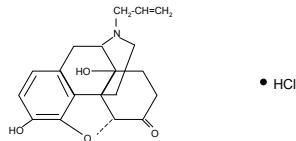


解麻注射液 0.4 毫克/毫升
Naloxone Injection “G.B.L.” 0.4mg/ml
衛署藥製字第 **G-9234** 048184 號
鴉片類藥品拮抗劑

組成

本藥(Naloxone Hydrochloride 注射液，美國藥典)是一種鴉片類藥品拮抗劑，是 Oxymorphone 的同種合成物。結構上與 Oxymorphone 不同點在於氮原子上以丙烯基取代甲基。



Naloxone Hydrochloride 為白色至半透明粉末，可溶於水、弱酸及強鹼中，微溶於酒精，幾乎不溶於乙醚及氯仿。

本藥為供靜脈注射、肌肉注射及皮下注射的滅菌溶液，有三種不同濃度：每毫升含有 0.02mg、0.4mg 及 1.0mg 的 Naloxone Hydrochloride。於 0.02mg 和 0.4mg 濃度中，每毫升含有 8.6mg 氯化鈉。於 1.0mg 濃度中，每毫升含有 8.35mg 氯化鈉。於 0.4mg 和 1.0mg 濃度中，每毫升亦含有 2.0mg 的 Methylparaben 和 Propylparaben，兩種防腐劑比率為 9 比 1。以鹽酸調整 pH 值為 3.5±0.5。

本藥亦有三種不含 Paraben 的配方：每毫升含 0.02mg、0.4mg 及 1.0mg 的 Naloxone Hydrochloride。每種濃度每毫升均含有 9.0mg 氯化鈉，以鹽酸調整 pH 值為 3.5±0.5。

【臨床藥理】依文獻記載

完全或部分逆轉鴉片類藥品抑制作用

本藥可預防或逆轉鴉片類藥品的作用，包括呼吸抑制、鎮靜及低血壓。亦可逆轉 Pentazocine 造成之擬精神病症與不安的副作用。

本藥為純鴉片類藥品拮抗劑，不具有其他鴉片類藥品拮抗劑的麻醉催激性或類嗎啡作用；本藥不會造成呼吸抑制、擬精神病作用或瞳孔收縮。若未投與鴉片類藥品或無其他鴉片類藥品拮抗劑的麻醉催激作用存在時，注射本品不具有藥理活性。本藥不會產生抗藥性及生理或心理的依賴性。若產生鴉片類藥品生理依賴性時，注射本藥會造成禁斷症狀。本藥之藥理機轉尚未十分明瞭，但據有力證據顯示本藥佔據鴉片類藥品的接受器而產生拮抗作用。靜脈注射本藥後，在兩分鐘內即產生明顯的作用；肌肉注射或皮下注射投與之作用則略為減慢。本藥的藥效視投與劑量及投與途徑而定。肌肉注射的藥效較靜脈注射持久。本藥需重複投與之劑量則需視麻醉藥品所使用之劑量或投與途徑而定。本藥經靜脈投與後，迅速分佈體內，主要經由肝臟代謝，與葡萄糖苷酸結合後由尿中排出。研究報告顯示，在成人血清中半衰期約 30 至 81 分鐘（平均 64±12 分鐘），新生兒之血漿半衰期為 3.1±0.5 小時。

敗血性休克之輔助治療

雖然藥理機轉尚未十分明瞭，本藥可阻斷敗血性休克病人類似 Endorphin 所引發的低血壓。

本藥於某些敗血性休克病例，顯示具有血壓升高的作用且可持續數小時之久，但此升壓反應並未顯示增加病人的存活率。對本藥有反應的病人，在治療敗血性休克療程初期投與本藥。由於治療的病例數有限，最適當的劑量及治療方法尚未確立。已發表的報告顯示在 3 到 5 分鐘單劑輸注 0.4mg，並視反應重複給藥 3-5 次，具有增壓效果。亦有報告顯示輸注劑量為 5 分鐘輸注 0.03mg/kg 至 0.2mg/kg。若有反應，則於 1 到 24 小時持續以每小時靜脈注射 0.03mg/kg 至 0.3mg/kg 治療，或視臨床反應增加劑量。

賦形劑

Sodium chloride、Methyl paraben、Propyl paraben、Sodium hydroxide、Hydrochloric acid、Water for injection。

適應症

麻醉藥品過量之解毒劑。

說明

本藥可完全或部份逆轉鴉片類藥品的抑制作用，包括由天然或合成的鴉片類麻醉藥品，如 Propoxyphene, Methadone 及一些同時具有拮抗及催激性的止痛劑如 Nalbuphine, Pentazocine 及 Butorphanol 所引起的呼吸抑制。本藥亦可用於診斷疑似產生鴉片類藥品耐受性或急性鴉片類藥品過量。本藥可用於敗血性休克的輔助治療以增加血壓。（參閱臨床試驗藥理：敗血性休克之輔助治療）

以下根據文獻記載

【禁忌症】

已知對 Naloxone Hydrochloride 中任一成分過敏之患者禁用。

警語

對於已知或懷疑母親對鴉片類藥品產生身體依賴之新生兒須小心使用本藥，因為在這一類已產生依賴性之患者，會造成突然及完全的鴉片類藥品做用逆轉，可能出現急性戒斷症狀。

對於已產生鴉片類藥品生理依賴性的患者可能有下列所述的鴉片類藥品禁斷的症狀或其他症狀：身體疼痛，腹瀉，心悸過速，發熱，流鼻涕，打噴嚏，豎毛，發汗，打呵欠，噁心或嘔吐，緊張，不安或亢奮，寒戰或顫抖，腹部絞痛，衰弱及血壓升高。新生兒的鴉片類藥品禁斷症狀亦包括痙攣，過度哭鬧及過度弛緩。對本藥之藥效反應良好者必須加以繼續監控。由於鴉片類藥品作用持久性可能超越本品，應視需要重複投與本品。

本藥對非鴉片類藥品所引起的呼吸抑制無效，例如對 Buprenorphine 引起的呼吸抑制無法達到完全之逆轉效果。當這些不完全逆轉的現象發生時，需借助呼吸器以幫助呼吸。

注意事項

一般注意事項

除了使用本藥外，在鴉片類藥品急性中毒時，其他復甦方法如保持呼吸道暢通，人工呼吸器，心臟按摩與血管收縮劑，於必要時，亦應使用以挽回生命。

手術後突然逆轉鴉片類藥品所產生的抑制作用，可能會導致噁心，嘔吐，發汗，顫抖，心悸過速，血壓上升，痙攣，心室性心悸過速及振顫，肺水腫和心跳停止並可能導致死亡。

手術後病人有產生低血壓、高血壓、心室性心悸過速、心室振顫與肺水腫之案例報告。且有報告上述症狀會造成死亡、昏迷及腦病變的後遺症。這些情況發生於原罹患心臟血管疾病之患者或服用其他藥品後產生心臟血管副作用者。雖然上述現象未有證據顯示與使用本藥有直接關聯性，對於罹患心臟疾病或以具強烈心臟毒性藥品治療之患者，如低血壓、心室性心悸過速或振顫及肺水腫的患者使用本品時仍需小心注意。一般認為使用本藥所引起的肺水腫病理和精性肺水腫類似，例如中樞傳導過量的 Catecholamine 反應導致大量血流入肺血管床而增加水靜壓。

致癌性，致基因突變性，致不孕性

評估本藥對動物可能產生之致癌性目前未經研究。在 Ames 致基因突變性試驗及體外的人類淋巴球染色體迷亂試驗中，本藥的突變性反應極弱，而在以中國田鼠 V79 細胞所做的體外 HGPRT 基因突變性試驗及大鼠的體內骨髓染色體迷亂實驗顯示，並無致基因突變現象。以高於人類一般劑量 50 倍(10mg/day) 的量對小白鼠及大鼠所做的繁殖試驗，並無致不孕現象。

孕婦

致畸性反應

美國懷孕使用分級列屬 B 級：以高於人類一般劑量 50 倍(10mg/day) 的量對小白鼠及大鼠之繁殖實驗中，並無證據顯示本藥損害其生殖能力或對其胎兒造成傷害。因本品並未對孕婦進行良好的對照研究，鑑於動物之生殖研究並不能用來預知人類的反應，除非十分必要時才可使用本藥於孕婦。

非致畸性反應

對已知或懷疑有鴉片類藥品依賴性的孕婦使用本藥時，應權衡其利害得失，因為母體產生依賴性經常使胎兒也產生依賴性。

使用於分娩

尚未知本藥是否影響分娩過程的時間。

授乳婦

本藥尚未證實是否經乳汁排出體外，因多數藥品可經乳汁排出，授乳婦使用本藥時應謹慎。

使用於兒童及新生兒的敗血性休克

本藥用於治療兒童及新生兒敗血性休克的低血壓時，其安全性及有效性尚未確立。

使用於腎功能不全患者

目前尚無良好對照的臨床試驗來評估本藥使用於腎功能不全患者的安全性及有效性。本藥使用於這類患者時應特別小心。

使用於肝疾患者

目前尚無良好對照的臨床試驗來評估本藥使用於肝疾患者的安全性及有效性。在一項對肝壞死病人所做的小型試驗中，顯示血漿 Naloxone 濃度約為無肝疾病患者的六倍。本藥的耐受性良好，無不良反應的報告。 本藥使用於肝疾患者時應特別小心。

不良反應

手術後反應

手術後病人使用本藥有下列不良反應：低血壓、高血壓、心室性心悸過速及振顫、呼吸困難、肺水腫、及心跳停止。亦有報告上述症狀引起死亡、昏迷及腦病變的後遺症。手術後病人使用過量的本藥會導致明顯的疼痛回復及焦躁。（參閱注意事項與劑量及投與途徑；成人用法：手術後發生鴉片類藥品抑制）