

卓 普 注 射 液 2.5毫克/毫升

Dropel Injection 2.5mg/mL

【成份】

Dropel為滅菌且不含熱原之水溶液，可供靜脈或肌肉注射使用。每毫升含 Droperidol 2.5mg。本品的賦形劑為mannitol、Lactic acid及注射用水。

【特性】**藥效學**

Dropel為一butyrophenone類精神阻斷劑。其藥理作用主要為多巴明阻斷及 α_1 抑腎上腺作用。

Dropel不具抗膽鹼及抗組織胺作用。

Dropel具有顯著的精神安定與鎮靜作用，能解除恐懼並可提供患者精神上超然及漠不關心的感覺，而仍能維持反射警覺性。Dropel亦可產生止吐作用，可降低外科手術過程中噁心與嘔吐的發生，於手術後提供止吐的保護作用。

Dropel可加強中樞神經抑制劑的作用。其輕微之 α_1 腎上腺阻斷作用，使末梢血管擴張並減少腎上腺素所引起的血壓升高作用。Dropel可產生低血壓，減輕末梢血管阻力，亦可降低肺動脈壓(尤其在肺動脈壓異常高時)。可以減少因腎上腺素引起的心律不整，但不能預防其他原因的心律不整。

藥物動力學

單一肌肉或靜脈注射於3—10分鐘後即開始作用，但最高濃度可能要30分鐘以後方可達到。其精神安定與鎮靜作用可持續2—4小時，然而警覺性改變可能長達12小時。靜脈注射後，血中濃度於最初15分鐘內迅速降低。血漿蛋白質結合率約為85—90%。分佈容積為99—168公升。75%之代謝物經由腎臟排泄。僅有1%之藥物以原型排泄於尿液中，而11%排泄於糞便。血漿清除率為570 mL/min。排除半衰期為134±13分鐘。

【適應症】

Droperidol適用於降低由於手術及診斷程序所造成之噁心、嘔吐。

【說明】**精神病治療**

在特別留意的狀況下(見“用法用量”欄之“心臟監護”項、“禁忌症”欄及“警語與特別注意事項”欄)本品可被當作精神阻斷劑以治療重度情緒激動、活動性過強或精神異常的攻擊性行為，包括精神分裂症反應及躁鬱症的躁期或受到干擾時如某些類型的急性大腦症狀及非精神病急性興奮。

【用法與用量】

本藥限由醫師使用。

劑量必須依照年齡、體重、身體狀況、現有之病理狀況、其他使用中之藥品與使用之麻醉劑種類及手術之程序個別化調整。同時需進行例行性之Vital signs及ECG監測。

成人劑量：最大初始劑量為2.5mg IM or slow IV，另可增加投與1.25mg之劑量以達到期望之作用，然而增加投與之劑量必須在潛在利益大於潛在危險性時小心投藥。

小孩劑量：2至12歲之小孩，最大初始劑量為0.1 mg/kg，並將病人之年齡及其他臨床因子納入考量，然而增加投與之劑量必須在潛在利益大於潛在危險性時小心投藥。

精神病治療

請參見本欄之“心臟監護”項、“禁忌症”欄及“警語與特別注意事項”欄和“藥效學”項。治療精神病時，須依個人狀況來決定劑量，且最好是於密切臨床照顧下開始使用本品以決定最適劑量。為了決定起始劑量，病人的年齡、症狀的嚴重度及之前對其它精神阻斷劑的反應須列入考慮，持續監護心臟功能一段時間以與最佳醫療診斷一致，至少要持續至治療後七小時。老年及體弱病人或先前曾有精神阻斷藥物副作用報告的病人可能需要較少量的藥品，且一半的正常起始劑量可能便足以產生治療反應。此類病人通常會於較頻繁的劑量決定期及使用較低劑量時達到最佳反應。成人：2.5—15 mg靜脈注射，高達10 mg靜脈注射，間隔4—6小時後可再次給藥(肌肉注射或靜脈注射)。

心臟監護

急性躁狂或情緒激動病人在使用初次劑量之前進行ECG檢查可能會有困難，但任何狀況下仍須於病人急性症狀消失後儘快進行檢查。顧慮到給與droperidol可能會有機率不大的QT波延長，甚至torsade de pointes，須作好ECG監護及備妥完整的心臟復甦設備。在院外droperidol僅可用於精神病危象的救治(如急性躁狂或重度情緒激動)。須使用單次注射，無論是靜脈注射(不超過2.5mg)或肌肉注射(不超過5mg)，且病人須立即以配備心臟復甦設備的救護車送至醫院。假如需要額外的鎮靜作用，可考慮使用適當的鎮靜作用藥物(如benzodiazepine)。

【禁忌症】

已知對本品或其他代謝物過敏的病人、嚴重抑鬱症病人、昏迷病人或Parkinson症患者禁用本品。QTc大於450微秒的病人不能使用droperidol(見“警語與特別注意事項”欄) Droperidol不能用於後天性QT波延長病人，如併用已知會延長QT波的藥物(見“交互作用”欄)、已知患有低血鉀症或低血鎂症者、臨床意義重大的心跳過慢及已知的先天性QT波延長或有先天性QT波延長症狀的家族史。

【警語與注意事項】

目前已有多件Droperidol在正常或低於使用劑量下：產生QT Interval延長或產生致死性之torsades de pointes 心律不整之個案，部分個案並發生在沒有QT Interval延長危險因子之病患，同時有些為死亡個案。

由於潛在嚴重心律不整作用及致死，Droperidol應只能用於其他適當之治療無效，即由於這些藥品因為無耐受性之不良作用致在治療劑量下無法達到作用或效能不足。

所有使用本藥品之病人需於投藥前進行12點之ECG檢查，已決定是否有QT Interval延長之情形，如有QT Interval延長則不得投與本藥品。當病人因使用本藥品之利益高於潛在嚴重心律不整之危險時，在使用本藥品前必須進行ECG檢查，同時持續到投藥後2—3小時。

Droperidol對於已知或懷疑有QT Interval，延長之病人時需極度小心(e.g.,

congestive heart failure, bradycardia, use of a diuretic, cardiac hypertrophy, hypokalemia, hypomagnesemia, or administration of other drugs known to increase the QT Interval), 其他之危險因子包括年齡超過65歲, 酒精濫用、及使用其他藥品如 benzodiazepines, volatile anesthetics, and IV opiates. Droperidol 開始治療必須小心降低劑量逐漸向上調整至達到期望效果。

須在衡量利弊及適當醫療照護下才能使用 Droperidol。
接受麻醉及中樞神經抑制藥物或顯示中樞神經抑鬱患者, 應小心監測。投與 Droperidol 後, 曾發現輕微至中度之低血壓或心搏過速。此反應通常會自然消失。然而, 若低血壓現象持續, 則應考慮血容量減少之可能性並適度補充體液。投與 Droperidol 於嗜鉻細胞瘤患者, 曾觀察到嚴重的高血壓和心搏過速。因此, 此類病人要避免使用。Droperidol 主要由肝臟代謝故肝功能不全的病人使用時須小心。確定或疑似具備下列心律不整危險因子的病人使用 droperidol 之前須審慎評估: 重大心臟疾病病史者 (包括嚴重心室心律不整、第二級或第三級心房心室阻斷、竇房結功能受損、阻塞性心衰竭、缺血性心臟疾病、猝死的家族病史、腎衰竭 (特別是長期接受透析的病人)、重大的慢性阻塞性肺部疾病及呼吸衰竭和電解質被擾亂的危險因子如病人正在服用會鉀離子流失的利尿劑、與緊急狀況下投與的胰島素有關或有長期嘔吐及/或腹瀉的病人。有這些情況的病人, 須做 ECG、電解質的 (鉀離子及鎂離子) 及腎功能檢查, 以當作評估的一部份。

遲緩性運動困難

如同其它精神阻斷劑, 某些病人在長期治療或停藥後可能會出現遲緩性運動困難。這個病狀的主要特徵舌頭、臉、嘴或關節的非自主性節律性運動。這種症狀可能會持續發生於某些病人。恢復治療、增加劑量或改用其它不同的抗精神病藥物可能會遮蔽這個症狀。須儘早停止治療。

【交互作用】

禁忌使用已知會延長QT波的藥物, 包括特定的抗心律不整藥物如Class IA 藥物(如quinidine disopyramide及procainamide)及Class III藥物 (如amiodarone及sotalol)、三環類抗鬱劑amitriptyline): 特定的四環抗鬱劑(如maprotiline)、特定的抗精神病藥物(如phenothiazines, pimozid及sertindole) 特定的抗組織胺藥物 (如astemizole及terfenadine)、cisapride、bepidil、halofantr及sparfloxacin。

Droperidol 可能加強鎮靜劑(barbiturates, benzodiazepines, morphinomimetics) 的作用亦可能加強抗高血壓劑之作用, 故可能引起直立性低血壓。如同其他鎮靜劑Droperidol可能加強鴉片類藥物所引起之呼吸抑制。由於Droperidol阻斷多巴明接受器, 故可能抑制多巴明劑如bromocriptine, lisuride或L-dopa之作用。理論上, 某些藥物 (如Phenobarbital, carbamazepin phenytoin) 及抽煙、酗酒等習慣會刺激肝臟中之代謝酶, 可能提高精神阻斷劑之代謝分解, 故應視情況調整劑量。

【懷孕及授乳】

Droperidol 於動物實驗中並無致畸胎性, 亦曾使用於某些懷孕婦女個案中。然而, 仍應謹慎評估使用Droperidol之實得效益與潛在危險。

【駕駛及操作機械之能力】

接受Droperidol注射之病患應於充份時間後始能駕駛或操作器械, 如投與5mg劑量時應間隔10小時, 而投與更高劑量時則應間隔24小時以上。

【副作用】

中樞神經作用:

Droperidol可能產生類帕金森氏症或運動不能性之錐體外徑副作用。然此類副作用於抗帕金森藥物或抗膽鹼藥物治療後為可逆性反應。少數病例可能有逆理反應, 包括幻覺、靜坐不能或憂慮等。

精神阻斷惡性症狀:

如同其它精神阻斷劑, 本品曾與精神阻斷惡發性症狀的病例有關, 精神阻斷惡性症狀是一種少見的特異質反應, 主要特徵為體溫過高、大範圍肌肉僵硬、自發性情緒不穩定、意識不清。體溫過高常為此症狀的早期徵象。此類病人須立刻停用本品, 並給與適當的支持性療法及小心監護。

心臟血管作用:

Droperidol 投與後, 可能有輕微至中度之低血壓或偶發性心跳過速。(請參考【警語與注意事項】欄) 極罕有QT波延長、心室心律不整及猝死的報告, 這些可能較常發生於高劑量和易罹患此類疾病的病人。

內分泌作用:

抗精神病神經阻斷藥物的荷爾蒙作用包括高泌乳素血症, 可能會引起乳漏、女樣男乳症及月經過少或已經停止。極罕有不當ADH分泌症狀的病例報告。

其他作用:

罕有體溫失調和過敏反應如皮膚發疹或血管水腫的報告。

【過量】

症狀

Droperidol之過量主要經其過度之藥理作用而證實。

藥物過量之症狀為精神性漠不關心並轉移為睡眠狀態, 有時可能伴有低血壓。

給予較高劑量或感應性高之病人, 可能產生錐體外徑副作用 (流涎、運動困難或偶有肌肉僵直)。於致毒劑量時可能會產生痙攣。

罕有QT波延長、心室心律不整及猝死的病例報告。

治療

並無特定之解毒劑。若發生錐體外徑副作用時, 可投與抗膽鹼劑。

理論上任何病人使用本品 (見“用法用量欄”之“心臟監護”項及“警語及注意事項”欄) 一旦發生本品過量建議要立刻作ECG檢查, 該ECG檢驗須評估可能QT波延長, 且該病人須評估易導致torsade de pointes併發的因子, 如電解質失調 (特別是低血鉀症或低血鎂症) 及心跳過慢。

若明顯低血壓發生時, 應維持循環體液並給予適當之治療。

如有換氣不足或缺氧現象, 應即供給氧氣且施以適當之呼吸輔助。並應維持暢通之呼吸管道, 必要時可給予口咽管或氣管內插管。如有需要, 病人應接受24小時或更長時間之觀察, 並應維持體溫及適度之流體補充。

【配伍不相容性】

本注射液不能與其他產品混合。

【貯存】

25°C貯存10毫升安瓿裝亦需避免被冰凍。要置於兒童不及之處。

【包裝】

每支1毫升安瓿裝, 10毫升安瓿小瓶裝

委託者: 禾利行股份有限公司

台北市基隆路2段189號14F-1

製造廠: 壽元化學工業股份有限公司

嘉義市新民路128號