

**PRILOCAINE HCl**  
4% with Epinephrine 1:200,000

**DESCRIPTION:**

Prilocaine (2-propylamino-o-propionolouidide) a hydrochloride salt, is a white crystalline odourless power soluble in water and resistant to acid and alkaline hydrolysis. Dental cartridges of Prilocaine HCl 4% with Epinephrine 1:200,000 should not be autoclaved since Epinephrine may be altered by heat.

Each mL of Prilocaine HCl 4% with Epinephrine 1:200,000 contains the following:

Prilocaine HCl USP	40mg
Epinephrine	0.005 mg
Sodium Metabisulfite	0.5 mg
Citric Acid	0.2 mg
Sodium Hydroxide or Hydrochloride Acid	to adjust pH
Water for injection USP	q.s. 1 mL

**ACTIONS:**

Prilocaine stabilizes the neuronal membrane and therefore prevents the initiation and transmission of nerve impulses thereby producing anesthesia of about one hour duration in most cases. Anaesthesia is very rapid on onset and more profound and longer than Prilocaine 4% without a vasoconstrictor. Prilocaine, because of its non-ester chemical structure, is not detoxified by circulating plasma esterases.

**INDICATION:**

Prilocaine 4% with Epinephrine 1:200,000 is indicated for the production of local anaesthesia for dental procedures by nerve block or infiltration injection.

**CONTRAINDICATIONS:**

Prilocaine is contraindicated in patients with a known hypersensitivity (allergy) to amide type local anaesthetics and those patients with congenital or idiopathic methemoglobinemia. Epinephrine is contraindicated by hypertension, thyrotoxicosis, diabetes, and certain cardiovascular disorders.

Methemoglobinemia studies carried out on experimental animals and man indicate that Prilocaine is capable of producing methemoglobinemia. However, the normal dosage of 1-2 mL in dentistry would not be capable of producing methemoglobinemia, which is statistically significant.

**WARNING:**

Resuscitative equipment and drugs should be immediately available when any local anaesthetic is used.

The American Heart Association has made the following recommendations regarding the use of local anaesthetics with vasoconstrictors in patients with ischemic heart disease: "Vasoconstrictor agents should be used in local anesthesia solutions during dental practice only when it is clear that the procedure will be shortened or the analgesia rendered more profound. When a vasoconstrictor is indicated, extreme care should be taken to avoid intravascular injection. The minimum possible amount of vasoconstrictor should be used." (Kaplan, EL, editor: Cardiovascular disease in dental practice, Dallas 1986, American Heart Association.)

**PRECAUTIONS:**

Prilocaine HCl 4% with Epinephrine 1:200,000 as with all local anaesthetics containing a vasoconstrictor, should be used with great caution in patients receiving drugs known to produce blood pressure alterations (i.e. MAO inhibitors, tricyclic antidepressants, phenothiazines, etc.) as either severe and sustained hypotension or hypertension may occur. The safety and effectiveness of Prilocaine depends on proper dosage, correct technique, adequate precautions and readiness for emergencies.

The lowest dose that results in effective anaesthesia should be used to avoid high plasma levels and serious undesirable side effects. Injection of repeated doses of the drug may cause significant increases in blood levels, as the drug or its metabolites tend to accumulate. Tolerance varies with the status of the patient. Debilitated, elderly patients, acutely ill patients, and children should be given reduced doses depending on their age and physical status. Solutions containing a vasoconstrictor should be used with caution in the presence of diseases which may adversely affect the cardiovascular system. The drug should be used with caution in persons with known drug sensitivities. Care should be used to avoid intravascular injection. Aspiration before and during injection is suggested. Slow injection (not over 1 mL per minute) is important to avoid systemic reactions.

Serious cardiac arrhythmias may occur if solutions containing a vasoconstrictor are used along with administration of chloroform, halothane, cyclopropane, trichloroethylene, or similar agents.

**ADVERSE REACTIONS:**

Adverse experiences following the administration of prilocaine are similar in nature to those observed with other amide-type local anesthetic agents. These adverse experiences are, in general, dose-related and may result from high plasma levels (which may be caused by excessive dosage, rapid absorption, unintended intravascular injection or slow metabolic degradation), injection technique, volume of injection, hypersensitivity, idiosyncrasy or diminished tolerance on the part of the patient. Serious adverse experiences are generally systemic in nature.

Reactions involving the central nervous system are characterized by excitation and/or depression. Nervousness, dizziness, blurred vision, or tremors may occur followed by drowsiness, unconsciousness, and respiratory arrest.

Reactions involving the cardiovascular system include depression of the myocardium, hypotension, bradycardia, and possibly cardiac arrest.

The treatment of a patient with toxic manifestations consist of assuring and maintaining an open airway, and supporting adequate ventilation using oxygen and assisted or controlled respiration as required. This will be sufficient in most cases. Should circulatory depression occur, vasopressors such as Ephedrine or Metaraminol, and intravenous fluids may be used. Should a convulsion occur and persist despite oxygen therapy, small increments of an ultrashort acting barbiturate (thiopental or thiamylal) or a short acting barbiturate (pentobarbital or secobarbital) may be given intravenously. Intravenous barbiturates should only be used by those familiar with their use.

Allergic reactions are characterized by cutaneous lesions, urticaria, edema, or anaphylactoid reactions. The detection of sensitivity by skin tests is of doubtful value.

Persistent paresthesias of the lips, tongue, and oral tissues have been reported with the use of prilocaine, with slow, incomplete, or no recovery. These post-marketing events have been reported chiefly following nerve blocks in the mandible and have involved the trigeminal nerve and its branches.

**DOSAGE AND ADMINISTRATION:**

The dosage varies and depends on the area to be anaesthetized, vascularity of tissues, individual tolerance, and the technique used. The lowest dose needed to provide effective anaesthesia should be used. For specific techniques of local anaesthetic administration, consult standard textbooks on this subject.

For infiltration and nerve block injections in the upper or lower jaw, a dose of one cartridge will usually suffice. Each cartridge contains 1.8 mL of anaesthetic with 72 milligrams of Prilocaine.

The maximum dose for normal healthy adults is 600 mg (8mg/kg) or approximately 8 cartridges.

The maximum dosage for children should be calculated by using one of the standard pediatric drug formulas. Using Clark's rule for example for a child of 5 years weighing 23 kg, the dose of Prilocaine Hydrochloride should not exceed 150 mg (7mg/kg of body weight) or approximately 2 cartridges.

Any unused portion of a cartridge should be discarded. Do not sterilize cartridges with quaternary ammonium germicides as they react with the aluminum of the metal cap.

**HOW SUPPLIED:**

Prilocaine HCl 4% with Epinephrine 1:200,000 is supplied in containers of 50 cartridges, each containing 1.8 mL of solution.

**NOVOCOL**

Pharmaceutical of Canada, Inc.  
25 Wolsley Court, Cambridge, Ontario N1R 6X3



Made in Canada  
Rev. 11/07 (2548-1)

# CHLORHYDRATE DE PRILOCAÏNE

4% avec épinéphrine 1:200 000

## DESCRIPTION:

Le sel de Chlorhydrate de Prilocaine (2-propylamino-0-propionotoluidide) est une poudre cristalline blanche et inodore. Soluble dans l'eau, il résiste à l'hydrolyse aussi bien par les acides que par les alcalins. Les carpules dentaires de chlorhydrate de prilocaine à 4% avec épinéphrine à raison de 1:200 000 ne doivent pas être mises à l'autoclave parce que la chaleur peut altérer l'épinéphrine.

Chaque mL de Chlorhydrate de Prilocaine à 4% avec épinéphrine à raison de 1:200 000 contient:

Chlorhydrate de Prilocaine USP	40 mg
Épinéphrine	0,005 mg
Métabisulfite de Sodium	0,5 mg
Acide Citrique	0,2 mg
Hydroxide de Sodium ou Acide Chlorhydrique	pour ajuster le pH
Eau pour préparation injection USP	q.s. 1 mL

## ACTION:

La Prilocaine stabilise la membrane neuronale et empêche ainsi la formation et la transmission d'impulsions nerveuses. Elle produit alors un effet anesthésique local qui, dans la plupart des cas, dure environ une heure. Le début d'action de la Prilocaine est très rapide, et l'effet anesthésique est plus prononcé et dure plus longtemps que celui de la Prilocaine à 4% sans vasoconstricteur. En raison de sa structure chimique dépourvue d'esters, la Prilocaine n'est pas détoxiquée par les estérases plasmatiques en circulation.

## INDICATIONS:

La Prilocaine à 4% avec épinéphrine à raison de 1:200 000 est indiquée dans les interventions dentaires pour l'anesthésie locale par blocage nerveux ou par infiltration.

## CONTRE-INDICATIONS:

La Prilocaine est contre-indiquée chez les sujets caractérisés par une hypersensibilité (allergie) connue aux anesthésiques locaux du type amide ainsi que chez les malades présentant une méthémoglobinémie congénitale ou idiopathique. L'épinéphrine est contre-indiquée dans l'hypertension, la thyrotoxicose, le diabète et certains troubles cardio-vasculaires.

Les études sur la méthémoglobinémie réalisées chez des animaux de laboratoire et chez l'homme ont montré que la Prilocaine peut être à l'origine d'une méthémoglobinémie. La posologie normale, en dentisterie, étant de 1 à 2 mL, celle-ci ne devrait pas être susceptible d'occasionner une méthémoglobinémie, ce qui est important du point de vue statistique.

## MISE EN GARDE:

Lors de l'emploi de tout anesthésique local, il faut s'assurer d'avoir sous la main le matériel de réanimation d'urgence et les médicaments appropriés.

La American Heart Association a fait les recommandations suivantes sur la présence d'agents vasoconstricteurs dans la solution d'anesthésique local chez les patients atteints de cardiopathie ischémique: "Les agents vasoconstricteurs devraient seulement être employés dans les solutions d'anesthésique local en pratique dentaire lorsque nous savons avec certitude que la durée de la procédure ne sera pas longue ou qu'une analgésie plus profonde s'avère nécessaire. En présence d'un agent vasoconstricteur, une attention soutenue doit être portée à la prévention d'injection intravasculaire. La moindre quantité possible d'un tel agent devrait être utilisée." (Kaplan, EL, rédacteur: Cardiovascular disease in dental practice, Dallas 1986, American Heart Association.)

## PRÉCAUTIONS:

Le Chlorhydrate de Prilocaine à 4% avec épinéphrine à raison de 1:200 000 doit, comme tout autre anesthésique local contenant un vasoconstricteur, être utilisé avec beaucoup de prudence chez les malades qui reçoivent un médicament capable de modifier la tension artérielle (par exemple, les inhibiteurs de la MAO, les antidépresseurs tricycliques, les phénothiazines, etc.) car une hypotension ou une hypertension graves et persistantes peuvent s'ensuivre. L'innocuité et l'efficacité de la Prilocaine dépendent de l'administration d'une dose appropriée, de la précision de la technique, des précautions adéquates et de la promptitude à réagir en cas d'urgence.

Afin d'éviter de provoquer des concentrations plasmatiques élevées et des effets secondaires indésirables, il convient d'appliquer la posologie la plus faible capable de produire une anesthésie efficace. L'injection de doses successives de Prilocaine peut causer un accroissement significatif du taux sanguin après chaque administration, en raison de la lente accumulation du médicament ou de ses métabolites. La tolérance varie selon l'état du patient. Les sujets âgés, affaiblis ou gravement malades et les enfants recevront des doses moindres, proportionnelles à leur poids et leur état physique. En présence d'affections qui peuvent perturber le système cardio-vasculaire, on utilisera avec précaution les solutions contenant un vasoconstricteur. La prudence est de rigueur lors de l'emploi du médicament chez les personnes présentant une hypersensibilité médicamenteuse connue. Il faut prendre garde de ne pas effectuer une injection intravasculaire. On recommande d'effectuer des aspirations avant et durant l'injection. Afin d'éviter les réactions générales, on doit injecter lentement le médicament (au maximum 1 mL par minute).

Des arythmies cardiaques graves peuvent se produire lorsque des préparations contenant un vasoconstricteur sont utilisées pendant ou après l'administration de chloroforme, halothane, cyclopropane, trichloréthylène ou autres substances similaires.

## EFFETS INDÉSIRABLES:

Les réactions indésirables causées par l'administration de prilocaine sont de nature similaire à celles observées avec d'autres agents anesthésiques locaux de type amide. Ces réactions indésirables sont, en général, reliées à la dose et peuvent être provoquées par des concentrations plasmatiques élevées (lesquelles peuvent être causées par un dosage excessif, une absorption rapide, une injection intravasculaire non intentionnelle ou une dégradation métabolique lente), la technique d'injection, le volume de l'injection, l'hypersensibilité, l'idiosyncrasie ou la tolérance réduite du patient. Les réactions indésirables graves sont généralement de nature systémique.

Les réactions du SNC sont de nature excitative ou dépressive, ou les deux, et peuvent se manifester par de la nervosité, des étourdissements, une vision brouillée ou des tremblements suivis de somnolence, de convulsions, d'inconscience, voire d'un arrêt respiratoire. Les réactions excitatives peuvent être très brèves ou même absentes et, dans ce dernier cas, les premières manifestations pourront prendre la forme d'une somnolence progressant vers l'inconscience et l'arrêt respiratoire.

Les réactions touchant l'appareil cardio-vasculaire comprennent la dépression du myocarde, l'hypotension, la bradycardie et même l'arrêt cardiaque.

En présence de manifestations de toxicité, il faut maintenir les voies respiratoires libres, aider la ventilation avec le l'oxygène et utiliser la respiration assistée ou contrôlée, au besoin. Ces mesures suffisent habituellement à maîtriser la plupart des réactions. Si une dépression circulatoire survient, on peut employer des vasopresseurs tels que l'éphédrine ou le métaraminol et des solutés i.v. Si des convulsions persistent en dépit de l'oxygénothérapie, on peut administrer, par voie intraveineuse, de petites doses successives d'un barbiturique à action très courte, (thiopental ou tiamylal) ou d'un barbiturique à action courte (pentobarbital ou sécobarbital). L'administration d'un barbiturique intraveineux ne devrait se faire que par une personne qui en maîtrise bien la technique.

Les réactions allergiques se caractérisent par des lésions cutanées, de l'urticaire, de l'oedème ou des réactions anaphylactoides. Le dépistage de la sensibilité par cutiréaction a une valeur douteuse.

La paresthésie persistante des lèvres, de la langue et des tissus oraux a été observée avec l'emploi de chlorhydrate de prilocaine, dont le rétablissement est lent, incomplet ou nul. Ces événements après commercialisation ont été déclarés principalement à la suite de blocage nerveux au niveau de la mandibule, ayant eu effet sur le nerf trijumeau et ses ramifications.

## POSOLOGIE ET ADMINISTRATION:

La posologie varie et dépend de la région à anesthésier, de la vascularité des tissus, de la tolérance du sujet et de la technique employée. On recommande d'administrer la plus petite dose requise pour produire une anesthésie efficace. En ce qui concerne les méthodes et techniques d'administration particulières à suivre, on se reportera aux manuels standards d'art dentaire.

Pour l'infiltration et les injections d'un bloc dans la mâchoire supérieure ou inférieure, la dose d'une carpule suffit habituellement. Chaque carpule contient 1,8 mL de solution anesthésique et solution anesthésique et 72 mg de Prilocaine.

La dose maximale pour un adulte en santé est de 600mg (8mg/kg) ou approximativement 8 cartouches.

La dose maximale pour les enfants devrait être calculé en se servant d'une des formules standard de pédiatrie. Par exemple en se servant de la règle de Clark, pour un enfant de 5 ans pesant 23kg, la dose de Chlorhydrate de Prilocaine ne devra excéder 150mg (7mg/kg de poids corporel) ou approximativement 2 cartouches.

Tout portion inutilisée d'une carpule dentaire doit être mise au rebut. Ne pas stériliser les carpules à l'aide d'un germicide à base d'ammonium quaternaire, car cette substance réagira avec l'aluminium dont est fabriqué de capuchon métallique.

## PRÉSENTATION:

Le Chlorhydrate de Prilocaine à 4% avec épinéphrine à raison de 1:200 000 est présenté en contenants de 50 carpules, chacune renfermant 1,8 mL de solution.

## NOVOCOL

Pharmaceutical of Canada, Inc.  
25 Wolseley Court, Cambridge, Ontario N1R 6X3



Fabriqué au Canada  
Rév. 11/07 (2548-1)