**利多卡因**

文章版本号：3

最后发布时间：2014-4-15 9:47:50

**【药物名称】**

中文通用名称：利多卡因

英文通用名称：Lidocaine

其他名称：达络、立快妥、利度卡因、利舒卡、塞罗卡因、赛露鹰、赛罗卡因、抒利、昔罗卡因、Anestacon、Duncaine、Gravocain、Lida-Mantle、Lidocainum、Lidoderm、Lignocaine、Lignostab、Xylestesin、Xylocaine、Xylocard、Xylocitin、Xylotox。

**【药理分类】**

麻醉用药及麻醉辅助药>>麻醉用药>>局部麻醉用药

镇痛药>>阿片类镇痛药

心血管系统用药>>抗心律失常药>>钠通道阻滞药(Ⅰ类)

神经系统用药>>抗癫痫药及抗惊厥药

镇痛药>>抗偏头痛药

镇痛药>>其它镇痛药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.主要用于浸润麻醉、硬膜外麻醉、表面麻醉(包括在胸腔镜、上消化道内镜检查或腹腔手术时作黏膜麻醉用)及神经传导阻滞。

2.盐酸利多卡因注射液可用于急性心肌梗死后室性期前收缩和室性心动过速，亦可用于洋地黄类中毒、心脏外科手术及心导管引起的室性心律失常。但对室上性心律失常通常无效。

**其他临床应用参考**

1.用于带状疱疹后遗神经痛。(FDA批准适应症)

2.盐酸利多卡因注射液可用于控制癫痫持续状态，有效治疗对其他药物已产生耐药性的癫痫发作。

3.鼻内给予盐酸利多卡因注射液对治疗偏头痛有效。

4.静脉注射可用于治疗慢性疼痛综合征。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.表面麻醉  (1)盐酸利多卡因胶浆：①胃镜检查前5-10分钟将本药含于咽喉部片刻后慢慢咽下，2-3分钟后可将胃镜插入进行检查。一次10g。②涂抹于食管、咽喉、气管或尿道等导管的外壁。③阴道检查：用棉花签蘸5-7ml涂于局部。④尿道扩张术或膀胱镜检查：用量200-400mg。(2)盐酸利多卡因气雾剂：可供作内镜检查用，一次10-30ml(2%)或一次5-15ml(4%)。咽喉、气管用最大剂量为一次100-200mg。(3)盐酸利多卡因注射液：一次不超过100mg(2%-4%)。注射给药时一次量不超过4.5mg/kg(不用肾上腺素)或7mg/kg(用1:200000浓度的肾上腺素)。

2.局部浸润麻醉  盐酸利多卡因注射液(0.25%-0.5%)：一次50-300mg。

3.区域阻滞麻醉  盐酸利多卡因注射液(0.25%-0.5%)：治疗用静注，首剂1-2mg/kg，极量4mg/kg；静滴每分钟以1mg为限。反复多次给药，间隔时间不得短于45-60分钟。

4.神经(干、丛)阻滞  (1)碳酸利多卡因注射液：一次15ml(259.5mg)，极量20ml(346mg)。(2)盐酸利多卡因注射液：①臂丛(单侧)：250-300mg(1.5%)。②口腔：20-100mg(2%)。③肋间神经(每支)：30mg(1%)，极量为300mg。④宫颈旁浸润：左右侧各100mg(0.5%-1%)。⑤椎旁脊神经阻滞(每支)：30-50mg(1%)，300mg为限。⑥阴部神经：左右侧各100mg(0.5%-1%)。

5.交感神经节阻滞  (1)颈星状神经节：盐酸利多卡因注射液(1%)，一次50mg。(2)腰麻：盐酸利多卡因注射液(1%)，一次50-100mg。

6.硬膜外麻醉  (1)盐酸利多卡因注射液(1.5%-2%)：胸腰段250-300mg。(2)碳酸利多卡因注射液：根据需要阻滞的节段数和患者情况调节用量，常用量为10-15ml。

7.骶管阻滞  盐酸利多卡因注射液(1%)：用于分娩镇痛，剂量为200mg。

·心律失常

1.静脉注射  按1-1.5mg/kg(一般50-100mg)作为首次负荷量静脉注射2-3分钟，必要时每5分钟重复1-2次。1小时内最大负荷量为4.5mg/kg(或0.3g)，最大维持剂量为每分钟4mg。

2.静脉滴注  用负荷量后以1-4mg/min或0.015-0.03mg/(kg·min)的速度静脉滴注。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全者用于抗心律失常时应减少用量，盐酸利多卡因注射液(0.1%)以0.5-1mg/min静脉滴注，每小时不超过100mg。

◆肝功能不全时剂量

肝功能不全者用于抗心律失常时应减少用量，盐酸利多卡因注射液(0.1%)以0.5-1mg/min静脉滴注，每小时不超过100mg。碳酸盐注射液作硬膜外阻滞时也应酌减药量。

◆老年人剂量

老年人用药应根据需要及耐受程度调整剂量，大于70岁患者剂量减半。用于抗心律失常时，盐酸利多卡因注射液(0.1%)以0.5-1mg/min的速度静脉滴注，每小时不超过100mg。

◆其他疾病时剂量

心力衰竭、心源性休克、肝血流量减少者用于抗心律失常时应减少用量，盐酸利多卡因注射液(0.1%)以0.5-1mg/min静脉滴注，每小时不超过100mg。心功能不全者用其碳酸盐注射液作硬膜外阻滞时也应酌减药量。

**儿童**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.局部给药  (1)用于麻醉时，盐酸利多卡因剂的用量因个体而异，一次给药最高总量不超过4-4.5mg/kg，常用浓度为0.25%-0.5%，特殊情况才可用1%浓度。(2)皮肤局部麻醉，利多卡因软膏(5%)：用药局部不超过5g(含本药250mg)，最大日剂量为17-20g(含本药850-1000mg)。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.局部给药  白内障手术局部麻醉，盐酸利多卡因凝胶(2%)：手术前15-20分钟局部用药3-5次。或盐酸利多卡因注射液(4%)：每侧眼一次2滴，缓慢滴入每侧眼中，手术前60分钟给药6次。

2.颈交感神经阻滞  盐酸利多卡因注射液(1%)：总剂量为5ml(50mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

3.局部浸润麻醉  盐酸利多卡因注射液(0.5%-1%)：总剂量为1-60ml(5-300mg)，最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

4.皮肤表面麻醉  离子电渗疗法，上升阶段，在30秒内使得电流从0上升至1.77毫安；主要传导阶段，使电流保持1.77毫安持续9分钟；下降阶段，在30秒内使得电流缓慢的下降至0。

5.静脉区域阻滞  盐酸利多卡因注射液(0.5%)：总剂量为10-60ml(50-300mg)，最大个体剂量不得超过4mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

6.腰椎硬膜外麻醉  依据需要麻醉的皮区数量确定剂量(每皮区2-3ml)。或使用盐酸利多卡因注射液(1.5%)：15-20ml(225-300mg)；盐酸利多卡因注射液(2%)：10-15ml(200-300mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

7.骶管麻醉  (1)用于产科麻醉，盐酸利多卡因注射液(1%)：20-30ml(200-300mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。(2)用于外科手术麻醉，盐酸利多卡因注射液(1.5%)：15-20ml(225-300mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

8.胸椎硬膜外麻醉  盐酸利多卡因注射液(1%)：20-30ml(200-300mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

9.腰交感神经阻滞  盐酸利多卡因注射液(1%)：5-10ml(50-100mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

10.泌尿道给药  用于泌尿系操作，盐酸利多卡因胶浆(2%)：男性：15ml(300mg)尿道内缓慢给药，为取得充分麻醉可额外再给予本药15ml(300mg)。12小时内最大剂量为600mg。女性：3-5ml(60-100mg)尿道内缓慢给药，12小时内最大剂量为600mg。

11.宫颈旁阻滞  盐酸利多卡因注射液(1%)：每侧10ml(100mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

12.臂丛阻滞  盐酸利多卡因注射液(1.5%)：15-20ml(225-300mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

13.口腔麻醉  盐酸利多卡因注射液(2%)：1-5ml(20-100mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

14.肋间神经阻滞  盐酸利多卡因注射液(1%)：3ml(30mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

15.脊柱旁神经阻滞  盐酸利多卡因注射液(1%)：3-5ml(30-50mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

16.阴部神经阻滞  盐酸利多卡因注射液(1%)：每侧10ml(100mg)。最大个体剂量不得超过4.5mg/kg，最大总剂量不得超过300mg。

17.经眼给药  盐酸利多卡因眼用凝胶：眼部计划手术区域缓慢滴入2滴，为维持麻醉效果可重复给药。

18.静脉给药  用于诱导快速气管插管，插管前2-3分钟给予本药1.5mg/kg。

19.脊椎麻醉  盐酸利多卡因注射液(5%)：1ml(50mg)，或盐酸利多卡因注射液(1.5%)：0.6-1ml(9-15mg)。

20.黏膜给药  利多卡因溶液(2%)：一次15ml，冲洗并吐出(口)或冲洗并吞下(咽)，可视需要每3小时给药1次。最大剂量为一日8剂或一日4.5mg/kg。

·室性心律失常

1.静脉给药  负荷剂量为一次50-100mg(0.7-1.4mg/kg)，静脉注射2-3分钟。可每5分钟重复1次，直至任何1小时内的剂量达到300mg。维持时，静脉滴注速率为1-4mg/min[0.014-0.057mg/(kg·min)]。发生心室颤动时，初始剂量为1-1.5mg/kg，若室颤持续可每5-10分钟给予额外剂量0.5-0.75mg/kg。最大剂量为3mg/kg。

·带状疱疹后遗神经痛

1.局部给药  使用本药贴片一次不超过3片，24小时周期内可保留12小时。

·癫痫持续状态

1.静脉给药  盐酸利多卡因注射液：用于癫痫持续状态，一次1.5-2mg/kg。

·偏头痛

1.经鼻给药  盐酸利多卡因注射液(4%)：用于偏头痛，一次0.4-0.5ml。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全者无需调整剂量。

◆肝功能不全时剂量

1.严重肝病患者使用本药贴片时需减少剂量(如减少贴片使用数、减少治疗区域、缩短用药时间)。

2.肝病患者使用本药注射液需减慢滴注速率，但无需调整负荷剂量。

◆老年人剂量

70岁及70岁以上伴有充血性心力衰竭、心源性休克或肝病的患者应降低负荷剂量(约为常规剂量的50%)，同时减慢滴注速率至1-2mg/min。

◆透析时剂量

血液透析后无需追加剂量。

◆其他疾病时剂量

充血性心力衰竭患者在使用本药治疗心律失常时应调整剂量，但具体调整方案目前仍存在分歧。

**儿童**

◆常规剂量

·局部麻醉

1.颈交感神经阻滞  瘦体重和身体发育正常的3岁以上儿童，依据年龄和体重确定最大剂量(3.3-4.4mg/kg)，且应一直采用最低有效浓度和剂量。

2.局部浸润麻醉  同“颈交感神经阻滞”。

3.静脉区域阻滞  盐酸利多卡因稀溶液(0.25%-0.5%)：推荐总剂量不超过3mg/kg，且应一直采用最低有效浓度和剂量。

4.腰椎硬膜外麻醉  同“颈交感神经阻滞”。

5.骶管麻醉  同“颈交感神经阻滞”。

6.胸椎硬膜外麻醉  同“颈交感神经阻滞”。

7.腰交感神经阻滞  同“颈交感神经阻滞”。

8.臂丛神经阻滞  同“颈交感神经阻滞”。

9.口腔麻醉  同“颈交感神经阻滞”。

10.肋间神经阻滞  同“颈交感神经阻滞”。

11.脊柱旁神经阻滞  同“颈交感神经阻滞”。

12.阴部神经阻滞  同“颈交感神经阻滞”。

13.静脉给药  用于诱导快速气管插管，一次1-2mg/kg插管前2-5分钟给药。

14.黏膜给药  利多卡因(2%)溶液：用于3岁及3岁以上儿童，一次约3.3-4.4mg/kg，冲洗并吐出(口)或冲洗并吞下(咽)，视需要可每3小时重复给药1次，最大剂量为一日8剂。用于3岁以下婴幼儿时，棉签蘸取本药1.25ml涂布于目标部位，视需要可每3小时1次，最大剂量为一日8剂。

15.局部给药  (1)用于伤口局部麻醉，盐酸利多卡因乳膏(4%和5%)：体重低于10kg的儿童，涂布面积不得超过100cm2；体重为10-20kg的儿童，涂布面积不得超过200cm2。(2)用于皮肤局部麻醉，利多卡因软膏(5%)：最大剂量为4.5mg/kg。

·室性心律失常

1.静脉给药  负荷剂量为1mg/kg(不超过100mg)，滴注速率为每分20-50μg/kg。

2.骨内给药  负荷剂量为1mg/kg(不超过100mg)。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全者无需调整剂量。

◆肝功能不全时剂量

肝病患者使用本药注射液需减慢滴注速率，但无需调整负荷剂量。

◆透析时剂量

血液透析后无需追加剂量。

◆其他疾病时剂量

休克、充血性心力衰竭和心脏停搏的患者可使用常规的弹丸式注射剂量，但滴注速率不得超过每小时1ml/kg。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

浸润麻醉  注射针头不应穿过感染区或肿瘤区，以防炎症扩散或肿瘤种植，可改用阻滞麻醉。

**注射液的配制**

盐酸利多卡因注射液用于抗心律失常时，静脉滴注一般以5%葡萄糖注射液配成1-4mg/ml药液滴注或用输液泵给药。

**【禁忌症】**

1.对本药或其他局部麻醉药过敏者。

2.严重心脏传导阻滞(包括窦房、房室传导阻滞及心室内传导阻滞)患者禁用本药注射剂。

3.预激综合征患者禁用本药注射剂。

4.阿-斯氏综合征(急性心源性脑缺血综合征)患者禁用本药注射剂。

5.有癫痫大发作史及未经控制的癫痫患者。

6.严重肝功能不全者。

7.卟啉病患者。

8.应用部位炎症、黏膜破损禁用本药气雾剂(国外资料)。

**【慎用】**

1.充血性心力衰竭患者。

2.严重心肌受损者。

3.低血容量及休克患者。

4.肝血流量减低患者。

5.高血压伴动脉硬化患者。

6.冠心病患者。

7.严重肾病患者(国外资料)。

8.心动过缓患者(国外资料)。

9.假胆碱酯酶缺乏者(国外资料)。

10.年老体弱者。

11.新生儿和早产儿。

12.妊娠期妇女。

**【特殊人群】**

**儿童**

新生儿用药可引起中毒，本药在早产儿中的半衰期为3.16小时，较正常婴儿(1.8小时)长，故新生儿和早产儿慎用。

**老人**

老年患者用药时，因药物清除率降低而半衰期延长，对中枢神经系统和心脏影响的风险增加。

**妊娠期妇女**

1.本药可透过胎盘屏障，与胎儿的蛋白结合率高于成人，也可导致胎儿心动过缓或心动过速，新生儿高铁血红蛋白血症，故妊娠期妇女慎用。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为B级。

**哺乳期妇女**

本药可随乳汁排泄，但国外认为哺乳期妇女用药是安全的。

**特殊疾病状态**

1.假胆碱酯酶缺乏者：此类患者用药可增加出现本药毒性的风险，应慎用。

2.严重肾病患者：此类患者重复使用本药可能因药物蓄积而致中毒，应慎用。

**【不良反应】**

1.心血管系统  低血压、心动过缓。血药浓度过高可引起心房传导速度减慢、房室传导阻滞以及抑制心肌收缩力和心排血量下降。还可出现室颤、心搏停搏、QT间期缩短、心肌梗死、静脉炎、血管收缩。有升高心脏除颤阈值的报道。心房颤动患者静脉给予本药偶可出现心室率加快。

2.呼吸系统  支气管痉挛、呼吸抑制。本药胶浆剂曾在手术中造成气道阻塞，使吸气相和呼气相的通气时间均延长。还可见呼吸停止。

3.肌肉骨骼系统  背痛、重度肌无力，在关节内镜和其他外科手术后进行关节内注射还可能出现关节软骨溶解。

4.泌尿生殖系统  尿道炎。

5.神经系统  可见嗜睡、感觉异常、肌肉震颤、惊厥、昏迷。还可出现头晕目眩、困倦、头晕、热感、冷感、麻木感、癫痫发作、头痛、眩晕、定向力障碍、抽搐等，尤其易在药物血浆浓度超过5μg/ml时发生。严重的不良反应常以嗜睡及感觉异常为先兆。剂量过大、吸收过快还可导致中毒反应，表现为耳鸣、激动、烦躁等中枢神经兴奋症状，并可发展为抽搐、昏迷、血压下降等。

6.精神  精神紊乱、欣快感、忧虑。

7.胃肠道  味觉障碍、呕吐。

8.血液  高铁血红蛋白血症、出血倾向、血小板紊乱。

9.皮肤  水肿、红斑。

10.眼  视觉障碍、眼部发热、结膜充血、角膜上皮缺损、复视。

11.过敏反应  本药气雾剂偶可引起超敏反应和过敏反应。此外，有本药口腔局部麻醉致过敏性休克继发急性左心力衰竭的个案报道。

12.其他  休克、椎旁脓肿、注射部位疼痛、恶性高热。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.西咪替丁、β-肾上腺素受体阻断药(普萘洛尔、美托洛尔、纳多洛尔)：

结果：合用可引起心脏和神经系统不良反应。

机制：本药经肝脏代谢受抑制，可使血药浓度增加。

处理：合用应调整本药剂量，并监测心电图及本药血药浓度。

2.安普那韦、利托那韦、达福普汀、洛匹那韦、奎奴普丁：

结果：合用可使本药血药浓度升高。

机制：以上药物可抑制细胞色素P450 3A4介导的本药代谢。

处理：合用应监测本药血药浓度，并据此调整剂量。

3.阿扎那韦：

结果：合用可使本药血药浓度升高，出现心脏毒性(QT间期延长、尖端扭转型室性心动过速、心脏停搏)的风险增加。

机制：阿扎那韦抑制细胞色素P450 3A4介导的本药代谢。

处理：合用应监测心电图和本药血药浓度。

4.达芦那韦：

结果：合用可使本药血药浓度升高。

处理：合用应谨慎，并监测本药血药浓度和不良反应(头晕、低血压、室性心律失常)。

5.圣约翰草：

结果：合用可增强本药的心血管系统毒性，并延迟其起效时间。

处理：使用本药前应停用圣约翰草至少5日。

6.玻璃酸酶：

结果：合用可增加本药的扩散，使本药起效加快，减少局部浸润引起的肿胀，但同时又可增加本药的吸收，增加发生全身毒性的风险。

7.地拉韦啶：

结果：合用可使本药毒性增加(室性心律失常、低血压、心力衰竭恶化)。

处理：合用应监测本药血药浓度和不良反应。

8.喷布洛尔：

结果：合用可使本药分布容积升高和消除半衰期延长。

9.Ⅲ类抗心律失常药物(如胺碘酮、溴苄铵、索他洛尔、多非利特、伊布利特)、Ⅰ类抗心律失常药物(如美西律、妥卡尼、莫雷西嗪、普罗帕酮、奎尼丁)：

结果：合用可能增加心脏毒性(心排血量减少，总外周血管阻力和平均动脉压降低)。

处理：合用时应密切监测心电图。

10.阿布他明：

结果：合用可能加剧或诱发室上性或室性心律失常。

处理：两药不可合用。

11.双氢麦角胺：

结果：合用可能导致血压极度升高。

处理：禁忌两药合用。

12.巴比妥类药物：

结果：合用可引起心动过缓、窦性停搏。

机制：此类药物可促进本药代谢。

13.顺阿曲库铵、瑞库溴铵、琥珀胆碱：

结果：合用可增强以上药物的神经肌肉阻滞作用。与琥珀胆碱合用还可能抑制呼吸。

处理：合用应调整以上药物的剂量。

14.硫酸吗啡脂质体：

结果：硬膜外联合给药时，可使吗啡的血药峰浓度升高。

15.丙泊酚：

结果：合用可增强丙泊酚的麻醉效应。

处理：合用应减少丙泊酚剂量。

16.氧化亚氮：

结果：本药可降低氧化亚氮的麻醉阈值，导致氧化亚氮中毒(窒息)。

处理：合用需减少氧化亚氮剂量。

17.普鲁卡因：

结果：合用可产生一过性谵妄及幻觉，但不影响本药血药浓度。

18.依曲韦林、奈韦拉平：

结果：合用可使本药血药浓度降低。

机制：以上药物可诱导细胞色素P450 3A4介导的本药代谢。

处理：合用时应谨慎。

19.可乐定：

结果：硬脑膜外联合给药时，可使本药血药峰浓度下降。

20.异丙肾上腺素：

结果：合用可使本药总清除率升高。

机制：异丙肾上腺素可增加肝血流量。

21.去甲肾上腺素：

结果：合用可使本药总清除率下降。

机制：去甲肾上腺素可减少肝血流量。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.盐酸利多卡因注射液不宜用于无器质性心脏病的单纯室性期前收缩。

2.神经病、败血症、脊柱畸形、严重高血压患者进行腰麻和骶管麻醉时应谨慎。

3.正接受单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药治疗的患者使用本药和血管收缩药时应谨慎，有导致严重持久的高血压风险。

4.本药胶浆剂不可作为气道内或探针内的润滑剂使用。

5.硬膜外阻滞或脊椎麻醉应避免使用含有防腐剂的麻醉药。

6.本药与肾上腺素或其他血管收缩药合用时，应避免使用麦角类催产药。

7.有炎症和脓毒症患者应在被推荐的部位注射使用。

8.本药毒性较普鲁卡因大，且易于扩散，应严格掌握用药总量。

9.头颈区域给药不应超过推荐剂量。

10.用于抗心律失常时：(1)除过敏反应外，疗效及不良反应程度与血药浓度相关。(2)由于药物迅速分布到组织中，达到治疗血药浓度迟缓，为了能较快地得到有效浓度，宜用负荷剂量加静脉维持量，如首次负荷量后5分钟不能达到理想效果，可再用首次量的1/3-1/2。(3)长期静脉滴注，遇有心脏或肝脏功能障碍者，应减慢滴注速度，以免超量。

11.在血供较少的部位(手指、耳鼻和阴茎等)合用本药和血管收缩药时，可使血流减少(如缺血性损伤或坏疽)。

12.本药不宜与金属器具长期接触。

13.某些疾病如急性心肌梗死患者常伴有α1-酸性蛋白及蛋白率增加，本药蛋白结合也增加，从而降低了游离血药浓度。

14.在破损或发炎的皮肤使用本药可能会引起全身吸收增加。

15.窦性心动过缓或不完全性心脏传导阻滞患者使用本药消除室性异位搏动，如事先未加快心率(如给予异丙肾上腺素或电刺激)，出现室性心律不齐的频率和严重程度更高，并可能出现完全性心脏传导阻滞。

**交叉过敏**

对其他酰胺类局麻药过敏者，对本药也可能过敏，但尚无本药与普鲁卡因胺、奎尼丁间交叉过敏反应的报道。

**不良反应的处理方法**

1.如心电图P-R间期延长或QRS波增宽，出现其他心律失常或原有心律失常加重者应立即停药，必要时用阿托品、异丙肾上腺素或起搏器治疗；血压下降时给予吸氧、纠正酸中毒及升压药；保持气道通畅等。

2.出现惊厥时可静注地西泮、短效巴比妥制剂或短效肌肉松弛药。

3.出现精神紊乱，一般在停用本药后恢复。持续发病者可用三氟拉嗪治疗。

4.给予纳洛酮可使静脉注射本药后呼吸频率减慢的发生率明显降低。

5.有报道，通过在液体中添加肝磷脂或氢化可的松(或两药同时使用)以及限制静脉输注的持续时间，在24小时内可减轻继发于输注本药的静脉炎。用量为肝磷脂每日4000U和(或)氢化可的松每日20mg。

**药物对检验值或诊断的影响**

本药可使血清肌酸酐值假性升高。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

用药期间应监测血压、心电图、电解质、血药浓度。

**参考值范围**

1.治疗浓度：1.5-5.0μg/ml(SI：6-21μmol/L)。

2.潜在毒性浓度：大于6μg/ml(SI：＞26μmol/L)。

3.毒性浓度：大于9μg/ml(SI：＞38μmol/L)。

**高警讯药物**

美国安全用药规范研究院(ISMP)将本药定为高警讯药物，使用不当将给患者带来严重危害。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

1.与牙科治疗相关的主要不良反应：口腔金属味。

2.牙科用药的常规剂量：成人，用于疱疹后遗神经痛的局部麻醉，将本药贴片用于疼痛最剧烈区域，单次应用最多可使用3片，在任何一个24小时周期内，贴片可保留时间长达12小时。

**精神状况信息**

对精神状态的影响：本药较少引起激动、焦虑、欣快感和幻觉。

**护理注意事项**

1.牙科使用时应预防窒息，并在操作前1小时避免进食或饮水。

2.静脉注射时应严密监测生命体征(心电图)，并评估不良反应和中枢神经系统毒性。

3.实验室检查：监测本药血药浓度。

**【药物过量】**

**过量的表现**

用药过量可引起惊厥和心脏停搏。

**【药理】**

**药效学**

本药为中效酰胺类局麻药和Ⅰb类抗心律失常药。作为局麻药时，其对周围神经的作用机制与其他局麻药相同，通过抑制神经细胞膜的钠离子通道起到阻断神经兴奋与传导的作用，对中枢神经系统有兴奋和抑制双相作用。本药的局部麻醉作用较普鲁卡因强，维持时间较普鲁卡因长1倍，毒性也相应增加。血药浓度低时，患者出现镇静作用，痛阈提高，能抑制咳嗽反射。当血药浓度超过5μg/ml时，则出现中毒症状，甚至引起惊厥。

本药盐酸盐与碳酸盐均由利多卡因碱基产生局麻作用。与盐酸盐相比，碳酸盐的阻滞作用较强，起效较快，肌肉松弛也较好。

本药作为抗心律失常药时，主要作用于浦肯野纤维和心室肌，抑制Na+内流，促进K+外流，明显缩短动作电位时程，相对延长有效不应期及相对不应期，降低心肌兴奋性，减慢传导速度，提高室颤阈，故能有效抗室性心律失常。对于受损和部分去极化的纤维，能恢复其正常传导功能。但随血药浓度升高，可引起心脏传导速度减慢、房室传导阻滞以及抑制心肌收缩力和心排血量下降。

**药动学**

本药碳酸盐和盐酸盐的药代动力学参数无显著差别。肌注后5-15分钟起效，一次肌注200mg后15-20分钟达治疗浓度，持续60-90分钟；静脉注射后立即起效(45-90秒)，持续10-20分钟。治疗血药浓度为1.5-5μg/ml，中毒血药浓度为5μg/ml以上。达稳态血药浓度的时间，一般人须持续静脉滴注3-4小时，急性心肌梗死者则需8-10小时。另有报道提到性别对本药的药动学有影响，给予同一剂量后男性的血药浓度较女性高。

本药90%经肝代谢，其代谢物单乙基甘氨酰二甲苯胺(MEGX)及甘氨酰二甲苯胺(GX)具有药理活性，持续静脉滴注24小时以上者，代谢产物可产生治疗及中毒作用。静脉注射后半衰期α相(t1/2α)不超过30分钟，半衰期β相为1-2小时。GX半衰期较长，约10小时，MEGX半衰期近似原药。心力衰竭、肝病患者、老年人及持续静脉滴注24-36小时以上者，药物的清除减慢。本药经肾脏排泄，10%为原形，58%为代谢物(GX)，不能被血液透析清除。

本药气雾剂吸收后，组织分布快而广，能透过血-脑脊液屏障和胎盘屏障。大部分经肝微粒体酶降解，随尿排出，少量随胆汁排泄。

**【制剂与规格】**

盐酸利多卡因注射液  (1)2ml:4mg。(2)2ml:40mg。(3)2ml:400mg。(4)5ml:50mg。(5)5ml:100mg。(6)10ml:200mg。(7)20ml:400mg。

碳酸利多卡因注射液(按利多卡因计)  (1)5ml:86.5mg。(2)10ml:173mg。(3)15ml:86mg。

盐酸利多卡因胶浆  10g:200mg。

盐酸利多卡因气雾剂  (1)2%。(2)4%。

盐酸利多卡因眼用凝胶  3.5%(1ml:35mg)。

利多卡因贴片  5%(1g:50mg)。

盐酸利多卡因溶液  2%(1ml:20mg)。

**【贮藏】**

注射液：密封保存。

胶浆：密封保存。

气雾剂：密封保存。

凝胶：遮光，于15-25℃密封保存。

贴片：于25℃(15-30℃)保存。

溶液：于20-25℃保存，不得冷冻。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 92977 版本 1.0