ANSM - Mis à jour le : 18/01/2022

1. DENOMINATION DU MEDICAMENT

MESOCAÏNE 50 mg/5ml solution injectable

2. COMPOSITION QUALITATIVE ET QUANTITATIVE

Lidocaïne (DCI) chlorhydrate..... 50 mg

Pour une ampoule de 5 ml

Excipient à effet notoire :

Ce médicament contient moins de 1 mmol (23 mg) de sodium par ampoule, c'est-à-dire qu'il est essentiellement « sans sodium ».

Pour la liste complète des excipients, voir rubrique 6.1.

3. FORME PHARMACEUTIQUE

Solution injectable.

4. DONNEES CLINIQUES

4.1. Indications thérapeutiques

- Anesthésie locale par infiltration.
- Anesthésie régionale : caudale, péridurale, plexique, tronculaire.
- Infiltrations intra ou péri-articulaires
- Infiltrations sympathiques.

4.2. Posologie et mode d'administration

En dehors de l'anesthésie locale par infiltration, la lidocaïne devra être uniquement utilisée par ou sous la responsabilité de médecins expérimentés dans les techniques d'anesthésie loco-régionale.

La forme, la concentration utilisées varient en fonction de l'indication et du but recherché, de l'âge et de l'état pathologique du patient. L'anesthésie obtenue est habituellement fonction de la dose totale administrée. La dose à injecter est fonction de la technique d'anesthésie pour laquelle le produit est utilisé.

Posologie

Chez l'adulte :

En anesthésie locale par infiltration :

La dose maximale à ne pas dépasser est de 200 mg. Pour des doses plus élevées, il est recommandé de recourir aux formes adrénalinées.

En anesthésie régionale (péridurale, caudale, plexique, tronculaire):

La dose maximale à ne pas dépasser est de 400 mg. Pour des doses plus élevées, il est recommandé de recourir aux formes adrénalinées.

Les formes les plus concentrées augmentent l'intensité du bloc moteur.

En obstétrique, pour l'anesthésie péridurale il est recommandé de diminuer les doses de moitié.

Pour les infiltrations péri et intra-articulaires et les infiltrations sympathiques :

La dose maximale à ne pas dépasser est de 200 mg. Pour les injections intra-vasculaires, les formes adrénalinées sont formellement contre-indiquées.

Population pédiatrique : Chez le nourrisson et le jeune enfant.

Utiliser la plus faible concentration possible d'anesthésique local.

En anesthésie locale par infiltration et régionale (péridurale, caudale, plexique, tronculaire):

Les doses maximales recommandées sont de 2 à 7 mg/kg suivant la technique utilisée.

La dose recommandée est de 2,5 mg/kg.

4.3. Contre-indications

Ce médicament NE DOIT JAMAIS être utilisé en cas de :

- hypersensibilité à la substance active, aux anesthésiques locaux à liaison amide ou à l'un des excipients mentionnés à la rubrique 6.1,
- porphyries,
- troubles de la conduction auriculo-ventriculaire nécessitant un entraînement électrosystolique permanent ou non encore réalisé,
- épilepsie non contrôlée par un traitement,
- contre-indications propres à la technique,
- en injection intra-vasculaire pour cette concentration.

4.4. Mises en garde spéciales et précautions d'emploi

Mise en garde :

L'attention des sportifs est attirée sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive des tests pratiqués lors des contrôles anti-dopage.

Un surdosage ou une injection IV rapide accidentelle peuvent provoquer des réactions toxiques.

Il n'est pas recommandé de faire une anesthésie locale par infiltration dans les zones infectées et inflammatoires.

Les techniques d'anesthésie loco-régionale ne sont pas recommandées chez les patients sous anticoagulants.

Pour les intra-vasculaires les formes adrénalinées sont formellement contre-indiquées.

L’anesthésie loco-régionale intraveineuse est contre-indiquée chez l’enfant de moins de 5 ans.

Précaution d’emploi :

L’utilisation de la lidocaïne nécessite :

Lors de l’anesthésie locale

- un interrogatoire destiné à connaître le terrain, les thérapeutiques en cours, les antécédents du patient,
- si nécessaire, une prémédication par une benzodiazépine à dose modérée,
- de faire l’injection (sauf indication particulière) strictement hors des vaisseaux, après aspirations répétées
- de disposer d’un matériel de réanimation (en particulier d’une source d’oxygène).

En outre lors de l’anesthésie régionale (caudale, péridurale, tronculaire, plexique) :

- de disposer d’une voie veineuse et d’un matériel complet de réanimation,
- de disposer de médicaments aux propriétés anticonvulsivantes (thiopental, benzodiazépines), myorelaxantes (benzodiazépines) d’atropine et de vasopresseurs,
- d’une surveillance électrocardiographique continue (cardioscope) et tensionnelle,
- de pratiquer une injection test de 5 à 10 % de la dose,
- d’injecter lentement en réaspirant fréquemment,
- de maintenir le contact verbal avec le patient.

La lidocaïne étant métabolisée par le foie, la quantité d’anesthésique utilisée sera limitée chez les insuffisants hépatiques.

Compte-tenu des effets indésirables de la lidocaïne au plan cardio-vasculaire, la quantité d’anesthésique utilisée sera limitée chez les insuffisants cardiaques.

Ce médicament contient moins de 1 mmol (23 mg) de sodium par ampoule, c’est-à-dire qu’il est essentiellement « sans sodium ».

4.5. Interactions avec d'autres médicaments et autres formes d'interactions

Aucune étude d’interaction n’a été réalisée.

4.6. Fertilité, grossesse et allaitement

Grossesse

Ne pas utiliser dans un bloc paracervical en anesthésie obstétricale, en raison du retentissement néo natal (hypertonie – hypoxie).

Il n’y a pas de données fiables de tératogénèse chez l’animal.

En clinique, l’analyse d’un nombre élevé de grossesses exposées n’a apparemment révélé aucun effet malformatif ou foetotoxique particulier de la lidocaïne. Toutefois seules des études

épidémiologiques permettraient de vérifier l'absence de risque.

En conséquence, l'utilisation de la lidocaïne ne doit être envisagée au cours de la grossesse que si nécessaire, mais peut être prescrite au moment de l'accouchement si besoin.

Allaitement

L'allaitement est possible.

4.7. Effets sur l'aptitude à conduire des véhicules et à utiliser des machines

Ce produit peut modifier les capacités de réactions pour la conduite de véhicules ou l'utilisation de machines.

4.8. Effets indésirables

La survenue d'un effet indésirable doit faire suspecter un surdosage.

Les réactions toxiques, témoin d'un surdosage en anesthésique local, peuvent apparaître dans deux conditions, soit immédiatement par surdosage relatif dû à un passage intraveineux accidentel, soit plus tardivement par surdosage vrai dû à l'utilisation d'une trop grande quantité d'anesthésique.

Tableau des effets indésirables

Le tableau ci-dessous présente les effets indésirables de la lidocaïne, identifiés après commercialisation. Les effets indésirables listés ci-dessous sont classés en fonction de leur fréquence et de leur classe de systèmes d'organes.

Les fréquences des effets indésirables sont classées selon la convention suivante : fréquent (? 1/100, 1/10) ; peu fréquent (? 1/1 000, 1/100) ; rare (? 1/10 000, 1/1 000) ; très rare (1/10 000) ; fréquence indéterminée (ne peut être estimée sur la base des données disponibles).

Classes de systèmes d'organes	Fréquence indéterminée (ne peut être estimée sur la base des données disponibles)
Affections du système immunitaire	Hypersensibilité[1], choc anaphylactique[1]
Affections psychiatriques	Nervosité[2], appréhension[2]
Affections du système nerveux	Agitation[2], tremblements[2], nystagmus[2], logorrhée[2], céphalées[2], bourdonnements d'oreilles[2]
Affections cardiaques	Tachycardie[3], bradycardie[3], dépression cardiovasculaire avec hypotension artérielle pouvant aboutir à un collapsus[3], troubles du rythme (extrasystoles ventriculaires, fibrillation ventriculaire)[3], troubles de la conduction (bloc auriculo-ventriculaire)[3]
Affections respiratoire, thoraciques et médiastinales	Tachypnée, apnée, bâillements[2]
Affections gastro-intestinales	Nausées

[1] Ces réactions d'hypersensibilité peuvent être caractérisées par des lésions cutanées, de l'urticaire, un gonflement/œdème, un angioedème ou des réactions anaphylactoïdes. La

détection de la sensibilité par un test de la peau reste non prédictive.

[2] Ces signes d'appel nécessitent une surveillance attentive pour prévenir une éventuelle aggravation avec : convulsions puis dépression du SNC. **Les concentrations veineuses auxquelles peuvent apparaître les premiers signes de toxicité neurologique sont de 5,6 µg/ml.**

[3] Ces manifestations cardiaques peuvent aboutir à un arrêt cardiaque. Devant l'apparition des premières manifestations toxiques, il est recommandé de demander au patient d'hyperventiler. **Les signes de toxicité cardiaque sont observés pour des concentrations de 20 µg/ml.**

Déclaration des effets indésirables suspectés

La déclaration des effets indésirables suspectés après autorisation du médicament est importante. Elle permet une surveillance continue du rapport bénéfice/risque du médicament. Les professionnels de santé déclarent tout effet indésirable suspecté via le système national de déclaration : Agence nationale de sécurité du médicament et des produits de santé (ANSM) et réseau des Centres Régionaux de Pharmacovigilance - Site internet : www.signalement-sante.gouv.fr.

4.9. Surdosage

Les manifestations toxiques neurologiques sont traitées par injection d'un barbiturique de courte durée d'action ou d'une benzodiazépine, oxygénation, ventilation assistée.

5. PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES

5.1. Propriétés pharmacodynamiques

Classe pharmacothérapeutique : Anesthésiques locaux. Système nerveux central, code ATC : N01BB02

La lidocaïne fait partie du groupe des anesthésiques à liaison amide.

Le pKa de la lidocaïne est de 7,7. C'est une base faible. Elle est liée aux protéines (essentiellement les alpha 1-glyco-protéines) à environ 65 %.

5.2. Propriétés pharmacocinétiques

Absorption

L'absorption de la lidocaïne dépend du lieu d'injection, de la dose administrée et de la présence ou non d'adrénaline.

La voie IV donne les concentrations les plus élevées. Le pic sanguin dépend de la quantité et surtout de la vitesse d'injection. Ainsi une injection de 2 mg/kg en 2 minutes donne une concentration artérielle de 3 µg/ml après 5 minutes et de 1 µg/ml après 30 minutes.

Au cours des blocs, l'absorption varie avec le bloc considéré.

Après injection SC, l'absorption varie avec la vascularisation. Une dose de 200 mg injectée au niveau de l'avant bras donne, une demi-heure après l'injection, des concentrations de 0,30 à 0,50 µg/ml.

Distribution

La distribution, à partir du sang, se fait dans tous les tissus, surtout ceux richement vascularisés (cœur, poumon, cerveau, foie rate), puis dans les tissus adipeux et musculaires.

Métabolisation et élimination

La métabolisation de la lidocaïne est essentiellement hépatique : dégradation enzymatique par le système mono-oxygénasique dépendant du cytochrome P 450 ; 70 % de la lidocaïne injectée sont métabolisés en un seul passage. Les métabolites les plus importants car actifs sont la mono-éthyl-glycine-xylidine (MEGX) et la glycine-xylidine (GX).Les métabolites sont éliminés dans les urines sauf une petite partie qui subit un cycle entéro-hépatique.

Passage transplacentaire

Le passage transplacentaire se fait par simple diffusion. Le rapport taux fœtal/ taux maternel est de 0,52 à 0,69.

5.3. Données de sécurité préclinique

Les données non cliniques issues des études conventionnelles de pharmacologie de sécurité, toxicologie en administration répétée, génotoxicité, cancérogénèse, et des fonctions de reproduction et de développement, n'ont pas révélé de risque particulier pour l'homme.

Évaluation du risque environnemental

Sans objet

6. DONNEES PHARMACEUTIQUES

6.1. Liste des excipients

Chlorure de sodium, soluté d'hydroxyde de sodium, eau pour préparations injectables

6.2. Incompatibilités

Le chlorhydrate de lidocaïne précipite de leurs solutions l'amphotéricine, la metohexitone sodique, le sulfadiazine sodique.

6.3. Durée de conservation

3 ans

6.4. Précautions particulières de conservation

Sans objet

6.5. Nature et contenu de l'emballage extérieur

Boîte de 1, 4 ou 6 ampoules bouteille autocassables (verre de type I) de 5 ml.
Toutes les présentations peuvent ne pas être commercialisées.

6.6. Précautions particulières d'élimination et de manipulation

Tout médicament non utilisé ou déchet doit être éliminé conformément à la réglementation en vigueur.

7. TITULAIRE DE L'AUTORISATION DE MISE SUR LE MARCHE

LABORATOIRES ETHYPHARM
179 BUREAUX DE LA COLLINE
92210 SAINT-CLOUD

8. NUMERO(S) D'AUTORISATION DE MISE SUR LE MARCHE

- 34009 331 080 1 4 : Boîte de 1 Ampoule bouteille autocassable (verre de type I) de 5 ml.
- 34009 331 081 8 2 : Boîte de 4 Ampoules bouteille autocassables (verre de type I) de 5 ml.
- 34009 331 082 4 3 : Boîte de 6 Ampoules bouteille autocassables (verre de type I) de 5 ml.

9. DATE DE PREMIERE AUTORISATION/DE RENOUVELLEMENT DE L'AUTORISATION

Date de première autorisation : 22/06/1988
Date de renouvellement de l'autorisation : durée illimité

10. DATE DE MISE A JOUR DU TEXTE

08/10/2021

11. DOSIMETRIE

Sans objet.

12. INSTRUCTIONS POUR LA PREPARATION DES RADIOPHARMACEUTIQUES

Sans objet.

CONDITIONS DE PRESCRIPTION ET DE DELIVRANCE

Liste II.