核准日期:2006年07月13日
修改日期:2013年02月20日
2017年04月10日
2020年10月15日
2021年07月06日

恩华 蒙安达

# 甲磺酸罗哌卡因注射液说明书

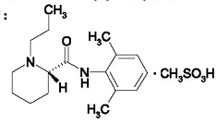
**请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。**

【药品名称】

通用名称：甲磺酸罗哌卡因注射液
商品名称：蒙安达
英文名称：Ropivacaine Mesilate Injection
汉语拼音：Jiahuangsuan Luopaikayin Zhusheye

【成份】

主要成份：甲磺酸罗哌卡因；
辅料：氯化钠、注射用水。
甲磺酸罗哌卡因其化学名称为(S)-N-(2，6-二甲基苯基)-1-丙基-2-哌啶甲酰胺甲磺酸盐。
其化学结构式为：



分子式：$C_{17}H_{26}N_2O \cdot CH_3SO_3H$
分子量：370.51

【性状】

本品为无色的澄明液体。

【适应症】

外科手术麻醉：
硬膜外麻醉（包括剖宫产术硬膜外麻醉）；
局部浸润麻醉。
急性疼痛控制：
用于术后或分娩镇痛，可采用持续硬膜外输注，也可间歇性用药；
局部浸润麻醉。

【规格】

10ml:89.4mg (以甲磺酸罗哌卡因计)

【用法用量】

| | 浓度 (mg/ml) | 容积 (ml) | 剂量 (mg) | 起效时间 (min) | 持续时间 (hr) |
|---|---|---|---|---|---|
| 外科手术麻醉 | | | | | |
| 腰椎硬膜外腔阻滞 | 5.96 | 15-30 | 89.4-178.8 | 15-30 | 2-4 |
| 麻醉 | 8.94 | 15-25 | 134.1-223.5 | 10-20 | 3-5 |
| （外科手术） | 11.92 | 15-20 | 178.8-238.4 | 10-20 | 4-6 |
| 腰椎硬膜外腔阻滞麻醉 | 5.96 | 20-30 | 119.2-178.8 | 15-25 | 2-4 |
| （剖宫手术） | 8.94 | 15-20 | 134.1-178.8 | 10-20 | 3-5 |
| 胸椎硬膜外腔阻滞麻醉 | 5.96 | 5-15 | 29.8-89.4 | 10-20 | |
| （外科手术） | 8.94 | 5-15 | 44.7-134.1 | 10-20 | |
| 神经干阻滞 | 5.96 | 35-50 | 208.6-298 | 15-30 | 5-8 |
| （如臂丛麻醉） | 8.94 | 10-40 | 89.4-357.6 | 10-25 | 6-10 |
| 浸润麻醉（做小神经阻滞或局部浸润麻醉） | 5.96 | 1-40 | 5.96-238.4 | 1-15 | 2-6 |
| 分娩镇痛 | | | | | |
| 腰椎硬膜外腔阻滞麻醉 | | | | | |
| 初始剂量 | 2.39 | 10-20 | 23.9-47.8 | 10-15 | 0.5-1.5 |
| 维持剂量 | 2.39 | 6-14ml/h | 14.34-33.46mg/h | | |
| 追加剂量 | 2.39 | 10-15ml/h | 23.9-35.85 mg/h | | |
| 术后镇痛 | | | | | |
| 腰椎硬膜外腔阻滞麻醉持续输注 | 2.39 | 6-14ml/h | 14.34-33.46mg/h | | |
| 胸椎硬膜外腔阻滞麻醉持续输注 | 2.39 | 6-14ml/h | 14.34-33.46mg/h | | |
| 浸润麻醉 | 2.39 | 1-100 | 2.39-239 | 1-5 | 2-6 |
| | 5.96 | 1-40 | 5.96-238.4 | 1-5 | 2-6 |

【不良反应】

罗哌卡因的不良反应和其它长效酰胺类的局麻药是类似的。除了不小心注射进血管或过量等意外事件，局麻的副反应几乎是少见的。要将其与阻滞神经本身引起的生理反应相区别，如硬膜外麻醉时的血压下降和心动过缓。用药过量和不小心注射入血管可能引起严重的全身反应。过敏反应：对酰胺类的局麻药来说是很少见的（最严重的过敏反应是过敏性休克）。神经并发症：神经系统的疾病以及脊柱功能不良（如前脊柱血管综合症，蛛网膜炎马尾综合症）和区域麻醉有关，而和局部麻醉药几乎无关。急性全身性毒性：只有在高剂量或意外将药物注入血管内而使药物血浆浓度骤然上升或者是药物过量的情况下，罗哌卡因才会造成急性毒性反应。曾有一例患者因作臂神经丛阻断时，无意中将200mg药物注入血管内后，发生惊厥。大部分和麻醉有关的不良反应都和神经阻滞的影响和临床情况有关，很少和药物的反应有关。在临床研究治疗中病人低血压发生率为39%，恶心的发生率为25%。一般临床报道不良反应（＞1%）是低血压、恶心、心动过缓、焦虑、感觉减退。

【禁忌】

① 对酰胺类局麻药过敏者禁用。
② 严重肝病患者慎用。
③ 低血压和心动过缓者慎用。
④ 慢性肾功能不全伴有酸中毒及低血浆蛋白患者慎用。
⑤ 年老或伴其它严重疾患即需施用区域麻醉的患者，在施行麻醉前应尽力改善患者状况，并适当调整剂量。

【注意事项】

区域麻醉的实施必须在人员和设备完善的基础上进行。用于监测和紧急复苏的药物和设备应随手可得。在实施较大麻醉前应先给病人建立静脉通路。有关临床医务人员应进行适当的培训并能熟悉副作用、全身毒性和其它并发症的诊断和治疗。

有些局部麻醉如头颈部的注射，严重不良反应的发生率较高，而与所有的局麻药无关。对于年老或伴有其它严重疾患而需施用区域麻醉的病人，应特别注意。为降低严重不良反应的潜在危险，在施行麻醉前，应尽力改善病人的状况，药物剂量也应随之调整。

由于罗哌卡因在肝脏代谢，所以严重肝病患者应慎用，由于药物排泄延迟，重复用药时需减少剂量。通常情况下肾功能不全病人如用单一剂量或短期治疗不需调整用药剂量。慢性肾功能不全患者伴有酸中毒及低蛋白血症，发生全身性中毒的可能性增大。

硬膜外麻醉会产生低血压和心动过缓，如预先输液扩容或使用血管性增压药物，可减少这一副作用的发生，低血压一旦发生可以用5-10mg麻黄素静脉注射治疗，必要时可重复用药。

对驾驶及操作机械的影响：即使没有明显的中枢神经系统毒性，局部麻醉会轻微的影响精神状况及共济失调，还会暂时损害运动和灵活性，这些作用与剂量有关。

药品未加防腐剂只能一次性使用，任何残留在打开容器中的液体必须抛弃。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

妊娠

关于孕妇使用罗哌卡因后对胎儿生长的影响尚无临床实验，建议慎用。

分娩时使用罗哌卡因作为产科麻醉或镇痛已有充分的实验报告，未见任何副作用。

哺乳

在人乳中罗哌卡因或其代谢物的分泌状况未曾研究。根据大鼠实验中乳汁/血浆浓度的比值，估计幼鼠日摄入量为其母鼠剂量的4%。假设在人类乳汁/血浆浓度比值与大鼠相同，则母乳哺育的婴儿所摄入罗哌卡因的量较妊娠时有孕妇子宫中接受的剂量要低得多。

【儿童用药】

本品目前尚无研究资料。

【老年用药】

参见【用法与用量】，或遵医嘱。

【药物相互作用】

接受其它局麻药或与酰胺类结构相关的药治疗的病人如同时使用罗哌卡因注射液应小心谨慎，因为毒性作用是可以累加的。

【药物过量】

急性全身性毒性：意外将局麻药注入血管，可能立即产生毒性反应。当给药过量时需要1-2小时才达到血浆峰值浓度，达峰时间取决于注射部位。因此中毒症状会延迟出现。全身性中毒反应可能包括中枢神经系统和心血管系统。中枢神经系统中毒是通过逐渐加重的症状和体征逐步反应出来。最先出现的症状是视觉和听觉受干扰，口周麻木、头昏、轻微头痛，麻刺感，和平衡失调。语言障碍、肌肉僵直和肌肉震颤是非常严重的症状，可能是惊厥急性发作的先兆。这些症状不要和神经官能症行为相混淆。这些症状出现后，会出现意识丧失和癫痫在发作的惊厥，时间持续几秒钟至几分钟。由于突然惊厥引起的肌肉活动增加和对呼吸的影响，会立即产生缺氧和碳酸过多的症状，在有些情况下会出现窒息。呼吸和代谢性酸中毒会增加局麻的毒性作用。局麻药物通过中枢神经系统和代谢途径的重新分布，使机体得到恢复。一般来说，只要未注射大量的药物，机体就可以很快得到恢复。发生心血管系统中毒情况更为严重，全身高浓度局麻药会引起低血压、心动过缓、心律失常甚至心跳停止。在志愿者静脉注射罗哌卡因会引起心脏传导和心肌收缩抑制的症状。除非病人使用一般的麻醉药或大量的镇静剂如安定、巴比妥钠，中枢神经系统中毒的现象一般会在心血管毒性作用产生前出现。急性中毒的治疗：如果出现急性全身中毒的现象必须立即停止注射局麻药。如果发生惊厥，必须治疗。治疗的目的是供氧，中止惊厥和维持体循环。必要时可给予面罩供氧来辅助通气。如果在15-20秒内惊厥没有自动停止，必须静脉给予抗惊厥药。静脉注射100-150mg硫喷妥钠可快速中止惊厥发作，也可选择起效缓慢的安定5-10mg静脉注射。琥珀酰胆碱能很快地中止肌肉抽搐，但病人需要气管插管和控制通气。如果确实出现心血管系统抑制症状（如低血压、心动过缓），可静注5-10mg麻黄素，必要时2-3分钟后重复推注。如果出现循环衰竭，必须立即进行心脏复苏，适当供氧、通气和维持循环以及治疗酸中毒，对抢救生命是特别重要的。

【药理毒理】

药理作用

罗哌卡因为酰胺类局麻药，可能通过升高神经动作电位的阈值，延缓神经冲动的扩布，降低动作电位升高的速度，发挥阻断神经冲动的产生和传导的作用。麻醉作用的产生与神经纤维的轴径、髓鞘形成和传导速度有关。

毒理研究

遗传毒性：体外小鼠淋巴瘤试验显示罗哌卡因具有微弱的致突变作用。但其它遗传毒性试验结果均为阴性，提示体外小鼠淋巴瘤试验的结果可能不会在体内出现。

生殖毒性：雄鼠从交配前9周，雌鼠从交配前2周开始皮下给予罗哌卡因，直至交配后第42天，剂量为23mg/kg/天，大鼠的生育力和一般生殖行为没有受到明显影响，但由于罗哌卡因对孕鼠的毒性，产后3天内幼仔的死亡数增多。大鼠和家兔在致畸敏感期皮下注射罗哌卡因，剂量最高分别达到26mg/kg/天和13mg/kg/天（按体表面积折算约为人用最大剂量的1/3），未见罗哌卡因具有致畸作用。大鼠在围产期皮下给予罗哌卡因，剂量最高达26mg/kg/天，未见胎仔的后期发育、分娩、哺乳以及仔鼠的生存力和生长受到明显影响。根据大鼠试验中乳汁/血浆药物浓度的比值，幼鼠的罗哌卡因日摄入量为母鼠剂量的4%。

【药代动力学】

据文献资料：罗哌卡因的pKa为8.1，分布率为141（25℃n-辛醇/磷酸盐缓冲液PH7.4）。罗哌卡因的血浆浓度取决于剂量、用药途径和注射部位的血管分布。罗哌卡因符合线性代学，最大血浆浓度和剂量成正比。罗哌卡因从硬膜外的吸收是完整的和双相的，其半衰期顺序分别为14分钟和4小时。缓慢吸收是清除罗哌卡因的限速因子，这可以解释为什么硬膜外用药比静脉用药清除半衰期要长。罗哌卡因总血浆清除率440ml/min。游离血浆清除率为8L/min。肾脏清除率为1ml/min，稳定状态的分布容积47L，终末半衰期为1.8hr。罗哌卡因经肝脏中间代谢率为0.4。罗哌卡因在血浆中主要和α1-酸糖蛋白结合，非蛋白结合率为6%。当连续硬膜外注射时，可观察到罗哌卡因总的血浆浓度的增加和手术后α1-酸糖蛋白浓度的增加有关，未结合的（药理学活性）浓度的变化比总血浆浓度的变化要小。罗哌卡因易于透过胎盘，相对非结合浓度而言很快达到平衡。与母体相比胎儿体内罗哌卡因与血浆蛋白结合率程度低，从而使胎儿的总血浆浓度也比母体的低。罗哌卡因主要是通过芳香羟基化作用而充分代谢，静脉注射后总剂量的86%通过尿液排出体外，其中仅1%与未代谢的药物有关。主要代谢物是3-羟基罗哌卡因，其中约37%以结合物形式从尿液中排泄出来，尿液中排泄出的4-羟基罗哌卡因，N-去烷基代谢物和4-羟基去烷基代谢物约为1-3%。结合的和非结合的3-羟基罗哌卡因在血浆中仅显示可测知的浓度。3-羟基罗哌卡因和4-羟基罗哌卡因有局麻作用，但是麻醉作用比罗哌卡因弱。罗哌卡因在体内没有消旋作用的证据。

【贮藏】

遮光、密闭保存。

【包装】

安瓿，5支/盒。

【有效期】

24个月

【执行标准】

$WS_1$-XG-021-2016

【批准文号】

国药准字H20052621

【上市许可持有人】

药品上市许可持有人：江苏恩华药业股份有限公司
注册地址：徐州经济技术开发区杨山路18号

【生产企业】

企业名称：江苏恩华药业股份有限公司
生产地址：徐州高新技术产业开发区
邮政编码：221000
电话号码：4009002262
传真号码：0516-87767118
网　　址：www.nhwa-group.com