患者使用本药和血管收缩药时应谨慎。

6.头颈区域给药不应超过推荐剂量。

7.高浓度时应加适量的肾上腺素，以减少药物吸收。

8.重复剂量可引起血药浓度升高。

9.本药心脏毒性较大，其引起循环衰竭和惊厥比值较小(CC/CNS=3.7±0.5)，心脏毒性症状出现较早，往往循环衰竭与惊厥同时发生。

10.局麻药可能激发家族性恶性高热。

11.硬膜外给药时不小心注入蛛网膜下腔可致致命的高位或全脊椎麻醉。为预防其并发症，注药前应回抽腰穿针。

**不良反应的处理方法**

如出现严重不良反应，可静脉注射麻黄碱或阿托品。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

1.麻醉时应监测麻醉效应的起始与消退及对疼痛的反应。

2.用药时应监测血压。

3.硬脑膜外给药时应每隔2小时监测胸5-6节段的麻醉程度，以防刺穿硬脑膜导致全脊髓阻滞及呼吸道麻痹。

4.连续输注时，应监测血药浓度。

5.硬膜外给药时，使用3-10分钟后应检查感觉及运动功能是否丧失。

**高警讯药物**

美国安全用药规范研究院(ISMP)将本药定为高警讯药物，使用不当将给患者带来严重危害。

**其他注意事项**

1.本药无外用制剂。

2.药液不宜与金属长期接触。

**【国外专科用药信息参考】**

**精神状况信息**

1.对精神状态的影响：用药后可能引起焦虑和坐立不安。

2.对精神障碍治疗的影响：因可能导致严重的高血压或低血压，正使用吩噻嗪类药、单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药者慎用。

**护理注意事项**

监测患者麻醉区域感觉恢复情况。

**【药物过量】**

**过量的表现**

1.用药过量可出现高血压、抽搐、心搏骤停、呼吸抑制及惊厥。

2.用药过量或误入血管可产生严重的毒性反应，一旦发生心肌毒性则几乎无复苏的可能。

**【药理】**

**药效学**

本药为长效酰胺类局麻药，作用机制与其他局麻药相同，主要是通过抑制神经细胞膜的钠离子通道，阻断神经兴奋与传导。本药起效较慢，持续时间长，其麻醉强度为普鲁卡因的16倍、利多卡因的2-3倍；作用时效是普鲁卡因的8倍，毒性较利多卡因大4倍。

**药动学**

本药注入人体后，首先在注射部位进行局部分布，主要由神经组织摄取，按浓度梯度以弥散方式扩散，其弥散度与盐酸利多卡因相似。一般在给药15-20分钟后达血药峰浓度，作用可维持3-6小时或更长时间。当药物浓度达一定水平时，神经的兴奋与传导被阻断。本药脂溶性较高，总蛋白结合率为95%。主要在肝脏代谢，代谢速度慢，代谢产物为哌可二甲代苯胺(PPX)。由肾脏排泄，5%以原形随尿排出。肝肾功能障碍时，药物代谢受阻，易出现药物蓄积，引发毒性反应。

**遗传、生殖毒性与致癌性**

◆生殖毒性  产科行宫颈旁阻滞后，可导致胎儿心动过缓、缺氧、酸中毒、胎死宫内。

**【制剂与规格】**

盐酸布比卡因注射液  (1)5ml:25mg。(2)5ml:37.5mg。

**【贮藏】**

注射液：遮光，密闭保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 92979 版本 1.0