

65. 局所麻酔薬の血中濃度

From MY point of view

- 投与部位により最高血中濃度や、持続時間などが異なり、血中濃度の上昇にタイムラグが生じる。
- 局所麻酔薬の血中濃度上昇に伴い段階的に中枢神経症状が出現することが知られている。^(1 付録)
- 血中濃度に影響を与える因子: 麻酔薬の量、ブロックの種類(投与部位)、麻酔薬の特性(脂溶性・タンパク結合率)、低タンパク症、アシドーシス、アドレナリン添加の有無
- 局所麻酔薬を使用する場合には必ず局所麻酔薬中毒を頭の片隅に。

出典 1)勉強会 25 回参照 2)麻酔科トラブルシューティング AtoZ 3)LisaVol.25 No.6 2018 4)周術期超音波ガイド下神経ブロック 改訂第2版

- 局所麻酔薬の作用において、pKa は作用発現時間に脂溶性が効力にタンパク結合率が作用時間に関係する。
- ボランティア健康成人男性に局所麻酔薬を持続静脈投与して、中枢神経毒性の初発症状が出現する血中リドカイン濃度は $5 \mu\text{g/ml}$ 程度。同様の実験による痙攣閾値は $10\text{--}15 \mu\text{g/ml}$ であった。⁽²⁾
- しかし、偶発的血管内注入では、短時間で血中濃度が上昇する可能性がある。⁽²⁾
- リドカインの局所麻酔薬中毒の血中濃度は $5\text{--}10 \mu\text{g/ml}$ で発現されるとされるが、脳への動脈血管内に、1%リドカインで 0.069ml 注入するだけでその濃度に達することが推測される。⁽³⁾
- 局所麻酔薬の血中濃度は注入後しばらくして上昇する。(下記表参照)。⁽⁴⁾
- 20 万倍エピネフリン添加は、局所麻酔薬の血中への吸収を抑え、血中濃度の 10-30%減少させる。
- 神経ブロック後、30 分程度は局所麻酔薬中毒の可能性に注意して観察する必要がある。
- 肋間神経ブロックは血中濃度上昇が起こりやすい。

麻酔薬	麻酔法	投与量 (mg)	C _{max} (μg/mL)	T _{max} (min)	血中中毒量 (μg/mL)
リドカイン	肋間神経	400	6.8	15	5
	硬膜外	400	4.27	20	
	腕神経叢	400	4.00	25	
	腹横筋膜面 ⁽⁹⁾	400	3.6	30	
メピバカイン	肋間神経	500	8.06	9	5
	硬膜外	500	4.95	16	
	腕神経叢	500	3.68	24	
	坐骨・大腿神経	500	3.59	31	
ブピバカイン	肋間神経	140	0.90	30	3
	硬膜外	150	1.26	20	
	腕神経叢	150	1.0	20	
	坐骨・大腿神経	400	1.89	15	
ロピバカイン	肋間神経	140	1.10	21	4
	硬膜外	150	1.07	40	
	腕神経叢	190	1.3	53	
	腹横筋膜面 ⁽¹⁰⁾	3 (mg/kg)	2.54	30	
レボブピバカイン	硬膜外	75	0.36	50	4
	腕神経叢	250	1.2	55	

C_{max}: 最高血中濃度, T_{max}: 最高血中濃度に至る時間.

薬物	分子量	解離定数	脂溶性*	タンパク結合率 (%)
リドカイン	234	7.9	366	64
メピバカイン	246	7.6	130	77
ロピバカイン	262	8.1	775	94
ブピバカイン	288	8.1	3420	95

* 脂溶性はオクタノール緩衝剤分配係数 (高いほど脂溶性が高い) を示す