

苦息樂卡因® 注射液 2%

衛署藥輸字第 021497 號

Xylocaine® Injection 2%

Lidocaine hydrochloride

注射用溶液劑

組成

每毫升溶液劑中，含有 20 毫克之 lidocaine hydrochloride。所含之輔藥，請參閱「賦形劑內容表」。

劑型

Xylocaine 注射用溶液劑為無菌、等張水狀溶液。此溶液劑之酸鹼度為 5.0 至 7.0。以藥水瓶 (vial) 包裝者，則含有保存劑，可供多次劑量使用。

適應症

局部麻醉

劑量及給藥法

本藥限由醫師使用。

注射時應特別小心，以免不慎打到靜脈之內，而引起急性毒性反應。建議在注射前及注射中應時常謹慎地倒抽一下。當要給予較大之劑量時，如硬膜外阻斷時，建議應以含有腎上腺素之 lidocaine 3-5 毫升先行測試病人反應。若不慎打到靜脈之內，可藉其使心跳暫時性增加來察覺。

主要劑量應以每分鐘 100 至 200 毫克之速率緩慢注射，或在增加劑量時，持續與病人交談。若發生毒性反應，應立即停止注射。

一般而言，要完全阻斷較大神經所有神經末梢時，需要使用較高之濃度；而當阻斷所需之強度較小時（如分娩疼痛之解除），則使用較低之濃度即可。藥物使用之容積會影響麻醉分佈之範圍。

使用含有腎上腺素之溶液劑，可增加其作用之時間（參閱劑量表）。

在本仿單末端之劑量表，列出常用之麻醉技術對一般成人之建議劑量，以供參考。在計算需求劑量時，醫師之經驗及病人身體狀況之相關資訊，均相當重要。當長時間使用阻斷麻醉時，如採用重覆給藥之方式，應考量藥物在血漿之濃度到達中毒濃度，或導致局部神經傷害之危險性。

禁忌症

已知對醯胺類(amide)麻醉劑，或溶液劑中其他成份（如含有腎上腺素溶液劑中之 methylparahydroxybenzoate 或 sodium metabisulphite)會發生過敏反應者。

已知對甲基及丙基對羥基苯甲酸酯（methyl-/propyl paraben），或對其代謝物對氨基苯甲酸（PABA）過敏者。對於酯類局部麻醉劑或其代謝物 PABA 過敏之病患應避免使用含有對羥基苯甲酸酯之 lidocaine 配方。

使用上需特別提醒及注意之事項

區域或局部麻醉程序，應在有適當設備及人員之場所實施，急救及監視所需之藥物及設備，應備妥且可立即使用。當實施大型阻斷麻醉時，在注射局部麻醉劑之前，應先插妥靜脈存留導管組。醫師對要施行之程序，應已接受適當及特定之訓練，且對副作用之診斷及全身性毒性，或其他併發症之治療相當熟悉（參閱劑量過度）。

有些局部麻醉之程序可能與嚴重之不良反應有關，但與其使用那一種局部麻醉劑無關，如：

- 中樞神經阻斷，可引起心血管之抑制，尤其在血容積不足之時。硬膜外麻醉施用於心血管功能已受損之病人時，應特別小心。
- 眼球後注射時，藥物非常可能會到達蜘蛛膜下腔，引起暫時性之目盲、心血管崩潰、呼吸暫停、痙攣等。這些狀況必須迅速地診斷及治療。眼球後或眼球周圍注射局部麻醉劑時，有相當低之機率，會引起永久性眼肌功能不良。其主要原因包肌肉及（或）神經，受到傷害及（或）局部毒性作用所致。此類組織反應之嚴重度，與其受傷害之程度、局部麻醉劑之濃度及組織暴露在局部麻醉劑之時間長短均有關。基於這個理由，如同使用其他局部麻醉劑一樣，應使用能產生效果之最低濃度及最小劑量。血管收縮劑及其他添加物可能會加重組織之反應，故僅在必要時才使用。
- 頭頸部區域之注射，可能會不小心打到動脈之內，即使是小劑量下，亦可引起腦部之症狀。
- 子宮頸周圍阻斷，有時會引起胎兒心跳過緩或過速，故需要密切監視胎心之速率。
- 上市後報告有病人接受手術處置後於關節內持續輸注局部麻醉劑產生軟骨溶解。報告有軟骨溶解的案例中，大部分發生在肩關節。由於多種構成因素以及與此作用機轉相關的科學文獻說法的不一致性，故因果關係仍未明。Xylocaine 未被核准使用於關節內持續輸注之適應症。

為了降低發生危險性副作用之機率，下列病人要特別注意：

- 心臟傳導部分或完全阻滯之病人，因為局部麻醉劑可抑制心肌之傳導。
- 進行性肝臟疾病或腎功能嚴重不良之患者。
- 老年人及體質很差之患者。這類病人較常使用神經阻斷區域麻醉，而非全身麻醉；在進行大型阻斷麻醉之前，應嘗試儘量改善病人之身體狀況。硬膜外麻醉可能引起低血壓及心跳遲緩；此項危險性可藉事先從血液循環給予膠體溶液，或注射血管收縮劑（如 ephedrine 20-40mg 肌肉注射）來預防。低血壓應立即以擬交感神經作用劑靜脈注射治療，需要時可再給藥。
- 有使用第三類抗心律不整藥物（例如：amiodarone）之病患，必須受到嚴密的監視且須監

測其心電圖 (ECG)，因為 lidocaine 與第三類抗心律不整藥物對心臟方面的作用會相加。
- 急性紫質症之患者。Xylocaine 注射用溶液劑可能會造成紫質症，對於急性紫質症的病人，只能在必要且急迫時才能使用。對於紫質沉著性的病人應採取適當的防護措施。

對患有高血壓、控制不良之甲狀腺毒症、缺血性心臟病、心臟傳導阻滯、腦血管循環不良、進行性糖尿病、及其他可能受影響病理狀況之患者，使用含有腎上腺素之溶液劑時，應特別小心。這類溶液用於身體上動脈末梢，血液供應受到限制之區域（如手指），或其他血液供應不足之部位時，亦應特別小心。（請參閱「交互作用」）。

含有抗微生物保存劑之局部麻醉劑，例如以多劑量藥瓶供應者，不得用於椎管內麻醉 (intrathecal anaesthesia)。

交互作用

病人服用其他局部麻醉劑或藥物，若其結構與醯胺類 (amide) 局部麻醉劑類似者，諸如特定的抗心律不整藥物 (如 mexilitine 和 tocainide)，；則使用 lidocaine 時，因其毒性具加成性，要特別注意。

目前尚未有特別針對局部麻醉劑與第三類抗心律不整藥物（例如：amiodarone）之交互作用之研究被執行，但建議要小心注意 (參閱「使用上需特別提醒及注意之事項」)。

重覆以高劑量 lidocaine 給予持續一段長時間時，一些會降低 lidocaine 代謝的藥品 (例如：cimetidine 或 β 受體拮抗劑) 可能會造成潛在的毒性血中濃度。若是遵照 lidocaine 的建議劑量做短期間的治療，上述之交互作用因此沒有臨床上的重要性。

懷孕及授乳

已經有相當多懷孕及有齡之婦女曾接受過 lidocaine，是相當合理的假設；但到目前為止，並無任何與生殖障礙（如：畸形發生率並未增加）有關之報告被發表。添加腎上腺素可能會降低子宮之血流量及收縮能力，尤其是在不小心打入母親之血管內後，胎兒因局部麻醉劑而引起不良反應，如心跳遲緩，多半出現於子宮頸周圍阻斷麻醉。此種反應可能因高濃度之麻醉劑到達子宮所致。

lidocaine 可進入母親之乳汁中，但如此之微量，通常對新生兒並無危險性。

對開車或操作機器能力之影響

依局部麻醉劑所用劑量之多寡，其可能對心智功能有輕微的影響，且可暫時性地使運動及動作協調能力受損。

不良反應

如果不是藥物過量或誤打入血管內，局部麻醉劑很少引起不良反應。此必須與神經阻斷麻醉

本身所引起之生理作用相區別，如硬膜外麻醉時，引起之低血壓及心跳遲緩。藥物過量或誤打入血管內所生之影響，可能會相當嚴重（請參閱「藥物過量」）。

藥物不良反應

很常見 (>1/10)	一般：噁心 循環系統：低血壓
常見 (1/10-1/100)	循環系統：心跳徐緩、高血壓 中樞神經系統：感覺異常、暈眩 腸胃系統：嘔吐
不常見 (1/100-1/1000)	中樞神經系統：中樞神經毒性之症狀（痙攣、口周圍感覺異常、舌頭麻木、聽覺過敏、視覺混亂、失去知覺、震顫、輕度頭痛、耳鳴、口齒不清）
罕見 (<1/1000)	一般：過敏反應，最嚴重的案例曾出現過敏性休克 中樞神經系統：神經病變、周邊神經受損、蛛網膜炎 眼睛：複視 循環系統：心跳停止、心律不整 呼吸道：呼吸抑制

藥物過量

急性全身性毒性

全身性毒性反應包括了中樞神經系統及心血管系統。這樣的反應通常是因為意外的血管內注射、過量、或是經由富含血管的組織不尋常的快速吸收而導致局部麻醉劑的血中濃度過高所致。（請參閱「使用上需特別提醒及注意之事項」）

所有醃胺類局部麻醉劑的中樞神經系統症狀都類似，而心臟方面的症狀在質與量方面皆會因藥物的不同而有所差異。

意外地將局部麻醉劑注射入血管內可能造成立即的全身性毒性反應（發生於數秒內至數分鐘）。在某些藥物過量的案例中，全身性毒性的徵兆出現時間較晚（注射後的 15 至 60 分鐘）是因為該局部麻醉劑在血中的濃度增加較緩慢所致。

中樞神經系統之毒性為層次分明之反應，其症狀及症候會逐漸加重。第一個症狀為嘴唇感覺異常、舌頭麻木、頭暈、聽覺過敏、耳鳴及視力障礙。口齒不清、肌肉抽筋或顫抖則為較嚴重之症狀，其後即為全身痙攣。此類症候千萬不要誤以為只是神經活動之狀態而已。意識不清及其後可能跟隨之痙攣大發作，可能維持數秒至數分鐘。痙攣之後，因肌肉活動增加正常，呼吸受干擾，及可能造成呼吸道機能不順暢，很快就會發生血氧過低及血中二氧化碳過高。嚴重時可能會導致呼吸暫停。酸中毒、高血鉀、低血鈣及血氧過低會加強局部麻醉劑之毒性反應。

局部麻醉劑由中樞神經系再分佈及接著代謝和排泄後，可恢復正常。除非注射大量藥物，否則很快即可恢復。

心血管系統之毒性效應一般會造成更嚴重的情況且其通常係由中樞神經系統中毒症候前導，但是，當病人被全身麻醉或其因使用會引起鎮靜之藥物而正處於重度鎮靜狀態時，如 benzodiazepine 及 barbiturate，這些中樞神經系統中毒症候前導徵兆會因而被蒙蔽。在全身性濃度過高之下，可發生低血壓、心跳徐緩、心律不整、甚至於心跳停止。

由於兒童通常只有在麻醉開始後才會出現較大的阻斷現象，因此針對此族群須特別注意其中毒之早期徵兆。

急性毒性之治療

如果發生急性全身性毒性之症候，應立即停止注射局部麻醉劑。

如果發生痙攣，則需要加以治療。所有急救之藥物及設備應在立即可用之狀態；治療之目標為供應氧氣、停止痙攣及維持循環。氧氣一定得給予，必要時還要提供換氣輔助裝置（面罩及換氣袋）。如果痙攣無法在 15 至 20 秒內停止時，必須由靜脈給予抗痙攣劑。Thiopentone 100 至 500mg 靜注，可迅速消除痙攣。或者改用 diazepam 5 至 10mg 靜注亦可，不過其作用開始時較慢。Suxamethonium 亦能迅速終止肌肉之痙攣；但其需要氣管插管及人工換氣，且需由有經驗之專家使用才行。如果心血管之抑制相當明顯（低血壓、心跳徐緩），應給予 ephedrine 5 至 10mg 靜注，需要時可在 2 至 3 分鐘後再給藥。發生循環停止時，應立即實施心肺復甦術。提供最適度之氧氣及換氣，及維持其循環系統，並治療其酸中毒，均為維持生命所必須之重要措施，因為血氧過低及酸中毒，均會增加局部麻醉劑之全身性毒性。腎上腺素 0.1 至 0.2mg 靜注或心內注射應儘快給予，需要時可再給藥。

賦形劑內容表

Sodium chloride (張力調節劑), sodium hydroxide/hydrochloric acid (pH 酸鹼值調整至 5.0-7.0), methyl parahydroxybenzoate (防腐劑), 注射用水.

配伍禁忌

lidocaine 在 pH 值大於 6.5 以上時，其溶解度大為降低；故要加入鹼性溶液（如：碳酸鹽類）時要特別考慮此點，否則會發生沈澱。

貯存時注意事項

Xylocaine（不含腎上腺素）多劑量藥瓶；貯存於不高於 25°C 處，不可冷凍。

多劑量藥瓶在開瓶超過 3 天之後，不可再使用。

使用及處理之規定

本溶液劑若不含保存劑者，應在打開後立即用使用；任何剩下來之溶液均應丟棄。多劑量藥瓶比單劑量小瓶較易受到微生物污染；所以應儘可能使用單劑量小瓶。如果要使用多劑量藥瓶，則必須採取適當之控制程序以預防污染。

包括：

- 使用單次使用之無菌注射器具。
- 在每次插入多劑量藥瓶抽取時，使用無菌之針頭及針筒。
- 避免多劑量藥瓶與任何可能導致污染之液體或污染物接觸。

Xylocaine 不建議用高溫滅菌法再消毒。多劑量藥瓶在開瓶超過 3 天之後，不可再使用。

Xylocaine 之建議劑量

本表所給予之劑量，係考量有效產生阻斷之需要劑量，且應視為使用於普通成人之標準劑量。一般而言，含有腎上腺素之局部麻醉劑劑量，與不含腎上腺素者相同。就作用開始時間及作用時間來看，個人間之變異頗大，無法精確地定量。至於其他種類之區域麻醉技術，請參考標準教科書。神經阻斷若使用含有腎上腺素之溶液，且使用之容積較大時，有引起腎上腺素全身性毒性之危險性。

Up to (不大於)。NR=未推薦

阻 斷 類 型	濃度(mg/ml)	濃度(%)	劑量	劑量(mg)	作用開始 時間(分)	作用時間(時)	作用時間(時)
			NA*	A**		NA*	A**
局部浸潤	5	0.5	≤ 80	≤ 400	1-2	1.5-2	2-3
	10	1.0	≤ 40	≤ 400	1-2	2-3	3-4
手指阻斷	10	1.0	1-5	10-50	2-5	1.5-2	NR
助間阻斷(每一神經)	10	1.0	1-5	20-50	3-5	1-2	3-4
	15	1.5	2-4	30-60	3-5	2-3	4-5
子宮頸旁(每一邊)	10	1.0	10	100	3-5	1-1.5	2-2.5
外陰部(每一邊)	10	1.0	10	100	5-10	1.5-2	2-3
靜脈區域阻斷(Bier's block)							
1.上肢 ^(b)	5	0.5	40	200	10-15	至止血帶 打開為止	NR
2.下肢(大腿止血帶) ^(b)	5	0.5	60	300	10-15	同上	NR
3.下肢(小腿止血帶) ^(b)	5	0.5	40	200	10-15	同上	NR
關節內阻斷 ^(c)	5	0.5	≤ 60	≤ 300	5-10	沖洗後 30-60 分鐘	
	10	1.0	≤ 40	≤ 400	5-10	沖洗後 30-60 分鐘	

眼球後(周圍)	20	2.0	4	80	3-5	1.5-2	NR
	10	1.0	10-15	100-150	3-5	1.5-2	NR
臂神經叢							
1.腋下	10	1.00	40-50	400-500	15-30	1.5-2	3-4
	15	1.5	30-50	450-600	15-30	1.5-3	3-5
2.鎖骨上、斜角肌內 及鎖骨下	10	1.0	30-40	300-400	15-30	1.5-2	3-4
3.血管周圍	15	1.5	20-30	300-450	15-30	1.5-3	3-5
坐骨神經	15	1.5	15-20	225-300	15-30	2-3	3-5
	20	2.0	15-20	300-400	15-30	2-3	3-4
股骨、閉孔肌及側面皮膚(三合一)	15	1.5	30	450	15-30	2-3	3-5
腰部、硬膜外 ^(a)	20	2.0	15-25	300-500	15-20	1.5-2	2-3
胸部、硬膜外 ^(a)	15	1.5	10-15	150-225	10-20	1-1.5	1.5-2
	20	2.0	10-15	200-300	10-20	1-1.5	1.5-2
尾部、硬膜外 ^(a)	10	1.0	20-30	200-300	15-30	1-1.5	1-2
尾部、硬膜外(兒童)	10	1.0	0.5ml/kg	0.5ml/kg	10-15	1-1.5	1.5-2

A**：表示含腎上腺素

NA*：表示不含腎上腺素

(a) 劑量包括測試劑量

(b) 注射 20 分鐘內取出止血帶

(c) 上市後報告有病人接受手術處置後於關節內持續輸注局部麻醉劑產生軟骨溶解。Xylocaine 未被核准使用於此適應症 (參閱「使用上需特別提醒及注意之事項」)。

最新修訂日期：2013 年 3 月

PAIN.000-096-759.3.0

製造廠：Recipharm Monts

廠址：18, rue de Montbazou-37260 Monts, France

藥商：臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

地址：台北市敦化南路二段 207 號 21 樓

電話：23782390