

靜注用苦息樂卡因 2%注射液

Xylocaine® 2% for Intravenous Injection

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	1mL 中 Lidocaine HCl	20mg
含量	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：有高度的竇性心搏過慢，或房室阻斷等的心搏過緩性之心律不整，同時伴有心室性心律不整時，使用人工心律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。

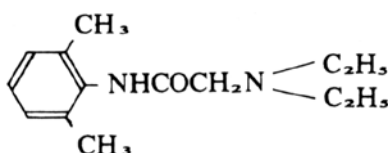
【關於有效成分的理化學性質】

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】

Lidocaine hydrochloride anhydrous, Sodium Chloride, Hydrochloric acid/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)

製造廠：Cenexi

廠 址：52, rue Marcel et Jacques Gaucher, 94120 Fontenay-sous-Bois, 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：(02)23782390