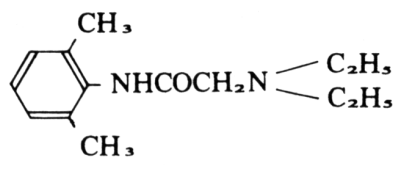


息痛卡因[®] 注射劑 1%

<p>息痛卡因注射劑 1%</p>	<p>本藥限由醫師使用</p> <p>衛署藥輸字第 022080 號</p>
<p><i>Xylocaine® Injection 1%</i></p> <p><i>Lidocaine hydrochloride</i></p>	
<p>【產品資訊】</p> <p>可產生局部或區域性麻醉作用之注射液。</p>	

【藥名】

XYLOCAINE®之活性成份為 lidocaine hydrochloride 。Lidocaine hydrochloride (AAN)之 CAS 號碼為 6108-05-0 而 lidocaine hydrochloride anhydrous 之 CAS 號碼為 73-78-9。Lidocaine hydrochloride 之化學名為 2-Diethylaminoaceto-2', 6'-xylylide 。其在澳洲核准之名稱為 lignocaine hydrochloride 。Lidocaine 之化學構造為：



性状

Lidocaine 被分類為細胞膜穩定劑，為一種胺類局部麻醉劑；性質極為安定，且其單方溶液可用高壓高溫方式滅菌，若需要時最多可再重複滅菌兩次。Lidocaine hydrochloride 單方溶液為無菌、等張之溶液，含有 Lidocaine hydrochloride 、調整 pH 值之 sodium chloride/ sodium hydroxide 及注射用水。息痛卡因溶液不含抗菌劑，因此只能使用一次並將剩餘藥品丟棄。Lidocaine hydrochloride 單方溶液 pH 值約為 5.0-7.0。Lidocaine 鹽基之 pKa 值為 7.85(25°C)；油/水分佈係數為 2.9；分子量为 234.3。

【藥理學】

如同其他局部麻醉劑，Lidocaine 可藉由防止鈉離子穿越神經膜向內移動，而可逆地阻止神經衝動沿著神經纖維傳導。醯胺類 (amide) 局部麻醉劑被認為是在神經膜內的鈉離子管道作用。局部麻醉劑對於腦部及心肌內可激發之細胞膜 (excitable membrane) 可能有相似的作用。 若有過量的藥品快速的到達全身循環系統，將會出現毒性症狀與徵兆，主要是由中樞神經系統及心血管系統所發出。中樞神經系統毒性通常比心血管作用早發生，因其於血中藥品濃度較低時即會發作。局部麻醉劑對心臟的直接作用包括：傳導速率減慢、心收縮力下降，最後導致心跳停止。硬膜外及脊椎給藥後可能會發生間接的心血管作用，如：低血壓及心跳減緩，視其伴隨交感神經阻斷程度而定。

【藥動學】

Lidocaine 麻醉之開始作用時間快速，麻醉作用之持續時間則為中等。在浸潤麻醉 1-5 分鐘後開始作用，其他類型的麻醉則為 5-15 分鐘。吸收速率依劑量、給藥途徑、注射部位、血管分佈狀況而定。肋間神經阻斷會產生最高之血漿濃度（每注射 100mg 約 1.5µg /ml)，而腹部皮下注射則最低（每注射 100mg 約 0.5µg /ml)。硬膜外阻斷及主要神經阻斷所產生之最高血漿濃度則介於中間。Lidocaine 自硬膜空間的吸收可分為兩相；第一相約 9 分鐘，第二相約 82 分鐘。緩慢的吸收是 Lidocaine 排除速率之限制步驟，這也說明了經由硬膜注射時之排除半衰期比經靜脈注射時要長。Lidocaine 之蛋白質結合程度視藥品濃度而定，其結合比例會隨濃度的增加而降低。在濃度介於 1-4µg free base/ml 時，60-80% 的 lidocaine 會與蛋白質結合。結合比例也與血漿 α₂-acid glycoprotein 的濃度有關。Lidocaine 會藉由被動擴散通過腦血管及胎盤障壁。由於胎兒之血漿蛋白質結合程度比母體低，因此雖然其游離 lidocaine 的濃度與母體相同，母體之總體血漿濃度會比較高。

Lidocaine 之整體血漿廓清率為 0.95L/min，在穩定狀態之分佈體積為 91L，排除半衰期約為 1.6 小時，估計之肝臟萃取比例為 0.65。約有 90%之靜脈 lidocaine 劑量會快速的在肝臟藉由去乙基化 (de-ethylation) 而形成 monoethylglycinexylidide (MEGX) 及 glycinexylidide (GX)，再切斷 amide 鍵而形成 xylylidine 及 4-hydroxyxylylidine 的方式被代謝，再被排除至尿液。只有低於 10% 以下的劑量會以未改變的形式被排除至尿液。

其主要代謝物 MEGX 及 GX 亦具藥理活性。Lidocaine 之代謝速率顯示會受到肝臟血流所限制，所以在病人罹患急性心肌梗塞及/或鬱血性心衰竭之後，其代謝速率會降低，肝臟或肝組織壞死的病人其 lidocaine 代謝速率也會降低，可能是由於灌流的改變所造成。

作用期間的長短與所使用的濃度、給予的劑量、欲阻斷的神經及病人的狀況而定。2% 溶液會在硬膜給藥後產生作用達 1.5-2 小時，而作為周邊神經阻斷時則可達 5 小時。當使用 1%溶液時，對運動神經纖維的作用較小，作用時間也較短。

【適應症】

局部麻醉

說明：

- 浸潤
- 靜脈區域麻醉
- 周邊神經阻斷技術，如肋間神經阻斷
- 主神經叢阻斷，如腎神經叢阻斷
- 硬膜外阻斷
- 蜘蛛膜下阻斷

【禁忌症】

- 對胺類局部麻醉劑過敏或對本品所含之任一賦形劑過敏者。以皮膚試驗來偵測患者是否會過敏之效果有限。
- 局部麻醉劑不能用於患有未矯正低血壓或凝血方面疾病或接受抗凝劑治療的病人之硬膜外麻醉或脊髓麻醉。
- 當欲注射之區域有發炎和 / 或膿毒症和 / 或有敗血症的患者，不可進行局部麻醉術。
- 硬膜外麻醉時，不論使用何種局部麻醉劑，皆應考慮其相關之一般禁忌。

【注意事項】

- 當使用任何局部麻醉劑時，需有急救設備、藥品及氧氣在旁可立即使用，以便能立即處理可能發生包括心血管、呼吸或中樞神經系統之不良反應。因為在主要阻斷之後可能產生低血壓及心跳徐緩，應在注射局部麻醉劑之前插入一條 IV 導管。適當處理與劑量有關之毒性若有耽擱、因任何原因而引起之換氣不足 (underventilation)及或改變敏感性，可能會導致酸中毒、心跳停止及死亡。
- 注射時速度要緩慢且要經常回抽，以避免不小心打入血管內而引起腦部的症狀，即使是低劑量。
- 雖然關節內視鏡和外科手術處置後於關節內持續輸注局部麻醉劑之用法未被核准，但上市後研究發現使用此類輸注液之患者有軟骨溶解現象產生。報告有軟骨溶解的案例中，大部分發生在肩關節，而持續輸注含腎上腺素或不含腎上腺素局部麻醉劑達 48 至 72 小時之兒童或成人患者身上，報告有關節孟與肱骨軟骨溶解的案例發生。無足夠資料證明短期輸注局部麻醉劑是否與這些現象無關。這些症狀(如關節痛、僵硬、麻痺)發作的起始時間都不一樣，但極可能發生在手術後第 2 個月。目前對於軟骨溶解現象尚無有效的治療方法。對於發生軟骨溶解的患者需進一步加以診斷及治療處置，其中部分患者需進行關節造形或置換肩關節。因此 Xylocaine 不能作為手術後關節內持續輸注使用。
- 在每一次局部麻醉後應仔細並經常不斷的監測病人的心血管和呼吸的生命徵兆，以及病人的神智狀態。應謹記在心在這段時間坐立不安、焦慮、耳鳴、暈眩、視力模糊、顫抖、沮喪或嗜睡，可能是中樞神經系統中毒的早期警告徵兆。
- 低分子量 Heparins 及 Heparinoids(脊椎/硬膜外出血)－神經軸麻醉(硬膜外/脊椎麻醉)時，正以低分子量 heparins 或 heparinoids 抗凝血之病患會有發生硬膜外及脊椎出血的風險，此會造成長期或永久性麻痺。使用硬膜外導管、外傷或重覆於硬膜外/脊椎穿刺，以及併用其他會影響血液平衡的藥物，如 NSAID、血小板抑制劑或其他抗凝劑，會增加出血的風險。應經常監測病患神經損傷之徵兆及症狀。
- Xylocaine®之安全性及有效性，端賴適當之劑量、正確之技術及適度的謹慎小心；對各種不同之區域麻醉，應參考教科書所提示之特別技術及注意事項。
- 應使用能產生有效麻醉之最低劑量（參見用法用量）；重覆注射 Xylocaine®可能會造成 lidocaine 或其代謝物之蓄積，而引起毒性反應。

對升高的血中濃度之耐受性，視病人的狀況而定。年老、年輕或衰弱的病人，包括有深度肝臟疾病或嚴重腎功能不良者，應視其年齡及身體狀況而降低相當的劑量。

- Lidocaine 用於患有癱瘓、心臟傳導不良、心跳徐緩、嚴重休克或毛地黃中毒的病人時應高度謹慎。對於心血管功能不良者給予 lidocaine 時也應高度謹慎，因為他們可能較無法代償因這些藥品所產生之與房室傳導延長相關的功能改變。對於有 Stokes-Adams 症候群或 Wolff-Parkinson-White 症候群的病人應非常地謹慎，以避免意外的注射至動-靜脈。
- 中樞神經的阻斷可能會造成心血管的抑制，特別是有低血容量的患者。有心血管功能損傷的病患使用硬膜外麻醉時須小心注意。硬膜外麻醉可能會導致低血壓及心跳徐緩。出現低血壓時應立即以靜脈注射交感神經擬似劑處理，若必要時可重覆給予。
- 如果病人已有不正常之神經學症狀時 (例如，重症肌無力)，使用局部麻醉劑應極度謹慎。當有嚴重中樞神經系統或脊柱疾病時 (例如腦膜炎、脊髓液阻斷、顱內或脊髓出血、腫瘤、脊髓炎、梅毒、結核病或脊柱之轉移性病害)，使用硬膜外、尾部 (caudal) 及脊髓麻醉時應極度謹慎。
- 因為 lidocaine 由肝臟代謝，經腎臟排除，因此肝及 / 或腎功能不良之患者，應考慮其發生藥物蓄積之可能性（參見用法用量）。
- 在頭、頸部注射局部麻醉劑時（包括眼球後、牙科及星狀神經節阻斷），若不小心將小劑量之局部麻醉劑打入血管內或蜘蛛膜下腔，可能會產生與意外將大劑量打入血管時所引起之全身性毒性反應相類似的不良反應。執行眼球後阻斷麻醉的醫師，應知悉在使用局部麻醉劑施行眼球後阻斷麻醉時，曾有心血管虛脫 (collapse) 及呼吸停止之案例報告。故如同其他區域阻斷麻醉的步驟一樣，在執行眼球後阻斷麻醉之前，應確定所需之設備、藥品及專業人員均在備用狀態。眼球後注射在非常偶然的情況下會到達蜘蛛膜下腔，造成暫時性失明、心血管虛脫、窒息及痙攣等。這些需迅速診斷及治療。於眼球後及眼球周圍注射局部麻醉劑會伴隨危險之永久眼球肌肉功能失調，主要原因包括肌肉及神經外傷及/或局部毒性作用。這些組織反應的嚴重性與外傷程度、與局部麻醉劑濃度及組織接觸局部麻醉劑的時間有關。因此，使用所有局部麻醉劑時，應給予最低有效濃度及劑量。血管收縮劑只可用於指示時，因其可能會加重組織反應。
- 子宮頸旁阻斷麻醉之後經常發生胎兒心跳過慢/過快，並且伴隨胎兒酸中毒及低血氧。偶有出生前後之罹病及死亡案例報告被提出。當使用劑量超過推薦劑量時，胎兒發生心跳過慢之風險會增加，必須小心的監測胎兒的心跳速率。
- 已知對某些藥物有過敏病史之患者，使用 lidocaine 時要特別注意。
- 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會有相加性。
- 息痛卡因注射劑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皆應採取適當之預防措施。

對駕駛及操作機器能力的影響

視劑量而定，局部麻醉劑可能對心智功能有非常輕微的影響，而且可能暫時對移動及肌肉的協調有損害。

致癌性/突變性/生殖損傷：

一個對 lidocaine 代謝物 2,6-xylylidine 所進行之為期两年的口服毒性研究，已顯示對於雌鼠與雄鼠，每天服用 900 mg/m² (150 mg/kg) 之 2,6-xylyidine 會導致癌症及鼻腔的腺癌。在低劑量 (15 mg/kg) 或對照動物，並未觀察到鼻腔腫瘤。此外，這個化合物也會造成雌鼠與雄鼠之皮下纖維瘤及/或纖維肉瘤 (在 150 mg/kg 時有意義)。2,6-xylylidine 之基因毒性潛力已經被研究，但卻有混雜的結果：在對基因突變 (在以代謝活化之 Ames 試驗和在小白鼠淋巴癌分析呈弱陽性反應) 及染色體損傷 (當濃度在會使藥品自溶液中沉澱的程度時，中國田鼠卵巢細胞之染色體迷亂 (chromosomal aberration)) 的分析，結果呈陽性。在對染色體損傷 (核仁分析 (micronucleus assay)) 及 DNA 損傷 (非預定 DNA 分析) 所進行之活體分析，則未發現有基因毒性的證據。在大鼠肝臟， ethmoid turbinates 之 DNA 共價結合研究則顯示，2,6-xylyidine 於活體在某些狀況可能有基因毒性。

於懷孕期間使用：A 級 (Category A)

懷孕期間使用 lidocaine 之安全性尚未確立。雖然，lidocaine 已被廣泛的用於懷孕期間的外科手術，但未曾發現其對母體或胎兒產生不良效應之案例報告；目前並無對懷孕婦女所進行之 lidocaine 對胎兒發育之效應的適當或良好對照之研究。

Lidocaine 已有效地用於產科鎮痛，且其對分娩之產程罕有不良影響。婦女分娩時以 Lidocaine 硬膜外給藥後，lidocaine 可穿過胎盤障壁。然而，其在臍靜脈之濃度比在母體循環系統低。建議在產科區域麻醉後，應檢查新生兒之血糖濃度。

【注意】

胎兒心跳過慢可能與子宮頸旁阻斷麻醉有關（請參見“注意事項”的第 12 點）。

【於哺乳期間使用】

Lidocaine 可進入母親之乳汁；但哺乳婦靜脈注射 lidocaine 後，其乳汁中所含之 lidocaine 量不太可能導致藥物本體在以母乳餵食的嬰兒體內產生顯著的蓄積。至於嬰兒由乳汁中接受之 lidocaine 是否會引起特異或過敏反應，則仍在評估中。

【藥品交互作用】

- 抗心律不整藥物：
 - 胺類局部麻醉劑，如 lidocaine 用於有使用其他局部麻醉劑或是其他與胺類局部麻醉劑結構有相關之藥品例如一些抗心律不整藥物 (如 disopyramide, procainamide, mexiletine) 之病人時，因可能產生其潛在性對心臟之作用，所以使用應小心。特別針對 lidocaine 與第三類抗心律不整藥物 (例如：amiodarone)之交互作用之研究尚未被執行，但建議要小心注意（請參見“注意事項”）。
- Amiodarone
 - Amiodarone 已在兩個案例報告中被報導會降低 lidocaine 之廓清率，雖然在一個對 lidocaine 藥物動力學所進行之小型前瞻性合併療法的研究發現廓清率或其他藥物動力學因子並無改變。這種合併療法已被報導會突然引起發作 (seizure) 及導致嚴重實性心搏徐緩及一段長時間的竇房停止 (sinoatrial arrest)。在有更多 lidocaine 與 amiodarone 同時服用的經驗以前，應小心監測接受合併療法的病人。
- β 腎上腺素性接受體拮抗劑：
 - Propranolol 及 metoprolol 會使由靜脈給藥之 lidocaine 的代謝降低；應考量其他 β 腎上腺素性阻斷劑亦可能有相同效應。若同時給與這些藥品，應仔細觀察病人是否有 lidocaine 毒性的徵兆。
- Cimetidine：
 - Cimetidine 會使由靜脈給予之 lidocaine 之清除率下降；兩藥併用時，曾發生血中 lidocaine 濃度過高而發生毒性效應之案例。
- 抗痙攣劑：
 - Phenytoin 及其他抗癲癇藥品，如 phenobarbitone、primidone 及 carbamazepine，顯示會使 lidocaine 之代謝增加，但此效應之顯著性尚待確定。Phenytoin 及 lidocaine 併用，對心臟之抑制效應具加成性。
- 吸入性麻醉劑：
 - Lidocaine 會降低吸入性麻醉劑 (如 nitrous oxide) 之最低有效濃度。
- 骨骼肌鬆弛劑：
 - Lidocaine 與骨骼肌鬆弛劑 (如 suxamethonium) 會導致過度的神經肌肉阻斷，因此併用必須小心。
- 結構與局部麻醉劑相關之藥品：
 - Lidocaine 應小心用於接受與局部麻醉劑結構相關藥品之病患。

【對實驗室檢驗之作用】

- Creatinine
 - 對於 lidocaine 血漿濃度達治療濃度的病人，當以一種酵素方法測量 creatinine 時約比以 Jaffe method 測量時高 15-35%。此現象是由於 lidocaine 代謝物 N-ethylglycine 干擾測量所造成。
- Creatine kinase
 - 肌肉注射 lidocaine 可能會引起 creatine kinase 的濃度增加最高達 48 小時，這可能會干擾到心肌梗塞的診斷。

【不良反應】

投與 Lidocaine 之不良反應與其他胺類局部麻醉劑所見特徵類似。這些不良反應通常與劑量有關，而且可能是因為劑量過高或吸收過快造成血中藥物濃度過高而引起，或病人本身之過敏、特異體質或耐受性減低所導致。

嚴重不良反應在本質上通常為全身性。下列類型為常被報告之不良反應：

中樞神經系統 (CNS)：
中樞神經系統的特徵是刺激性及/或抑制性，其特徵為頭重腳輕、神經質、恐懼、欣快感、困惑、暈眩、睏乏、耳鳴、聽覺過敏、視力模糊、嘔吐、灼熱感、發冷或麻木、抽筋、顫抖、失去意識、呼吸抑制及/或中止、煩躁、吞嚥困難、口周圍感覺異常、舌頭麻木及說話含糊。刺激性的表徵可能相當短暫或根本沒有發生，其毒性的第一個表徵為睏乏，隨後轉變為失去意識及呼吸抑制。在 lidocaine 給藥後出現睏乏通常是藥物血中濃度過高的早期徵兆，而且可能是因吸收快速而發生。對失去意識的病人，應注意血管性虛脫，因為 CNS 作用可能不明顯，且在某些病例毒性的早期徵兆可能會進展到痙攣而最後導致呼吸抑制及/或中止。有復甦設備及抗痙攣藥品可處理這些病人是非常重要的。(參見藥物過量-藥物過量之治療)

心血管系統：

心血管系統的表徵通常是抑制性的，特徵為心搏徐緩、低血壓及心血管衰竭甚至可能導致心跳停止。也曾經觀察到有心律不整及高血壓的現象。變性血紅素血症可能會在靜脈給藥後發生。

發生心血管毒性作用前一般都會先出現中樞神經系統毒性的徵兆，除非病患正接受全身性麻醉或是因接受 benzodiazepine 或 barbiturate 類藥物而正處於重度鎮靜狀態。在極少數的案例中，曾有未先出現中樞神經作用前兆而發生心跳停止的狀況。

在兒童方面，某些案例中由於全身麻醉所造成的阻斷現象，使得局部麻醉的早期毒性徵兆可能很難被偵測。

血液動力學方面：

局部麻醉劑可能會導致母體低血壓。

過敏：

過敏反應之特徵為皮膚炎損傷、蕁麻疹、水腫或類過敏性反應/休克。

罕見對股類局部麻醉劑發生過敏反應，

以皮膚試驗來偵測患者是否會過敏之價值令人存疑。

神經學反應：

因使用局部麻醉劑而直接引起神經學方面不良效應可能與授予局部麻醉劑之總劑量有關，亦可能依其使用之藥品、給藥之途徑及病人之身體狀態而定。

神經學反應伴隨的神經阻斷包括持續的麻木，感覺異常，和其他感覺不安。

在一個對 10,400 個接受 lidocaine 脊椎麻醉病人所做的前瞻性回顧，姿勢性頭痛 (positional headache)、低血壓及背痛之發生率約 3%，寒顫 2%，周邊神經系統症狀、噁心、呼吸不流暢及複視各低於 1%。其中許多可能與局部麻醉之給藥技術有關，可能與局部麻醉劑有關或無關。

在執行尾椎或腰椎硬膜阻斷時，偶而可能會發生導管不小心穿透蜘蛛膜下腔的狀況。隨之而來的不良反應有一部分可能與授予硬膜下的量有關。

這些不良效應可能包括不同程度之脊椎阻斷 (包括所有的脊椎阻斷)、因脊椎阻斷所引起之低血壓、膀胱及腸子失去控制、會陰 (perineal) 的感覺及性功能喪失。嘗試尾椎或腰椎硬膜阻斷時，在罕見的情況下曾發生某些位於較下面的脊椎之運動、感覺及/或自主 (括約肌的控制) 持續性的功能缺陷，且恢復緩慢 (好幾個月) 或恢復不完全。背痛和頭痛亦曾在這些麻醉過程中被注意到。

也曾觀察到有周邊神經傷害及蛛網膜炎。

[劑量及給藥]

本藥限由醫師使用。

應使用最低有效劑量，且應依據病人之狀況及所採用之區域麻醉類型而定。因 xylocaine 溶液不含抗菌劑所以僅能使用一次，任何剩餘的部份應丟棄。

Lidocaine 用於心血管功能不良的病人應非常小心，因為他們可能較無法代償因這些藥物所引起之與 AV 傳導延長有關之功能改變。

成人：

XYLOCAINE 單方溶液推薦劑量係以 70 公斤成年病人對各種麻醉過程之平均劑量：

給藥方法	濃度 (%)	單方		
		體積 mL	劑量 mg	
浸潤麻醉	0.5	40	200	
	1.0	20	200	
	2.0	10	200	
靜脈區域麻醉*	Bier's Block	40	200	
		—	—	
臂神經叢阻斷	1.0	—	—	
	1.5	—	—	
其他神經阻斷	肋間	—	—	
	脊椎旁	1.0	3-5	30-50
會陰(每邊)	1.0	10	100	
子宮頸旁	1.0	10	100	
星狀神經節阻斷	頸	1.0	5	50
	腰	1.0	10	100
	硬膜外麻醉**			
胸椎	1.0	10-20	100-200	
腰椎	1.5			
	2.0	5-10	100-200	
尾椎	1.5			
硬膜外止痛	腰椎	1.0	10-20	100-200
	尾椎	1.0	10-20	100-200

* 靜脈給予 lidocaine 可能會引起低血壓反應，且可能快速造成過量，因此，當 Bier's block 於靜脈區域給予每單一注射劑量 200mg 時，建議應緩慢釋放止血帶。

** 劑量視欲麻醉之節段數目而定 (每節段 2-3mL)

注意

1. 建議劑量：

上述建議之濃度及體積僅供參考；中毒劑量在不同病人之間變化很大，且毒性效應在任何一種局部麻醉給藥方法均有可能發生。

因此需嚴密監視病人之反應；專家建議在任何一次麻醉過程之中，lidocaine 給藥之劑量不應超過 3mg/kg。然而，給予之劑量需依個人狀況及麻醉方式作最適當之調整，這裏所引用之最大劑量，僅供劑量調整參考之用。

2. 低血壓：

在進行胸、腰及尾椎硬膜外麻醉之時，可能出現血壓驟降及/或肋間麻痺症狀，這可能是因為所使用之劑量過高、病人之姿勢不適當或不小心將麻醉劑打到蜘蛛膜下腔所致。血壓過低及心跳過慢，可能是因交感神經阻斷而引起。

3. 測試劑量：

進行硬膜外麻醉時，應先給予 3-5mL 之局部麻醉劑，做為測試劑量。

給予測試劑量後，保持與病人之對話，並密切監視其心跳及血壓 5 分鐘；若未出現注射到蜘蛛膜下腔或血管內之徵兆時，則可給予主劑量。

在給予總劑量之前，應隨時回抽針筒 (確定無回血)，緩慢地注射主劑量，並持續評估病人之狀況；如發現中毒之症狀或徵候時，應立即停止注射。

用於兒童

對幼童而言，需依其體重及體表面積，來使用較低之劑量。劑量須依病人個人需要來計算，且依據醫師之經驗及對病人之瞭解來調整。

為降低發生毒性效應之機率，對大多數使用於幼童之各類麻醉，均建議採用 0.5% 或 1% 之 xylocaine 為宜。

在兒童方面，某些案例中由於全身麻醉所造成的阻斷現象，使得局部麻醉的早期毒性徵兆可能很難被偵測。

用於老年人

對老年患者，可能需要降低劑量，尤其是心血管和或肝功能已受損者。

在硬膜外麻醉時，以較小之劑量即可能獲得有效麻醉。

肝功能受損者

雖然 lidocaine 經由肝臟代謝，但並無須減少局部麻醉劑劑量之依據；但在重覆給藥時，仍需小心處理。

腎功能受損者

腎功能受損者，在短期間內 (24 小時) 對 lidocaine 之廓清率影響不大；但長期或重覆給藥時，可能會因積蓄而發生毒性效應。

[藥物過量]

症狀

因使用局部麻醉劑導致急診之案例，通常係因血中藥物濃度過高，或意外將局部麻醉劑打到蜘蛛膜下腔所致 (參見不良反應及注意事項)。

意外的注射到血管內，毒性作用在 1-3 分鐘內明顯。

若是過量，最高血中濃度在 20-30 分鐘時可能尚未達到，視注射部位而定，毒性徵兆可能會延遲出現。毒性作用主要牽涉到中樞神經系統及心血管系統。

在兒童方面，某些案例中由於全身麻醉所造成的阻斷現象，使得局部麻醉的早期毒性徵兆可能很難被偵測。

急性毒性症狀

中樞神經系統之毒性是一種分級的反應，依症狀及徵兆而升高嚴重度。第一個症狀為口圍感覺異常 (circumoral paraesthesia)、舌頭麻木、頭重腳輕、聽覺過敏 (hyperacusis) 及耳鳴。視覺障礙及肌肉顫抖則比較嚴重，且在全身痙攣發作之前發生。不應將這些徵兆視為是神經質的行為。

失去意識及大發作痙攣可能會隨之發生，而且可能持續幾秒至幾分鐘。由於肌肉活動增加且正常呼吸受到干擾，因此在痙攣後很快的發生氧過少及高二氧化碳血症。在嚴重的病例可能會產生窒息。酸中毒會增加局部麻醉劑之毒性作用。

恢復是由於局部麻醉劑自中樞神經系統之再分佈及代謝。除非投與的劑量很大，否則可以很快恢復。

心血管毒性顯示狀況更為嚴重。低血壓、心跳過慢、心輸出量下降、心臟阻斷、心律不整，甚至心室心律不整、心室纖維性顫動、心跳停止，皆可能會因全身局部麻醉劑濃度太高所引起。

一般在心血管系統毒性作用發生之前，中樞神經系統毒性的徵兆已經出現，除非患者正在接受全身麻醉或以如 benzodiazepine 或 barbiturate 之類藥品重度鎮靜。在極少數的案例中，曾有未先出現中樞神經作用前兆而發生心跳停止的狀況。

藥物過量之治療

若出現急性全身性中毒，應立即停止注射局部麻醉劑。若發生痙攣則需要立即關照以維持患者之呼吸道，並藉由可傳送呼吸道正壓之面罩來協助或控制氧氣換氣。應評估循環是否足夠，應謹記用於治療痙攣之藥品當以靜脈注射時會抑制循環。

當痙攣持續時，儘管有適當的呼吸道支持，若病人的循環狀態許可，則可以靜脈注射如超短效作用之巴比妥鹽 (如 thiopentone) 或 benzodiazepine (如 diazepam) 等適當的抗痙劑。醫師在使用局部麻醉劑之前，應熟悉這些抗痙劑。Suxamethonium 可快速停止肌肉痙攣，但需要氣管插管及控制換氣，只有熟悉此過程者才可使用。如果發生心室纖維性顫動或心跳停止時，需進行有效之心臟復甦治療，必要時得持續一段時間。最佳供氧及換氣，支持循環系統及治療酸中毒對於維持生命皆非常重要。

若發生心血管抑制 (低血壓、心跳徐緩)，應考慮給予適當之處置，如給予靜脈注射液、血管收縮劑、心臟變時功能增強劑 (chronotropic agent) 或心肌收縮功能增強劑 (inotropic agent)。孩童應給予與年齡及體重相稱之劑量。血液透析對於 lidocaine 急性過量之治療價值極微小。

[上市產品及貯存條件]

Xylocaine 1.0%

(Lidocaine hydrochloride 10mg/mL)

5ml, 20ml Polyamp 安瓿

5ml Polyamp 安瓿應該存放於 25°C 以下。

20ml Polyamp 安瓿應該存放於 30°C 以下。

局部麻醉劑會與某些金屬起反應，並使其釋出離子；如果注射此有金屬離子的局部麻醉劑，可能引起嚴重局部刺激。必須採取適當之預防措施，以避免 xylocaine 溶液與金屬表面，如金屬碗盆、套管及針筒之金屬部分過長時間的接觸。

已變色的溶液，及安瓿單劑量包裝小瓶中未使用之剩餘溶液，應拋棄不用。

最新修訂日期：2010 年 9 月

製造廠：AstraZeneca Pty Ltd.

地址：(Plant) 10-14 Khartoum Road North Ryde, NSW 2113, Australia

(Office) Alma Road, North Ryde, New South Wales 2113, Australia

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

