MONOGRAPHIE DE PRODUIT

INCLUANT RENSEIGNEMENTS SUR LE MÉDICAMENT POUR LE PATIENT

PrXYLOCAINE® EN GELÉE À 2 %

Chlorhydrate de lidocaïne

20 mg/mL

USP

Anesthésique topique

Aspen Pharmacare Canada Inc.
201 - 2030 Bristol Circle
Oakville, ON, L6H 0H2

Date d'approbation initiale :
Le 31 décembre 1951

Date de révision :
Le 02 janvier 2025

Numéro de contrôle de la présentation : 237711

Les marques de commerce sont la propriété de, ou exploitées sous licence par, le Groupe de sociétés Aspen.

TABLE DES MATIÈRES

TABLE DES MATIÈRES 2
PARTIE I : RENSEIGNEMENTS POUR LE PROFESSIONNEL DE LA SANTÉ 3
1 INDICATIONS 3
1.1 Enfants 3
1.2 Personnes âgées 3
2 CONTRE-INDICATIONS 3
3 POSOLOGIE ET ADMINISTRATION 4
3.1 Considérations posologiques 4
3.2 Dose recommandée et modification posologique 4
4 SURDOSAGE 6
5 FORMES POSOLOGIQUES, CONCENTRATIONS, COMPOSITION ET EMBALLAGE 8
6 MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS 9
6.1 Populations particulières 12
6.1.1 Femmes enceintes 12
6.1.2 Allaitement 12
6.1.3 Enfants 12
6.1.4 Personnes âgées 13
7 EFFETS INDÉSIRABLES 13
7.1 Aperçu des effets indésirables 13
8 INTERACTIONS MÉDICAMENTEUSES 14
8.1 Aperçu 14
8.2 Interactions médicament-médicaments 15
8.3 Interactions médicament-aliments 16
8.4 Interactions médicament-plantes médicinales 16
8.5 Interactions médicament-épreuves de laboratoire 16
8.6 Interactions mode de vie 16
9 MODE D'ACTION ET PHARMACOLOGIE CLINIQUE 16
9.1 Mode d'action 16
9.2 Pharmacodynamie 17
9.3 Pharmacocinétique 17
10 ENTREPOSAGE, STABILITÉ ET TRAITEMENT 18
11 INSTRUCTIONS PARTICULIÈRES DE MANIPULATION 18
PARTIE II : RENSEIGNEMENTS SCIENTIFIQUES 20
12 RENSEIGNEMENTS PHARMACEUTIQUES 20
RENSEIGNEMENTS SUR LE MÉDICAMENT POUR LE PATIENT 21

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

PARTIE I : RENSEIGNEMENTS POUR LE PROFESSIONNEL DE LA SANTÉ

1 INDICATIONS

XYLOCAINE en gelée à 2 % (chlorhydrate de lidocaïne) est indiquée pour :

- Anesthésie de surface et lubrification :
  - Urètre de l'homme et de la femme durant la cystoscopie, la mise en place d'une sonde, l'exploration par sonde et d'autres interventions endo-urétrales;
  - Cavités nasales et pharyngiennes avant diverses techniques endoscopiques comme la gastroscopie et la bronchoscopie;
  - Proctoscopie et rectoscopie;
  - Intubation trachéale.

- Traitement symptomatique de la douleur associée à la cystite et à l'urétrite.

1.1 Enfants

Enfants (2 à 18 ans) : Il faut administrer aux enfants des doses réduites en fonction de leur âge, de leur poids et de leur état physique (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION, Populations particulières).

Enfants (< 2 ans) : Il faut utiliser la lidocaïne avec prudence chez les enfants de moins de 2 ans en raison du manque de données appuyant l'innocuité et l'efficacité de ce produit dans cette population (voir MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS, Populations particulières).

1.2 Personnes âgées

Personnes âgées (> *65* ans) : L'expérience suggère que l'emploi chez les personnes âgées est associé à des différences en matière d'innocuité. Il faut administrer aux personnes âgées des doses réduites en fonction de leur âge et de leur état physique (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION, Populations particulières MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS-Populations particulières).

2 CONTRE-INDICATIONS

XYLOCAINE en gelée à 2 % est contre-indiquée chez les patients qui présentent une hypersensibilité à ce médicament ou à l'un des ingrédients de la formulation de ce dernier, incluant les ingrédients non-médicinaux, ou à un composant du contenant. Pour obtenir une liste complète, veuillez consulter la section « Formes posologiques, concentration, composition et emballage ».

- chez les patients ayant des antécédents connus d'hypersensibilité aux anesthésiques locaux de type amide ou aux autres composants de la préparation (voir FORMES POSOLOGIQUES, CONCENTRATIONS, COMPOSITION ET EMBALLAGE).
- en cas d'hypersensibilité connue au méthylparabène et/ou au propylparabène (agents de conservation contenus dans XYLOCAINE en gelée à 2 %) ou à leur métabolite, l'acide para-aminobenzoïque (PABA).

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

- Il faut également éviter d'administrer des préparations de lidocaïne contenant des parabènes aux patients ayant des antécédents de réactions allergiques aux anesthésiques estérifiés locaux qui sont métabolisés par les PABA.
- chez les patients souffrant de méthémoglobinémie congénitale ou idiopathique.
- chez les nourrissons nécessitant un traitement par des agents pouvant provoquer la formation de méthémoglobine, e.g., sulfamides, et qui sont âgés de 12 mois ou moins (voir INTERACTIONS MÉDICAMENTEUSES).

3 POSOLOGIE ET ADMINISTRATION

3.1 Considérations posologiques

Lorsqu'on utilise XYLOCAINE en gelée à 2 % (chlorhydrate de lidocaïne) en concomitance avec d'autres produits renfermant de la lidocaïne, il faut tenir compte de la dose totale provenant de toutes les formes pharmaceutiques.

- XYLOCAINE en gelée à 2 % en seringue de plastique ne contient pas d'agent de conservation et est destinée à un usage unique. La seringue est graduée, c.-à-d. qu'une ligne de 3 mm de gelée équivaut à environ 1 mL de gelée (20 mg de chlorhydrate de lidocaïne).
- XYLOCAINE en gelée à 2 % présentée en tube contient des agents de conservation.

L'absorption de la lidocaïne en gelée dans le rhino-pharynx est habituellement moins importante qu'avec les autres produits de lidocaïne. Les concentrations sanguines de lidocaïne sont relativement faibles et inférieures aux concentrations toxiques après l'instillation de gelée sur les muqueuses intactes de l'urètre et de la vessie à des doses allant jusqu'à 800 mg.

3.2 Dose recommandée et modification posologique

Anesthésie urétrale

Anesthésie de surface de l'urètre chez l'homme adulte

Pour produire une analgésie suffisante chez l'homme, on doit généralement administrer 20 mL de gelée (400 mg de chlorhydrate de lidocaïne). La gelée est instillée lentement jusqu'à ce que le patient éprouve une sensation de pression (environ 10 mL) (200 mg). On applique alors une pince à verge autour de la couronne pendant quelques minutes, puis on instille le reste de la gelée.

Pour des techniques comme l'introduction d'une sonde ou la cystoscopie, où l'anesthésie est particulièrement importante, on peut instiller une plus grande quantité de gelée (de 30 à 40 mL) en 3 à 4 portions et attendre de 10 à 12 minutes pour permettre à l'anesthésique d'agir avant d'insérer l'instrument. La gelée instillée dans la vessie est aussi efficace pour d'autres techniques dans cette région anatomique.

Pour anesthésier seulement l'urètre antérieur de l'homme, p. ex. la mise en place d'une sonde, de petits volumes (de 5 à 10 mL, soit 100 à 200 mg de HCl de lidocaïne) sont habituellement suffisants pour une lubrification adéquate.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

Anesthésie de surface de l'urètre chez la femme adulte

Instiller petit à petit de 5 à 10 mL de gelée, de façon à remplir complètement l'urètre. Au besoin, on appliquera de la gelée sur le méat et on le recouvrira d'un tampon d'ouate. Afin d'obtenir une anesthésie adéquate, il faut attendre quelques minutes avant de procéder aux techniques urologiques.

Endoscopie

L'instillation de 10 à 20 mL de gelée est recommandée pour une analgésie adéquate; on peut appliquer une petite quantité pour lubrifier l'instrument. Lorsqu'on combine la lidocaïne en gelée à d'autres produits de lidocaïne (pour une bronchoscopie par exemple), la dose totale de lidocaïne ne doit pas dépasser 400 mg.

Proctoscopie et rectoscopie

On peut utiliser jusqu'à 20 mL pour des interventions anales ou rectales. La dose totale de lidocaïne ne doit pas dépasser 400 mg.

Lubrification en vue d'une intubation endotrachéale

Appliquer environ 2 mL de gelée sur la surface externe de la sonde endotrachéale immédiatement avant l'insertion. Éviter de faire pénétrer la gelée dans la lumière de la sonde (voir MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS). Ne pas se servir de la gelée pour lubrifier les mandrins de la sonde endotrachéale. On recommande aussi de ne pas utiliser une sonde endotrachéale sur laquelle de la gelée a séché, car la lubrification ne sera pas adéquate.

Posologie maximale

Adultes

La dose de XYLOCAINE en gelée à 2 % dépend de l'endroit où elle est appliquée. Les doses considérées comme étant sûres sont 400 mg (20 mL) pour un emploi oral et 800 mg (40 mL) pour une administration urétrale ou vésicale. Aucune posologie maximale unique de XYLOCAINE en gelée à 2 % n'a été établie. Il ne faut pas administrer plus de quatre doses par 24 heures.

Enfants
On doit surveiller de près les enfants pendant et après l'utilisation d'anesthésiques topiques, car ils courent un plus grand risque que les adultes de présenter des événements indésirables graves (p. ex., méthémoglobinémie).

- 2 à 11 ans
  Il est difficile de recommander une dose maximale d'un médicament chez les enfants, car elle varie selon l'âge et le poids. La quantité maximale par dose de XYLOCAINE en gelée à 2 % ne doit pas dépasser 6 mg/kg de poids corporel ou 3 mL par 10 kg. Il ne faut pas administrer plus de quatre doses par 24 heures.

- 12 à 18 ans
  Chez les enfants de plus de 12 ans, il faut ajuster la dose en fonction de leur poids et de leur état physique.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

Populations particulières
Les patients affaiblis âgés, les patients gravement malades, les patients souffrant de sepsie et les enfants devraient recevoir des doses réduites qui correspondent à leur âge, leur poids et leur état physique, car ils peuvent être plus sensibles aux effets systémiques provoqués par des taux élevés de lidocaïne dans le sang en raison de doses répétées.

4 SURDOSAGE

Les réactions toxiques générales aiguës dues aux anesthésiques locaux sont habituellement associées à des concentrations plasmatiques élevées observées lors de l'administration de ces agents à des fins thérapeutiques et proviennent surtout des systèmes nerveux central et cardiovasculaire (voir EFFETS INDÉSIRABLES et MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS). Il faut se rappeler que des interactions médicamenteuses pharmacodynamiques pertinentes sur le plan clinique (c.-à-d. des effets toxiques) pourraient se produire lors de l'utilisation de la lidocaïne avec d'autres anesthésiques locaux ou agents ayant une structure moléculaire semblable, ainsi qu'avec les antiarythmiques de classes I et III, en raison des effets additifs de ces médicaments (voir INTERACTIONS MÉDICAMENTEUSES).

Symptômes

Les réactions toxiques touchant le *système nerveux central* se manifestent progressivement par des symptômes et des signes de gravité croissante. Les premiers symptômes sont la paresthésie péribuccale, l'engourdissement de la langue, la sensation de tête légère, l'hyperacousie et l'acouphène. Les troubles de la vision et les tremblements musculaires sont des symptômes plus graves et précèdent le début des convulsions généralisées. Une perte de conscience et des convulsions de type grand mal peuvent s'ensuivre et durer de quelques secondes à plusieurs minutes. L'hypoxie et l'hypercapnie surviennent rapidement à la suite des convulsions, en raison de l'activité musculaire accrue combinée à l'interférence avec la respiration normale. Une apnée peut se produire dans les cas graves. L'acidose, l'hyperkaliémie, l'hypocalcémie et l'hypoxie intensifient et prolongent les effets toxiques des anesthésiques locaux

Le rétablissement est dû à la redistribution et au métabolisme de l'anesthésique local. Il peut être rapide, à moins qu'on ait administré de grandes quantités de médicament.

On observe parfois des effets sur le *système cardiovasculaire* lorsque les concentrations générales sont élevées; ces effets comprennent l'hypotension grave, la bradycardie, les arythmies et le collapsus cardiovasculaire.

Les effets toxiques cardiovasculaires sont généralement précédés de signes de toxicité au niveau du système nerveux central, à moins que le patient reçoive un anesthésique général ou soit en sédation profonde après l'administration d'un médicament, comme une benzodiazépine ou un barbiturique.

Méthémoglobinémie

De rares cas de méthémoglobinémie ont été signalés.

Une légère méthémoglobinémie est caractérisée par une cyanose, soit une décoloration bleutée ou brunâtre de la peau, surtout autour des lèvres et des lits unguéaux, qui ne se résorbent pas

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

en respirant de l’oxygène à 100 %. Les signes cliniques peuvent également comprendre de la pâleur et un effet marbré de la peau.

La méthémoglobinémie grave (concentrations de MétHb au-delà d’environ 25 %) est associée à des signes d’hypoxémie, c.-à-d., dyspnée, tachycardie et dépression de la conscience.

Une méthémoglobinémie d’origine médicamenteuse peut survenir avec l’emploi de certains médicaments, y compris, entre autres, les amides amino-acides, les sulfamides, les acétanilides, les colorants d’aniline, la benzocaïne, la lidocaïne, la chloroquine, la dapsone, le naphtalène, les nitrates et les nitrites, la nitrofurantoïne, la nitroglycérine, le nitroprussiate, la pamaquine, l'acide para-amino-salicylique, la phénacétine, le phénobarbital, la phénytoïne, la primaquine et la quinine.

On a démontré que l’acétaminophène provoquait la formation de méthémoglobine *in vitro* et chez les animaux. Chez les humains, la formation de méthémoglobine est très rare tant aux doses thérapeutiques que lors de surdoses d’acétaminophène.

On doit se rappeler que XYLOCAINE en gelée à 2 % est contre-indiqué chez les patients souffrant de méthémoglobinémie congénitale ou idiopathique et pour les nourrissons de 12 mois et moins qui doivent recevoir des médicaments pouvant provoquer la formation de méthémoglobine. Les patients qui présentent un déficit en glucose-6-phosphate déshydrogénase sont plus susceptibles de présenter une méthémoglobinémie d’origine médicamenteuse (voir aussi CONTRE-INDICATIONS, MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS).

Traitement

Il faut d'abord penser à la prévention, surtout par une surveillance attentive et constante des signes vitaux cardiovasculaires et respiratoires et de l'état de conscience du patient après chaque administration d'anesthésique local. Au premier signe de changement, administrer de l'oxygène.

La première étape de la prise en charge des réactions toxiques générales consiste à s’assurer que les voies respiratoires sont libres, à les maintenir ainsi et à fournir une ventilation assistée ou contrôlée avec de l’oxygène et un système capable de fournir une pression positive immédiate dans les voies respiratoires à l’aide d’un masque. On peut ainsi prévenir les convulsions si elles ne se sont pas encore manifestées.

Si le patient présente des convulsions, l'objectif du traitement est de maintenir la ventilation et l'oxygénation, et de soutenir la circulation. On doit donner de l'oxygène et assister la ventilation si nécessaire (masque et sac ou intubation trachéale). Si les convulsions ne cessent pas spontanément en 15 à 20 secondes, administrer un anticonvulsivant par voie intraveineuse pour faciliter une ventilation et une oxygénation adéquates. Le thiopental sodique i.v. à raison de 1 à 3 mg/kg de poids corporel est le premier choix. Ou encore, on peut administrer du diazépam i.v. à raison de 0,1 mg/kg de poids corporel, bien que l'action de ce médicament soit lente. Les convulsions prolongées peuvent nuire à la ventilation et à l'oxygénation du patient. Le cas échéant, l'injection d'un myorelaxant (p. ex. succinylcholine à raison de 1 mg/kg de poids corporel) facilitera la ventilation et l'oxygénation peut être contrôlée. On doit envisager une intubation endotrachéale précoce quand on utilise de la succinylcholine pour contrôler l'activité motrice convulsive.

Droits d’auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

Si une dépression cardiovasculaire devient manifeste (hypotension, bradycardie), il faut administrer de 5 à 10 mg d'éphédrine i.v. et répéter cette dose après 2 à 3 minutes si nécessaire.

Si un arrêt circulatoire survient, on doit procéder immédiatement à la réanimation cardio-respiratoire. Il est essentiel d'assurer une oxygénation et une ventilation continues et de fournir une assistance circulatoire et un traitement pour l'acidose, puisque l'hypoxie et l'acidose intensifieront la toxicité générale des anesthésiques locaux. On doit administrer de l'épinéphrine (de 0,1 à 0,2 mg en injection intraveineuse ou intracardiaque) le plus tôt possible, et répéter la dose au besoin.

Chez les enfants, on doit administrer des doses d'épinéphrine en fonction de l'âge et du poids du patient.

Chez les nourrissons, des concentrations de méthémoglobine de jusqu'à 5 – 6 % ne sont pas considérées importantes sur le plan clinique, puisque le traitement de la méthémoglobinémie symptomatique n'est pas généralement nécessaire à moins que les concentrations de méthémoglobine ne soient supérieures à 25 – 30 %. Toutefois, la gravité des symptômes cliniques plutôt que le taux de méthémoglobine pourrait s'avérer la première considération pouvant entraîner l'initiation d'un traitement. La plupart des patients se sont rétablis spontanément après le retrait de la gelée. On peut traiter la méthémoglobinémie par une injection intraveineuse lente de bleu de méthylène. On a, par contre, signalé dans la littérature que le bleu de méthylène doit être utilisé avec prudence en tant que traitement de la méthémoglobinémie chez les patients présentant un déficit en glucose-6-phosphate déshydrogénase, car il pourrait ne pas être efficace pour ces patients et même causer une anémie hémolytique.

Pour traiter une surdose présumée, communiquez avec le centre antipoison de votre région.

5 FORMES POSOLOGIQUES, CONCENTRATIONS, COMPOSITION ET EMBALLAGE

Tableau 1 – Formes posologiques, concentrations, composition et emballage

Voie d'administration	Forme posologique / concentration / composition	Ingrédients non-médicinaux
Topique	20 mg/mL de gelée dans une seringue de 10 mL	Hydroxypropyl méthylcellulose, eau purifiée, et hydroxyde de sodium et/ou acide chlorhydrique.
Topique	20 mg/mL de gelée dans un tube de 30 mL	Méthylparabène, propylparabène, hydroxypropyl méthylcellulose, eau purifiée, et hydroxyde de sodium et/ou acide chlorhydrique.

Emballage

XYLOCAINE en gelée à 2 % est offert en seringues en plastique préremplies de 10 mL et en tubes d'aluminium de 30 mL munis d'un cône applicateur.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

La seringue ne contient aucun agent de conservation et est destinée uniquement à l'usage unique.

6 MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS

Généralités

UNE POSOLOGIE EXCESSIVE OU DES INTERVALLES COURTS ENTRE LES DOSES PEUVENT ENTRAÎNER DES CONCENTRATIONS PLASMATIQUES ÉLEVÉES DE LIDOCAÏNE OU DE SES MÉTABOLITES ET DES EFFETS INDÉSIRABLES GRAVES POUVANT S'AVÉRER MORTELS, y compris une méthémoglobinémie. Le degré d'absorption dans les muqueuses varie, mais il est particulièrement élevé dans l'arbre bronchique. Une telle utilisation peut donc entraîner une élévation rapide ou excessive des concentrations plasmatiques et être accompagnée d'un risque accru de symptômes toxiques tels que des convulsions et une méthémoglobinémie. IL FAUT AVERTIR LES PATIENTS DE RESPECTER RIGOUREUSEMENT LA POSOLOGIE RECOMMANDÉE. Cela est particulièrement important chez les enfants, car les doses varient en fonction du poids. La prise en charge des effets indésirables graves peut nécessiter l'utilisation d'un équipement de réanimation, d'oxygène et d'autres médicaments de réanimation (voir SURDOSAGE).

Afin d'éviter des concentrations plasmatiques élevées et des effets indésirables graves, il faut utiliser la plus faible posologie capable de produire une anesthésie efficace. La tolérance aux concentrations sanguines élevées varie selon l'état du patient.

On doit utiliser la lidocaïne avec prudence en présence d'un sepsis et/ou d'un traumatisme de la muqueuse dans la région d'application, étant donné le risque d'une absorption générale rapide dans ces cas.

Lorsqu'on utilise XYLOCAINE en gelée à 2 % chez les plus jeunes enfants, particulièrement chez les nourrissons de moins de 3 mois, on doit s'assurer que le soignant comprenne que la dose et la région d'application doivent être limitées et que toute ingestion accidentelle doit être évitée (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION). On doit surveiller étroitement les enfants pendant et après l'utilisation de lidocaïne, car ils courent un plus grand risque que les adultes de présenter de graves effets indésirables (p. ex. méthémoglobinémie).

Les patients paralysés sous anesthésie générale peuvent présenter des concentrations sanguines plus élevées que les patients qui respirent spontanément. Les patients non paralysés sont plus susceptibles d'avaler une bonne partie de la dose, laquelle subit alors un important métabolisme de premier passage hépatique après l'absorption dans l'intestin.

Éviter tout contact avec les yeux.

Un grand nombre de médicaments utilisés au cours de l'anesthésie peuvent déclencher une hyperthermie maligne peranesthésique familiale. Il a été démontré que l'emploi d'anesthésiques locaux de type amide dans l'hyperthermie maligne est sûr. Cependant, le blocage nerveux ne préviendra pas nécessairement l'apparition d'une hyperthermie maligne au cours d'une intervention chirurgicale. Il est aussi difficile de prévoir la nécessité d'une anesthésie générale

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

additionnelle. Par conséquent, on doit avoir établi un protocole standard pour la prise en charge de l'hyperthermie maligne.

Lorsqu'on lubrifie la sonde endotrachéale, on doit éviter de faire pénétrer la gelée dans la lumière de la sonde. Lorsque la gelée pénètre dans la lumière, il arrive qu'elle sèche sur la paroi interne de la sonde et forme un résidu qui tend à s'agglutiner lorsqu'on recourbe la sonde, rétrécissant ainsi la lumière. On a rapporté quelques rares cas où ce résidu a obstrué la lumière de la sonde. Il ne faut pas non plus utiliser de gelée pour lubrifier les mandrins de la sonde endotrachéale.

Lorsqu'on utilise des anesthésiques topiques dans la bouche, il faut avertir le patient que l'anesthésie locale peut nuire à la déglutition et aggraver ainsi les risques d'aspiration. L'engourdissement de la langue ou de la muqueuse buccale peut accroître le risque de morsure involontaire. Il faut s'abstenir de consommer des aliments ou de mâcher de la gomme pendant que la bouche ou la gorge demeurent sous l'effet de l'anesthésie. Voir également Partie III : Renseignements destinés aux consommateurs.

XYLOCAINE en gelée à 2 % est inefficace sur la peau intacte.

Dans les modèles animaux, la lidocaïne a démontré des propriétés porphyrinogéniques. XYLOCAINE en gelée à 2 % ne doit être prescrite aux patients atteints de porphyrie aiguë que dans des situations urgentes ou graves et les patients doivent faire l'objet d'une surveillance étroite. Il faut prendre les précautions appropriées pour tous les patients porphyriques.

Carcinogenèse et mutagenèse

Des tests de génotoxicité avec la lidocaïne n'ont mis en évidence aucun pouvoir mutagène. La 2,6-diméthylaniline, un métabolite de la lidocaïne, a présenté de faibles signes d'activité dans certains tests de génotoxicité. Une étude de toxicité orale chronique du métabolite 2,6-diméthylaniline (0, 14, 45, 135 mg/kg) administré dans la nourriture à des rats a montré une incidence significativement plus élevée de tumeurs dans les fosses nasales des mâles et des femelles qui ont été exposés tous les jours à la dose la plus élevée de 2,6-diméthylaniline pendant 2 ans. La dose la plus faible provoquant des tumeurs, testée chez les animaux (135 mg/kg), correspond approximativement à 45 fois la quantité de 2,6-diméthylaniline à laquelle un sujet de 50 kg serait exposé après l'application de 10 g de lidocaïne à 4 % en solution topique pendant 24 heures sur la muqueuse, si on suppose un degré d'absorption maximal théorique de 100 % et une transformation en 2,6-diméthylaniline de 80 %. Si l'on se base sur une exposition annuelle (dose uniquotidienne de 2,6-diméthylaniline chez des animaux et 5 séances de traitement avec 10 g de lidocaïne à 4 % en solution topique chez les humains), les marges de sécurité seraient d'environ 3400 fois plus élevées lorsqu'on compare l'exposition chez les animaux à l'exposition chez les humains.

Troubles cardiovasculaires

La lidocaïne doit aussi être utilisée avec prudence chez les patients atteints d'une bradycardie ou d'une dysfonction cardiovasculaire, car ceux-ci pourraient être moins aptes à compenser les variations fonctionnelles associées à la prolongation de la conduction auriculo-ventriculaire produite par les anesthésiques locaux de type amide.

On doit utiliser la lidocaïne avec prudence en présence de choc grave.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

Conduite de véhicules et utilisation de machines

Aux doses recommandées, XYLOCAINE en gelée à 2 % n'a pas d'effet sur la capacité de conduire et de faire fonctionner des machines. Toutefois, en cas de surdose, ça pourrait être différent. On suggère au patient de déterminer comment il ou elle se sent et d'être conscient(e) de devoir user de prudence s'il ou elle conduit ou opère des machines ou un véhicule potentiellement dangereux.

Troubles hépatiques

Comme les anesthésiques locaux de type amide tels que la lidocaïne sont métabolisés par le foie, ils doivent être utilisés avec prudence chez les patients atteints de troubles hépatiques, surtout à des doses répétées. Étant incapables de métaboliser les anesthésiques locaux normalement, les patients atteints d'une affection hépatique grave risquent davantage de présenter des concentrations plasmatiques toxiques.

Troubles neurologiques

Épilepsie : Le risque d'effets secondaires touchant le système nerveux central à l'emploi de la lidocaïne chez les patients atteints d'épilepsie est très faible, pour autant que les recommandations posologiques soient suivies (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION).

Locomotion et coordination : En général, les préparations de lidocaïne en solution topique produisent de faibles concentrations plasmatiques du produit en raison de sa faible absorption générale. Toutefois, les anesthésiques locaux peuvent avoir un effet très léger sur la fonction mentale et la coordination (dépendant de la dose) et entraver temporairement la locomotion et la vigilance, même en l'absence de toxicité manifeste sur le SNC.

Troubles rénaux

La lidocaïne est métabolisée essentiellement par le foie en monoéthylglycinexylidine (MEGX, qui exerce une certaine activité sur le SNC), puis en ses métabolites, la glycinexylidine (GX) et la 2,6-diméthylaniline (voir MODE D'ACTION ET PHARMACOLOGIE CLINIQUE). Seule une petite fraction (2 %) de la lidocaïne est excrétée dans l'urine sous forme inchangée. La pharmacocinétique de la lidocaïne et de son métabolite principal n'a pas été modifiée de façon significative chez les patients sous hémodialyse (n = 4) ayant reçu une dose de lidocaïne administrée par voie intraveineuse (i.v.). On ne prévoit donc pas que l'insuffisance rénale influe de manière significative sur la pharmacocinétique de la lidocaïne lors de l'application brève de XYLOCAINE en gelée à 2 % selon les directives posologiques (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION). On doit user de prudence lorsqu'on utilise la lidocaïne dans les cas d'insuffisance rénale grave, étant donné que les métabolites de la lidocaïne peuvent s'accumuler pendant un traitement prolongé (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION).

Sensibilité/résistance

Il faut utiliser la lidocaïne avec prudence chez les personnes qui présentent une hypersensibilité médicamenteuse connue.

XYLOCAINE en gelée à 2 % est contre-indiquée chez les patients ayant des antécédents connus d'hypersensibilité aux anesthésiques locaux de type amide, aux autres composants de la solution, au méthylparabène et/ou au propylparabène (agents de conservation) ou à leur

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

métabolite, l'acide para-aminobenzoïque (PABA). Il faut également éviter d'administrer des préparations de lidocaïne contenant des parabènes aux patients ayant des antécédents de réactions allergiques aux anesthésiques estérifiés locaux qui sont métabolisés par les PABA (voir CONTRE-INDICATIONS).

6.1 Populations particulières

On recommande d'administrer aux sujets affaiblis, gravement malades ou présentant un sepsis des doses réduites en fonction de leur âge, de leur poids et de leur état physique parce que ces patients pourraient être plus sensibles aux effets généraux de la lidocaïne, les concentrations sanguines de ce produit étant plus élevées après l'administration de doses répétées.

XYLOCAINE en gelée à 2 % est contre-indiqué chez les patients souffrant de méthémoglobinémie congénitale ou idiopathique et chez les patients avec un déficit en glucose-6-phosphate déshydrogénase qui sont plus susceptibles de présenter une méthémoglobinémie d'origine médicamenteuse (voir aussi CONTRE-INDICATIONS).

6.1.1 Femmes enceintes

Il n'existe aucune étude appropriée et bien contrôlée chez la femme enceinte à propos de l'effet de la lidocaïne sur le développement du fœtus.

Il est raisonnable de supposer qu'au fil des ans, la lidocaïne a été administrée à un grand nombre de femmes enceintes et de femmes en âge de procréer. Jusqu'à présent, on n'a rapporté aucune perturbation spécifique du processus de reproduction, p. ex. aucune fréquence accrue de malformations. Il faut toutefois faire preuve de prudence au début de la grossesse quand l'organogenèse est à son maximum.

Travail et accouchement : La lidocaïne n'est pas contre-indiquée durant le travail et l'accouchement. Lorsqu'on administre XYLOCAINE en gelée à 2 % en concomitance avec d'autres produits contenant de la lidocaïne pendant le travail et l'accouchement, il faut tenir compte de la dose totale provenant de toutes les formes pharmaceutiques utilisées.

6.1.2 Allaitement

La lidocaïne et ses métabolites sont excrétés dans le lait humain. Aux doses thérapeutiques, la quantité de lidocaïne et de ses métabolites dans le lait humain est faible et ne devrait généralement pas poser de risque pour le nourrisson.

6.1.3 Enfants

On doit surveiller les enfants de près pendant et après l'emploi d'anesthésiques topiques, car ils courent un risque plus élevé que les adultes de présenter des effets indésirables graves (p.ex., méthémoglobinémie).

Lorsqu'on utilise XYLOCAINE en gelée à 2 % chez les plus jeunes enfants, on doit s'assurer que le soignant comprenne que la dose et la région d'application doivent être limitées et que toute ingestion accidentelle doit être évitée (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION).

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

XYLOCAINE en gelée à 2 % ne doit pas être appliqué sur les muqueuses génitales d'enfants ou de nourrissons en raison de données insuffisantes en matière d'absorption.

On doit rappeler aux parents l'importance du soutien émotionnel et psychologique des enfants plus jeunes qui doivent subir une intervention médicale ou chirurgicale.

Enfants (2 à 18 ans) : On recommande d'administrer des doses réduites aux enfants en fonction de leur âge, de leur poids et de leur état physique, parce que ceux-ci pourraient être plus sensibles aux effets généraux de la lidocaïne, les concentrations sanguines de ce produit étant plus élevées après l'administration de doses répétées (voir POSOLOGIE ET ADMINISTRATION).

Enfants (< 2 ans) : Il faut utiliser XYLOCAINE en gelée à 2 % avec prudence chez les enfants de moins de 2 ans en raison du manque de données appuyant l'innocuité et l'efficacité de ce produit chez ces patients. XYLOCAINE en gelée à 2 % est contre-indiqué chez les nourrissons de 12 mois ou moins qui doivent être traités par des médicaments pouvant provoquer la formation de méthémoglobine (voir aussi CONTRE-INDICATIONS).

6.1.4 Personnes âgées

Les patients âgés risquent d'être plus sensibles aux effets généraux de la lidocaïne étant donné que les concentrations sanguines de ce produit sont plus élevées après l'administration de doses répétées; il est donc possible qu'il faille réduire la dose chez ces patients.

7 EFFETS INDÉSIRABLES

7.1 Aperçu des effets indésirables

Les manifestations indésirables consécutives à l'administration de lidocaïne s'apparentent à celles observées avec d'autres anesthésiques locaux de type amide. Elles sont généralement liées à la dose et peuvent résulter de concentrations plasmatiques élevées dues à un surdosage ou à une absorption rapide ou bien elles peuvent être attribuables à une hypersensibilité, une idiosyncrasie ou une baisse de la tolérance du patient.

On a rapporté une fréquence accrue de maux de gorge postopératoires après la lubrification de la sonde endotrachéale avec de la lidocaïne en gelée.

Les manifestations indésirables graves touchent habituellement tout l'organisme. Les manifestations rapportées le plus souvent appartiennent aux catégories suivantes :

Système nerveux central : Les manifestations touchant le SNC sont excitatives et/ou dépressives et peuvent survenir sous forme des signes et symptômes suivants, dont la gravité est croissante : paresthésie péribuccale, sensation de tête légère, nervosité, appréhension, euphorie, confusion, étourdissements, somnolence, hyperacousie, acouphène, vision trouble, vomissements, sensations de chaleur, de froid ou d'engourdissement, soubresauts musculaires, tremblements, convulsions, perte de conscience, dépression et arrêt respiratoires. Les manifestations excitatives (soubresauts musculaires, tremblements, convulsions) peuvent être très brèves, voire inexistantes, et dans ce cas, le premier signe de toxicité peut être une somnolence progressant vers la perte de conscience et l'arrêt respiratoire.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

En général, la somnolence consécutive à l'administration de lidocaïne est un signe précoce de concentrations plasmatiques élevées et peut résulter d'une absorption rapide.

Système cardiovasculaire : Les manifestations cardiovasculaires sont habituellement dépressives et caractérisées par la bradycardie, l'hypotension, l'arythmie et le collapsus cardiovasculaire pouvant mener à l'arrêt cardiaque.

Réactions allergiques : Les réactions allergiques sont caractérisées par des lésions cutanées, de l'urticaire, de l'œdème ou, dans les cas les plus graves, un choc anaphylactique. Les réactions allergiques aux anesthésiques de type amide sont rares (< 0,1 %) et peuvent résulter d'une sensibilité à l'anesthésique local ou à d'autres composants de la préparation (voir FORMES POSOLOGIQUES, COMPOSITION ET EMBALLAGE).

8 INTERACTIONS MÉDICAMENTEUSES

8.1 Aperçu

La lidocaïne est surtout métabolisée dans le foie par les isoenzymes CYP 1A2 et CYP 3A4 en ses deux principaux métabolites qui sont pharmacologiquement actifs, la monoéthylglycinexylidine (MEGX) et la glycinexylidine (GX). La lidocaïne affiche un coefficient d'extraction hépatique élevé. Seule une petite fraction (2 %) de la lidocaïne est excrétée dans l'urine sous forme inchangée. On s'attend à ce que la clairance hépatique de la lidocaïne dépende grandement du débit sanguin.

Lorsqu'ils sont administrés en concomitance avec la lidocaïne, les inhibiteurs puissants du CYP 1A2, comme la fluvoxamine, peuvent occasionner une interaction métabolique entraînant une augmentation de la concentration plasmatique de lidocaïne. Par conséquent, on doit éviter l'administration prolongée de lidocaïne chez les patients traités par des inhibiteurs puissants du CYP 1A2, comme la fluvoxamine. Il a été démontré que lorsqu'ils sont administrés en concomitance avec la lidocaïne i.v., l'érythromycine et l'itraconazole, deux inhibiteurs puissants du CYP 3A4, produisent un effet modeste sur la pharmacocinétique de la lidocaïne i.v. On a signalé que d'autres médicaments, tels que le propranolol et la cimétidine, réduisent la clairance de la lidocaïne i.v., probablement en exerçant des effets sur le débit sanguin hépatique et/ou sur le métabolisme.

Lors de l'application topique de lidocaïne, il est important de surveiller les concentrations plasmatiques pour des raisons d'innocuité (voir MISES EN GARDE ET PRÉCAUTIONS, Généralités; EFFETS INDÉSIRABLES). Toutefois, étant donné la faible exposition générale et la courte durée de l'application topique, les interactions médicament-médicament mentionnées plus loin ne devraient pas être significatives sur le plan clinique lorsque XYLOCAINE en gelée à 2 % est administré selon les recommandations posologiques.

Des interactions médicamenteuses pharmacodynamiques pertinentes sur le plan clinique pourraient se produire lors de l'utilisation de la lidocaïne avec d'autres anesthésiques locaux ou agents ayant une structure moléculaire semblable, ainsi qu'avec les antiarythmiques de classes I et III, en raison des effets additifs de ces médicaments.

L'administration concomitante de XYLOCAINE en gelée à 2 % avec d'autres agents pouvant provoquer la formation de méthémoglobine à des patients de 12 mois ou moins peut entraîner des signes cliniques de méthémoglobinémie (voir CONTRE-INDICATIONS, MISES EN GARDE

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

ET PRÉCAUTIONS, INTERACTIONS MÉDICAMENTEUSES, EFFETS INDÉSIRABLES).

8.2 Interactions médicament-médicaments

Anesthésiques locaux et agents dont la structure s'apparente à celle des anesthésiques locaux de type amide

La lidocaïne doit être utilisée avec prudence chez les patients qui reçoivent d'autres anesthésiques locaux ou des agents ayant une structure moléculaire semblable à celle des anesthésiques locaux de type amide, p. ex. les antiarythmiques comme la mexilétine, puisque leurs effets toxiques s'additionnent.

Antiarythmiques

Antiarythmiques de classe I

Les antiarythmiques de classe I (comme la mexilétine) doivent être utilisés avec prudence, car leurs effets toxiques sont additifs et possiblement synergiques.

Antiarythmiques de classe III

La prudence est recommandée lors de l'utilisation d'antiarythmiques de classe III en concomitance avec la lidocaïne en raison des possibilités d'interactions pharmacodynamiques ou pharmacocinétiques, ou les deux. Une étude sur les interactions médicamenteuses a révélé que la concentration plasmatique de lidocaïne pourrait augmenter après l'administration i.v. d'une dose thérapeutique de lidocaïne à des patients traités par amiodarone (n = 6). Des rapports de cas ont décrit une toxicité chez les patients traités en concomitance avec la lidocaïne et l'amiodarone. Les patients traités avec des antiarythmiques de classe III (p. ex. amiodarone) devraient être sous surveillance étroite, et l'observation électrocardiographique est à envisager, car les effets cardiaques de ces médicaments et de la lidocaïne pourraient être additifs.

Inhibiteurs puissants des isoenzymes CYP 1A2 et CYP 3A4

Les isoenzymes CYP 1A2 et CYP 3A4 jouent un rôle dans la formation du MEGX, un métabolite pharmacologiquement actif de la lidocaïne.

Fluvoxamine : La prise d'inhibiteurs puissants du CYP 1A2, comme la fluvoxamine, pendant l'application prolongée de lidocaïne dans des régions où l'absorption générale est importante (p. ex. muqueuses), peut occasionner une interaction métabolique entraînant une hausse de la concentration plasmatique de lidocaïne. Chez des volontaires sains, on a noté une réduction de 41 à 60 % de la clairance plasmatique d'une dose unique de lidocaïne i.v. pendant l'administration concomitante de fluvoxamine, un puissant inhibiteur sélectif du CYP 1A2.

Érythromycine et itraconazole : Chez des volontaires sains, il a été démontré que l'érythromycine et l'itraconazole, qui sont de puissants inhibiteurs du CYP 3A4, abaissent de 9 à 18 % la clairance de la lidocaïne à la suite de l'administration d'une dose unique de lidocaïne i.v.

Durant l'administration concomitante de fluvoxamine et d'érythromycine, la clairance plasmatique de la lidocaïne a diminué de 53 %.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

β-bloquants et cimétidine

À la suite de l'administration d'une dose unique de lidocaïne i.v. à des volontaires sains, on a noté que la clairance de la lidocaïne avait diminué jusqu'à 47 % lors de l'administration concomitante avec le propranolol, et jusqu'à 30 % lors de l'administration concomitante avec la cimétidine. La diminution de la clairance de la lidocaïne lorsqu'elle est administrée en concomitance avec ces médicaments est probablement due au ralentissement du débit sanguin hépatique et/ou à l'inhibition des enzymes hépatiques des microsomes. Il faut envisager la possibilité d'interactions d'importance clinique avec ces médicaments pendant un traitement prolongé avec des doses élevées de lidocaïne.

Méthémoglobinémie

Chez les patients traités en concomitance avec Xylocaine en gelée à 2 % et d'autres agents pouvant provoquer la formation de méthémoglobine, y compris, entre autres, les sulfamides, les acétanilides, les colorants d'aniline, la benzocaïne, la chloroquine, la dapsone, le naphtalène, les nitrates et les nitrites, la nitrofurantoïne, la nitroglycérine, le nitroprussiate, la pamaquine, l'acide para-amino-salicylique, la phénacétine, le phénobarbital, la phénytoïne, la primaquine et la quinine, Xylocaine en gelée à 2 % pourrait provoquer la formation de méthémoglobine et entraîner des signes cliniques apparents de méthémoglobinémie (voir CONTRE-INDICATIONS et SURDOSAGE).

On a démontré que l'acétaminophène provoquait la formation de méthémoglobine *in vitro* et chez les animaux. Chez les humains, la formation de méthémoglobine est très rare tant aux doses thérapeutiques que lors de surdoses d'acétaminophène.

8.3 Interactions médicament-aliments

On n'a pas établi d'interactions entre la lidocaïne et les aliments.

8.4 Interactions médicament-plantes médicinales

On n'a pas établi d'interactions avec les produits à base de plantes médicinales.

8.5 Interactions médicament-épreuves de laboratoire

On n'a pas établi d'interactions avec les tests de laboratoire.

8.6 Interactions mode de vie

On n'a pas établi d'interactions avec le mode de vie.

9 MODE D'ACTION ET PHARMACOLOGIE CLINIQUE

9.1 Mode d'action

La lidocaïne stabilise la membrane neuronale en inhibant le flux ionique nécessaire au déclenchement et à la conduction de l'influx nerveux, exerçant ainsi une action anesthésique locale. On croit que les anesthésiques locaux de type amide agissent dans les canaux sodiques de la membrane nerveuse.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

9.2 Pharmacodynamie

Début d'action

L'anesthésie se produit habituellement en 5 minutes, selon la région où la gelée est appliquée. L'anesthésie dure environ 20-30 minutes. XYLOCAINE en gelée à 2 % (chlorhydrate de lidocaïne) est inefficace sur la peau intacte.

Hémodynamique

La lidocaïne, comme d'autres anesthésiques locaux, peut aussi exercer des effets sur les membranes excitables du cerveau et du myocarde. Si des quantités excessives de médicament atteignent rapidement la circulation générale, il y aura manifestation de symptômes et de signes de toxicité au niveau des systèmes nerveux central et cardiovasculaire.

Les réactions toxiques reliées au système nerveux central (voir SURDOSAGE) précèdent habituellement les réactions cardiovasculaires, car elles se produisent à des concentrations plasmatiques moins élevées. Les effets directs des anesthésiques locaux sur le cœur comprennent le ralentissement de la conduction, l'inotropisme négatif et finalement l'arrêt cardiaque.

9.3 Pharmacocinétique

Absorption : La vitesse et le degré d'absorption dépendent de la concentration et de la dose totale administrée, du lieu spécifique d'application et de la durée d'exposition. Après l'application d'anesthésiques locaux sur des surfaces lésées ou des muqueuses, l'absorption est généralement rapide, mais c'est à la suite de l'administration intratrachéale ou bronchique qu'elle est la plus rapide. L'absorption de la lidocaïne en gelée dans le rhino-pharynx est habituellement moins importante qu'avec les autres produits de lidocaïne. Après l'instillation de gelée sur les muqueuses intactes de l'urètre et de la vessie à des doses allant jusqu'à 800 mg, les concentrations sanguines de lidocaïne sont relativement faibles et inférieures aux concentrations toxiques. La lidocaïne est en outre bien absorbée dans le tractus gastro-intestinal, mais en raison de sa biotransformation dans le foie, on retrouve peu de médicament sous forme inchangée dans la circulation générale.

Distribution : La lidocaïne a une clairance plasmatique totale de 0,95 L/min et un volume de distribution à l'état d'équilibre de 91 L.

La lidocaïne traverse facilement le placenta et un équilibre est atteint quant à la fraction libre (non liée) du médicament. Étant donné que le degré de liaison aux protéines plasmatiques chez le fœtus est moins élevé que chez la mère, la concentration plasmatique totale sera supérieure chez la mère, mais la concentration de la fraction libre du médicament sera la même.

La liaison plasmatique de la lidocaïne dépend de la concentration du médicament, la fraction liée diminuant à mesure que la concentration augmente. À des concentrations de 1 à 4 µg de base libre par mL, de 60 à 80 % de la lidocaïne est fixée aux protéines. La liaison est aussi fonction de la concentration plasmatique de l'alpha-1-glycoprotéine acide. La lidocaïne traverse les barrières hémato-encéphalique et placentaire, probablement par diffusion passive.

Métabolisme : La lidocaïne est rapidement métabolisée par le foie; les métabolites et le médicament inchangé sont excrétés par les reins. La biotransformation s'effectue par réactions

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

de N-désalkylation oxydative, d'hydroxylation du noyau, de clivage de la liaison amide et de conjugaison. Seulement 2 % de la lidocaïne est excrétée sous forme inchangée. La majeure partie est d'abord métabolisée en monoéthylglycinexylidide (MEGX) et ensuite, en glycinexylidide (GX), puis en 2,6-diméthylaniline. On retrouve jusqu'à 70 % de cet agent dans l'urine sous forme de 4-hydroxy-2,6-diméthylaniline. Les effets pharmacologiques et toxicologiques de la MEGX et de la GX sont similaires à ceux de la lidocaïne, quoique moins puissants. La GX a une demi-vie (environ 10 heures) plus longue que la lidocaïne et peut s'accumuler pendant une administration prolongée.

Élimination : La lidocaïne a une demi-vie d'élimination de 1,6 heure et un taux d'extraction hépatique évalué à 0,65. La clairance de la lidocaïne est presque entièrement due au métabolisme hépatique, et dépend du débit sanguin dans le foie et de l'activité des enzymes métabolisantes. Environ 90 % de la lidocaïne administrée par voie intraveineuse est excrétée sous forme de métabolites variés; moins de 10 % est excrétée sous forme inchangée dans l'urine. Le métabolite urinaire principal est un conjugué de la 4-hydroxy-2,6-diméthylaniline, représentant de 70 à 80 % de la dose excrétée dans l'urine.

Après l'injection d'un bolus intraveineux, la demi-vie d'élimination de la lidocaïne est habituellement de 1,5 à 2,0 heures. La demi-vie d'élimination chez les nouveau-nés (3,2 heures) est environ deux fois plus élevée que chez les adultes. La demi-vie peut doubler ou se prolonger davantage en présence d'une dysfonction hépatique. La dysfonction rénale ne modifie pas la cinétique de la lidocaïne, mais peut accroître l'accumulation des métabolites.

Populations particulières et états pathologiques

L'acidose augmente la toxicité générale de la lidocaïne, tandis que l'utilisation de dépresseurs du SNC peut faire hausser les concentrations de lidocaïne requises pour produire des effets évidents sur le SNC. Les manifestations indésirables objectives sont de plus en plus visibles à mesure que les concentrations plasmatiques veineuses s'élèvent au-dessus de 6,0 µg de base libre par mL.

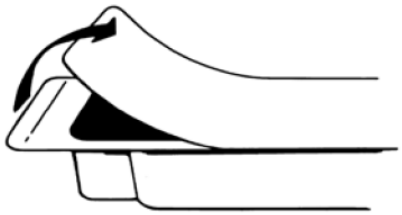
10 ENTREPOSAGE, STABILITÉ ET TRAITEMENT

Conserver entre 15 et 30 °C. Éviter le gel.

11 INSTRUCTIONS PARTICULIÈRES DE MANIPULATION

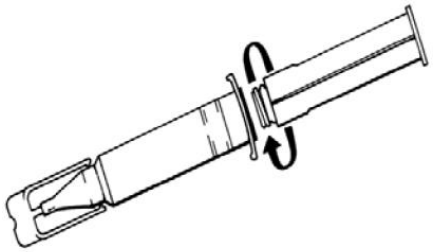
Mode d'emploi – XYLOCAINE en gelée à 2 %, Seringue

1. Enlever la pellicule de papier.

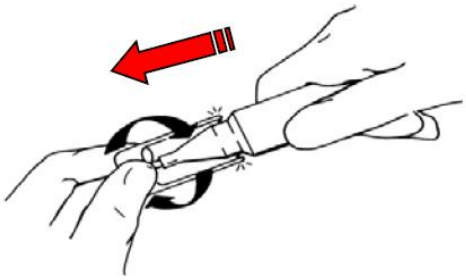


Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

2. Visser la tige du piston dans le bouchon gris, dans le sens des aiguilles d'une montre, jusqu'à ce que le bouchon tourne.

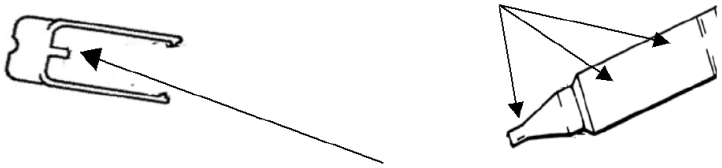


3. Tourner la languette protectrice, **sans la plier**, **puis tirer légèrement** pour briser le sceau.



4. **Faire sortir une petite quantité (c.-à-d. 1 cm) de gelée. Inspecter la seringue pour vérifier s'il n'y a pas de morceau de plastique dans la gelée.**

   Remarque : Il pourrait être difficile de déceler un morceau de plastique transparent par inspection visuelle dans la gelée claire parce que le plastique pourrait ressembler à une poche d'air.



Si la languette protectrice est brisée, ne pas utiliser la seringue.

5. **Ne pas utiliser la seringue et la jeter si on soupçonne la présence d'un morceau de plastique brisé.**

6. **Si la languette protectrice est intacte et qu'il n'y a pas de morceau de plastique dans la gelée, la seringue est prête à utiliser.**

Pour de plus amples renseignements, communiquer avec Aspen Pharmacare Canada Inc. au 1-(844)-330-1213.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

PARTIE II : RENSEIGNEMENTS SCIENTIFIQUES

12 RENSEIGNEMENTS PHARMACEUTIQUES

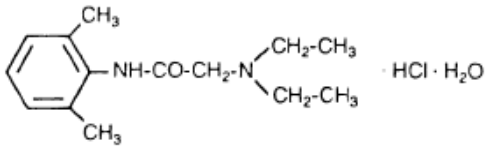
Substance pharmaceutique

Nom propre : Chlorhydrate de lidocaïne

Nom chimique : chlorhydrate d'acétamide monohydrate 2-(Diethylamino)-N-(2,6-dimethylphenyl)

Formule moléculaire et masse moléculaire : $C_{14}H_{22}N_2OHClH_2O$ (288,8)

Formule de structure :



Propriétés physicochimiques : Poudre cristalline ou cristaux blancs ou presque blancs. Le chlorhydrate de lidocaïne ne contient pas de carbone asymétrique et n'est donc pas doté d'activité optique. Très soluble dans l'eau. Librement soluble dans l'alcool.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

LISEZ CE DOCUMENT POUR ASSURER UNE UTILISATION SÉCURITAIRE ET EFFICACE DE VOTRE MÉDICAMENT

RENSEIGNEMENTS SUR LE MÉDICAMENT POUR LE PATIENT

XYLOCAINE® en gelée à 2 %
Gelée de chlorhydrate de lidocaïne

Lisez ce qui suit attentivement avant de prendre **XYLOCAINE® en gelée à 2 %** et lors de chaque renouvellement de prescription. L'information présentée ici est un résumé et ne couvre pas tout ce qui a trait à ce médicament. Discutez de votre état de santé et de votre traitement à votre professionnel de la santé et demandez-lui s'il possède de nouveaux renseignements au sujet de **XYLOCAINE® en gelée à 2 %**.

Pour quoi XYLOCAINE® en gelée à 2 % est-elle utilisée?
XYLOCAINE en gelée à 2 % est une gelée topique utilisée chez les adultes et les enfants (2 ans et plus), pour lubrifier et engourdir (produire une perte temporaire de sensation) la peau. Elle est utilisée :
- par votre médecin avant certains types d'interventions médicales;
- pour aider à soulager la douleur associée à l'inflammation de la vessie et de l'urètre.

Comment XYLOCAINE® en gelée à 2 % agit-elle?
XYLOCAINE en gelée à 2 % appartient à un groupe de médicaments appelés anesthésiques topiques. Les anesthésiques topiques bloquent les signaux nerveux, causant une perte de sensibilité ou un engourdissement temporaire dans la région où ils sont appliqués.

Quels sont les ingrédients dans XYLOCAINE® en gelée à 2 %?
Ingrédients médicinaux : chlorhydrate de lidocaïne à 2 %
Ingrédients non médicinaux : hydroxypropyl méthylcellulose, eau purifiée, hydroxyde de sodium et/ou acide chlorhydrique (pour ajuster le pH).

XYLOCAINE en gelée à 2 % dans un tube contient aussi les agents de conservation méthylparabène et propylparabène.

XYLOCAINE® en gelée à 2 % est disponible sous les formes posologiques qui suivantes :
Gelée: 20 mg /mL

XYLOCAINE® en gelée à 2 % est disponible :
- en tubes de 30 mL tube avec embout applicateur contenant, en tout, 600 mg de chlorhydrate de lidocaïne/tube;
- en seringues de 10 mL à usage unique contenant, en tout, 200 mg de chlorhydrate de lidocaïne/seringue.

Ne prenez pas XYLOCAINE® en gelée à 2 % si :
- si vous êtes allergique :
  - à la lidocaïne ou à tout autre type d'anesthésique dont le nom se termine par « caïne »
  - à l'un des ingrédients non médicinaux de XYLOCAINE en gelée à 2 % (voir la liste des ingrédients non médicinaux précitée)

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

    - au méthylparabène et/ou au propylparabène (agents de conservation utilisés dans le format tube) ou à l'acide para-aminobenzoïque (PABA) – une substance résultant de la décomposition du méthylparabène et du propylparabène
- si vous avez un trouble sanguin appelé méthémoglobinémie
- si vous souffrez d'une condition appelée « déficit en glucose-6-phosphate déshydrogénase »
- chez les nourrissons de 12 mois ou moins qui prennent des médicaments pouvant causer un trouble sanguin appelé méthémoglobinémie (p.ex., sulfamides)

Pour éviter des effets secondaires et afin de garantir une bonne utilisation du médicament, consultez votre professionnel de la santé avant de prendre XYLOCAINE® en gelée à 2 %. Mentionnez à votre professionnel de la santé tous vos problèmes de santé, notamment :

- tous les autres médicaments que vous prenez, y compris les médicaments en vente libre;
- si vous souffrez de troubles cardiaques comme :
    - un rythme cardiaque plus lent que la normale (bradycardie);
    - un battement de cœur irrégulier (arythmie);
- si vous avez déjà eu une mauvaise réaction ou une réaction allergique ou inhabituelle à XYLOCAINE en gelée à 2 % ou à tout autre médicament dont le nom se termine par « caïne »;
- si vous pensez être allergique ou sensible à l'un des ingrédients de XYLOCAINE en gelée à 2 %; (voir la liste des ingrédients ci-dessus);
- si vous avez une infection, une éruption cutanée, une coupure ou une blessure dans la région où vous désirez appliquer XYLOCAINE en gelée à 2 % ou près de celle-ci;
- si vous avez une maladie de peau qui est grave ou qui couvre une grande surface;
- si vous avez des problèmes de reins ou du foie;
- si vous êtes épileptique;
- si vous ou un membre de votre famille avez reçu un diagnostic de trouble pouvant provoquer des problèmes neurologiques ou cutanés (porphyrie);
- si vous êtes en état de choc profond;
- si vous êtes enceinte ou avez l'intention de le devenir, ou si vous allaitez.

Autres mises en garde que vous devriez connaître :

Conduite de véhicules et utilisation de machines : Vous devez déterminer comment vous vous sentez après avoir utilisé XYLOCAINE en gelée à 2 % avant de conduire ou d'utiliser de la machinerie lourde.

Emploi chez les enfants : Les enfants sont plus à risque de présenter de graves effets secondaires. Suivez toujours les instructions de votre médecin lorsque vous utilisez XYLOCAINE en gelée à 2 %, surtout sur les enfants et les nourrissons. **On ne doit jamais l'utiliser sur les organes génitaux des enfants et des nourrissons.**

Utiliser XYLOCAINE en gelée à 2 % dans la bouche : Lorsqu'on utilise des anesthésiques topiques dans la bouche ou la gorge, la langue et les parois de la bouche peuvent devenir engourdies et rendre la déglutition difficile. Ceci peut accroitre le risque de vous étouffer ou de vous mordre accidentellement la langue ou l'intérieur des joues. Vous devriez éviter de manger ou de boire des mets ou des breuvages très chauds ou très froids et de mâcher de la gomme jusqu'à ce que l'engourdissement se soit dissipé.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

Informez votre professionnel de la santé de tous les produits de santé que vous prenez, y compris les médicaments, les vitamines, les minéraux, les suppléments naturels ou les produits de médecine alternative.

Les produits qui suivent pourraient être associés à des interactions médicamenteuses avec XYLOCAINE® en gelée à 2 % :

- les médicaments en vente libre;
- les antiarythmiques utilisés pour traiter les problèmes cardiaques (p. ex., mexilétine, amiodarone). Votre médecin devrait vous surveiller de près et vous faire subir un électrocardiogramme (ÉCG) si vous prenez XYLOCAINE en gelée à 2 % avec de l'amiodarone;
- d'autres anesthésiques locaux;
- l'érythromycine utilisée pour traiter les infections bactériennes;
- l'itraconazole utilisée pour traiter les injections fongiques;
- Si vous devez utiliser de fortes doses de ce médicament pendant de longues périodes, il est possible qu'il y ait des interactions médicamenteuses avec les médicaments suivants :
  - le propranolol utilisé pour traiter les problèmes cardiaques,
  - la cimétidine utilisée pour traiter les problèmes gastro-intestinaux,
  - la fluvoxamine utilisée pour traiter la dépression
- d'autres médicaments pouvant causer une méthémoglobinémie, y compris : les sulfamides, l'acétanilide, les colorants d'aniline, la benzocaïne (ou d'autres anesthésiques de type « -caïne »), la chloroquine, la dapsone, la naphtalène, les nitrates ou nitrites, la nitrofurantoïne, la nitroglycérine, la nitroprusside, la pamaquine, l'acide para-amino-salicylique, la phénacétine, le phénobarbital, la phénytoïne, la primaquine, la quinine et les fortes doses d'acétaminophène.

Comment utiliser XYLOCAINE® en gelée à 2 % :

XYLOCAINE en gelée à 2 % peut être :

- appliqué par votre médecin lorsque vous ou votre enfant arrivez pour l'intervention médicale
- pour votre usage personnel pour traiter certaines conditions comme :
  - la douleur causée par l'inflammation de l'urètre ou de la vessie, ou
  - l'auto-cathétérisme

Lorsqu'utilisé par un professionnel de la santé :

- Votre dose ou la dose de votre enfant dépendra de :
  - la partie du corps où XYLOCAINE en gelée à 2 % sera appliqué, et
  - votre âge, tout état de santé ou condition médicale et tout médicament que vous ou votre enfant prenez

Lorsqu'utilisé pour vous traiter ou pour traiter votre enfant :

- **N'utilisez pas plus de XYLOCAINE en gelée à 2 %, ni plus souvent ou plus longtemps que ne le recommande le médecin ou la présente notice, car vous pourriez ressentir des effets secondaires indésirables importants.**
- Appliquez la gelée **UNIQUEMENT** sur une peau intacte. Si vous avez un problème cutané particulier ou d'autres affections pouvant nécessiter la supervision d'un médecin, parlez-en à votre médecin avant d'utiliser XYLOCAINE en gelée à 2 %.
- XYLOCAINE en gelée à 2 % devrait commencer à agir dans les 5 à 15 minutes suivant l'application. L'effet d'engourdissement dure généralement de 20 à 30 minutes.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

- Vous devriez :
    - bien nettoyer la région à traiter avant chaque application de gelée
    - utiliser la plus petite quantité de gelée pour contrôler vos symptômes
    - éviter le contact avec les yeux
- Vérifiez auprès de votre médecin ou votre pharmacien si vous :
    - avez des questions sur comment appliquer ou mesurer la quantité de XYLOCAINE en gelée à 2 % dont vous avez besoin;
    - vous traitez ou que vous traitez votre enfant et que votre état ou celui de votre enfant ne semble pas s'améliorer au bout de 3 à 5 jours;
    - avez l'impression que l'effet de XYLOCAINE en gelée à 2 % est trop fort ou trop faible

Posologie pour enfants (2 ans et plus) : Suivre les instructions du médecin qui vous indiqueront quelle quantité de gelée à utiliser, combien souvent l'appliquer sur la région affectée et comment l'appliquer.

Mode d'emploi - XYLOCAINE en gelée à 2 %, tube

Les directives générales suivantes concernent la quantité maximale de XYLOCAINE en gelée à 2 % qui peut être utilisée **chez des adultes sans consulter un médecin**. Ces lignes directrices ne s'appliquent qu'aux personnes en bonne santé. Si vous avez des problèmes de peau particuliers ou d'autres troubles qui exigent une supervision médicale, parlez-en à votre médecin avant d'utiliser XYLOCAINE en gelée à 2 %.

Posologie pour adultes :

- Pour l'emploi oral : une dose de 20 mL (environ 2/3 du tube) est recommandée comme étant généralement sécuritaire.
- Pour l'emploi dans l'urètre avant l'insertion de cathéters urinaires : une dose de 5 à 20 mL (jusqu'à environ 2/3 d'un tube) est recommandée comme étant généralement sécuritaire
- Pour l'emploi dans l'urètre et la vessie : 40 mL (environ 1 tube complet plus 1/3 d'un autre tube) sont recommandés comme étant généralement sécuritaires.

N'utilisez pas plus de 4 doses au cours d'une période de 24 heures.

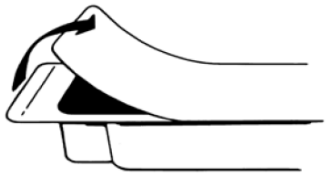
Mode d'emploi – XYLOCAINE en gelée à 2 %, Seringue

Posologie pour adultes (seringue préremplie) : Si vous utilisez une seringue préremplie pour traiter votre affection, suivez le **Mode d'emploi – XYLOCAINE en gelée à 2 %, Seringue** (ci-dessous) et les instructions de votre médecin ou de votre pharmacien sur la quantité à utiliser.

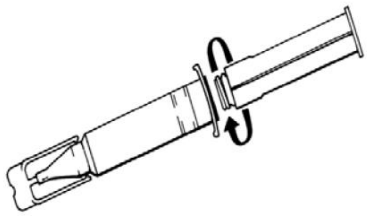
- La seringue est graduée (elle comporte des lignes indiquant le volume de gelée dans la seringue). Une ligne de 3 mm de gelée équivaut à environ 1 mL de gelée (20 mg de chlorhydrate de lidocaïne).

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

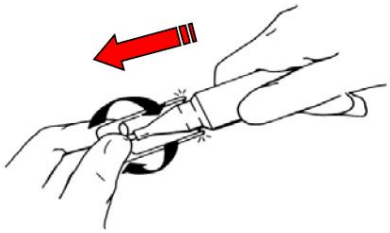
1. Enlever la pellicule de papier.



2. Visser la tige du piston dans le bouchon gris, dans le sens des aiguilles d'une montre, jusqu'à ce que le bouchon tourne.

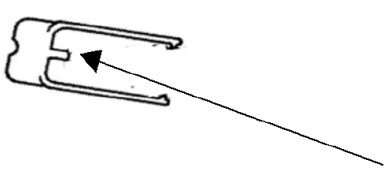


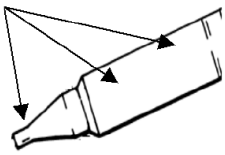
3. Tourner la languette protectrice, **sans la plier**, **puis tirer légèrement** pour briser le sceau.



4. **Faire sortir une petite quantité (c.-à-d. 1 cm) de gelée. Inspecter la seringue pour vérifier s'il n'y a pas de morceau de plastique dans la gelée.**

   Remarque : Il pourrait être difficile de déceler un morceau de plastique transparent par inspection visuelle dans la gelée claire parce que le plastique pourrait ressembler à une poche d'air.





Si la languette protectrice est brisée, ne pas utiliser la seringue.

5. **Jetez la seringue et NE l'utilisez pas si vous croyez que la gelée contient des fragments de plastique brisé.**

6. **Si la languette protectrice est intacte et qu'il n'y a pas de morceaux de plastique dans la gelée, la seringue peut être utilisée.**

Si vous avez des questions ou des problèmes, communiquer avec Aspen Pharmacare Canada Inc. au 1-(844)-330-1213.

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.

Surdosage :

Si vous croyez avoir utilisé trop de XYLOCAINE en gelée à 2 %, communiquez immédiatement avec votre professionnel de la santé, le service des urgences d'un hôpital ou votre centre antipoison régional, même si vous ne présentez aucun symptôme.

Les symptômes d'une surdose comprennent :
- engourdissement des lèvres et du contour de la bouche
- sensation de tête légère
- étourdissement
- vision brouillée
- tremblements
- crises d'épilepsie
- perte de conscience

Quels sont les effets secondaires qui pourraient être associés à XYLOCAINE® en gelée à 2 %?

En prenant XYLOCAINE® en gelée à 2 %, vous pourriez ressentir des effets secondaires autres que ceux énumérés dans cette liste. Si vous ressentez des effets secondaires non énumérés ici, contactez votre professionnel de la santé.

Effets secondaires graves et mesure à prendre			
Symptôme / effet	Contactez votre professionnel de la santé		Cessez de prendre le médicament et obtenez de l'aide médicale immédiate
	Uniquement si l'effet est sévère	Dans tous les cas	
RARE Réactions allergiques comme : Difficulté à avaler ou à respirer, respiration sifflante; chute de tension artérielle; avoir la nausée et vomir; urticaire ou éruption cutanée; enflure du visage, des lèvres, de la langue ou de la gorge.	**X**		**X**
RARE **Méthémoglobinémie** Peau qui prend une coloration brunâtre ou grisâtre, surtout autour des lèvres et des ongles			**X**
EXTRÊMEMENT RARE Somnolence, engourdissement de la langue, sensation de tête légère, bourdonnement dans les oreilles, vision brouillée, vomissements, étourdissement, rythme cardiaque inhabituellement lent, évanouissement, nervosité, sudation inhabituelle, tremblement ou crises convulsives.			

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés

Ces symptômes surviennent généralement lorsque de grandes quantités de XYLOCAINE en gelée à 2 % sont utilisées sur une longue période de temps.			

En cas de symptôme ou d'effet secondaire gênant non-mentionné dans le présent document ou d'aggravation d'un symptôme ou d'effet secondaire vous empêchant de vaquer à vos occupations quotidiennes, parlez-en à votre professionnel de la santé.

Déclaration des effets secondaires

Vous pouvez signaler tout effet secondaire soupçonné d'être associé à l'emploi des produits de santé à Santé Canada :

- en visitant la page web sur la Déclaration des effets indésirables (https://www.canada.ca/fr/sante-canada/services/medicaments-produits-sante/medeffet-canada/declaration-effets-indesirables.html) pour l'information relative à la déclaration en ligne, par la poste ou par télécopieur; ou
- en composant le numéro sans frais 1-866-234-2345.

REMARQUE : Si vous avez besoin de renseignements concernant la prise en charge des effets secondaires, communiquez avec votre professionnel de la santé. Le Programme Canada Vigilance ne fournit pas de conseils médicaux.

Entreposer :

À la température ambiante (15 – 30 °C). Évitez le gel. Gardez le médicament dans son emballage d'origine. Garder hors de la portée et de la vue des enfants.

N'utilisez pas XYLOCAINE en gelée à 2 % après la date limite figurant sur l'emballage.

Pour en savoir davantage au sujet de XYLOCAINE® en gelée à 2 %, vous pouvez :

- Communiquer avec votre professionnel de la santé
- Lire la monographie de produit intégrale rédigée à l'intention des professionnels de la santé, qui renferme également les renseignements sur les médicaments pour les patients. Ce document est publié sur le site Web de Santé Canada (https://health-products.canada.ca/dpd-bdpp/switchlocale.do?lang=fr&url=t.search.recherche); le site Web du fabricant http://aspenpharma.ca/, ou peut être obtenu en téléphonant au 1-844-330-1213.

Le présent dépliant a été rédigé par Aspen Pharmacare Canada Inc.

Dernière révision : le 02 janvier 2025

Droits d'auteur 2025 du Groupe de sociétés Aspen ou ses donneurs de licence. Tous droits réservés.