

## **Renseignements thérapeutiques**

### **Carbocaine 1%**

Chlorhydrate de mépivacaïne injectable USP à 10 mg/mL

### **Carbocaine 2%**

Chlorhydrate de mépivacaïne injectable USP à 20 mg/mL

Anesthésique local

Pfizer Canada inc.  
17300 Trans-Canada Highway  
Kirkland, Québec  
H9J 2M5

DATE DE RÉVISION:  
2 août 2017

Numéro de contrôle: 204807

## Renseignements thérapeutiques

### Carbocaine 1%

Chlorhydrate de mépivacaïne injectable USP à 10 mg/mL

### Carbocaine 2%

Chlorhydrate de mépivacaïne injectable USP à 20 mg/mL

### Anesthésique local

**Pharmacologie :** La mépivacaïne stabilise la membrane des neurones et empêche la production et la transmission des influx nerveux, exerçant de ce fait une action anesthésique locale. Ses propriétés pharmacologiques sont un peu semblables à celles de la lidocaïne (qui a une structure chimique similaire), mais elle agit plus rapidement et légèrement plus longtemps que la lidocaïne. La mépivacaïne a été utilisée pour tous les types d'anesthésie par infiltration et par blocage nerveux régional.

L'effet anesthésique se fait sentir rapidement, le bloc sensoriel survenant en l'espace d'environ 3 à 20 minutes, dépendamment du patient et de facteurs comme la technique d'anesthésie, le type de bloc et la concentration de la solution. Le degré de blocage moteur obtenu dépend également de la concentration de la solution. La mépivacaïne à 1 % procure un blocage sensoriel et sympathique sans perte des fonctions motrices; elle convient donc à l'anesthésie de petits nerfs superficiels. La solution à 2 % entraîne un blocage sensoriel et moteur complet, quel que soit le type de nerf.

La durée de l'anesthésie varie également en fonction du patient ainsi que de la technique, du type de bloc et de la concentration. L'anesthésie que procure la mépivacaïne est normalement suffisante pour une intervention chirurgicale d'une durée de 2 à 2,5 heures. Selon certains rapports, les vasoconstricteurs ne prolongent pas significativement l'anesthésie produite par la mépivacaïne, mais l'ajout d'épinéphrine (1:200 000) à la solution peut favoriser l'hémostase locale et retarder l'absorption générale de l'anesthésique.

La somnolence et la lassitude observées sous lidocaïne ont été peu fréquentes avec la mépivacaïne. La mépivacaïne fait également preuve d'une excellente compatibilité tissulaire; aucun cas d'irritation ou de lésion n'a été signalé.

**Indications :** Production d'une anesthésie locale ou régionale par infiltration locale, bloc nerveux périphérique et bloc central, y compris blocs péridural et caudal.

**Contre-indications :** Hypersensibilité connue à la mépivacaïne, à d'autres anesthésiques locaux de type amide, ou à d'autres composants de la solution de mépivacaïne.

**Mises en garde :** Les anesthésiques locaux ne doivent être utilisés que par des cliniciens expérimentés dans le diagnostic et le traitement des manifestations toxiques et autres urgences aiguës qui pourraient résulter du bloc effectué. Il faut s'assurer d'avoir à sa

**disposition immédiate un équipement de réanimation cardiorespiratoire, des médicaments de réanimation, dont de l'oxygène, et le personnel nécessaire pour traiter ces réactions toxiques et toute urgence connexe (voir Effets indésirables et Précautions). Tout retard dans le traitement approprié d'une manifestation toxique liée à la dose, d'une ventilation inadéquate, quelle qu'en soit la cause, et/ou d'une altération de la sensibilité peuvent se solder par l'acidose, l'arrêt cardiaque et possiblement la mort.**

Les solutions d'anesthésiques locaux qui renferment des agents de conservation antimicrobiens (c.-à-d. celles qui sont offertes en flacons multidoses) ne doivent pas être utilisées pour l'anesthésie péridurale ou caudale, car l'innocuité de tels agents n'a pas été établie dans les cas d'injection intrathécale, qu'il s'agisse d'une injection intentionnelle ou accidentelle.

Il faut procéder à l'aspiration de sang ou de liquide céphalo-rachidien (s'il y a lieu) avant l'injection de tout anesthésique local, tant pour la dose initiale que pour les doses subséquentes, afin d'éviter une injection intravasculaire ou sous-arachnoïdienne. Cependant, une aspiration négative n'écarte pas la possibilité d'une injection intravasculaire ou sous-arachnoïdienne.

On ne doit pas utiliser de solutions de mépivacaïne avec épinéphrine ou d'autres vasopresseurs en association avec des médicaments ocytociques de type ergot de seigle, car il peut survenir une hypertension grave et persistante. L'administration de solutions de mépivacaïne additionnées d'un vasoconstricteur comme l'épinéphrine à des patients recevant des inhibiteurs de la monoamine-oxydase (IMAO) ou des antidépresseurs tricycliques (triptyline, imipramine) peut également causer une hypertension grave et prolongée, et doit se faire avec une extrême prudence.

Les techniques d'anesthésie locale doivent être mises en œuvre prudemment en présence d'inflammation et/ou d'un foyer infectieux à proximité du point d'injection prévu.

Il est déconseillé de mélanger la mépivacaïne à tout autre anesthésique local ou d'employer un anesthésique local avant ou en même temps que la mépivacaïne, car les données concernant l'utilisation clinique de tels mélanges sont insuffisantes.

**Ces solutions ne sont pas destinées à l'anesthésie rachidienne ou dentaire.**

**Précautions :** Généralités – Pour un bloc régional majeur, il convient que le patient reçoive des solutions intraveineuses à l'aide d'un cathéter à demeure, afin qu'une voie intraveineuse reste disponible tout au long de l'intervention. Pour éviter une injection intravasculaire, il faut répéter fréquemment l'aspiration avant et pendant l'injection, qui doit se faire lentement. La tendance actuelle consiste à privilégier l'injection par doses fractionnées, en assurant une surveillance constante du patient, plutôt que l'injection rapide en bolus. Lorsqu'on utilise une technique continue (intermittente) par cathéter, il faut faire des aspirations avec la seringue avant et pendant chaque injection additionnelle. Une aspiration négative de sang n'écarte pas la possibilité d'une injection intravasculaire.

Lors de l'administration péridurale, il est conseillé d'administrer d'abord une dose d'essai et d'en surveiller les effets avant de donner une dose complète. Lorsqu'on utilise une technique continue par cathéter, une dose d'essai doit être administrée avant la dose initiale ainsi qu'avant chaque injection additionnelle, car le tube de plastique inséré dans l'espace épidual peut se déplacer dans

un vaisseau sanguin ou pénétrer la dure-mère. Lorsque les conditions cliniques le permettent, la dose d'essai devrait contenir de l'épinéphrine (de 10 à 15 µg, selon ce qui est suggéré), pour permettre la détection d'une injection intravasculaire accidentelle. Si elle est injectée dans un vaisseau sanguin, cette quantité d'épinéphrine provoquera vraisemblablement une réaction en moins de 45 secondes, sous la forme d'une hausse de la fréquence du pouls et de la tension artérielle, d'une pâleur péribuccale, de palpitations et de nervosité si le patient n'est pas sous sédation. Chez le patient sous sédation, seule une augmentation de la fréquence du pouls de 20 battements ou plus par minute, pendant 15 secondes ou plus, pourrait être observée. Il faut donc demeurer à l'affût d'une augmentation de la fréquence cardiaque après l'administration de la dose d'essai. Cette dernière devrait également contenir un anesthésique de type amide, pour permettre la détection d'une injection intrathécale non intentionnelle, laquelle se manifesterait en quelques minutes sous la forme de signes de bloc rachidien. L'obtention de résultats négatifs avec la dose d'essai ne garantit pas que l'aiguille est bien positionnée.

L'injection de doses répétées d'un anesthésique local peut causer une augmentation significative des concentrations sanguines due à l'accumulation lente du médicament ou de ses métabolites ou à une dégradation métabolique lente. La tolérance aux concentrations sanguines élevées varie selon l'état du patient. Il est recommandé d'administrer des doses réduites aux sujets âgés affaiblis ainsi qu'aux sujets gravement malades, selon leur âge et leur état physique. Les anesthésiques locaux doivent également être administrés avec prudence en présence d'un grave dérèglement du rythme cardiaque, de choc, de bloc cardiaque ou d'hypotension.

Les solutions d'anesthésiques locaux contenant un vasoconstricteur doivent être administrées prudemment et en doses minutieusement restreintes dans les zones irriguées par des artères terminales, comme les doigts, les orteils, le nez, les oreilles ou le pénis, et dans toute autre zone où l'irrigation sanguine est compromise. En présence de maladie vasculaire hypertensive, la réponse au vasoconstricteur risque d'être amplifiée, entraînant possiblement lésion ischémique ou nécrose.

La mépivacaïne doit être utilisée avec prudence chez les patients ayant une allergie ou une sensibilité connue à certaines substances.

L'emploi de la mépivacaïne commande également la prudence en cas d'atteinte hépatique ou rénale, ainsi que de dysfonction cardiovasculaire.

De graves arythmies cardiaques liées à la dose peuvent survenir chez des patients qui reçoivent des solutions contenant un vasoconstricteur comme l'épinéphrine pendant ou immédiatement après l'administration d'anesthésiques puissants par inhalation. Au moment de décider si pareils produits seront utilisés en concomitance chez un patient donné, il faut prendre en considération l'action combinée des deux agents sur le myocarde, la concentration et le volume du vasoconstricteur utilisé et, s'il y a lieu, le temps écoulé depuis l'injection. Si l'épinéphrine est utilisée, la concentration recommandée est de 1:200 000.

Un grand nombre de médicaments utilisés au cours de l'anesthésie peuvent déclencher une hyperthermie maligne familiale. Comme la possibilité que les anesthésiques locaux de type amide provoquent une telle réaction est inconnue, et qu'il est impossible de prévoir la nécessité d'une

anesthésie générale additionnelle, il est souhaitable d'établir un protocole standard pour le traitement de l'hyperthermie maligne.

Injection au niveau de la tête et du cou : L'injection de faibles doses d'anesthésiques locaux dans la région de la tête et du cou pourrait produire des réactions indésirables semblables aux réactions toxiques générales observées après une injection intravasculaire accidentelle de doses plus élevées. Il faut effectuer les injections avec le plus grand soin.

Grossesse / anesthésie obstétricale : L'effet de la mépivacaïne sur la reproduction n'a pas fait l'objet d'études chez l'animal. On n'a pas non plus mené d'études adéquates et bien contrôlées chez les femmes enceintes quant à l'effet de la mépivacaïne sur le développement du fœtus. Durant la grossesse, la mépivacaïne ne devrait être employée que si les avantages possibles dépassent clairement les risques encourus par le fœtus, ce qui n'empêche pas l'utilisation de la mépivacaïne au terme de la grossesse, pour l'anesthésie ou l'analgésie obstétricale.

Des cas d'hypotension maternelle ont été rapportés à la suite d'une anesthésie régionale. Les anesthésiques locaux entraînent la vasodilatation en bloquant les nerfs sympathiques.

Les anesthésies péridurale, paracervicale et caudale et le bloc du nerf honteux interne peuvent modifier les forces de la parturition par l'intermédiaire de changements au niveau de la contractilité utérine ou des efforts expulsifs de la mère. Dans une étude, le bloc paracervical a été associé à un raccourcissement de la durée moyenne de la première période du travail et à une dilatation plus facile du col utérin. Toutefois, il a été rapporté que l'anesthésie péridurale prolonge la deuxième période du travail en éliminant le réflexe de poussée abdominale de la parturiente ou en entravant la fonction motrice. L'anesthésie obstétricale peut accroître le besoin d'utilisation de forceps.

L'emploi de certains anesthésiques locaux durant le travail et l'accouchement peut entraîner une diminution de la force et du tonus musculaires du nourrisson au cours des 24 à 48 heures suivant la naissance. La portée à long terme de cette observation est inconnue.

Une bradycardie fœtale peut survenir chez 20 à 30 % des patientes soumises à un bloc paracervical au moyen d'anesthésiques locaux de type amide, et peut être associée à une acidose fœtale. La fréquence cardiaque du fœtus doit toujours faire l'objet d'une surveillance pendant le bloc paracervical. Le médecin doit évaluer les avantages d'un tel bloc par rapport aux risques, qui sont accrus en cas de prématurité, de grossesse prolongée, de toxémie gravidique et de détresse fœtale. La conformité à la posologie recommandée est de la plus haute importance dans l'anesthésie obstétricale par bloc paracervical. Lorsque les doses recommandées ne produisent pas une analgésie adéquate, il y a lieu de soupçonner une injection intravasculaire ou une injection intracrânienne chez le fœtus.

Des cas compatibles avec une injection intracrânienne accidentelle d'une solution d'anesthésique local ont été rapportés après un bloc intentionnel paracervical et/ou du nerf honteux interne chez la mère.

Des cas de convulsions et de collapsus cardiovasculaire chez la mère, à la suite d'un bloc paracervical effectué en début de grossesse avec certains anesthésiques locaux (aux fins d'une interruption volontaire de grossesse), portent à croire que l'absorption générale peut être rapide

dans de telles circonstances. L'injection doit se faire lentement avec aspirations fréquentes. Il faut prévoir un intervalle de 5 minutes entre les injections de chaque côté du col.

Chez les parturientes soumises à un bloc régional, il est extrêmement important d'éviter la compression aorto-cave exercée par l'utérus gravide. La patiente doit être maintenue en décubitus latéral gauche.

Allaitement : On ne sait pas si les anesthésiques locaux sont excrétés dans le lait humain.

Effets indésirables : Les réactions à la mépivacaïne sont typiques de celles qui sont associées à d'autres anesthésiques locaux de type amide. Une cause importante de réactions indésirables à ce groupe de médicaments réside dans les concentrations plasmatiques élevées, qui peuvent résulter d'un surdosage, d'une injection intravasculaire accidentelle ou d'une dégradation métabolique lente. Un léger picotement passager a été noté à l'occasion lors de l'injection.

Système nerveux central : Ces manifestations sont caractérisées par l'excitation et/ou la dépression. Elles peuvent survenir sous forme de désorientation, d'agitation, d'anxiété, d'étourdissements, d'acouphène, de vision trouble ou de tremblements pouvant même aller jusqu'à des convulsions. Cependant, les manifestations excitatives peuvent être passagères, voire inexistantes, et la dépression sera le premier signe d'une réaction indésirable. Cela peut être rapidement suivi d'une sensation de somnolence progressant vers la perte de conscience et l'arrêt respiratoire. D'autres effets centraux tels nausées, vomissements, frissons et constriction des pupilles peuvent survenir.

De fortes doses ou une injection intravasculaire accidentelle peuvent entraîner des concentrations plasmatiques élevées, de même qu'une dépression du myocarde, un affaiblissement du débit cardiaque, un bloc cardiaque, de l'hypotension (ou parfois de l'hypertension), une bradycardie, des arythmies ventriculaires et, dans certains cas, l'arrêt cardiaque.

Les réactions de type allergique sont rares et peuvent résulter d'une sensibilité à l'anesthésique local ou à l'un des composants de la solution, comme le méthylparaben (agent de conservation antimicrobien ajouté aux flacons multidoses). Des cas de sensibilité croisée à d'autres anesthésiques locaux de type amide ont été rapportés. L'utilité de procéder à des épreuves de sensibilité n'a pas été formellement établie.

Les effets neurologiques consécutifs à une anesthésie péridurale ou caudale peuvent inclure : bloc rachidien de degrés variés (y compris un bloc rachidien total ou haut), hypotension résultant d'un bloc rachidien, rétention urinaire, incontinence urinaire et fécale, perte de sensation périnéale et de fonction sexuelle, anesthésie persistante, paresthésie, faiblesse, paralysie des membres inférieurs et perte de maîtrise des sphincters, le rétablissement de ces effets pouvant être lent, incomplet ou nul; maux de tête, maux de dos, méningite septique, méningisme, ralentissement du travail, augmentation de la fréquence des accouchements avec forceps; paralysie du nerf crânien due à une traction sur le nerf causée par une perte de liquide céphalo-rachidien; névrite; engourdissement.

Surdosage – Symptômes et traitement : La prise en charge des effets toxiques des anesthésiques locaux doit être de nature symptomatique; il n'existe pas d'antidote précis. Le médecin doit être prêt à maintenir la perméabilité des voies aériennes et à fournir une ventilation assistée ou contrôlée avec de l'oxygène au besoin. Le traitement d'appoint destiné au système

cardiovasculaire comprend l'administration de solutions intraveineuses et, au besoin, de vasopresseurs (choisir de préférence un agent qui augmente la contractilité myocardique).

Les convulsions peuvent être maîtrisées à l'aide d'oxygène et de l'administration intraveineuse d'un barbiturique ou d'un myorésolutif, dont la dose sera augmentée par petits paliers, comme suit : privilégier d'abord un barbiturique à action ultra-rapide comme le thiopental ou le thiamylal; si on n'a pas accès à ces agents, opter pour un barbiturique à courte durée d'action (p. ex., sécobarbital ou pentobarbital) ou un myorésolutif à courte durée d'action (succinylcholine). Les myorésolutifs et les barbituriques intraveineux ne doivent être administrés que par des professionnels habitués à ces produits.

Posologie : Comme c'est le cas de tous les anesthésiques locaux, la posologie de la mépivacaïne varie selon la technique d'anesthésie, la région à anesthésier, la vascularité des tissus, le nombre de segments neuronaux à bloquer, la profondeur de l'anesthésie et le degré de relâchement musculaire requis, la durée d'anesthésie voulue, la tolérance individuelle et l'état physique du patient. Chez l'adulte sain de taille moyenne qui n'est pas sous sédation, la dose unique recommandée ne doit généralement pas dépasser 400 mg. Les schémas posologiques suivants se sont en général révélés satisfaisants, et sont donc proposés à titre indicatif. Il convient d'administrer l'anesthésique aux dose et concentration les plus faibles permettant de produire l'effet voulu. La posologie recommandée s'applique à l'adulte moyen; elle doit être réduite pour les personnes âgées ou affaiblies.

Bloc nerveux (p. ex., cervical, brachial, intercostal, du nerf honteux interne) : De 5 à 40 mL de solution à 1 %, ou de 5 à 20 mL de solution à 2 %, selon la région à anesthésier et l'étendue du bloc. Pour les blocs du nerf honteux interne, injecter la moitié de la dose totale de chaque côté.

Bloc paracervical : Maximum de 20 mL de solution à 1 % (injecter lentement la moitié de la dose de chaque côté, à intervalle de 5 minutes) par période de 90 minutes.

Bloc transvaginal : Jusqu'à 30 mL de solution à 1 % (injecter la moitié de la dose de chaque côté).

Blocs caudal et péridural : De 15 à 30 mL de solution à 1 %, ou de 10 à 20 mL de solution à 2 % exempte d'agent de conservation.

Infiltration : Jusqu'à 40 mL de solution à 1 % (ou l'équivalent dans le cas d'une solution plus diluée, selon la région à opérer).

Bloc thérapeutique (soulagement de la douleur) : De 1 à 5 mL de solution à 1 % ou à 2 %.

Chez les enfants, la dose doit être calculée en pourcentage de la dose totale recommandée chez l'adulte, en fonction du poids corporel (jusqu'à concurrence de 5 ou 6 mg/kg). Chez les enfants de moins de 3 ans ou pesant moins de 14 kg, utiliser la solution à 1 %.

La solution de mépivacaïne peut être diluée à parts égales avec du chlorure de sodium injectable USP. La mépivacaïne a été administrée à des doses dépassant celles qui sont mentionnées ci-dessus sans entraîner d'effets indésirables graves. Cela dit, la prudence s'impose lors du recours à des doses plus fortes; dans la plupart des cas, il ne faut pas dépasser une dose de 7 mg/kg au total.

L'administration de doses répétées ne doit en aucun cas se faire à des intervalles de moins de 1,5 heure. La dose totale par période de 24 heures ne doit pas dépasser 1000 mg.

Présentation : Infiltration et bloc nerveux : Un millilitre de solution contient 10 mg de chlorhydrate de mépivacaïne dans de l'eau pour injection. Ingrédients non médicinaux : chlorure de sodium et méthylparaben. Peut également contenir de l'hydroxyde de sodium et/ou de l'acide chlorhydrique (pour l'ajustement du pH). Sans gluten, lactose, ni sulfites. Flacons multidoses de 50 mL (1 %), boîtes de 5.

Blocs caudal et péridural : Un millilitre de solution contient 10 mg de chlorhydrate de mépivacaïne dans de l'eau pour injection. Ingrédients non médicinaux : chlorure de calcium (dihydraté), chlorure de potassium et chlorure de sodium. Peut également contenir de l'hydroxyde de sodium et/ou de l'acide chlorhydrique (pour l'ajustement du pH). Sans gluten, lactose, sulfites, ni agents de conservation. Flacons unidoses de 30 mL (1 %), boîtes de 5.

Blocs caudal et péridural : Un millilitre de solution contient 20 mg de chlorhydrate de mépivacaïne dans de l'eau pour injection. Ingrédients non médicinaux : chlorure de calcium (dihydraté), chlorure de potassium et chlorure de sodium. Peut également contenir de l'hydroxyde de sodium et/ou de l'acide chlorhydrique (pour l'ajustement du pH). Sans gluten, lactose, sulfites, ni agents de conservation. Flacons unidoses de 20 mL (2 %), boîtes de 5.

© 2003 Association des pharmaciens du Canada. Tous droits réservés.