



# 麻佳因注射液 0 · 5 %

## MARCAINE INJECTION 0.5%

衛署藥輸字 第 017201 號

限由醫師使用

版本日期 2022-08-26

### 1 性狀

#### 1.1 有效成分及含量

一毫升注射液含bupivacaine 5毫克。

#### 1.2 賦形劑

氯化鈉 (張度調節劑)

氫氧化鈉及/或鹽酸，將pH值調整到4.0-6.5

注射用水

#### 配伍禁忌

當pH > 6.5時，bupivacaine的溶解度很低。添加鹼性溶液（如碳酸鹽）時必須考慮到這一點，因為可能會發生沈澱。

#### 1.3 劑型

注射劑。

#### 1.4 藥品外觀

澄清、無色溶液。

### 2 適應症

局部麻醉。

說明：

Bupivacaine適用於多種麻醉技術，包括局部浸潤、大小神經阻斷、硬膜外阻斷及關節鏡檢查。

### 3 用法及用量

#### 3.1 用法用量

本藥限由醫師使用。

應小心避免血管內注射，以防止急性毒性反應。建議在開始注射時及注射期間應小心抽吸。注射大劑量時，如硬膜外阻斷，建議先注射3-5毫升bupivacaine加adrenaline的測試劑量。不小心的血管內注射可由心搏率暫時增加看出。主體劑量應以20-25毫克/分鐘的速度，或以增加劑量的方式緩慢注射之，注射期間不斷與病人保持口頭聯繫。若出現毒性症狀，則應立即停止注射。

避免不必要的高劑量局部麻醉劑。一般而言，完全阻斷大神經的所有神經纖維所需要的藥物濃度比較高。較小的神經或僅需較不強烈的阻斷時（例如消除產痛），可使用較低的濃度。使用的藥量會影響麻醉散佈的程度。長時間的阻斷可使用留置導管來注射或輸注局部麻醉劑。這種技術在硬膜外麻醉很普遍，也可用於臂神經叢麻醉及胸膜間止痛。

仿單最後的劑量表乃是常用麻醉技術的劑量指引。計算需要的劑量時，臨床醫師的經驗，以及對病人身體狀況的了解都非常重要。施行長時間阻斷時，不論是以持續輸注抑或反覆注射給藥，都

必須考慮達到毒性血漿濃度或引起局部神經損傷的風險。到目前為止的經驗顯示，一般成人對於24小時內投與400毫克的耐受性良好。

### MARCAINE之劑量建議

下表的劑量是產生有效阻斷所需之劑量，應被視為一般成人的使用指引。至於作用開始與作用時間，因為個別差異很大，所以並不精確。關於其他區域的局部麻醉技術，請查閱標準教科書。

神經阻斷類型	濃度		劑量		作用開始	作用期間	註解
	毫克/毫升	%	毫升	毫克	分鐘	小時	
局部浸潤	5.0	0.5	≤30	≤150	1-3	4-8	
眼球後	5.0	0.5	2-4	10-20	~5	4-8	參閱注意事項
眼球周圍	5.0	0.5	6-10	30-50	~10	4-8	
肋間 (每條神經)	5.0	0.5	2-3	10-15	3-5	4-8	
胸膜間	5.0	0.5	20	100	10-20	4-8	
臂神經叢：							
腋下鎖骨上、 斜角肌間及 鎖骨下	5.0	0.5	30-40	150-200	15-30	4-8	
血管周圍	5.0	0.5	20-30	100-150	15-30	4-8	
坐骨神經	5.0	0.5	10-20	50-100	15-30	4-8	
三合一 (股神經、閉孔神經及外側皮神經)	5.0	0.5	20-30	100-150	15-30	4-8	
腰椎硬膜外	5.0	0.5	15-30	75-150	15-30	2-3	劑量包括測試劑量
胸椎硬膜外	5.0	0.5	5-10	25-50	10-15	2-3	劑量包括測試劑量

5.0	0.5	20-30	100-150	15-30	2-3	劑量包括測試劑量
-----	-----	-------	---------	-------	-----	----------

#### 4 禁忌

Bupivacaine溶液禁用於已知對醯胺類 ( amide ) 局部麻醉劑或對本品任何賦形劑過敏者。

Bupivacaine溶液亦禁用於靜脈區域麻醉 ( Bier氏阻斷術 )，因為若bupivacaine無意間漏到血液循環中，可能引起急性全身毒性反應。

#### 5 警語及注意事項

##### 5.1 警語/注意事項

使用bupivacaine施行硬膜外麻醉或周邊神經阻斷期間，曾有發生心跳停止或死亡的報告。有些案例即使予以適當的準備及處置，仍難以或無法使其復甦。

Bupivacaine與所有的局部麻醉劑一樣，若在局部麻醉程序中血中濃度過高，可能會引起中樞神經系統與心血管系統的急性毒性反應，特別是在無心的由靜脈注射給藥或注射到血管密佈的區域時。曾有心室心律不整、心室纖維顫動、猝發心血管虛脫及死亡與bupivacaine的高全身濃度有關的報告。

區域麻醉必須在有適當的設備與人員，一切必要的監視和急救設備與藥物可立即取得的區域中進行。施行大阻斷之前，必須先插入靜脈套管，再注射局部麻醉劑。臨床醫師必須受過充分且適當的該項處置之訓練，也必須熟悉副作用、全身性毒性或其他併發症之診斷及治療 ( 參閱【副作用】與【過量】 )。

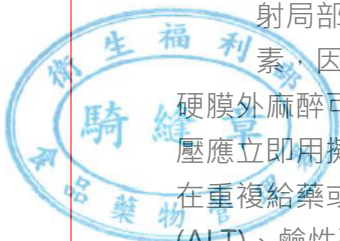
大周邊神經阻斷意指在血管密佈的部位投與大量的局部麻醉劑，這些部位往往靠近大血管，血管內注射及/或全身性吸收的風險增加，可能會造成高血漿濃度。

雖然區域麻醉經常是最好的麻醉技術，下列病人必須特別注意，以減低發生危險副作用的風險：

- 老年人及整體狀況不好的病人。
- 有部分或完全心臟傳導阻斷之病人，因為局部麻醉劑會抑制心肌傳導。
- 有晚期肝病或嚴重腎功能障礙之病人。
- 妊娠後期的病人。
- 接受第三類抗心律不整藥 ( 如amiodarone ) 治療的病人。應密切監視病人的狀況，並考慮監測心電圖，因為心臟作用可能有相加性。

某些局部麻醉過程可能發生嚴重的不良反應，無論使用哪一種局部麻醉劑，例如：

- 中樞神經阻斷可能會造成心血管抑制，尤其是循環血量減少的時候。對於心血管功能不良的病人，施行硬膜外麻醉應小心。
- 眼球後注射偶爾會達到腦蜘蛛膜下腔，造成暫時性失明、心血管虛脫、呼吸暫停及痙攣等。
- 眼球後及眼球周圍注射局部麻醉劑可能有少許持續眼肌功能障礙的風險。主要的原因包括創傷，及/或對肌肉及/或神經的局部毒性作用。這些組織反應的嚴重性與創傷的程度，局部麻醉劑的濃度及組織暴露在局部麻醉劑的時間有關。因此，必須使用最低有效濃度與劑量，和所有局部麻醉劑一樣。血管收縮劑可能會加重組織反應，只有在需要時方可使用。頭頸部注射可能會不小心注射到動脈內，即使是低劑量也可能立即引起腦部症狀。
- 子宮頸旁阻斷麻醉有時會引起胎兒心搏徐緩/心搏過速，因此必須小心監視胎兒的心搏率。
- 麻佳因注射劑並未核准於關節內使用，曾有上市後報告指出，病人在接受術後關節內持續注



射局部麻醉劑後出現軟骨溶解的案例，主要通報案件包含肩關節。雖然這些案例存在多重因素，因果關係尚未確立，麻佳因注射劑仍未核於關節內注射。

硬膜外麻醉可能會導致低血壓和心搏徐緩。這種副作用可藉由注射血管加壓劑來降低風險。低血壓應立即用擬交感神經藥物靜脈注射加以治療，需要時重複給藥。

在重複給藥或長時間輸注bupivacaine後，已觀察到肝功能不全伴隨可逆性的丙胺酸轉胺酶 (ALT)、鹼性磷酸酶 (ALP) 和膽紅素升高。少數文獻曾報導bupivacaine與藥物性肝損傷 (DILI) 發展之間的關聯性，特別是在長期使用bupivacaine。雖然這種反應的病理生理學仍不清楚，但立即停用bupivacaine即可顯示快速的臨床改善。如果在bupivacaine給藥期間觀察到肝功能不全的跡象，則應停止使用。

### 5.3 操作機械能力

除了直接的麻醉作用之外，局部麻醉劑即使沒有明顯的中樞神經毒性，也會對精神功能和協調功能產生非常輕微的影響，可能暫時削弱行動和警覺性。

## 6 特殊族群注意事項

### 6.1 懷孕

認為已經有許多孕婦及育齡婦女使用過bupivacaine，是相當合理的；但到目前為止，還沒有特定生殖過程障礙（例如增加胎兒畸形之發生率）之報告。

由局部麻醉劑引起的胎兒副作用（例如胎兒心搏徐緩），在施行子宮頸周圍阻斷麻醉時最明顯。這種反應可能是高濃度的麻醉劑達到胎兒體內造成的。

### 6.2 哺乳

Bupivacaine和其他局部麻醉劑一樣，會進入母親的乳汁中，但如此之微量通常對新生兒並無危險性。

## 7 交互作用

對於正在接受其他局部麻醉劑或化學結構類似醯胺類局部麻醉劑的藥物（例如某些抗心律不整藥如lidocaine、mexiletine和tocainide）治療的病人，使用bupivacaine時須謹慎，因為毒性反應有相加性。未曾進行bupivacaine與第三類抗心律不整藥（如amiodarone）的交互作用研究，但應小心。

## 8 副作用/不良反應

### 8.1 臨床重要副作用/不良反應

一般

本藥的不良反應與其他長效局部麻醉劑近似。藥物本身引起的不良反應難以與神經阻斷的生理作用（如血壓降低、心搏徐緩）、針穿刺造成的直接事件（如神經損傷）或間接事件（如硬膜外膿瘍）區別。

藥物不良反應表

很常見 ( >1/10 )	血管障礙：低血壓 胃腸障礙：噁心
常見 ( >1/100 <1/10 )	神經系統障礙：感覺異常、頭暈 心臟障礙：心搏徐緩 血管障礙：高血壓 胃腸障礙：嘔吐



	腎與泌尿障礙：尿液滯留
少見 ( >1/1,000 <1/100 )	神經系統障礙：中樞神經系統毒性的症狀與徵候：( 痙攣、嘴唇周圍感覺異常、舌頭麻木、聽覺過敏、視覺障礙、喪失意識、肌肉震顫、頭昏、耳鳴、構音困難 )
罕見 ( <1/1,000 )	免疫系統障礙：過敏反應、過敏性反應/休克 神經系統障礙：神經病變、周邊神經損傷、蜘蛛膜炎、輕度癱瘓與半身不遂 眼障礙：複視 心臟障礙：心跳停止、心律不整 呼吸障礙：呼吸抑制

### 急性全身毒性

全身毒性反應主要發生在中樞神經系統 ( CNS ) 與心血管系統 ( CVS )。Bupivacaine若因意外的血管內注射、用量過高、或從血管密佈區域不尋常的快速吸收以致血中濃度過高，便可能會引起急性毒性反應 ( 參閱【注意事項】 )。中樞神經系統反應與所有醃胺類局部麻醉劑類似，而心臟反應在質與量上都則視藥物而定。

中樞神經系統的毒性是一種層次分明的反應，其症狀與徵候會逐漸加重。最初的症狀通常是嘴唇周圍感覺異常、舌頭麻木、頭昏、聽覺過敏、耳鳴、視覺障礙。構音困難、肌肉抽搐或震顫是比較嚴重的症狀，其後即為全身痙攣。這些症狀絕對不可被誤判為神經過敏反應。接著可能發生意識喪失及癲癇大發作痙攣，可能持續幾秒至幾分鐘。痙攣之後，由於肌肉的活動增加，再加上干擾正常呼吸且呼吸道功能可能喪失，以致很快就發生缺氧及血碳酸過多。嚴重時可能會導致呼吸停止。酸中毒性高血鉀、低鈣血症和缺氧會加強並擴大局部麻醉劑的毒性作用。

局部麻醉劑由中樞神經系統再分佈與代謝之後，便可恢復正常。除非投予大量的藥物，否則很快即可恢復。

嚴重的案例可以觀察到對心血管系統的毒性，而且通常會先出現中樞神經系統毒性的徵候。處於重度鎮靜狀態下或正在接受全身麻醉的病人，可能沒有前驅中樞神經系統症狀。局部麻醉劑的全身濃度過高時可能引發低血壓、心搏徐緩、心律不整，甚至心跳停止，但極少數案例未出現任何前驅中樞神經系統症狀，便發生心跳停止。

### 急性毒性之治療

出現急性全身毒性時，必須立刻停止注射局部麻醉劑。中樞神經系統症狀 ( 痙攣，中樞神經系統抑制 ) 必須立即用適當的呼吸道/呼吸支持並給予抗痙攣劑加以治療。

出現心血管抑制時 ( 低血壓、心搏徐緩 )，應考慮給予靜脈輸液、增壓劑、心肌收縮劑，和/或視需要給予脂肪乳劑做適當的治療。

血液循環停止時，應立即施行心肺復甦術，提供適度的氧氣及換氣、維持循環系統，以及治療酸中毒，都是維持生命的必要措施。

萬一發生心跳停止，必須延長急救才能有好的成果。

## 9 過量

意外將局部麻醉劑注入血管內會立即 ( 幾秒至幾分鐘 ) 引起全身毒性反應。如果是用藥過量，全身毒性出現得比較晚 ( 注射後16-60分鐘 )，因為局部麻醉劑血中濃度增加得比較慢。

## 10 藥理特性

藥物治療學分類 ( ATC碼 )：N01B B01



Bupivacaine是長效型醃胺類局部麻醉劑，兼具麻醉與止痛作用。在高劑量時，有手術麻醉作用；但在低濃度時，會產生感覺神經阻斷作用（止痛），對運動神經纖維的阻斷作用比較小。

Bupivacaine局部麻醉作用的開始及作用期間，視使用的劑量和給藥部位而定。

## 10.2 藥效藥理特性

Bupivacaine和其他局部麻醉劑一樣，藉阻止鈉離子經過神經細胞膜之向內移動，可逆性地阻斷神經衝動沿著神經纖維傳播。神經細胞膜的鈉離子通道被認為是局部麻醉劑的接受體。

局部麻醉劑對其他能被興奮的細胞膜可能有類似作用，例如在腦與心肌的細胞。如果達到體循環的藥物過多，就會出現中樞神經系統和心血管系統的毒性症狀與徵候。

中樞神經系統毒性的徵候通常比心血管系統毒性早出現，因為中樞神經系統毒性發生在較低的血漿濃度。局部麻醉劑對心臟的直接作用包括減緩傳導，減弱心肌的收縮力，最後心跳停止。由硬膜外給藥後，可能會出現間接的心血管作用（低血壓、心搏徐緩），視所伴隨之交感神經阻斷的程度而定。

## 10.3 臨床前安全性資料

目前尚無資訊。

## 11 藥物動力學特性

目前尚無資訊。

## 12 臨床試驗資料

目前尚無資訊。

## 13 包裝及儲存

### 13.1 包裝

參閱外包裝。

### 13.2 效期

參閱外包裝。

### 13.3 儲存條件

25°C以下儲存，不可冷凍。

## 14 病人使用須知

使用與處理說明：

本溶液不含防腐劑且容器打開後應立即使用。剩餘的溶液應棄置不用。

本藥不建議再滅菌。

## 15 其他

版本編號

BUPI-2022-08-1

CCDS vNov2020

製造廠

RECIPHARM MONTS

18 RUE DE MONTBAZON, F-37260 MONTS, FRANCE

111.08.26



台北市大安區敦化南路二段207號20樓