

Anesthésiques locaux

Les anesthésiques locaux (AL) sont des substances chimiques capables d'abolir temporairement le fonctionnement des terminaisons et des fibres nerveuses au voisinage ou au contact de leur point d'administration entraînant une suspension de l'excitabilité et de la conductibilité des éléments nerveux. Les fibres nerveuses sont inégalement sensibles à l'action de ces molécules (disparition dans l'ordre des sensations douloureuses, thermiques, et enfin tactiles).

1-Propriétés :

L'utilisation des AL et leurs efficacité aux concentrations utilisables cliniquement dépend de :

- ✓ Réversibilité d'action (récupération des capacités nerveuses après disparition de l'action pharmacologique).
- ✓ Tolérance locale : l'utilisation des AL ne doit pas être à l'origine de dommage cellulaire ou de réactions inflammatoires.
- ✓ Tolérance générale : Le passage plasmatique et la fixation tissulaire ne doivent pas altérer les fonctions vitales.
- ✓ Non toxique.

2-Classification : 3 groupes (tableau 1)

○ *Anesthésique à fonction ester :*

- Utilisation: anesthésie de contact ou anesthésie par infiltration exemple: procaine.
- Inconvénient: hydrolyse rapide par les pseudocholinestérases plasmatiques d'où leur brièveté d'action.
- Contre-indication en cas de déficit en pseudocholinestérases plasmatiques.

○ *Anesthésique à fonction amide:*

- Ont une durée d'action plus prolongée.
- Sont lentement métabolisés par le foie exemple: lidocaïne (mesocaine, xylocaïne), bupivacaïne (marcaïne)

○ *Anesthésique à fonction éther:*

- à usage externe.
- Utilisation: application locale dans les prurits et certains examens endoscopiques exemple: pramocaïne (tronothane): crise hémorroïdale.

3-Mode d'administration : On peut distinguer :

3-1-Anesthésie de surface :

- Application sur la peau.
- l'anesthésiant traverse le revêtement épithélial et parvient aux terminaisons nerveuses.
- Délai: 2 à 3 minutes.
- Durée d'action: 20 à 30 minutes.
- Pas de gestes chirurgicaux (degré d'insensibilité insuffisant).
- Réservée aux réactions douloureuses ou prurigineuses.

3-2- Anesthésie par infiltration :

- Le produit est injecté dans les tissus muqueux de la région à anesthésier, il diffuse et inhibe la transmission de l'influx dans les extrémités nerveuses sensibles de la région désirée.

3-3-Anesthésie de conduction :

- Introduction au voisinage d'un tronc nerveux assurant l'innervation sensitive de la région désirée.
- Effet: bloquer la propagation des influx entre la périphérie et les centres exp: rachianesthésie.

4-Mode d'action :

Les anesthésiques locaux provoquent une diminution de la perméabilité des ions Na⁺. Ils stoppent de manière réversible la transmission de l'influx nerveux en bloquant les canaux sodiques voltage-dépendants des fibres nerveuses. Le blocage des flux entrants de sodium inhibe la dépolarisation. Il en résulte une dépression de l'excitabilité et une diminution de la conductibilité. C'est ainsi qu'ils rendent insensibles à la douleur le territoire correspondant à l'innervation du site d'administration.

5-Pharmacocinétique :

Les AL sont destinés à agir au site d'injection, c'est leur concentration locale qui est responsable de l'effet observé. La résorption systémique est une étape de leur élimination, permettant leur métabolisme ultérieur. L'importance et la vitesse de la résorption dépend de la vascularisation du tissu.

La fixation protéique (principalement liée à l' α 1-glycoprotéine) de tous les amides est importante. Elle varie de 65 % pour la lidocaïne à 96 % pour la bupivacaïne et la ropivacaïne. Les facteurs diminuant cette fixation (acidose, hypoventilation, âge inférieur à un an ou au contraire très avancé) augmentent la toxicité systémique des AL.

La rapidité de l'injection des AL est associée à une majoration de la fraction libre, ce qui augmente encore le risque toxique. La demi-vie plasmatique est très variable mais en général brève. Le Métabolisme dépend de la structure chimique de l'AL :

○ *Les esters (procaïne, tétracaïne):*

Ces molécules sont hydrolysées au niveau du plasma par les pseudo-cholinestéases et donnent naissance à l'acide para-aminobenzoïque qui est sans doute à l'origine des réactions allergiques aux AL.

○ *Les amides (lidocaïne):*

Ces molécules sont métabolisées au niveau du foie. L'insuffisance hépatique mais aussi certains médicaments (propranolol...) s'accompagnent d'un allongement parfois considérable de t_{1/2} et d'une prolongation des effets pharmacologiques.

6-Indications :

Les AL ont pour indications:

○ *Anesthésie locale ou locorégionale:*

Ils sont utilisés pour les interventions:

- Locale: odontostomatologique, ORL, ophtalmologique.
- Générale: rachianesthésie.....
- Explorations endoscopiques.

○ *Traitement des douleurs localisées modérées :*

- Prurit, mal de gorge, aphte.
- Crise hémorroïdaire, otite externe.
- Douleur post-traumatique...

○ *Troubles du rythme ventriculaire:*

-La lidocaïne : anti-arythmique.

7-Contre-indications :

Sont rares voir exceptionnelles :

- Allergie aux produits
- Porphyrie (maladie métabolique du cycle de l'hème due à un déficit enzymatique).
- Troubles de conduction intracardiaque.

- Epilepsie non contrôlée.

8-Effets indésirables :

- Effets indésirables cardiovasculaires: hypotension, bradycardie, troubles du rythme, fibrillation ventriculaire, voir arrêt cardiaque.

- Effets indésirables neurologiques: bourdonnement d'oreille, dysphorie, surdité, paresthésies céphalées, sensations nauséuses, convulsions localisées « habituellement traitées par l'injection d'une benzodiazépine comme le diazépam (valium*) ».

- Effets indésirables respiratoires: dépression respiratoire, apnée.

9-Accidents :

-Très rares.

-Lorsqu'ils se produisent: sont sévères et nécessitent un traitement immédiat (approprié).

-Les accidents sont de 2 types: **accidents allergiques** très rares et souvent confondus avec les accidents toxiques ou un **surdosage** qui peut être **réel** par emploi de dose trop élevée ou **relatif** suite à un passage trop rapide de l'AL responsable d'un pic plasmatique mal toléré, même s'il est transitoire.

-les manifestations toxiques se traduisent la plupart du temps par d'abord des manifestations neurologiques puis cardiovasculaires.

NB :

La toxicité des AL dépend de la dose injectée, du site d'injection (vascularisation et proximité du SNC), du choix de l'AL (la lidocaïne, la procaine, la mépivacaïne et la ropivacaïne sont moins toxiques que la buvipacaïne), de la vitesse d'injection et de l'adjonction ou non d'adrénaline (limite la résorption).

10-Interactions médicamenteuses :

- Accélération du métabolisme des AL par les barbituriques.
- Ralentissement du métabolisme: iproniazide, anesthésiques halogénés, B-bloquants, cimétidine.
- Interactions liées au vasoconstricteur (adrénaline): IMAO, antidépresseurs tricycliques.

11-Intérêt de l'ajout d'un vasoconstricteur:

- les vasoconstricteurs utilisés sont:

-Adrénaline

-Noradrénaline (à moindre degré),...

- Le vasoconstricteur permet d'avoir:

-Une action locale d'une durée suffisante

-Des effets systémiques faibles

-Une élimination relative du sang dans la zone d'opération.

-L'anesthésiant est maintenu au site d'action.

NB:

Les vasoconstricteurs ne doivent pas être utilisés lors d'une anesthésie locale au niveau des extrémités (doigts, orteils) car il y a risque de nécrose par ischémie.

12-Contre-indications des formes contenant de l'adrénaline :

- Insuffisance coronarienne.

- Troubles du rythme ventriculaire.

- Injection intraveineuse.

- Hypertension artérielle sévère.

- Cardiomyopathie obstructive.

- Hyperthyroïdie.

- Injection au niveau des extrémités.

Tableau 1 : Principaux anesthésiques locaux					
Type	DCI	Spécialité	Présentation	Posologie	Demi-vie (h)
Ester	Procaine	Procaine Lavoisier® + G	Sol. inj. 10 ou 20 mg/mL	Adulte : 100 à 600 mg	Quelques minutes
	Tétracaine	Solutricine® tétracaine	Cp à sucer 0,2 mg	Enfant > 6 ans : 2 à 4 comprimés à sucer par jour, en espaçant les prises d'au moins 2 heures. Adulte : 6 à 8 comprimés à sucer par jour, en espaçant les prises d'au moins 1 heure. Il est préférable de sucer le comprimé lentement à distance des repas sans le croquer ni l'avaler.	-
Amide	Lidocaïne	Xylocaïne® + G	Solution injectable 0,5 %, 1 % et 2 %, flacon de 20 mL ou ampoule de 5 mL	Enfant : maximum 2 à 7 mg/kg Adulte : maximum 400 mg	1,6
			1 et 2 % avec adrénaline 1/200 000, flacon de 20 mL	Nourrisson et jeune enfant : maximum 10 mg/kg Adulte : maximum 500 mg	
		Xylocaïne® nébuliseur	Solution pour pulvérisation buccale 5 %	Enfant > 6 ans : 2 à 4 mg par kg de poids, sans dépasser 200 mg Adulte : 10 à 25 pulvérisations	
		Xylocaïne® à la naphthazoline	Solution pour application muqueuse 1,2 g/24 mL	Enfant > 6 ans ; 2 à 4 mg/kg sans dépasser 200 mg Adulte : maximum 200 mg	
		Xylocaïne® visqueuse	Gel oral 2 % (tube de 100 g)	Adulte : 10 à 15 mL, au maximum 3 fois/jour	
	Xylocaïne® gel urétral	Gel urétral 2 % (seringue préremplie de 10 g)	Enfant : 2 à 4 mg/kg Adulte : maximum 200 mg		
Lidocaïne + prilocaïne	Emla® + G	Crème 125 mg + 125 mg/5 g	Enfant de 0 à 12 mois : 0,5 g Enfant de 1 à 12 ans : 1 à 2 g Enfant > 12 ans et adulte : 2 à 3 g	1,6	
		Emlapatch® + G	Pansement adhésif cutané 25 mg + 25 mg (1 g d'émulsion/10 cm²)		Appliquer le nombre de pansements nécessaires selon la surface à traiter. Enfant de 0 à 3 mois : 1 patch à la fois au maximum Enfant de 3 à 12 mois : 2 patches à la fois au maximum
Articaïne	Bucanest®, Septanest®	Sol. inj. 4 %	Enfant > 4 ans : selon la zone à anesthésier, maximum 5 mg/kg Adulte : selon la zone à anesthésier, maximum 7 mg/kg	2	
	Alphacaine N®, Deltazine®	Sol. inj. 40 mg/mL avec adrénaline			
Quinisocaïne	Quotane®	Crème 0,5 %	Une application 2 ou 3 fois par jour	-	
Mépi vacaïne	Carbocaïne® + GRSH	Solution injectable 1 % ou 2 % avec ou sans adrénaline	Enfant > 1 mois : maximum 5 mg/kg Adulte : maximum 400 mg	2	
Ropivacaïne	Naropéine® RSH	Solution injectable 0,2 %, 0,75 % et 1 %	Enfant de 0 à 12 ans : 1 à 2 mg/kg Enfant > 12 ans et adulte : 2 à 300 mg	1,8	
Bupivacaïne	Bupivacaïne Aguetant® + GRSH	Solution injectable 2,5 ou 5 mg/mL avec ou sans adrénaline	Enfant : 2,5 mg par année d'âge Adulte : 6 à 8 mg	1,9	
Lévobupivacaïne	Chirocaïne® RSH	Solution injectable ou solution à diluer pour perfusion 0,625, 1,25, 2,5 ou 5 mg/mL	Enfant < 12 ans : 0,625-2,5 mg/kg Adulte : 2,5 à 150 mg	1,9	
Oxybuprocaine	Cébésine® + G	Collyre 0,4 % en flacon ou unidoses de 0,4 mL	1 à 2 gouttes de collyre, une à deux minutes avant l'examen ou l'intervention	-	
Éther	Pramocaïne	Tronothane®	Gel pour application locale 1 %	1 application matin et soir ou avant l'examen	-

G : génériques ; RSH : réservé au secteur hospitalier.

Tableau-1 : Principaux anesthésiques locaux.