

480027042

**Rx** Thuốc bán theo đơn

## **Xylocaine® Jelly 2%** *lidocaine hydrochloride*

### **THÀNH PHẦN**

*Hoạt chất*

1 g (tương ứng với 1 ml) Xylocaine jelly chứa: 20mg Lidocaine hydrochloride khan.

### **TÁ DƯỢC**

Hydroxypropyl methylcellulose, natri hydroxide và/hoặc axit hydrochloric đến pH=6,2-6,8, methyl parahydroxybenzoate (chỉ có ở dạng ống), propyl parahydroxybenzoate (chỉ có ở dạng ống), nước cất.

### **DẠNG TRÌNH BÀY**

Xylocaine jelly có dạng gel trong suốt hoặc hầu như trong suốt, hơi có màu. Chất dẫn hoạt chất chính gồm nước được làm đặc bằng hydroxypropyl methylcellulose. Gel trong tuýp thuốc chứa methyl parahydroxybenzoate và propyl parahydroxybenzoate.

### **CHỈ ĐỊNH**

Xylocaine jelly được chỉ định để gây tê bôi trơn bề mặt:

- Niệu đạo nam giới và nữ giới trong soi bàng quang, đặt catheter, thăm dò bằng ống thông và các thủ thuật khác ở niệu đạo.
- Khoang mũi và họng trong các thủ thuật nội soi như soi dạ dày và soi phế quản.
- Trong soi hậu môn và trực tràng.
- Đặt nội khí quản.

Điều trị triệu chứng đau do viêm bàng quang và viêm niệu đạo. Giảm đau sau khi cắt bao quy đầu ở trẻ em.

### **LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH SỬ DỤNG**

Xylocaine jelly 2% có tác dụng gây tê niêm mạc nhanh và hoàn toàn, hiệu lực gây tê kéo dài (khoảng 20-30 phút). Tác dụng gây tê thường xảy ra nhanh (trong vòng 5 phút tùy theo vùng sử dụng thuốc).

Cũng như bất kỳ thuốc gây tê tại chỗ khác, tính an toàn và hiệu lực của lidocaine phụ thuộc vào liều thích hợp, kỹ thuật chính xác, thận trọng đầy đủ và sẵn sàng các phương tiện cấp cứu.

Nên xem liều đề nghị sau đây như là sự hướng dẫn. Kinh nghiệm và sự hiểu biết của người thầy thuốc về tình trạng sinh lý của bệnh nhân có tầm quan trọng trong việc tính toán liều cần thiết.

Sự hấp thu thuốc tại niêm mạc có thể thay đổi nhưng đặc biệt cao ở phế quản. Sự hấp thu lidocaine jelly ở mũi và họng thường thấp hơn so với các chế phẩm chứa lidocaine khác. Sau khi bơm thuốc ở liều 800mg (=40 ml Xylocaine Jelly) vào niêm mạc niệu đạo và bàng quang không tổn thương, nồng độ của lidocaine trong máu khá thấp và dưới ngưỡng gây độc.

Đối với bệnh nhân lớn tuổi hoặc mất sức, trẻ em trên 12 tuổi, bệnh nhân có bệnh lý cấp tính hoặc bệnh nhân bị nhiễm trùng huyết nên sử dụng liều phù hợp tuổi, thể trọng và tình trạng thực thể.

Trẻ em dưới 12 tuổi, liều sử dụng không vượt quá 6 mg/kg. Không dùng quá 4 liều trong vòng 24 giờ.

Gây tê niệu đạo: Gây tê bề mặt niệu đạo ở nam giới trưởng thành: liều cần thiết đủ giảm đau là 20 ml (= 400 mg lidocaine hydrochloride). Bơm thuốc chậm cho đến khi bệnh nhân có cảm giác căng hoặc cho đến khi đã bơm được nửa ống thuốc (10 ml = 200 mg lidocaine hydrochloride). Kẹp vành dương vật trong vài phút, sau đó bơm phần thuốc còn lại.

Khi mức độ gây tê là thực sự quan trọng, ví dụ trong quá trình thăm dò bằng ống thông hoặc soi bàng quang, một lượng lớn thuốc (ví dụ 30 - 40 ml=600-800 mg lidocaine hydrochloride) có thể được bơm thành 3-4 phân liều và để thuốc tác dụng trong vòng 10 phút trước khi đưa dụng cụ vào. Thuốc được bơm vào bàng quang cũng có hiệu lực cho các thủ thuật tại chỗ.

Gây tê bề mặt niệu đạo ở người nữ trưởng thành: bơm 5-10ml (=100-200 mg lidocaine hydrochloride) thuốc thành từng phân liều nhỏ để làm đầy niệu đạo. Để đạt hiệu quả gây tê đầy đủ, cần đợi vài phút trước khi thực hiện thủ thuật niệu đạo.

Nội soi: Bơm liều 10-20 ml (=200-400 mg lidocaine hydrochloride) đủ để giảm đau và có thể sử dụng một lượng nhỏ để bôi trơn dụng cụ. Khi sử dụng phối hợp với các chế phẩm có lidocaine khác (ví dụ trong soi phế quản), tổng liều lidocaine không được vượt quá 400 mg.

Soi hậu môn và trực tràng: dùng liều có thể lên đến 20 mL (=400 mg lidocaine hydrochloride) cho các thủ thuật ở hậu môn và trực tràng. Tổng liều không quá 400 mg lidocaine hydrochloride (=20ml Xylocaine Jelly).

Bôi trơn khi đặt nội khí quản: bôi khoảng 2ml thuốc (=40mg lidocaine hydrochloride) trên bề mặt ống thông ngay trước khi đặt vào khí quản. Cần thận trọng tránh đưa thuốc vào trong lòng ống.

### **CHỐNG CHỈ ĐỊNH**

Tiền sử quá mẫn với thuốc gây tê tại chỗ nhóm amide, hay các thành phần khác của thuốc.

Quá mẫn với thuốc gây tê tại chỗ nhóm amide hoặc với bất kỳ tá dược nào của thuốc.

Quá mẫn với methyl và/hoặc propyl parahydroxybenzoat (methyl -/ propyl paraben), hoặc với chất chuyển hóa para amino benzoic acid (PABA) của chúng. Tránh dùng các thuốc lidocaine mà trong công thức bào chế có chứa paraben cho bệnh nhân dị ứng với thuốc gây tê tại chỗ nhóm este hoặc với chất chuyển hóa PABA của chúng.

### **LƯU Ý VÀ THẬN TRỌNG ĐẶC BIỆT KHI SỬ DỤNG**

## QUÁ LIỀU

### Nhiễm độc toàn thân cấp tính

Phản ứng nhiễm độc khởi đầu chủ yếu ở hệ thần kinh trung ương và hệ tim mạch.

*Nhiễm độc hệ thần kinh trung ương* là sự đáp ứng theo mức độ, với các triệu chứng và dấu hiệu ngày càng trầm trọng. Các triệu chứng đầu tiên là mất cảm giác quanh miệng, tê lưỡi, xây xẩm, tăng thính lực và ù tai. Rối loạn thị giác và run cơ là những triệu chứng trầm trọng hơn và xuất hiện trước khi co giật toàn thân. Mất ý thức và động kinh cơn lớn có thể xảy ra, kéo dài vài giây đến vài phút. Giảm oxy máu và tăng CO<sub>2</sub> máu xuất hiện nhanh sau cơn co giật, do gia tăng hoạt động cơ và sự hô hấp bị cản trở. Trường hợp nặng có thể gây ngạt thở. Sự nhiễm toan làm gia tăng độc tính của thuốc gây tê tại chỗ.

Sự hồi phục là do tái phân bố và chuyển hoá của thuốc gây tê tại chỗ ở hệ thần kinh trung ương. Hồi phục xảy ra nhanh trừ khi đã sử dụng lượng lớn thuốc gây tê tại chỗ.

*Tác dụng trên hệ tim mạch* chỉ gặp trong trường hợp nồng độ thuốc trong máu cao. Trong trường hợp này có thể dẫn đến hạ huyết áp trầm trọng, chậm nhịp tim, rối loạn nhịp tim và trụy tim mạch.

Tác dụng nhiễm độc trên tim mạch thường khởi đầu bởi các dấu hiệu nhiễm độc trên hệ thần kinh trung ương, trừ trường hợp bệnh nhân đang sử dụng thuốc gây tê toàn thân hoặc thuốc an thần mạnh như benzodiazepine hay barbiturate.

### Điều trị nhiễm độc cấp tính

Nếu xảy ra các triệu chứng nhiễm độc toàn thân thì các triệu chứng thực thể được tiên đoán là có bản chất tương tự với những triệu chứng nhiễm độc sau khi dùng thuốc gây tê tại chỗ bằng những đường dùng khác. Độc tính thuốc gây tê tại chỗ biểu hiện bằng những triệu chứng của sự kích thích hệ thần kinh và trong một số trường hợp nghiêm trọng, gây ức chế tim mạch và thần kinh trung ương.

Những triệu chứng thần kinh nghiêm trọng (co giật, ức chế hệ thần kinh trung ương) phải được điều trị triệu chứng bằng các biện pháp hỗ trợ hô hấp và dùng thuốc chống co giật.

Nếu ngưng tuần hoàn xảy ra, cần lập tức tiến hành hồi sức tim phổi. Thở oxy, thông khí liên tục và hỗ trợ tuần hoàn cũng như điều trị nhiễm toan có tầm quan trọng sống còn.

## ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: thuốc tê tại chỗ. Mã ATC: N01BB02.

Xylocaine jelly 2% có tác dụng gây tê niêm mạc nhanh và hoàn toàn và tác dụng bôi trơn làm giảm ma sát. Hỗn hợp base trong nước, có độ nhớt cao và sức căng bề mặt thấp, làm cho thuốc tiếp xúc lâu với mô, đem lại tác dụng gây tê kéo dài (khoảng 20-30 phút). Cảm giác tê thường xuất hiện nhanh (trong vòng 5 phút tùy theo vùng sử dụng thuốc).

Lidocaine cũng như các thuốc gây tê tại chỗ khác, có thể gây phong bế có hồi phục sự dẫn truyền xung động dọc theo sợi thần kinh do ngăn cản dòng ion natri vào trong màng tế bào thần kinh. Thuốc gây tê tại chỗ nhóm amide được nghĩ là gây tác động trong kênh natri của màng tế bào thần kinh.

Các thuốc gây tê tại chỗ cũng có tác động tương tự trên màng tế bào dễ bị kích thích ở não và cơ tim. Nếu lượng lớn thuốc đi vào hệ tuần hoàn nhanh, thì các triệu chứng và dấu hiệu nhiễm độc sẽ xuất hiện, xuất phát từ hệ thần kinh trung ương và tim mạch.

Nhiễm độc hệ thần kinh trung ương (Xem phần *Quá liều*) thường xuất hiện trước tác động trên hệ tim mạch, vì xảy ra ở nồng độ huyết tương thấp hơn. Tác động trực tiếp của thuốc gây tê tại chỗ trên tim bao gồm chậm dẫn truyền, ức chế co bóp cơ tim và có thể ngừng tim.

## ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC

Lidocaine được hấp thu sau khi dùng tại chỗ trên niêm mạc, tốc độ và mức độ hấp thu phụ thuộc vào nồng độ thuốc, tổng liều sử dụng, vị trí dùng thuốc và thời gian tiếp xúc. Nói chung, sau khi bôi tại chỗ, thuốc tê hấp thu rất nhanh sau khi dùng nội khí quản và phế quản. Lidocaine cũng hấp thu tốt qua niêm mạc đường tiêu hóa mặc dù một lượng nhỏ thuốc dạng không đổi hiện diện trong tuần hoàn do chuyển hóa sinh học tại gan.

Thông thường khoảng 65% lidocaine gắn kết với protein huyết tương. Thuốc tê tại chỗ nhóm amide không những gắn kết chủ yếu với alpha-1-acid glycoprotein mà còn với albumin. Lidocaine vượt qua hàng rào máu não và nhau thai, có lẽ là do hoạt tính khuếch tán thụ động.

Đường thải trừ chính của lidocaine là qua chuyển hóa ở gan. Ở người, đầu tiên lidocaine được khử N-alkyl thành monoethylglycine xylidine (MEGX), sau đó sẽ được thủy phân thành 2,6-xylidine và hydroxy hóa thành 4-hydroxy-2,6-xylidine. MEGX cũng có thể được khử nhóm alkyl hơn nữa thành glycine xylidine (GX). Tác động dược lý/độc tính của MEGX và GX tương tự như lidocaine nhưng ít mạnh bằng. GX có thời gian bán thải kéo dài hơn (khoảng 10 giờ) so với lidocaine và có thể tích lũy khi dùng kéo dài. Khoảng 90% lidocaine tiêm tĩnh mạch được bài tiết dưới dạng các chất chuyển hóa khác nhau, và ít hơn 10% được bài tiết không đổi ra nước tiểu. Chất chuyển hóa đầu tiên trong nước tiểu là một phức hợp của 4-hydroxy-2,6-xylidine, chiếm khoảng 70-80% liều tiết ra nước tiểu.

Thời gian bán thải của lidocaine sau khi tiêm bolus tĩnh mạch thông thường là 1,5-2 giờ. Do lidocaine được chuyển hóa ở tốc độ nhanh, bất cứ tình trạng nào mà ảnh hưởng đến chức năng gan đều có thể thay đổi động học của lidocaine. Thời gian bán thải có thể kéo dài 2 lần hoặc hơn ở bệnh nhân rối loạn chức năng gan. Rối loạn chức năng thận không ảnh hưởng đến động học lidocaine nhưng có thể gây tích lũy chất chuyển hóa.

Các yếu tố như nhiễm toan chuyển hóa và việc dùng các thuốc kích thích và ức chế thần kinh trung ương ảnh hưởng đến nồng độ lidocaine trong hệ thần kinh trung ương gây tác động toàn thân rõ rệt. Các biểu hiện ngoại ý khách quan gia tăng rõ rệt khi nồng độ thuốc trong huyết tương máu tăng hơn 6 mcg dạng kiểm tự do trên mỗi mL.

## DỮ LIỆU AN TOÀN TIỀN LÂM SÀNG

Trong các nghiên cứu ở súc vật, độc tính ghi nhận sau khi dùng liều cao lidocaine bao gồm tác động trên hệ thần kinh trung ương và hệ tim mạch. Chưa ghi nhận có tác động ngoại ý nào liên quan đến việc dùng thuốc ở các nghiên cứu về độc tính trên hệ sinh sản, cũng như lidocaine không cho thấy khả năng gây đột biến trong các thử nghiệm về tính gây đột biến *in vivo* hoặc *in vitro*. Chưa thực hiện các nghiên cứu về khả năng gây ung thư của lidocaine do phạm vi và thời gian điều trị bằng thuốc này.

Những thử nghiệm về độc tính trên gen cho thấy lidocaine không gây đột biến gen. Ít có bằng chứng về khả năng gây độc tính của chất chuyển hóa 2,6-xylidine của lidocaine trong một số thử nghiệm về độc tính trên gen. Chất chuyển hóa, 2,6-xylidine có nguy cơ gây ung thư trong các nghiên cứu độc tính tiền lâm sàng đánh giá nồng độ và thời gian tiếp xúc lâu dài với thuốc. Việc đánh giá nguy cơ khi so sánh nồng độ và thời gian tiếp xúc tối đa với thuốc ở người khi sử dụng thuốc không liên tục với nồng độ và thời gian tiếp xúc với thuốc sử dụng trong các nghiên cứu tiền lâm sàng cho thấy thuốc có khoảng an toàn rộng để sử dụng trong lâm sàng.

## THẬN TRỌNG ĐẶC BIỆT KHI BẢO QUẢN

Không bảo quản trên 30°C. Không được đông lạnh.

## HẠN DÙNG

24 tháng kể từ ngày sản xuất.

28 ngày kể từ khi mở nắp, dưới điều kiện bảo quản bình thường của thuốc.

## DẠNG TRÌNH BÀY

Xylocaine Jelly 2%, tuýp 30g. Hộp 10 tuýp.

*Ngày hiệu đính toa thuốc:* 05-09-2016

**ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG. NẾU CẦN THÊM THÔNG TIN XIN HỎI Ý KIẾN CỦA BÁC SỸ HOẶC DƯỢC SỸ.**

**THÔNG BÁO CHO BÁC SỸ HOẶC DƯỢC SỸ NHỮNG TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN GẶP PHẢI KHI DÙNG THUỐC.**

**THUỐC NÀY CHỈ DÙNG THEO ĐƠN CỦA BÁC SỸ.**

**ĐỂ XA TẮM TAY TRẺ EM.**

## NHÀ SẢN XUẤT

Recipharm Karlskoga AB,  
Bjorkbornsvagen 5  
SE-691 33 Karlskoga, Thụy Điển.

Cơ sở đăng ký/ Marketing Authorisation Holder: AstraZeneca Singapore Pte.,Ltd.

*XYLOCAINE is a trademark of the AstraZeneca group of companies.*

© AstraZeneca 2016

Doc ID-000920965 version 7.0