

“鎰浩” 利多卡因液 4% Lidocaine Solution 4% “Yihhaw”

【成分】

1毫升溶液含Lidocaine hydrochloride 40毫克

【藥理型式】

Lidocaine外用溶液是無色透明溶液。活性成分的賦形劑是水分及溶於水的防腐劑甲基對苯甲酸酯(methyl paraben)。酸鹼度是6.5 - 6.7。

【適應症】

局部麻醉劑。

【劑量和使用方法】 本藥限由醫師使用

利多卡因外用溶液的活性成分是Lidocaine。Lidocaine能提供迅速且完全的黏膜麻醉。經氣管內使用時吸收最迅速，麻醉作用通常很快發生（隨使用處的不同，在1-5分鐘內），持續約15 - 30分鐘。

Lidocaine的安全性和藥效和其他局部麻醉劑一樣，要根據正確的劑量、正確的技術、適當的預防措施和急救設備。

表面麻醉劑可以管腔灌注或噴霧方式給予，例如automizer或nebulizer。外用溶液也可以使用拋棄式的無菌棉棒給予。

下列的建議用量必須視為指引。計算需要劑量時，最重要的是臨床醫師的經驗和對病患生理狀況的了解。

黏膜吸收的程度變化很大，而支氣管各分支的吸收非常的高。只使用於聲帶下的區域時，因為較少輸送至腸道和較少首度代謝的損失，可能會造成血漿濃度過高。從噴霧器吸入時的血漿濃度低於使用噴霧器噴灑的濃度。

成人接受某種麻醉藥過程的建議劑量是2 - 7.5 ml利多卡因外用溶液(80-300 mg Lidocaine HCl)，在較長時間的過程時，可以使用高達400mg Lidocaine。此外，當與其他Lidocaine產品合用時，總劑量不能超過400mg。主要使用在喉頭、氣管和支氣管，劑量不能超過5ml (200mg Lidocaine HCl)使用噴霧器吸入時，可使用5-10 ml (200-400 mg Lidocaine HCl)。

體弱或年老病患、12歲以上的兒童、急性病患或敗血症病患，必須給予和他們年齡、體重和身體狀況相稱的劑量。

未滿12歲的兒童，每公斤體重劑量不能超過3mg。

【禁忌症】依文獻記載

對醯胺類(amide)局部麻醉劑或其他賦型劑過敏者。

已知對甲基及丙基對羥基苯甲酸酯(methyl- /propyl paraben)，或對其代謝物對胺基苯甲酸(PABA)曾發生過敏反應者。對於醯胺類局部麻醉劑或其代謝物PABA會過敏之病患應避免使用含有對羥基苯甲酸酯之Lidocaine配方。

【使用的特別警告和注意事項】依文獻記載

劑量超過或每劑給藥間隔太短都可能造成高血漿濃度和嚴重的不良反應。黏膜吸收的程度變化很大，而支氣管的各分支其吸收非常的高。預計要使用的部位有傷口或黏膜創傷的病患，要小心使用Lidocaine噴劑。黏膜損傷會增加全身性吸收。嚴重的不良反應之處理可能需要使用到復甦術設備，氧氣和其他復甦藥物，(參考「過量」)。

癱瘓病患在全身麻醉時，血中的濃度可能會比自然呼吸的病患高。無癱瘓病患比較容易吞下大量的劑量，在腸子吸收後，造成相當可觀的首度肝臟代謝。

口咽部使用外用麻醉劑可能會干擾吞嚥，因而造成肺部吸入的危險，舌頭或頰黏膜麻木可能會增加咬傷的危險。

如果所使用的劑量可能造成高血中濃度時，有些病患要特別注意以防止可能的危險性副作用。

- 局部或完全心臟傳導阻斷的病患
- 老年和身體不健康的病患

• 嚴重肝病或腎功能障礙的病患

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)，因為對心臟方面的影響可能有相加性。

利多卡因液4%不能做為漱口使用。使用利多卡因液4%漱口會因為過量、黏膜的迅速吸收以及/或攝取而增加全身毒性的風險。

利多卡因液4%可能會造成紫質生成作用(porphyrinogenic)，因此有急性紫質症(acute porphyria)之病患只應在有緊急或重大需求時才可使用。所有紫質症之病患使用本藥時應採取適當之預防措施。

【交互作用】依文獻記載

接受結構與局部麻醉劑相關的病患，使用Lidocaine時要小心，例如：Tocainide，因為它們的毒性有加成作用。

沒有特別針對局部麻醉劑與第三類抗心律不整藥物（例如：amiodarone）之交互作用的研究被執行過，但建議要小心注意。

重覆以高劑量Lidocaine給予持續一段長時間時，一些會降低Lidocaine清除率的藥品（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（例如：利多卡因液）的建議劑量做短期間的治療，上述的交互作用則沒有臨床上的重要性。

【懷孕期間和哺乳期間的使用】依文獻記載

有理由相信很多孕婦和懷孕年紀的婦女使用過Lidocaine。截至目前，沒有特定生產過程干擾的報告，例如：畸形的發生率沒有增加。

Lidocaine和其他局部麻醉劑一樣，可以進入母乳，但是劑量很低，一般不會對新生兒造成危險性。

【對開車和操作機器能力的影響】依文獻記載

依據局部麻醉劑的劑量，可能對心智功能有很輕微的影響，及可能會暫時性的妨礙運動和協調功能。

【不良作用】依文獻記載

過敏反應

對醯胺型局部麻醉劑產生過敏反應（最嚴重的病例是過敏性休克）的相當稀少(<0.1%)。溶液的其他成分，如：甲基對苯甲酸酯也可能造成此種反應。

急性全身毒性作用

如果Lidocaine因為快速吸收或過量造成全身濃度過高時，可能有急性毒性作用。(參考「藥效學性質」和「過量」)。

【過量】依文獻記載

急性全身毒性作用

毒性反應主要來自中樞神經系統和心臟血管系統。

中樞神經系統毒性作用是症狀和表徵越來越嚴重的層級反應。第一個症狀是口腔周圍感覺異常，舌頭麻木、頭昏眼花、聽覺過敏和耳鳴。全身抽搐前發生的視覺干擾和肌肉顫抖會更嚴重。

接著可能是失去意識和抽搐大發作，可能持續短短的幾秒至數分鐘。抽搐後因為肌肉活動增加及正常呼吸受干擾，可能緊接著出現缺氧和血碳酸過多症。嚴重病例可能出現呼吸停止。酸中毒會增加局部麻醉劑的毒性作用。

恢復是由於中樞神經系統中的局部麻醉劑再重分部和代謝。除非使用大量的藥物，否則恢復會很快。

只有全身濃度高的病例才會出現心臟血管作用。此類病例的可能出現症狀有：嚴重低血壓，心搏變慢，心律不整和心臟血管循環不足(cardiovascular collapse)。

心臟血管毒性作用一般是在中樞神經系統毒性表徵之後，除非病患接受全身麻醉或深度鎮定藥物，如 benzodiazepine 或 barbiturate。

急性毒性反應的治療

若出現全身性毒性的症狀，該徵兆預期在本質上與經由其他投與途

徑給予之局部麻醉劑相似。局部麻醉劑的毒性症狀為神經系統的刺激，在某些嚴重的案例會出現中樞神經及心血管的抑制。當出現嚴重的神經系統症狀時（癱瘓、中樞神經抑制），必須給予呼吸協助以及投與抗痙攣藥物之症狀治療。發生循環停止時，要立刻進行心肺復甦術。維持生命最重要的是有理想的氧氣供應和通氣及維持循環，以及酸中毒的治療。

【藥效學性質】依文獻記載

藥物治療學分類：局部麻醉劑

ATC code：N01B B02

利多卡因液4%為應用於黏膜之表面麻醉劑，尤其適用於耳鼻喉科、腸胃科及牙科。Lidocaine經由抑制鈉離子在神經細胞膜上的通透運輸，可逆性的阻斷神經衝動的傳導。相似的作用也可在腦部及心肌的可激發細胞膜上觀察到。

麻醉作用在5分鐘內可達到，端視使用部位的不同，而且可持續約15-30分鐘。

【藥物動力學性質】依文獻記載

Lidocaine於黏膜處局部給藥後開始吸收，決定吸收的速率和程度的因子有：所使用的濃度和總量、使用的部位和接觸的時間。一般而言，局部麻醉劑使用後最快的吸收作用是出現在氣管和支氣管部位。Lidocaine在胃腸道的吸收也很好，但是因為肝臟的生物轉換作用，很少有完整的藥物出現在循環中。

Lidocaine的血漿蛋白質結合能力是根據藥物濃度，濃度增加時結合比率降低。每ml游離態藥物濃度1至4 μ g時，有60至80%的Lidocaine是與蛋白質結合。結合能力也根據血漿 α -1-醱糖蛋白（ α -1-acid glycoprotein）濃度而定。

Lidocaine可能是以被動滲透方式通過血腦障礙和胎盤障礙。

肝臟快速的代謝Lidocaine，代謝物和原型藥物都由腎臟排除。生物轉換作用包括：氧化N-去鹼基作用（oxidative N-dealkylation）、環氫氧化作用（ring hydroxylation）、醞胺連結切斷和結合作用，N-去鹼基作用是生物轉化作用的一個主要途徑，產生的代謝物是monoethylglycinexylidene和glycinexylidene。這些代謝物的藥理和毒性反應都相似，但是強度低於Lidocaine。使用的Lidocaine約90%是以各種型式的代謝物排除，少於10%以原型排除。尿中的主要代謝物是4-hydroxy-2,6-dimethylaniline的結合態。

一次靜脈注射Lidocaine的排除半衰退期典型是1.5至2.0小時。因為Lidocaine排除速率相當的快，所有任何會影響肝功能的情況都可能改變Lidocaine的動力學。肝功能異常的病患半衰期可能延長兩倍或更多。腎功能異常不會影響Lidocaine的動力學，但是可能會增加代謝物的沉積。

一些因子，如：酸中毒，和使用中樞神經系統興奮劑和抑制劑，會影響Lidocaine產生明顯的全身作用時所需的中樞神經系統濃度。游離態藥物靜脈血漿濃度增加至每毫升超過6.0 μ g時，客觀的不良現象會明顯的增加。

【賦形劑】

Propylene glycol, methyl paraben, purified water

【不相容性】

Lidocaine的溶解度是限制在酸鹼度 >6.5 。加入如碳酸鹽的鹼性溶液時要注意，因為可能發生沉澱。

【儲存注意事項】

25°C以下貯存。不可冷凍。

【包裝】

4000毫升以下玻璃瓶裝

製造廠：利達製藥股份有限公司

廠址：437台中市大甲區中山路一段906號

委託者：鑑浩貿易股份有限公司

地址：105台北市松山區南京東路五段222號4樓

電話：02-27648055