

苦息樂卡因凝膠 2%

Xylocaine Jelly 2%

(lidocaine hydrochloride)

衛署藥輸字第 021286 號

本藥限由醫師使用

【成分】

有效成分：

每公克 Xylocaine 凝膠含 lidocaine hydrochloride 20 mg。

【劑型】

Xylocaine 凝膠係透明至幾乎透明，略微有色的凝膠。有效成分之基劑係由用羧丙基甲基纖維素（hydroxypropyl methylcellulose）增稠的水所組成。

凝膠注射劑(Jelly syringes)不含防腐劑。

管裝之 Xylocaine 凝膠另含甲基對羧基苯甲酸酯（methyl parahydroxybenzoate）與丙基對羧基苯甲酸酯（propyl parahydroxybenzoate）。

【適應症】

表面麻醉。

說明：

Xylocaine 凝膠適用於下述情況之表面麻醉和潤滑：

- 男性和女性之尿道，於施行膀胱鏡、導管插入術，以及藉由聲音或其他尿道內處置之探查時使用。
- 經鼻咽腔的內視鏡檢查，如胃鏡及氣管鏡。
- 直腸鏡及大腸鏡檢查。

- 氣管內插管。

與膀胱炎和尿道炎有關之疼痛的症狀治療。

兒童包皮環切術後之疼痛緩解。

【用法用量】

Xylocaine 凝膠 2% 在黏膜表面產生快速且顯著之麻醉效果，有長效性麻醉效果（約 20-30 分鐘）。麻醉效果通常快速產生（5 分鐘之內，視用藥部位而定）。

如同任何局部麻醉劑一樣，lidocaine 的安全性和有效性取決於適當的劑量、正確的技術、適當的預防措施和急救之準備。

下列劑量建議應被視為準則，在計算所需之劑量時，醫師的臨床經驗與對病人身體狀況的瞭解，都相當重要。

經由黏膜的吸收量常有變化，但是經由支氣管分支的吸收量特別高。Lidocaine 凝膠經由鼻咽的吸收量通常比其他的 lidocaine 產品低。將劑量高達 800 mg 之凝膠滴注於完整的尿道和膀胱後，lidocaine 的血中濃度相當低，而且低於毒性濃度。

衰弱或年紀大之病人、12 歲以上之兒童、急症病人、或敗血症病人，應視其年齡、體重及身體狀況，給予相配合之劑量。

年齡小於 12 歲之兒童，其劑量不可超過 6 mg/kg。

在二十四小時之內，不可給予超過四次之劑量。

尿道麻醉

成年男性尿道之表面麻醉：需要 20 mL 的凝膠（=400 mg lidocaine hydrochloride），以在男性身上產生適度的止痛效果。慢慢灌入凝膠，直到病人有壓痛的感覺，或者已經擠出半管（10 ml =200 mg lidocaine hydrochloride）為止。然後用陰莖鉗夾住陰莖冠，幾分鐘之後再灌入剩下的凝膠。

當麻醉格外重要時，例如施行探通術(sounding)及膀胱鏡檢查時，可將更大量的凝膠（30-40 mg）分成 3-4 份灌入，並讓它作用 10 分鐘，之後再插入儀器。將凝膠灌入膀胱內，也對這個部位的處置有效。

成年女性尿道之表面麻醉：分小部分灌入 5-10 mg 的凝膠，以充滿整個尿道。應等候幾分鐘，以產生適度的麻醉效果，再施行泌尿道處置。

內視鏡檢查

灌入 10-20 mg 凝膠，以產生適度的麻醉效果，並取少量的凝膠塗抹在儀器外部，

以產生潤滑作用。與其他 lidocaine 產品併用時（如支氣管鏡檢查），lidocaine 的總量不可超過 400 mg。

直腸鏡及大腸鏡檢查 (proctoscopy and rectoscopy)

過程中使用於肛門及直腸部位的量可用至 20 ml，lidocaine 的總量不可超過 400 mg。

氣管內插管之潤滑

施行插管之前，先取 2 ml 凝膠塗抹在管子的表面，應小心避免凝膠進入管腔內。

【禁忌症】

對醯胺類（amide）局部麻醉劑，或凝膠中其他成分有過敏病史者。

對醯胺類（amide）局部麻醉劑或其他賦形劑過敏者。

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）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。

【注意事項】

Lidocaine 產品的劑量過高或給藥間隔太短，可能會造成藥物的血漿濃度過高及嚴重的不良反應。應指導病人嚴格遵守建議劑量用藥（嚴重不良反應的之處置可能需要使用復甦設備、氧氣和其他急救藥物）（參閱【過量】）。

本藥由傷口及黏膜的吸收量比較多，尤其是支氣管分支。Lidocaine 凝膠經由鼻咽的吸收量常有變化，但通常比其他的 lidocaine 產品低。將 lidocaine 凝膠灌入尿道和膀胱之後，吸收量相當低。對於黏膜有創傷及/或給藥部位有局部敗血症之病人，使用 lidocaine 凝膠時應謹慎。

在口咽部使用局部麻醉劑，可能會妨礙吞嚥，因而增加吸入之危險性。舌頭或口腔黏膜麻木，可能增加咬傷之危險性。

本藥用於氣管內插管之潤滑時，應小心避免凝膠進入內視鏡管腔內，因凝膠於管腔內面之乾燥殘餘物可能會使管腔扭曲，管徑變窄，但鮮有殘餘物阻塞管腔之報告。

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。

如果其劑量或給藥可能造成藥物的血漿濃度過高，有些病人可能需要特別注意，

以免發生危險的副作用：

- 心臟傳導部分或完全阻斷之病人。
- 老年人及健康狀況差之病人
- 有晚期肝病或重度腎功能障礙的病人。

Xylocaine® gel 20mg/ml 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。

【交互作用】

對於服用中之藥物的化學結構與局部麻醉劑類似之病人，使用 lidocaine 時須謹慎，因為毒性反應有相加性。

特別針對局部麻醉劑與第三類抗心律不整藥物之交互作用之研究尚未被執行，但當治療病患時要小心注意。

重覆高劑量 lidocaine 持續給予一段長時間時，併用會減少 lidocaine 清除率的藥物（如 cimetidine 或是 β 受體阻斷劑）可能會造成 lidocaine 潛在的毒性血中濃度。若是遵照 lidocaine（如 Xylocaine Jelly 2%）的建議劑量做短期間的治療，則上述之交互作用沒有臨床上的重要性。

【懷孕與授乳期之使用】

已有許多孕婦及育齡婦女使用過 lidocaine，是相當合理的假設；但到目前為止，還沒有特定生殖過程障礙（例如增加胎兒畸形之發生率）之報告。

如同其他局部麻醉劑一樣，lidocaine 可進入母體之乳汁中，但如此之微量，通常對新生兒並無危險性。

【對駕駛與操作機器能力之影響】

局部麻醉劑對於精神功能可能有很輕微的影響，也可能暫時地使行動和協調功能受損，視其劑量而定。

【副作用】

局部反應

用 lidocaine 凝膠潤滑氣管內插管之後，曾有手術後「喉嚨痛」發生率增加之報告。

過敏反應

對醃胺類局部麻醉劑產生過敏反應（最嚴重的情況是過敏性休克）者相當罕見（ $<1/1000$ ）。凝膠的其他成分如甲基對羥基苯甲酸酯（methyl parahydroxy benzoate，僅限於管裝劑型）及丙基對羥基苯甲酸酯（propyl parahydroxy benzoate，僅限於管裝劑型）也可能引起此類反應。

急性全身毒性

如果因吸收快速或藥物過量，而導致藥物的血中濃度過高，lidocaine 會引起急性毒性反應（參閱【藥效學性質】及【過量】）。

【過量】

急性全身毒性

毒性反應主要發生在中樞神經系統與心臟血管系統。

中樞神經系統的毒性是一種層次分明的反應，其症狀與徵候會逐漸加重。最初的症狀是嘴唇周圍感覺異常、舌頭麻木、頭暈、聽覺過敏、耳鳴。視覺障礙和肌肉震顫是比較嚴重之症狀，其後即為全身痙攣。接著可能發生意識喪失及癲癇大發作痙攣，可能持續幾秒至數分鐘。由於肌肉的活動增加，再加上正常呼吸之干擾，以致很快就發生缺氧及血碳酸過多。嚴重時可能會導致呼吸停止。酸中毒會加強局部麻醉劑的毒性反應。

局部麻醉劑由中樞神經系統的再分佈與代謝之後，可恢復正常。除非投予大量藥物，否則很快即可恢復。

心血管反應僅見於全身性濃度過高時，此類案例可能引發嚴重之低血壓、心搏徐緩、心律不整及心血管虛脫。

除非病人正在接受全身麻醉，或因使用藥物（如 benzodiazepine 或 barbitrate）而處於重度鎮靜狀態下，否則在出現心血管系統的毒性反應之前，通常會先出現中樞神經系統中毒的徵候。

急性毒性之治療

若出現全身毒性之症狀，其徵兆本質上預期會與局部麻醉劑經由其他投與途徑而產生之徵兆相似。局部麻醉劑之毒性會以神經系統興奮之症狀表現，在某些嚴重的案例，會以中樞神經緊張及心血管抑制表現。

嚴重的神經學症狀出現時（痙攣、中樞神經系統抑制）必須以呼吸支持療法及投予抗痙攣藥物來做症狀上之治療。

發生循環停止時，應立即施行心肺復甦術，持續的提供適度的氧氣及換氣、維持循環系統，以及治療酸中毒，都是維持生命所必須之重要措施。

【藥效學性質】

藥物治療族群分類：局部麻醉劑，ATC code N01BB02

Xylocaine 凝膠 2% 在黏膜表面產生快速且顯著之麻醉效果，並有潤滑作用，減少摩擦。其水溶性基劑具有高度黏性，表面張力小，能與組織緊密且長時間接觸，故有長效性麻醉效果（約 20-30 分鐘）。麻醉效果通常快速產生（5 分鐘之內，視用藥部位而定）。

Lidocaine 與其他局部麻醉劑一樣，藉其阻止鈉離子經過神經細胞膜之向內移動，可逆性地阻斷神經衝動沿著神經纖維傳播。一般認為醯胺類局部麻醉劑作用在神經細胞膜的鈉離子通道內。

局部麻醉劑對於腦與心肌的可興奮細胞膜也有類似的作用。如果過量的藥物快速達到全身循環，就會出現來自中樞神經系統與心血管系統的毒性症狀與徵候。

中樞神經系統毒性通常比心血管系統的毒性反應先出現（參閱【過量】），因其在較低的血漿濃度便會發生。局部麻醉劑對心臟的直接效應包括降低傳導速率、降低心臟收縮力，也許還會使心跳停止。

【藥動學性質】

Lidocaine 在局部塗抹於黏膜後被吸收，其吸收速率與吸收量視使用的濃度、給藥總量、給藥特定部位及與藥物接觸之時間長短而定。一般而言，氣管內給藥及支氣管給藥之吸收速率最快。**Lidocaine** 在胃腸道之吸收亦良好，然而因肝臟之生體轉化作用，在血中其未經代謝之原藥相當少。

通常約有 65% 的 **lidocaine** 與血漿蛋白質結合。醯胺類局部麻醉劑主要與 α -1-酸性糖蛋白（ α -1-acid glycoprotein）結合，但也會與白蛋白結合。**Lidocaine** 可穿越血腦及胎盤障壁，可能係經由被動擴散作用。

Lidocaine 的主要排除途徑為肝臟代謝。**Lidocaine** 在人體的主要代謝途徑是 N-去烷基作用，形成 monoethylglycine xylicine (MEGX)，其後水解成 2,6 xylicine，羥基化形成 4-hydroxy-2,6-xylicine。MEGX 也可進一步去烷基化形成 glycine xylicine (GX)。MEGX 和 GX 的藥理及毒性作用與 **lidocaine** 類似，但強度較弱。GX 的半衰期比 **lidocaine** 長（約 10 小時），長期給藥會蓄積在體內。靜脈注射之 **lidocaine** 約有 90% 以各種代謝物的形式，少於 10% 則以原型由尿液排除。其在尿

中之主要代謝物為 4-hydroxy-2,6-xylidine 之結合物，約佔尿中排除劑量的 70-80%。

Lidocaine 靜脈注射後之排泄半衰期為 1.5-2.0 小時。因為 lidocaine 的代謝速率很快，所以任何影響肝功能之狀況都會改變 lidocaine 的動力學。肝功能不良的病人，其半衰期可能延長為 2 倍或更久。腎功能不良不會影響 lidocaine 的動力學，但可能會增加其代謝物的蓄積。

酸中毒及使用中樞神經系統之興奮劑和抑制劑等因素，均會影響足以引起明顯全身反應所需之 lidocaine 之中樞神經系統濃度。當游離態 lidocaine 的靜脈血漿濃度超過 6 µg/mL，客觀的不良反應便愈來愈明顯。

【臨床前之安全資料】

在動物實驗中，注意到在高劑量的 lidocaine 之下會產生包括影響中樞神經系統及心血管系統的毒性。在生殖毒性的實驗中並無顯示有藥物相關的副作用，且在體內及體外的遺傳突變試驗中，也並未顯示 lidocaine 有潛在的致突變性。Lidocaine 尚未被執行與癌症相關之研究，由於此藥在治療使用上之範圍及其作用時間的關係。

Lidocaine 的基因毒性測試結果並無證據顯示有致突變之可能性，而 lidocaine 之代謝物 2,6-xylidine 在某些基因毒性測試顯示微弱的致基因毒性證據。在一些慢性暴露之前臨床毒理試驗評估中，顯示代謝物 2,6-xylidine 具有致癌之可能性。以風險評估來比較間歇性使用 lidocaine 在人類計算到的最大暴露量以及臨床前試驗所使用的暴露量，顯示臨床上的使用具有很大的安全限度。

【賦形劑清單】

- 羥丙基甲基纖維素
- 氫氧化鈉 2 mol/L

及/或

- 鹽酸 2 mol/L，調整至 pH 6.2-6.8
- 甲基對羥基苯甲酸酯
- 丙基對羥基苯甲酸酯
- 純水

【特殊儲存注意事項】

儲存溫度不可超過 25°C，不可冷凍。

【使用與處理說明】

凝膠注射器僅供單次使用。

【保存期限】

參閱外包裝。

【包裝】

參閱外包裝。

【修訂日期】

2009 年 6 月

Xylocaine 為阿斯特捷利康公司集團所有之商標。

01/JG/TW.PAIN.000-076-537.4.0

製造廠名：Recipharm Karlskoga AB

製造廠址：Björkbornsvägen 5 SE-691 33 Karlskoga, Sweden.

藥商名稱：臺灣阿斯特捷利康股份有限公司

藥商地址：台北市敦化南路二段 207 號 21 樓

電 話：(02) 2378-2390