

壓泰定™ 注射液 5 毫克/毫升

Chenday Injection 5mg/ml

【成分】

壓泰定注射液每安瓿 5ml 含 25mg labetalol hydrochloride，為透明無色水溶液。Labetalol hydrochloride 之化學名為 2-hydroxy-5-[1-hydroxy-2-(1-methyl-3-phenyl-propylamino)ethyl]benzamide hydrochloride。

【適應症】

高血壓。

【用途】

Labetalol hydrochloride 適用於：緊急迅速控制嚴重高血壓，包括嚴重妊娠高血壓；需要降低血壓的麻醉術；以及伴隨急性心肌梗塞的偶發性高血壓。

【作用方式】

Labetalol hydrochloride 的降血壓作用係藉由阻滯周圍小動脈中的腎上腺 α 接受體以減少周邊血管阻力，而 Labetalol hydrochloride 本身也同時具有 β -阻斷作用，可保護心臟免於受到因周圍血管舒張所引起的反射交感神經傳動的影響。使用 Labetalol hydrochloride 後其心輸出量在休息狀態或過度運動之後並無明顯的減少，雖然收縮壓在運動當中會升高但舒張壓的相對變化則依然正常。而所有此類作用應係有利於高血壓患者。

【用法用量】

本藥限由醫師使用。

Labetalol hydrochloride 係專供住院病人靜脈注射使用。注射本劑時患者應採仰臥或側左之姿勢。靜脈注射 Labetalol hydrochloride 後三小時內患者應避免呈直立姿勢以免可能造成過度的姿勢性低血壓。

成人

使用一次全劑量注射方式(Bolus injection)時：在必須迅速降低血壓時，應給予靜脈注射 50mg 之劑量(注射時間至少要一分鐘以上)，且必要時，可每隔 5 分鐘重複一次直到獲得理想反應為止，惟總計量不得超過 200mg。通常 5 分鐘內即可產生最大作用，而作用時間大約約 6 小時，但也有可能長達 18 小時。

使用靜脈點滴輸注時：應使用 1mg/ml 之 Labetalol hydrochloride 溶液，亦即，將 8 安瓿(200mg)之 Labetalol hydrochloride 稀釋成共 200ml 含 Sodium chloride 及 Dextrose Injection BP(或 5% Dextrose Intravenous Infusion BP)之溶液。妊娠高血壓一開始之點滴輸注劑量為每小時 20mg，然後每隔 30 分鐘給予加倍之劑量直至獲得令人滿意之反應或達到每小時 160mg 之劑量為止。必要時，偶爾可給予較此為高之劑量。伴隨急性心肌梗塞的偶發性高血壓一開始之劑量為每小時 15mg，之後依血壓的控制情況逐漸增加至最大劑量為每小時 120mg 為止。其他因素引起的高血壓一開始之點滴輸注率為每分鐘約 2mg，直至獲得理想反應後即停止注射。其有效劑量通常為 50-200mg，但必要時亦可給予較高之劑量，尤其是嗜絡細胞瘤患者。點滴輸注的速率可由醫師判斷視反應情況加以調整。注射後或點滴輸注當中應監視血壓及心率。大多數患者都會有心率稍微降低的現象，至於嚴重心動徐緩情形則較少發生，可靜脈注射 atropine 1-2mg 加以控制。對於呼吸功能應加以觀察，尤其是已知有功能障礙的患者。只要血壓一經全劑量注射或點滴輸注加以適度控制後，應即以 Labetalol hydrochloride 錠進行維持療法，某初劑量為一天兩次，每次 100mg。Labetalol hydrochloride 使用於曾接受其他降血壓藥，包括 β 阻斷劑之患者，經證實無不良反應。須降低血壓的麻醉術：應使用標準麻醉劑<例如 sodium thiopentone>加以誘導，並以加有 halothane 抑或不加 halothane 的 nitrous oxide 及氧氣維持麻醉過程。Labetalol hydrochloride 的建議初劑量為 10-20mg 靜脈注射，視患者年齡及情況而定，對 halothane 有禁忌症的患者通常須較高的初劑量(25-30mg)。若注射後 5 分鐘仍未獲滿意的降低作用，則需再增加 5-10mg 直至達到理想的血壓為止。由於 halothane 和 Labetalol hydrochloride 具有互相加強的作用，因此 halothane 的濃度不應超過 1-1.5% 的範圍，以免造成血壓的過度降低。在使用 Labetalol hydrochloride 後可藉由改變 halothane 的濃度以及調整床檯的傾斜度迅速地簡易地調整血壓。使用 Labetalol hydrochloride 20-25mg 後的平均降低血壓的作用時間為 50 分鐘。Labetalol hydrochloride 的降血壓作用可隨時以 atropine 0.6mg 及停止使用 halothane 的方式加以中止。為維持手術中呼吸暢通，於必要時，可使用 tubocurarine 及 pancuronium 加以輔助及控制。而 IPPV 則可能會進一步加強 Labetalol hydrochloride 或 halothane 的降血壓作用。

孩童

本劑對孩童的安全性及有效性尚未確立。

【禁忌症】依文獻記載

Labetalol hydrochloride 禁忌使用於第二或第三期的心臟傳導阻斷、心臟休克以及其他伴有嚴重及持續低血壓或嚴重心動徐緩狀況的患者。當周圍血管收縮顯示低心輸出量時，Labetalol hydrochloride 注射液即禁忌使用於控制伴隨急性心肌梗塞的偶發性高血壓。Labetalol 禁忌使用於已知對本劑有過敏反應者。

【警語】依文獻記載

有極少數以 labetalol 治療而伴隨肝細胞受損的報告。惟肝受損現象係可逆性的。此種現象曾發生於短期及長期治療後。因此，當一有肝功能異常的初症狀時即應做適當的檢查。若檢查結果證實有肝受損現象或患者罹患黃疸，則應停止 labetalol 治療且不宜再使用。除非別無其他治療方式，否則 β 阻斷劑，即使是具有明顯心選擇性者，皆不宜使用於氣喘或曾有障礙性呼吸道病史者，必須使用於此類患者時，應事先防範可能導致支氣管痙攣的危險性。萬一使用 Labetalol hydrochloride 後發生支氣管痙攣的現象，則可給予吸入 β_2 催動劑，例如 Salbu-

tamol (所使用之劑量可能須較使用於氣喘的常用量稍大)，必要時可給予靜脈注射 atropine 1mg。

【注意事項】依文獻記載

對於心儲量不足者，在謹慎使用 Labetalol hydrochloride 之前，宜先以強心配醣體及利尿劑加以控制。麻醉施行之前不宜停用 Labetalol hydrochloride，惟應於麻醉誘導之前先給予靜脈注射 atropine。Labetalol hydrochloride 可能會增強 halothane 的降血壓作用。在麻醉過程中 Labetalol hydrochloride 可能會掩蓋了突發性出血的生理反應<心動過快及血管收縮>，因此須密切注意失血及維持血體積。Labetalol 若與第一類抗心律不整劑或 verapamil 類的鈣拮抗劑併用時須加以小心注意。

【懷孕及哺乳】依文獻記載

雖然動物試驗未顯示 Labetalol hydrochloride 有致畸胎作用，但只有在可能產生的益處大於可能引起的危險性時，才可使用於懷孕頭三個月的孕婦。Labetalol hydrochloride 可通過胎盤障礙，因此不可忽略了对胎兒及新生兒會有產生 α 及 β 腎上腺接受體阻斷的可能性。曾有極少數出生前後及新生兒障礙的報告(症狀包括心動徐緩、低血壓、呼吸抑制、低血糖、低體溫等)，有時此類症狀在出生一天或兩天後才會顯現，此時通常須迅速地給予支持療法<例如靜脈注射液及葡萄糖等>，但由於嚴重的子癇先兆，且尤其持久性地靜脈注射 labetalol，因此復原時間會較慢，這可能和早產兒的肝代謝功能不完全有關。雖然也曾有子宮內及新生兒死亡的報告，但可能與其他藥物(如，血管舒張劑、呼吸抑制劑)以及子癇先兆、子宮內成長遲滯和早產等作用有關。以上這些臨床經驗警告不可有不適當的長期高劑量使用 labetalol、延遲分娩以及併用 hydralazine。Labetalol hydrochloride 可從乳汁中排出，但未有報告指出對哺乳的嬰兒有不良反應。Labetalol 很少會引起可逆的肝臟性及膽汁鬱滯性黃疸，萬一有黃疸現象應即停藥。

【副作用】依文獻記載

Labetalol hydrochloride 通常耐受性良好。若在使用 Labetalol hydrochloride 後三小時內即讓患者成直立狀態則可能會引起顯著的姿勢性低血壓。極少數報告指出有過敏性反應、皮膚疹、搔癢、血管水腫及呼吸困難等現象。少部份會有鼻充血症狀。有極少數報告指出有肝功能測試數據升高、黃疸(包括肝細胞性及膽汁鬱滯性)、肝炎及肝壞死等現象。惟所有反應及症狀通常為可逆性的，只要停藥即可恢復正常。少數報告指出有心動徐緩及心臟傳導阻斷的現象。

【過量】依文獻記載

過量所引起的反應主要可能為心血管方面的作用，例如，高度的姿勢敏感性低血壓以及有時或可能發生的心動徐緩。此時應讓患者仰臥同時抬高雙腳。若有心衰竭現象則給予強心配醣體及利尿劑；若引起支氣管痙攣則給予吸入 β_2 催動劑。對於心動徐緩反應則靜脈注射 atropine 0.25-3mg。在改善循環方面若靜脈注射 noradrenaline 由 5-10mcg(μ g)開始，視情況再重複注射給藥，其效果比 isoprenaline 理想。或者是將 noradrenaline 以每分鐘 5mcg(μ g)的速率點滴輸注直至獲得理想的結果。若係嚴重過量則靜脈注射 glucagon 可能較理想，其初期劑量為 5-10mg 配以 dextrose 或生理食鹽水，再繼之以每小時 5mg 之速率做靜脈點滴或至足以維持正常心輸出為止。可能需要使用經靜脈的整律器。大量口服過量的 labetalol 曾發現有尿量減少性腎衰竭的現象。曾有一病例顯示使用 dopamine 增高血壓可能會加重腎衰竭作用。血液透析法可自循環中除去 1% 以下的 labetalol。

【藥物注意事項】依文獻記載

Labetalol hydrochloride 應避光貯存於 30°C 以下。
與其他藥物之配合性--Labetalol hydrochloride 可與下列靜脈點滴輸注液相配合：
5% Dextrose BP, 0.18% Sodium Chloride 及 4% Dextrose BP, 0.3% Potassium Chloride 及 5% Dextrose BP, Compound Sodium Lactate BP。未使用之混合液應於配製後 24 小時即丟棄。Labetalol hydrochloride 不可與 Sodium Bicarbonate Injection BP 4.2% W/V 相配合。

【藥物動力學】依文獻記載

Labetalol 的血漿半衰期約 4 小時，大約有 50% 的血中 labetalol 會與蛋白質結合。Labetalol 主要係經由與不活化的 glucuronide 代謝物結合而被代謝入尿液或經由膽汁隨排泄物排出。由動物試驗顯示穿過血腦障壁之藥物量僅為可忽視的微量。

【進一步之說明】依文獻記載

Labetalol hydrochloride 對腎功能無不良作用，且特別適用於患有腎臟病的高血壓患者。Labetalol hydrochloride 在鹼性溶液中可於 334nm 波長及 412nm 波長呈螢光反應，因此可能會干擾某些螢光物質包括 catecholamines 的檢驗。若以螢光法或光學方法檢驗尿中 catecholamines, netanephrine, normetanephrine 及 vanillylmandelic acid(VAM)時可能會因 labetalol 代謝物的存在而誤導致濃度增高。在測定 catecholamines 濃度時，若欲篩檢疑似患有嗜鉻細胞瘤或可能正接受 labetalol 治療之患者時可使用 HPLC 方法加以檢驗。

【賦形劑】Hydrochloric Acid、Water for Injection。

【包裝】

5 毫升安瓿裝，100 支以下盒裝。

使用前請依下列方式開啟安瓿

- (1) 一手握住安瓿瓶身，令圓點朝正面， (2) 另一手握住圓點上方的管徑，如
若瓶子上方的管徑內遺留有注射液 圖所示，向下折斷安瓿。
則輕敲或輕搖安瓿使其落回瓶身。



委託者：

正昌容生技有限公司

新北市蘆洲區民族路 263 巷 4 號 1 樓

製造廠：



台裕化學製藥股份有限公司

TAI YU CHEMICAL & PHARMACEUTICAL CO., LTD.

新竹縣竹東鎮員山路 11 巷 13 弄 1 號

TEL : (03)5826655 FAX : (03)5822389