

BÊTABLOQUANTS OU BLOQUANTS DES RÉCEPTEURS β -ADRÉNERGIQUES

Considérations générales

Mécanisme d'action

- Blocage des récepteurs β -adrénergiques, cardio-sélectifs (β -1) ou non cardio-sélectifs (β -1 et β -2)
- Vasodilatation par
 - blocage des récepteurs alpha-1 (labétalol)
 - action médiée par oxyde nitrique (nébivolol)

Cardiosélectivité

- Cardiosélectifs : acébutolol, aténolol, bisoprolol, métoprolol, nébivolol
- Non cardiosélectifs : autres β -bloquants

Indications

- Hypertension grade 1
- Hypertension grades 2 et 3 en association avec d'autres agents antihypertenseurs

Contre-indications

- Blocs auriculo-ventriculaires (AV) du 2^e et du 3^e degré
- Bradycardie sinusale d'origine diverse
- Allergie médicamenteuse ou intolérance connue aux β -bloquants
- Maladie du sinus (sauf en cas de port d'un stimulateur cardiaque permanent)

À éviter

- Asthme

Effets indésirables les plus fréquemment rencontrés

- Bloc AV
- Bradycardie
- Bronchospasme
- Céphalées
- Défaillance cardiaque
- Dysfonction sexuelle (homme)
- Effets sur le système nerveux central (dépression, cauchemars, insomnie)
- Étourdissements
- Exacerbation du syndrome de Raynaud
- Fatigue
- Hyperglycémie
- Intolérance à l'effort
- Nausées

Interactions médicamenteuses les plus significatives

- Agents causant de la bradycardie additive (ex. : amiodarone, dipyridamole, disopyramide, inhibiteurs des cholinestérases)

- Antiarythmiques : prolongation de la conduction sinoauriculaire (SA) et AV
- Bloquants des canaux calciques non-DHP : prolongation de la conduction SA et AV
- Clonidine : hypertension rebond si arrêt brusque de la clonidine, bradycardie
- Digoxine : ↓ importante de la fréquence cardiaque

Avant le début du traitement et lors de l'ajustement de doses

- Fréquence cardiaque
- Rythme cardiaque

Élimination

- Principalement rénale : aténolol, nadolol
- Principalement hépatique : métoprolol, propranolol, timolol
- Rénale/ hépatique : acébutolol, bisoprolol, pindolol, nébivolol

Précautions

- Éviter l'interruption soudaine du médicament
- Maladie pulmonaire obstructive (MPOC) (privilégier un β -bloquant cardio-sélectif)
- Insuffisance cardiaque non maîtrisée
- Bloc AV du 1^{er} degré
- Diabète (peut masquer certains signes d'hypoglycémie)
- Hyperthyroïdie (peut masquer certains signes)
- Troubles graves de la circulation artérielle périphérique (ex. : phénomène de Raynaud)
- Fréquence cardiaque : avant le début du traitement et lors de l'ajustement de la dose

Ajustement des doses

- Ajustement aux intervalles de 3 à 4 semaines (jusqu'à maîtrise de la pression artérielle si la fréquence cardiaque demeure égale ou supérieure au seuil déterminé par le médecin)
- Si cible non atteinte suite à l'introduction de la dose de départ, il est suggéré d'ajouter un diurétique thiazidique ou un BCC-DHP et d'ajuster au besoin
- Ces médicaments ne sont pas recommandés chez les personnes de plus de 60 ans en monothérapie initiale sauf si indication formelle (ex. : angine)

Tableau d'ajustement proposé des doses des β -bloquants

BÊTABLOQUANTS	NOM COMMERCIAL	AJUSTEMENT DES DOSES
Acébutolol	Monitan, Sectral*	100 → 200 → 400 mg DIE
Aténolol	Ténormin*	25 → 50 → 100 mg DIE
Bisoprolol	Monacor*	2,5 → 5 → 10 mg DIE
Labétalol	Trandate*	100 → 200 → 400 mg BID
Métoprolol (libération immédiate)	Lopresor*	25 → 50 → 75 → 100 mg BID
Métoprolol (libération prolongée)	Lopresor SR*	100 → 200 mg DIE
Nadolol	*	20 → 40 → 80 → 120 → 160 mg DIE
Nébivolol	Bystolic	2,5 → 5 → 10 mg DIE
Pindolol	Visken*	5 → 7,5 → 10 mg BID
Propranolol (libération immédiate)	*	40 → 80 mg BID
Propranolol (libération prolongée)	Inderal LA*	60 → 80 → 120 → 160 → 180 mg DIE
Timolol	Apo-timol*	5 → 10 → 15 mg BID

Note : des doses de départ plus faibles peuvent être utilisées chez les personnes âgées ou chez celles avec une fonction rénale diminuée, ou prenant un diurétique. Lorsque 50 % de la dose maximale est atteinte, il faut penser associer un agent d'une autre classe thérapeutique.

* de nombreuses formulations génériques sont disponibles