

LABÉTALOL (Trandate^{md})

Classification : Antihypertenseur

Mécanisme d'action :

- **β-bloquant** non cardio-sélectif: prévient la tachycardie réflexe, ↓ FC, débit cardiaque inchangé.
- **α₁-bloquant** au niveau des muscles lisses vasculaires : vasodilatation périphérique, ↓ RVP, ↓ TA.

Profil d'action (I.V.): Début d'action : 2-5 minutes
Pic d'action : 5-15 minutes
Durée d'action : 2-4 heures (dose unique), jusqu'à 5,5 heures (doses multiples)

Indication :

- Traitement des urgences hypertensives.
- Hypertension dans un contexte clinique particulier (exemple : dissection aortique)

Posologie :

2 méthodes :

A. Injections I.V. répétées :

Bolus I.V. initial de 20 mg administré en 2 minutes. Des injections supplémentaires de 20 à 80 mg peuvent être administrées à **intervalles de 10 minutes** jusqu'à ce qu'on obtienne la TA désirée ou jusqu'à une dose totale de 300 mg.

B. Perfusion I.V. :

Débuter à 2 mg/min. pour 10-20 minutes et ajuster le débit selon la réponse (TA et FC).

Dose habituelle : 0,5-2 mg/min. pouvant aller jusqu'à une dose cumulative de 300 mg (équivalent à 2 mg/min. pendant 2,5 heures).

La dose I.V. efficace se situe généralement entre 50 et 200 mg.

Une dose totale supérieure à 300 mg (perfusion TEMPORAIRE pouvant aller jusqu'à 6 mg/min. pendant quelques heures) peut être requise chez certains patients (par exemple, dans le contexte aigu d'AVC ischémique ou de dissection aortique).

Mise en garde : En raison de l'effet prolongé du labétalol lors d'une perfusion I.V. > 2 mg/min pendant quelques heures, un monitoring étroit de la TA et de la FC (au moins aux 30 min.) est requis afin d'éviter l'apparition d'hypotension ou de bradycardie excessive.

Présentation :

Flacon multidose de 100 mg/20 mL (5 mg/mL)

Préparation suggérée pour perfusion I.V. :

Retirer 10 mL d'un sac de 100 mL de D5% ou NaCl 0,9%
Injecter 300 mg (60 mL) de labétalol dans le soluté
Vol. total = 150 mL Conc. finale = 2 mg/mL

Dose (mg/minute)	Débit (mL/heure)
0,5 mg/minute	15 mL/h
1	30
1,5	45
2	60

Conversion I.V. → per os :

Puisque les effets **β-bloquant** et **α₁-bloquant** diffèrent selon que le labétalol est administré par **voie I.V.** ou **per os** (rapports d'environ **7:1** et **3:1** respectivement), la réponse clinique suite à la conversion I.V. → per os est imprévisible. Il est recommandé de donner 200 mg per os à la fin de la perfusion I.V. suivi d'une dose de 200-400 mg 6-12 heures plus tard. Les doses subséquentes varieront entre 400 et 2400 mg/24 heures selon la TA et la FC.

Stabilité et compatibilité :

Les compatibilités présentées sont une interprétation des données publiées en fonction des concentrations des médicaments étudiées et peuvent ne pas correspondre aux concentrations utilisées dans un établissement. Vérifier avec le pharmacien au besoin. La liste n'est pas exhaustive.

- Stable pendant 24 heures après dilution (à la température ambiante) dans D5%, NaCl 0,9%, Mixtes ou Lactate Ringier.
- Compatible en dérivation avec : amikacine, aminophylline, amiodarone, anidulafongine, argatroban, atropine, azithromycine, calcium (chlorure et gluconate), caspofongine, ceftazidime, ceftolozane-tazobactam, ciprofloxacine, cisatracurium, cyclosporine, daptomycine, dexmédétomidine, digoxine, diltiazem, diphenhydramine, dobutamine, dopamine, énalapril, éphédrine, épinéphrine, eptifibatide, ertapénem, érythromycine, esmolol, famotidine, fentanyl, fluconazole, ganciclovir, gentamicine, glycopyrrolate, granisétron, hydromorphone, hydroxyzine, imipénem-cilastatine, isoprotérénol, lévofloxacine, lidocaïne, linézolide, lorazépam, magnésium (sulfate de), mannitol, mépéridine, méropénem, méthylprednisolone, métoprolol, métronidazole, midazolam, milrinone, morphine, moxifloxacine, multivitamines intraveineuses, mycophénolate mofétil, naloxone, nitroglycérine, nitroprussiate de sodium, norépinéphrine, octréotide, ondansétron, pamidronate, pentamidine, phénobarbital, phentolamine, phényléphrine, phosphate (potassium), phytonadione, potassium chlorure, procainamide, propofol, propranolol, protamine, ranitidine, rocuronium, sodium (bicarbonate de), succinylcholine, sufentanil, tacrolimus, thiamine, ticarcilline-clavulanate, tigécycline, tobramycine, vancomycine, vasopressine, vérapamil, voriconazole et zolédronique acide.
- Incompatible avec : acyclovir, amphotéricine B liposomale, céfépime, céfotaxime, céfoxitine, ceftobiprole, ceftriaxone, céfuroxime, cloxacilline, dantrolène, dexaméthasone, diazépam, hydrocortisone, insuline régulière, kétorolac, micafongine, pantoprazole, pénicilline G (sodium), phénytoïne et pipéracilline-tazobactam.

Surveillance :

- Bolus :
 - Surveillance constante de l'**ECG** via télémétrie.
 - Mesures de la **TA** et de la **FC** aux 5 min.x 2 puis aux 15 min.x 1 heure puis aux 30 min. x 2 heures après chaque bolus.
- Perfusion continue :
 - Surveillance constante de l'**ECG** via moniteur.
 - Mesure de la **TA** et de la **FC** constante pour la 1^{re} heure suivant le début de la perfusion puis aux 30 minutes par la suite jusqu'à 2 heures après l'arrêt de la perfusion.

Précautions :

- Garder le patient **en position couchée** durant la perfusion et dans les 3 heures qui suivent si possible (risque d'hypotension orthostatique).
- L'effet hypotensif maximal survient 5 à 15 minutes après une dose bolus.
- Bradycardie à surveiller.

Contre-indications :

- Asthme et maladie pulmonaire obstructive
- Bradycardie sinusale
- Blocs AV de 2^e et 3^e degré
- Insuffisance ventriculaire droite secondaire à une hypertension pulmonaire
- Insuffisance cardiaque congestive non maîtrisée
- Choc cardiogénique