

Anesth Weekly

Nr 361 - 29 octobre 2014

10 aspects des anesthésiques locaux



les propriétés physico-chimiques

Substance	рКа	LAb (%)	O/B coeff	PB (%)	MW (Da)	EAC
Lidocaine	7.9	25	2.4	64	234	1
Mepivacaine	7.6	39	21	77	246	1
Bupivacaine	8.1	15	346	95	288	0.25
Ropivacaine	8.1	15	115	94	274	0.5
Prilocaine	7.9	24	25	55	220	1
Procaine	8.9	3	1.7	6	236	2
Articaine	7.8	28	17	70	321	1

Physicochemical properties pKa value, ionised fraction of LA (LAb) at pH 7.4 (in %), oil/buffer coefficient (O/B) with h-octanol/buffer at pH 7.4 and $25\,^{\circ}$ C, protein binding (PB, in %), molecular weight (MW, in Dalton) and relative effective anaesthetic concentrations at rat sciatic nerve (EAC). Adapted with permission from 7

Ces paramètres sont à connaître car ils expliquent le comportement des A·L· en présence d'acidose par exemple comme au niveau du placentaire·

cible primaire - les V.G.S.C.

Même si les A·L· sont hétérogènes, ils ont tous le même mode d'action: ils bloquent les canaux sodiques voltage-dépendant sur les axones· Ce blocage du canal entraîne un changement de forme et la création d'une charge positive au niveau du pore, ce qui a pour effet d'arrêter les influx nerveux à condition de s'étendre sur au moins deux noeuds de Ranvier·

LES ANESTHÉSIQUES LOCAUX (AL) FONT PARTIE DES PRODUITS ANESTHÉSIQUES QUE NOUS UTILISONS LE PLUS. L'EUROPEAN JOURNAL OF ANAESTHESIOLOGY SORT UN ARTICLE DE REVUE QUE JE VOUS RECOMMANDE

'LOCAL ANESTHETICS: 10 ESSENTIALS''
DONT LA LECTURE VOUS APPRENDRA
QUELQUE CHOSE, À COUP SÛR!

cible secondaire des A.L..

Outre leur action sur les canaux sodiques, les A·L· interagissent avec beaucoup d'autres structures: les récepteurs N·M·D·A·, les récepteurs couplés à la protéine G, les canaux potassiques, ··· Les A·L· par voie systémique ont une action co-anesthésique et exercent un effet anti-inflammatoire prononcé·

A.L. et tissus enflammés

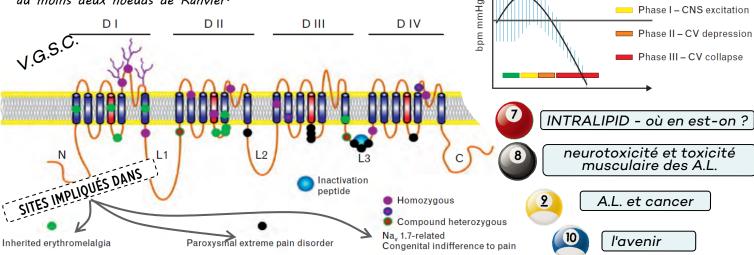
Les auteurs expliquent en détail pourquoi l'anesthésie locale en est difficile, mais pas impossible· IL faut utiliser des concentrations plus hautes et ajouter des vasoconstricteurs·

6

toxicité systémique - LAST

LAST = Local Anesthetic Systemic Toxicity

Administration of block



Modes de blocage des V.G.S.C.

Les different A·L· peuvent atteindre leur site de blocage, soit à partir du compartiment cytoplasmique, soit via la membrane lipidique, soit en entrant directement pat les canaux à larges pores·

Vous ne perdrez pas votre temps en lisant ce papier (11 pages) plein d'informations pertinentes·

PH. LIRK, S. PICARDI, M.W. HOLLMAN.
LOCAL ANAESTHETICS: 10 ESSENTIALS.

EUR J ANAESTHETICS: 10 ESSENTIALS.

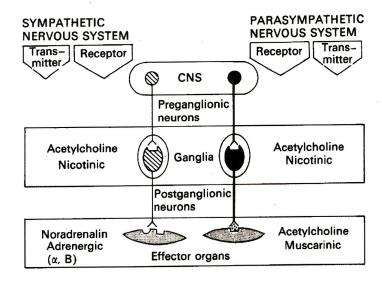
EUR J ANAESTHESIOL 2014; 31: 575 - 585.



Rappel:

système autonomique

Structures/ Organs	Sympathetic Stimulation	Adrenergic Receptors	Parasympathetic Stimulation
Eye			
Ciliary muscle	Relaxed for far vision	β	Contraction (accommodation for near vision)
Pupillary		,	ioi ileai vision)
muscles			· ·
Dilator	Dilated (mydriasis)	α	• • •
Sphincter	···		Contraction (miosis)
Lacrimal gland	•••		Secretion
Salivary glands Parotid,	Sparse, thick	α	Profuse serous
sublingual,	secretion		secretion
submaxillary	Chimalatad		
Thyroid gland Tracheobronchial tree	Stimulated		•••
Bronchial	Relaxed	B	Contracted
muscles Bronchial	(?)		Secretion
glands	• • • •		
Heart Rate	Increased	B	Decreased
Nate Output	Increased	β	Decreased
Esophagus	- 1		Increased
Motility	Decreased Contracted	α and β	Relaxed
Sphincters Stomach	Contracted	~	
Motility	Decreased	α and β	Increased
Sphincters	Contracted	α	Relaxed Increased
Secretion Liver	Inhibited Glycogenolysis,	β	11101 04504
Diver	gluconeogenesis		
Gallbladder and biliary ducts	Relaxed	β .	Contracted
Pancreas Blood vessels	Constriction		Dilation
Insulin	Reduced	α	Increased
secretion Spleen	Contraction of	α	
-	capsule		
Intestines Motility	Decreased	α and β	Increased
Sphincters	Relaxed	β	Contracted
Secretion	Decreased	α	Increased
Adrenal gland	Secretion of 80% E/20% NE	α	
Kidneys Arterioles Ureter	Constriction	α	Dilation
Tone and motility	Decreased	α	Increased
Urinary Bladder Detrusor	Relaxed	B	Contracted
muscles	Contracted	α	Relaxed
Trigone and sphincter Genital Organs	Contracted	•	
Seminal vesicles		α	(?)
Vas deferens	Contraction	α	(?) (depends
Uterus	Contraction Relaxation	β	on species and hormonal status)
Blood vessels			/
Coronary	Constriction	α	• • •
arteries	Dilation?	<mark>β</mark> α*	
Arteries in skeletal	Constriction Dilation	β	
muscles Arteries in peni	s (?)		Dilation
or clitoris All other arteries	Constriction	α	Dilation
Veins	Constriction	α	• • •



BIEN CONNAÎTRE(*) LE SYSTÈME AUTONOMIQUE

Quasi toutes les drogues de notre arsenal thérapeutique ont une influence sur les systèmes ORTHO et PARA sympathiques.

Ne parlons pas du système cardiovasculaire qui est lié étroitement à la balance entre le côté 'sympathique' et 'vagal'. Betabloquants, alphalytiques, catécholamines, anticholinergiques, beta2-mimétiques, alpha2-agonistes, et la liste pourrait remplir plusieurs pages.

Il y a d'autres situations où nous pouvons aider notre collègue chirurgien. Ainsi, si vous combinez une rachianesthésie à une A.G. (par exemple dans une PRT 'prostatectomie radicale totale' par tomie sus-pubienne, vous constaterez que les intestins sont racrapotés et prennent beaucoup moins de place dans la cavité abdominale, ce qui aide à travailler au fond du petit bassin.

Autres situations:

- ✓ l'hypertrophie prostatique qui a horreur des anticholinergiques et des alpha-agonistes
- le glaucome aigu
- le mélange atropine (glycopyrronium)
 + néostigmine permis du fait de récepteurs 'cibles' différents
- l'implication des récepteurs muscariniques dans les complications respiratoires chez les enfants après une infection des voies respiartoires supérieures

Le tableau ci-contre est emprunté au textbook (à lire) de John BONICA intitulé 'Pain Management'. 2nd ed. 1990 - p. 157

(*) même si ce n'est pas toujours facile

^{*}By circulating epinephrine only.



a saturation en oxygène normale pour un adulte jeune en bonne santé varie entre 96 et 98 %. Elle diminue légèrement avec l'âge (± -0.2 à .07 %)

En 2008, les urgentistes et les pneumologues de Baltimore ont étudié la variation de la SPO2, chez des patients asymptomatiques en fonction de certaines caractéristiques individuelles.

Ils ont étudié 871 patients sans symptômes. Cinquante avaient une SPO2 < 97% soit 5,7 % et seuls 13 (1,5 %) avaient moins de 96 %.

Vous trouverez ci-contre la diminution moyenne de la SPO2 en fonction du genre, poids, race, histoire d'asthme. Etonnamment, quasi pas de diminution pour les patients

fumeurs sans symptômes.

-0.6 -1.0 -0.8 -0.4 -0.2

CHUTE DE LA SPO2 MOYENNE (%)

M. WITTING, S. SCHARF - DIAGNOSTIC ROOM-AIR PULSE OXYMETRY: EFFECTS OF SMOKING, RACE AND SEX. AM J OF EMERGENCY MEDICINE (2008) 26: 131-136

HOMMES

OBÉSITÉ

FUMEUR

ÂGE >60 ANS

RACE BLANCHE

HISTOIRE ASTHME

