

靜注用苦息樂卡因2%注射液

Xylocaine® 2% for Intravenous Injection

28049021

本藥限由醫師使用
衛署藥輸字第020932號



貯法：保存於25°C以下

使用期限：標示於外盒等(製造後3年)

【禁忌】(下列患者請勿給藥)

- (1) 有嚴重刺激傳導障礙(完全房室阻斷等)的患者(會有引起心跳停止之虞)
- (2) 以前有過因本藥或Anilide類局部麻醉劑而引起過敏症的患者。

【組成、性狀】

Xylocaine		靜注用2%
成分含量	1mL中Lidocaine HCl	20mg
	1管中Lidocaine HCl	5mL 中100mg
劑型		注射劑
外觀		玻璃安瓿裝 (One-point cut) 無色澄明液
pH		5.0~7.0
滲透壓比(對生理食鹽水之比)		約1

【適應症】

心室性不整律之急性治療

【用法、用量】

靜脈一次給藥法

通常成人一次50~100mg(1-2mg/kg)(2%注射液2.5~5mL)以1~2分鐘的時間,緩慢地靜脈注射。效果不彰時,在5分鐘後給與相同的劑量。另外,期待效果得以持續時,以間隔10~20分鐘的時間追加給與相同的劑量也無妨,但是1小時內最高的基準給藥量是300mg(2%注射液:15mL)。

本藥靜脈注射的效果,一般在10~20分鐘後消失。

【使用上之注意事項】

1. 慎重給藥(對下列患者應慎重給藥)

- (1) 有輕度刺激傳導障礙的患者(會有引起高度的傳導障礙之虞)。
- (2) 有顯著的竇性心搏過慢的患者(會有引起症狀惡化之虞)。
- (3) 低血容的患者、在休克狀態的患者、或者有心臟衰竭的患者(會有引起心跳停止之虞)。
- (4) 有嚴重的肝功能或腎功能障礙的患者(會因代謝遲緩而有引起血漿中濃度上升之虞)。
- (5) 老年人(請參照「對老年人的給藥」欄)。

2. 重要的基本注意事項

- (1) 為避免給藥過量,須儘可能(點滴給藥時一定需要)在頻繁的血壓測量和心電圖的連續監看下給藥。
- (2) 與Disopyramid(抗心律不整藥)與Terfenadine併用,可能與QT延長、心室性心律不整產生有關。

3. 交互作用

併用注意(併用時注意事項)

藥品名	臨床症狀及處置方法	作用機轉及危險因子
Cimetidine	曾有使Lidocaine之血中濃度上升的報告。	由於Cimetidine對肝臟中代謝酵素之抑制作用,因此Lidocaine之代謝被認為會受到抑制。
Metoprolol, Propranolol	有使Lidocaine的血中濃度上升的現象。	降低心輸出量及肝臟血流,因此Lidocaine之代謝被認為會受到延遲。
Ritonavir	Lidocaine之AUC預期會增加。	由於在肝臟中代謝酵素之競爭性抑制,因此Lidocaine之代謝被認為會受到延遲。

4. 副作用

因為未實施使用成績調查等能使發生率變得明確的調查,故副作用的發生率並不清楚。

(1) 重大的副作用

- 1) 傳導系統的阻滯及休克：偶有PQ間期拉長或QRS複合波變寬等刺激傳導系統的阻滯,或發生血壓降低、休克、心搏過慢等,罕有招致心臟停止跳動。
- 2) 惡性高燒：罕有出現伴隨原因不明之心搏過速、心律不整、血壓變化、體溫急劇升高、肌肉強直、血液變暗紅色(發紺)、呼吸過度、發汗、酸中毒、高鉀血症、肌球蛋白尿(葡萄酒顏色的尿)等現象之嚴重惡性高燒。在使用本藥之中,有認出這類與惡性高燒有關之症狀時,應立即中止給藥,並採取靜脈注射Dantrolene Sodium,退燒、用純氧過度換氣、矯正酸鹼平衡等之適當處置。另外,本症可能會繼續發腎衰竭,故應謀求排尿量之維持。
- 3) 中樞神經系統：若出現震顫、痙攣等情形時,須立即中止給藥,同時施行人工呼吸、吸入氧氣等的處置,並給與超短效型的巴比妥類製劑。

(2) 其他的副作用

	發生率不明
中樞神經 ^註	瞻妄、眩暈、嗜睡、不安、欣快感、嘔吐、麻痺感

註) 在出現這類症狀時,須停藥或減量,並視其必要情況採取適當的處置。

5. 對老年人的給藥

本藥主要由肝臟代謝,由於老年人多半有肝機能衰退的情形,因此有血中濃度升高的可能性,可能會發生如震顫、痙攣等中毒症狀,當本藥是以連續靜脈輸注的方式給予,應留意用量慎重給藥。

6. 孕婦、產婦、授乳婦的給藥

對孕婦或可能已懷孕的婦女,限於判斷其治療上的有益性超越危險性時才可給藥 [有關懷孕中給藥的安全性尚未確立]。

7. 應用時的注意事項

- (1) 給藥時：有高度的實性心搏過慢,或房室阻斷等的心搏過緩性之心律不整,同時伴有心室性心搏過速時,使用人工心搏調節器增加心跳速率,須使用(期外收縮、心搏過速)本藥。
- (2) 調配時：因本劑中的Lidocaine是鹽酸鹽,將本藥與碳酸氫鈉等鹼性注射液混合時會使Lidocaine析出,因此請勿將其混合使用。
- (3) 切割安瓿時,為避免玻璃碎片掉入,安瓿銼鋸後,須用酒精棉等擦拭乾淨後再行截斷。

【藥效藥理】

1. 局部麻醉作用

其表面、浸潤和傳導的麻醉作用,經多年來眾多的基礎、臨床試驗,效果已被確認¹⁾。

2. 抗心律不整作用²⁻⁴⁾

- (1) 對於因冠狀動脈結紮、給與Digitalis、Epinephrine 機械性刺激等的因素而產生之心律不整,分別顯示有強力的抑制作用。
- (2) 在麻醉的狗電氣刺激所作的實驗結果,提高了心室纖維顫動的閾值。

3. 對循環系之其他作用⁵⁻⁷⁾

在2mg/kg以下的靜脈給藥下,對於狗之血壓、心收縮力、心跳速率、冠狀動脈血流量等之作用,顯示並無作用或僅略微增加。另一方面,在2mg/kg以上則顯示有輕度的減少現象。另外,在人體,與Procainamide之比較結果,XYlocaine之心臟機能抑制作用比Procainamide弱。

4. 作用機轉

經由阻斷心臟神經細胞上之鈉離子通道, lidocaine減緩動作電位之昇高速率,降低心房/心室傳導性,延遲去活性鈉離子通道之復原,並延長相關反拗期。

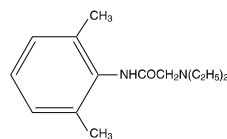
【關於有效成分的理化學性質】

一般名： Lidocaine (JAN)

(Lidocaine: WHO 建議之INN)

化學名： 2-diethylamino-N-(2,6-dimethylphenyl)acetamide

構造式：



分子式： C₁₄H₂₂N₂O

分子量： 234.34

融點： 66~69°C

性狀： Lidocaine 為白色~淡黃色的結晶或結晶性粉末。

具極淡的特異臭味,味微苦,會麻舌。極易溶於甲醇或乙醇(Ethanol),易溶於冰醋酸及乙醚(Ether),幾不溶於水。可溶於稀鹽酸。

【賦形劑清單】

Sodium Chloride, Sodium hydroxide q.s., pH 6.0-7.0, Water for injections.

【包裝】

靜注用 2% : 5mL X 10管 (安瓿)。

【主要文獻】

1. Wiedling, S.: Anaesthetist, 1 119 (1952)
2. Allen, J.D., et al.: Amer. J. Cardiol., 28 555 (1971)
3. Allen, J.D.: Brit. J. Pharmacol., 42 1 (1971)
4. Hitchcock, P.: Fed. Proc., 17, 378 (1958)
5. Bloor, C. M.: Circulation, 40 (Suppl.3), 47 (1969)
6. Thomsen, J. H.: Arch. Int. Pharmacodyn., 194 83 (1971)
7. Harrison, D. C., et al.: Circulation, 28 486 (1963)

【修訂日期】

2013年6月

製造廠： Genexi

廠址： 52, rue Marcel et Jacques Gaucher, 94120 Fontenay-sous-Bois, France

藥商： 安沛國際有限公司

地址： 台北市敦化南路二段207號20樓