

# Les anesthésiques locaux



Mélanie Davister  
4<sup>ème</sup> infirmière pédiatrique

Pathologies chirurgicales  
Prof. P. Erpicum

## Définition

☼ Les anesthésiques locaux sont des médicaments qui, en inhibant la conduction nerveuse là où ils sont administrés, rendent insensible à la douleur le territoire correspondant à cette innervation.

En réduisant la perméabilité membranaire aux ions  $\text{Na}^+$ , les anesthésiques locaux inhibent la dépolarisation et la conduction nerveuse. Ils ne bloquent pas l'orifice externe du canal mais l'orifice intracellulaire et doivent donc pénétrer à l'intérieur de la cellule pour agir.

La nécessité de la pénétration intracellulaire des anesthésiques locaux pour qu'ils soient actifs explique que des substances polaires à groupe ammonium quaternaire, appliquées à l'extérieur des cellules, sont inactives car elles ne traversent pas les membranes, alors que, introduites à l'intérieur de la cellule, elles ont des propriétés anesthésiques locales.

☼ Les anesthésiques locaux sont composés d'un noyau aromatique hydrophobe, d'une chaîne intermédiaire et d'un résidu aminé hydrophile.

En fonction du lien entre le noyau et la chaîne on distingue :

- 1) Les amino-esters qui sont métabolisés dans le plasma par les cholinestérases,
- 2) Les amino-amides qui sont métabolisés par le foie.

## Propriétés

Les anesthésiques locaux inhibent la conduction nerveuse d'une manière réversible sans altération du nerf. L'inhibition apparaît rapidement et à une durée plus ou moins longue selon les produits et les concentrations utilisées.

L'étendue du territoire rendu insensible à la douleur dépend des modalités d'administration de l'anesthésique local, soit au niveau des terminaisons nerveuses, soit au niveau d'un tronc nerveux par exemple.

A concentration suffisante, les anesthésiques locaux inhibent toutes les fibres nerveuses, sensibles, motrices, végétatives. Ils atteignent d'abord les fibres sensibles car celles-ci ont un plus petit diamètre que les fibres motrices. Mais aussi par le fait qu'elles ne sont pas myélinisées, elles sont plus faciles à atteindre par l'anesthésique.

Voici l'ordre dans lequel les sensations disparaissent ;

- ☼ Sensation douloureuse.
- ☼ Thermique (froid, chaud).
- ☼ Tactile.

La récupération se fait dans l'ordre inverse.

## Autres propriétés

☀ Les anesthésiques locaux, sauf la cocaïne qui n'est plus utilisée en thérapeutique, ont un effet vasodilatateur de mécanisme mal précisé.

L'apport simultané d'un vasoconstricteur, le plus souvent l'adrénaline ou épinéphrine, est très important car il évite la diffusion de l'anesthésique local qui reste ainsi à une concentration élevée au niveau du lieu d'injection pour anesthésie d'infiltration ou de conduction. Mais il ne faut jamais utiliser de vasoconstricteur pour l'anesthésie locale des extrémités : doigts, orteils, oreilles, verge, car il y a risque de nécrose par ischémie.

☀ La diffusion systémique d'un anesthésique local peut entraîner :

- Des effets vasculaires : vasodilatation.
- Des effets cardiaques : diminution de la conduction et de la force de contraction, se traduisant par une hypotension, voire un choc.
- Des effets neurologiques : tremblements pouvant précéder des convulsions que l'on explique par l'inhibition préférentielle d'aires cérébrales inhibitrices, ce qui entraîne une stimulation et enfin un arrêt respiratoire.

## Précautions

L'emploi des anesthésiques locaux nécessite les précautions suivantes

- Respect des contre-indications.
- Matériel de réanimation cardio-respiratoire prêt.
- Tests d'aspiration répétés.
- Injection lente.
- Maintient d'un contact verbal avec le patient.
- Arrêt de l'injection en cas de reflux de sang, en cas de douleur, en cas de résistance.

## Métabolisme

En principe, on ne souhaite pas que les anesthésiques administrés localement diffusent dans l'organisme. En réalité, une diffusion de l'anesthésique local existe toujours, même lorsqu'un vasoconstricteur lui est associé, mais elle doit être suffisamment lente pour ne pas avoir d'effets indésirables généraux.

Les anesthésiques locaux, comme les autres médicaments, sont métabolisés, c'est-à-dire subissent des biotransformations.

Les principales réactions sont l'hydrolyse par des estérases comme les cholinestérases plasmatiques ou tissulaires pour les anesthésiques locaux de type ester tels que la procaine et la tétracaïne.

Au niveau hépatique notamment, pour les anesthésiques locaux autres de type amide, c'est-à-dire la plupart d'entre eux.

## Indications et présentations

Les indications des anesthésiques locaux sont très nombreuses : explorations endoscopiques, interventions chirurgicales, petite chirurgie, extractions dentaires.

Les présentations pharmaceutiques sont adaptées à ces divers usages.

☼ Anesthésie locale ou régionale : formes injectables.

On distingue plusieurs sortes d'anesthésie locale :

- D'infiltration (l'anesthésique est injecté dans la zone à anesthésier)
- De conduction (l'anesthésique est administré au niveau d'un nerf et le territoire innervé est anesthésié)
- Spinale où l'on injecte l'anesthésique local soit dans le liquide céphalo-rachidien et elle est appelée intrarachidienne, soit dans l'espace épidural et elle est appelée épidurale ou périurale

Les formes contenant de l'adrénaline ne doivent pas être administrées par voie intraveineuse ni utilisées pour l'anesthésie des extrémités, doigts, verge, en raison de l'effet vasoconstricteur de l'adrénaline.

Exemple : Xylocaïne®, Procaïne®, Duranest®, Carbocaïne®, ...

☼ Anesthésie de surface : préparations pour applications cutanées

Exemple : Emla crème®, Emla patch®, Quotane®, ...

☼ Anesthésie de surface : préparations pour applications au niveau des muqueuses

Exemple : Xylocaïne® gel, Xylocaïne® nébuliseur, ...

☼ Rachianesthésie.

Exemple : Chirocaïne®.

## Effets indésirables

Les accidents d'origine allergique sont exceptionnels.

Les accidents dus à un surdosage sont beaucoup plus fréquents. Ils sont consécutifs à l'administration d'une dose trop élevée et d'un passage trop rapide dans la circulation sanguine. Ils se traduisent par des troubles cardiovasculaires et neurologiques précédés de signes subjectifs : paresthésie, céphalées, malaise général, sensations nauséuses, troubles visuels, pâleur.

Les troubles cardiovasculaires sont en général une chute de pression artérielle pouvant aller jusqu'au collapsus, des troubles du rythme cardiaque, voire même un arrêt cardiaque

Les troubles neurologiques sont des convulsions localisées puis généralisées avec, très exceptionnellement, un arrêt respiratoire. Ces convulsions sont habituellement traitées par l'administration d'une benzodiazépine injectable comme le diazépam.

## Prévention des accidents toxiques

- ☀ Injecter la solution tiédie lentement et pratiquer une aspiration pour vérifier que la solution n'est pas en intra-vasculaire.
- ☀ S'abstenir d'infiltrer les tissus inflammatoires ou infectés.
- ☀ Surveiller le patient pendant l'injection et dans les minutes qui la suivent afin de détecter précocement tout signe d'alerte. Devant tout signes, arrêter l'injection et surveiller les trois grandes fonctions : neurologiques, respiratoire et cardiovasculaire.
- ☀ Le stress est également un facteur de risque qui peut être diminué par le dialogue et des locaux agréables.

## Conduite à tenir devant un accident toxique

### Si accident mineur :

Arrêter les soins, allonger le patient en décubitus dorsal, position déclive. Vérifier la liberté des voies aériennes supérieures, rassurer le patient. Surveiller l'état de conscience, les fonctions respiratoires et circulatoires

### Si accidents majeur :

Appel à la fonction ARCA.

## Les différents anesthésiques locaux.

### Les amino-esteres

#### Procaïne

##### **Indications**

Anesthésie locale d'infiltration et anesthésie de conduction (blocs plexiques et tronculaires).

Avantages : pas de pharmacodépendances

Inconvénients : très vasodilatateur, très allergisant, durée d'action courte.

##### **Contre indications**

- Hypersensibilité aux anesthésiques locaux à fonction ester.
  - Allergie (asthme, rhume des foins, urticaire...),
  - Epilepsie non équilibrée sous traitement,
  - BAV de degré 2 ou 3 non appareillés,
  - Déficit en cholinestérase, traitement par anticholinestérasiques,
  - Enfant de moins de 30 mois,
  - Injection intra-vasculaire.
- Chez l'enfant, l'utilisation de la procaïne n'est pas recommandée.

### **- Effets indésirables**

- Lipothymies. (Malaise sans perte de connaissance)
- Manifestations allergiques allant de l'apparition de simples signes allergiques cutanés (rougeur cutanée, prurit.), à des manifestations cutanées sévères (rash, urticaire, oedème.), au choc anaphylactique.
- Manifestations toxiques liées à un surdosage.
- Effets sur le système nerveux central : nervosité, agitation, bâillements, tremblements, appréhension, nystagmus, logorrhée, céphalées, nausées, vomissements, bourdonnements d'oreilles, vertiges.

Ces signes d'appel nécessitent une surveillance attentive pour prévenir une éventuelle aggravation avec : convulsions, dépression du SNC ;

- Effets sur le système respiratoire : tachypnée puis apnée ;
- Effets sur le système cardiovasculaire : tachycardie, bradycardie, dépression cardiovasculaire avec hypotension artérielle pouvant aboutir à un collapsus, troubles du rythme (extrasystoles ventriculaires, fibrillation ventriculaire), troubles de la conduction (bloc auriculoventriculaire).

Ces manifestations cardiaques peuvent aboutir à un arrêt cardiaque.

Exemples : Procaine® 1 et 2%, forme injectable.

### **Tétracaïne**

Découverte en 1930, la tétracaïne est un anesthésique local très puissant et très toxique par voie générale.

Action plus prolongée que la procaine. (2 à 3 heures)

#### **Indications**

- Anesthésie locale.
- Examens par verre de contact.
- Extraction des corps étrangers superficiels de la cornée et de la conjonctive.
- Tout geste nécessitant une anesthésie locale de la cornée et de la conjonctive.

#### **Contre indications**

Hypersensibilité aux anesthésiques locaux.

#### **Effets indésirables**

Une irritation transitoire peut survenir à l'instillation.

## Aptocaïne

Utilisée uniquement si porphyrie<sup>1</sup> hépatique où les amino-amides sont contre-indiqués.

### Les amino-amides

#### Lidocaïne

Anesthésique local de type amino-amide et anti-arythmique de classe I (raccourcissement de la durée du potentiel d'action).

Stabilisation des membranes nerveuses par blocage des flux sodiques entrants.

Avantages : très peu vasodilatatrice, peu allergisante.

Inconvénients : effets toxiques par surdosage.

#### Indications

☼ Pour assurer un abord percutané indolore en cas de réalisation d'une technique invasive (ponction médullaire, biopsie rénale, hépatique, pose de cathéter veineux central, technique d'anesthésie loco-régionale, etc.) chez un enfant éveillé ou sous sédation légère ; la lidocaïne à 0,5, 1 ou 2 % est alors utilisée ;

☼ Pour réaliser le parage et la suture de petites plaies en salle d'urgence ;

☼ Pour anesthésier les muqueuses :

En chirurgie dentaire (application de lidocaïne visqueuse 3 min avant infiltration locale),  
Pour les soins de la muqueuse de la cavité buccale (en cas de stomatites, mucites, aphtes) : la lidocaïne visqueuse est appliquée avec un doigt ou un coton-tige sur les lésions douloureuses avant les repas ou les soins de bouche, toutes les 4 heures (l'analgésie débute après 5 min et dure de 20 à 30 min).

#### Contre-indications absolues

- Allergie
- Porphyrie
- Troubles de conduction intra-cardiaque
- Epilepsie non contrôlée par un traitement
- Antécédent d'hyperthermie maligne

L'insuffisance cardiaque et l'hypovolémie augmentent les pics de concentration plasmatique.

---

<sup>1</sup> Porphyries : ensemble d'affections, le plus souvent congénitales, dues à un déficit de différents enzymes intervenants dans la biosynthèse de l'hème (constituant de l'hémoglobine, formé d'un dérivé de la porphyrine et de fer, sur lequel se fixe l'oxygène).

Il s'en suit une accumulation des intermédiaires entre la porphyrine et l'hème qui sont excrétées dans l'urine, la bile et les selles.

La porphyrie est dénommée hépatique quand la production des intermédiaires siège dans la foie. Quand il s'agit de la moelle osseuse, on parle de porphyrie hématopoïétique.

Certaines présentations (Xylocaïne® adrénalinée) contiennent des sulfites susceptibles de provoquer une réaction anaphylactique.

La xylocaïne® 5% nébuliseur est contre-indiquée chez le nourrisson et le petit enfant (risque de spasme laryngé, risque de résorption très rapide)

### **Contre-indications aux formes contenant de l'adrénaline**

- Insuffisance coronarienne
- Troubles du rythme ventriculaire
- Injection intra-veineuse
- Hypertension artérielle sévère
- Cardiomyopathie obstructive
- Hyperthyroïdie
- Injection au niveau des extrémités
- Traitement par antidépresseurs tricycliques

### **Effets secondaires**

- Cardiovasculaires : hypotension, bradycardie, troubles du rythme, fibrillation ventriculaire
- Respiratoires : dépression respiratoire, apnée
- Neurologiques : bourdonnements d'oreille, dysphorie, surdité, convulsions
- Risque allergique faible

### **Surdosage**

La dose maximale recommandée chez l'enfant est de 7 mg/kg sans adrénaline, et de 10 mg/kg avec adrénaline.

Pour les muqueuses, la dose maximale de lidocaïne est de 3 mg/kg (2 mg/kg pour les enfants de moins de 3 ans). La dose maximale de lidocaïne topique lors des soins de la muqueuse buccale est de 2 mg/kg/h.

Convulsions généralisées, arrêt cardio-respiratoire.

### **Traitement des complications**

Varie en fonction de la symptomatologie

- Oxygénothérapie 100%
- Convulsions : benzodiazépine voire thiopental et intubation trachéale
- Alcalinisation
- Rétablissement d'une hémodynamique correcte.

Exemple : Xylocaine®.

## Prilocaine

40 fois moins toxique que la Lidocaïne

Avantages : durée d'action plus longue, métabolisme rapide.

Inconvénients : risque de méthémoglobinémie<sup>2</sup>.

### Indications

- Anesthésie par voie locale de la peau saine, avant ponctions veineuses ou sous-cutanées, avant chirurgie cutanée superficielle, instrumentale ou par rayon laser.
- Anesthésie des muqueuses génitales chez l'adulte, avant chirurgie superficielle : biopsie ou excision de lésions (instrumentale ou par rayon laser), avant infiltration à l'aiguille d'anesthésiques locaux.

### Contre indications

- Hypersensibilité connue aux anesthésiques locaux du groupe à liaison amide ou à tout autre composant de la crème.
- Méthémoglobinémie congénitale.
- Porphyrries.
- Ne pas appliquer chez les prématurés de moins de 37 semaines d'âge corrigé.
- Ne pas appliquer sur l'oeil ou à proximité des yeux, du fait du risque d'irritation marquée.
- Ne pas appliquer dans le conduit auditif externe si le tympan est lésé ou doit être perforé, du fait du risque de lésions de l'appareil auditif.
- Ne pas appliquer sur les muqueuses génitales de l'enfant compte tenu de données insuffisantes sur l'absorption et de l'absence de donnée clinique.

### Effets indésirables

- L'application cutanée ou muqueuse est susceptible d'induire un érythème ou une pâleur locale. Ces réactions cutanées sont bénignes, toujours réversibles et ne préjugent pas de la qualité de l'anesthésie obtenue.
- Très rarement, apparition d'un prurit ou d'une sensation locale de brûlure.
- Exceptionnelle allergie à la prilocaïne.
- Méthémoglobinémie, particulièrement chez l'enfant de moins de 3 mois, et en cas de surdosage.
- De rares cas de lésions locales discrètes au niveau du site d'application à type de purpura ou de pétéchies ont été rapportés, notamment après des temps d'application supérieurs à la durée recommandée chez les enfants porteurs de lésions cutanées ou d'un molluscum

Exemple : l'EMLA® qui contient également de la lidocaïne.

---

<sup>2</sup> La méthémoglobinémie est caractérisée par une capacité réduite du sang à transporter l'oxygène du fait de la diminution des niveaux d'hémoglobine normale. Il s'agit d'une maladie rare. Ce sont le plus souvent les nouveau-nés qui sont affectés; ils peuvent sembler en bonne santé, mais ils présentent des signes de bleuissement autour de la bouche, sur les mains et les pieds, ce qui explique donc le nom courant de « syndrome du bébé bleu ». Ces enfants peuvent avoir des troubles respiratoires ainsi que des vomissements et des diarrhées. Dans les cas extrêmes, on observe une léthargie marquée, une augmentation de la production de salive, une perte de conscience et des crises convulsives. Certains cas peuvent être mortels.

## Mépipacaine

Avantages : très légèrement vasoconstrictrice, bonne diffusion tissulaire.

### Indications

- blocs centraux et périphériques
- infiltrations locales

### Contre-indications absolues

- Allergie aux amin-amides
- Porphyrie
- Troubles de conduction intracardiaque
- Epilepsie non contrôlée par un traitement
- Antécédent d'hyperthermie maligne
- Injection intra-vasculaire
- Nourrisson de moins de 1 mois

### Posologie et mode d'administration

On utilise des solutions à 1% (10 mg/ml) ou 2% (20 mg/ml).

Dose maximale : 4 mg/kg, 400 mg

Durée d'action : 70 à 170 minutes

### Effets secondaires

- Cardiovasculaires : hypotension, bradycardie, troubles du rythme, fibrillation ventriculaire
- Respiratoires : dépression respiratoire, apnée
- Neurologiques : bourdonnements d'oreille, dysphorie, surdité, convulsions
- Risque allergique faible

### Surdosage

Convulsions généralisées, arrêt cardio-respiratoire

Exemple : Carbocaïne®, solution injectable.

## Ropivacaine

Anesthésique local de type amide, de longue durée d'action et de faible toxicité sur le SNC et l'appareil cardiovasculaire.

Molécule récente prudence car peu de recul.

Puissance voisine de la bupivacaine.

Posséderait une meilleure différenciation sensitivo-motrice.

Exerce une activité vasoconstrictrice.

### **Indications :**

Elle est indiquée dans les rachianesthésies, les anesthésies péridurales et certains blocs périphériques. Elle peut être utilisée pour des infiltrations par exemple dans des sites opératoires pour diminuer les douleurs post-opératoires.

La ropivacaine s'utilise aussi en anesthésie caudale chez les enfants entre 1 et 12 ans.

### **Effets indésirables :**

En cas de passage intra-vasculaire, sa toxicité cardiaque est réelle. Elle est également neurotoxique par cette voie. Les réactions allergiques sont exceptionnelles.

Exemple : Naropin®

## **Bupivacaine**

4 fois plus puissant que la Lidocaïne

Durée d'action : 2,5 à 5 heures.

### **Indications**

- Anesthésie locorégionale lors d'intervention chirurgicale : anesthésie tronculaire, caudale, péridurale.

- Dans le traitement de la douleur au cours d'algies diverses : néoplasiques, post-opératoires, post-traumatiques.

Dans la préparation à certains gestes thérapeutiques douloureux (kinésithérapie post-opératoire, post-traumatique).

### **Contre-indications absolues**

- Allergie aux amino-amides.
- Porphyrie.
- Hyperthermie maligne.
- Hypovolémie non corrigée.
- Insuffisance cardiaque congestive.
- Bloc de conduction intra-cardiaque.
- Anesthésie loco-régionale intraveineuse.

### **Effets secondaires**

- Cardiovasculaires : hypotension, bradycardie, troubles du rythme, fibrillation ventriculaire, arrêt cardiaque
- Respiratoires : dépression respiratoire, apnée
- Neurologiques : bourdonnements d'oreille, dysphorie, surdité, convulsions
- Risque allergique faible.

## **Surdosage**

Convulsions généralisées, arrêt cardio-respiratoire, troubles du rythme.

Exemple : Marcaïne®

## **Bibliographie**

### Internet

<http://www.pediadol.org>  
[www.informationhospitaliere.com](http://www.informationhospitaliere.com)  
<http://www.vulgaris-medical.com>  
<http://www.santeguerir.fr>  
<http://fr.wikipedia.org>  
<http://www.anesthesiste.org>  
<http://frankpaillard.perso.infonie.fr>  
<http://www.pharmacorama.com>  
<http://www.pediadol.org>

### Livres

Compendium 2005

Fattorusso/Ritter, Vademecum clinique : du diagnostic au traitement, Paris, Editions Masson