

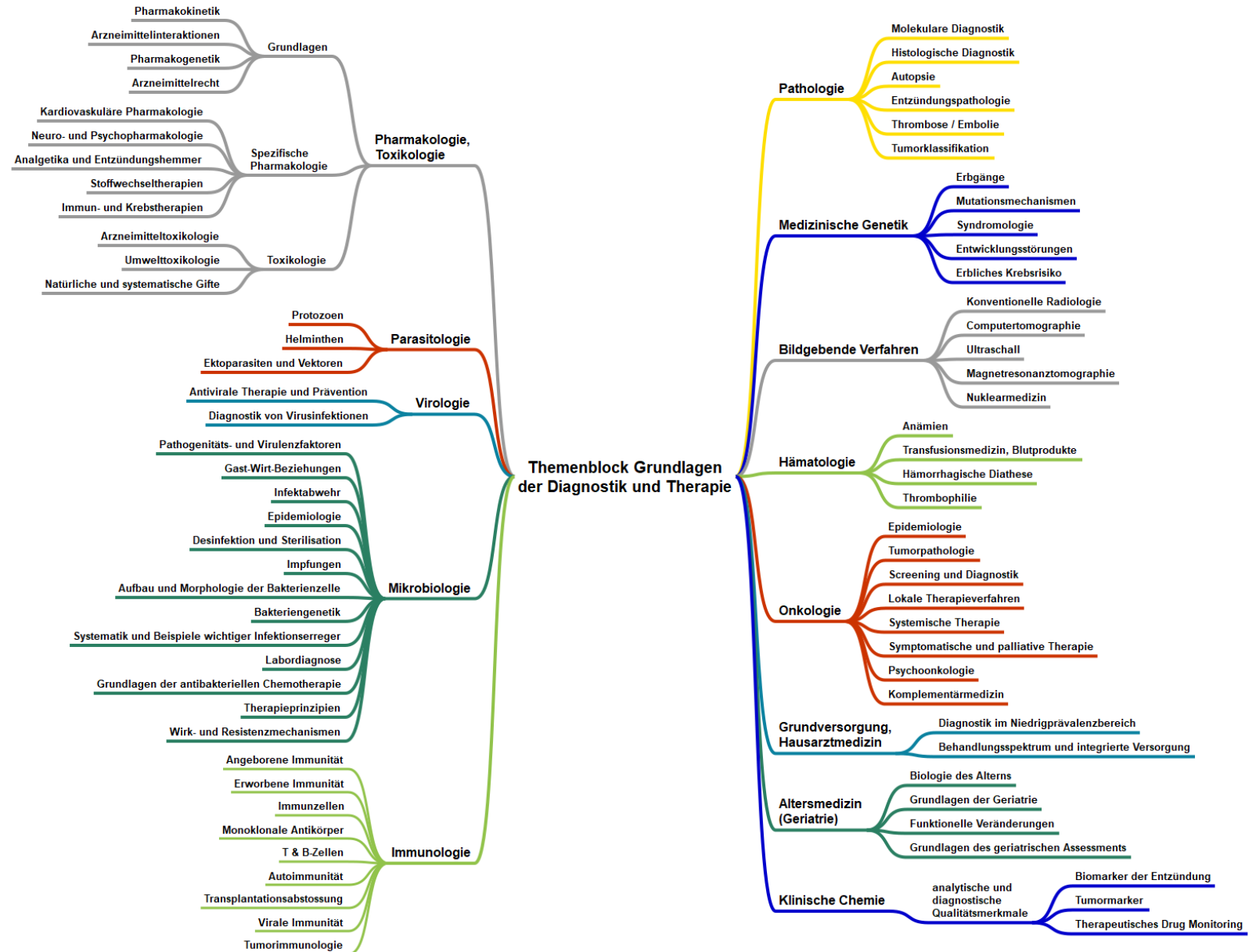
# Lokalanästhetika

24.10.2024

Hanns Ulrich Zeilhofer  
Institut für Pharmakologie und Toxikologie

[zeilhofer@pharma.uzh.ch](mailto:zeilhofer@pharma.uzh.ch)

# Mindmap

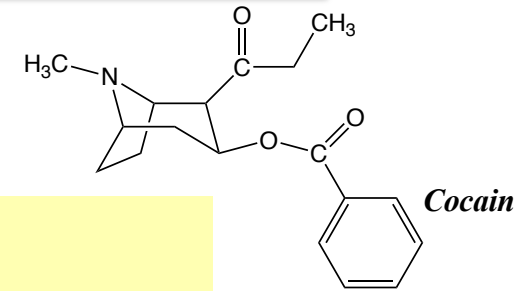


# Lernziele der Lektion

---

1. Sie können die Wirkungsweise, die therapeutische Verwendung und die unerwünschten Wirkungen von Lokalanästhetika wiedergeben.
2. Sie können den Sinn vasokonstriktorischer Zusätze und deren unerwünschten Wirkungen erklären.

# Cocain als Lokalanästhetikum



1855

**Gädecke:**

*Isolation des Alkaloids aus Erythroxylon coca*

1859

**Riemann:**

*Reindarstellung von Cocain*

1868

**Thomas Moréno y Maiz**, peruanischer Generalarzt:

*erste Anwendung in Tierversuchen*

1884

**Sigmund Freud**, Wien:

*Versuch der Behandlung der Opiatabhängigkeit mit Cocain*

1884

**Carl Koller**, Ophthalmologe in Wien:

*erste Anwendung von Cocain zur Lokalanästhesie*

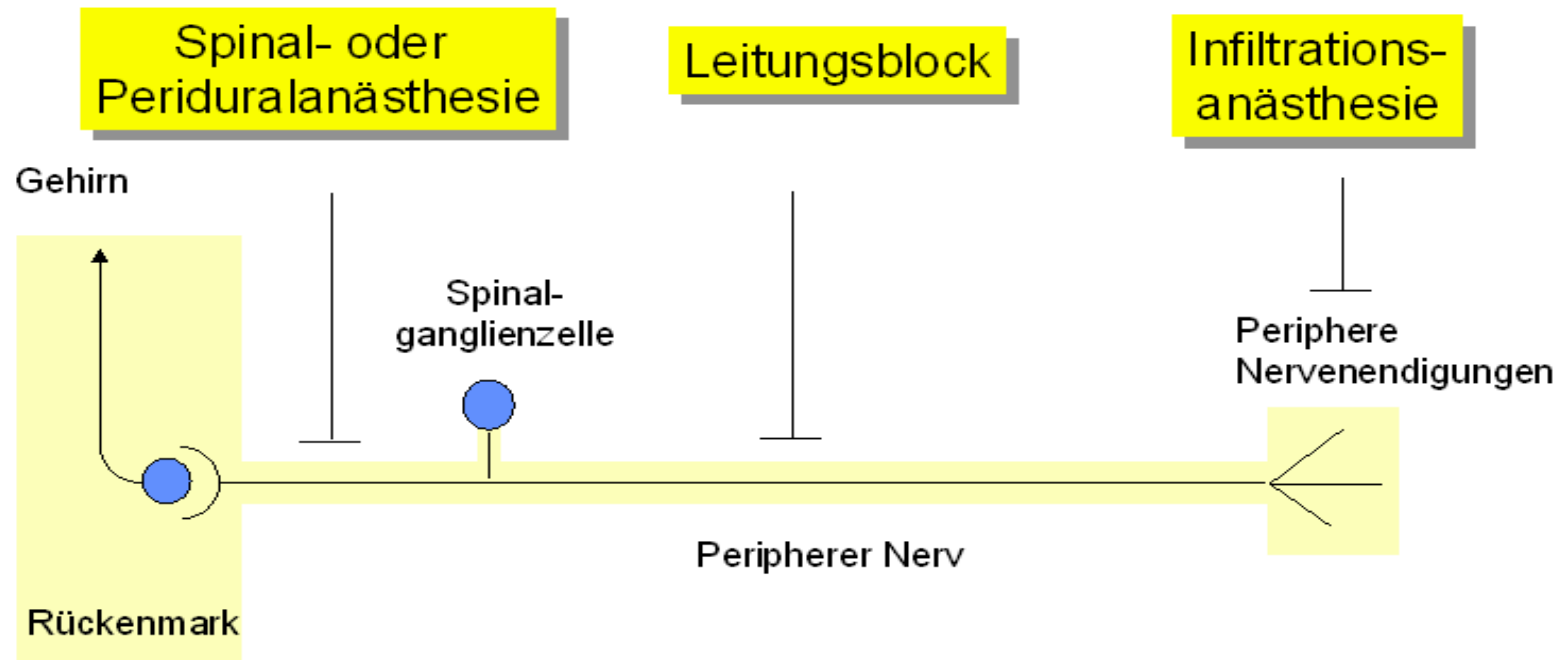
1885

**Halstead, Hartley und Hall**, Zahnärzte in New York:

*erste Injektion von Cocain, Abhängigkeit unter Ärzten*

# Formen der Lokalanästhesie

Oberflächen-  
anästhesie

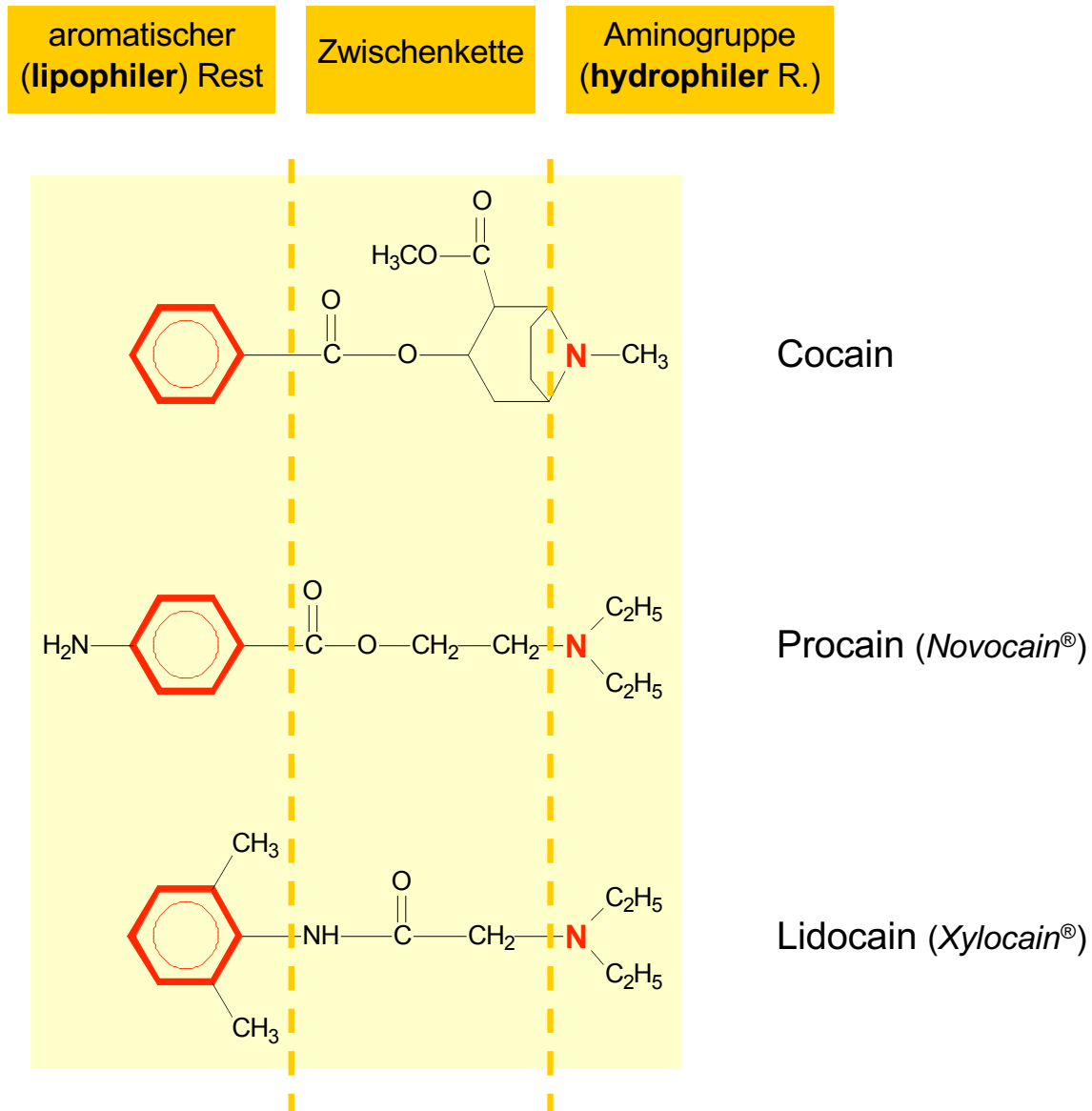


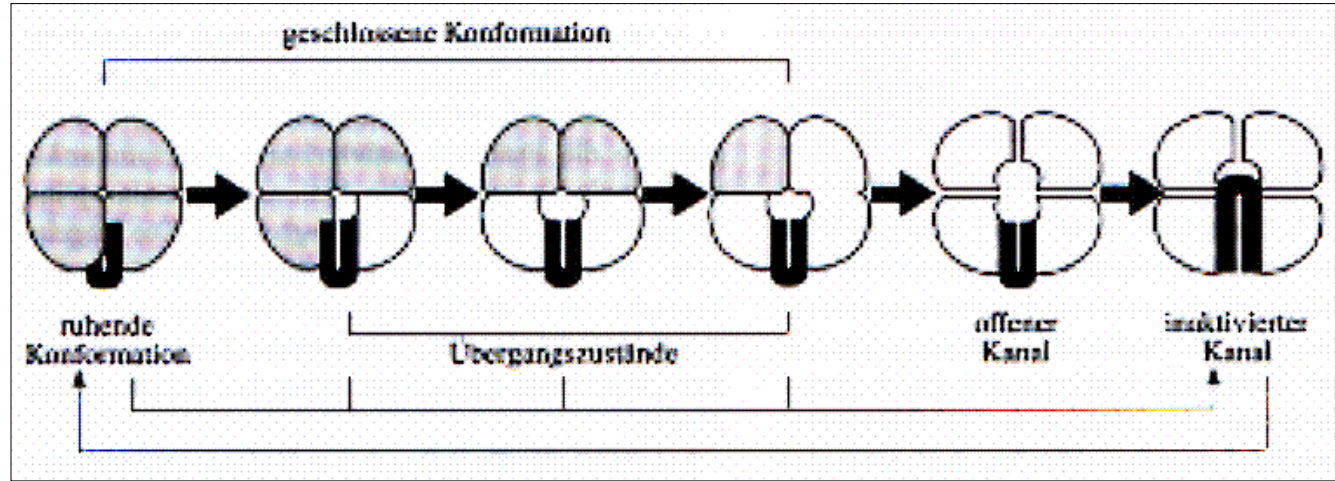
# Klassifikation von Nervenfasern

---

<i>Fasertyp</i>	<i>Funktion</i>	<i>Durchmesser (<math>\mu\text{m}</math>)</i>	<i>Geschwindigkeit (m/s)</i>
A $\alpha$	Motoneurone	15	100
A $\beta$	Berührung/Druck	8	50
A $\gamma$	Muskelspindel	5	20
A $\delta$	Temperatur/Schmerz	< 3	15
B	sympath. postganglionär	3	7
C	Schmerz/symp. postgangl.	1	1

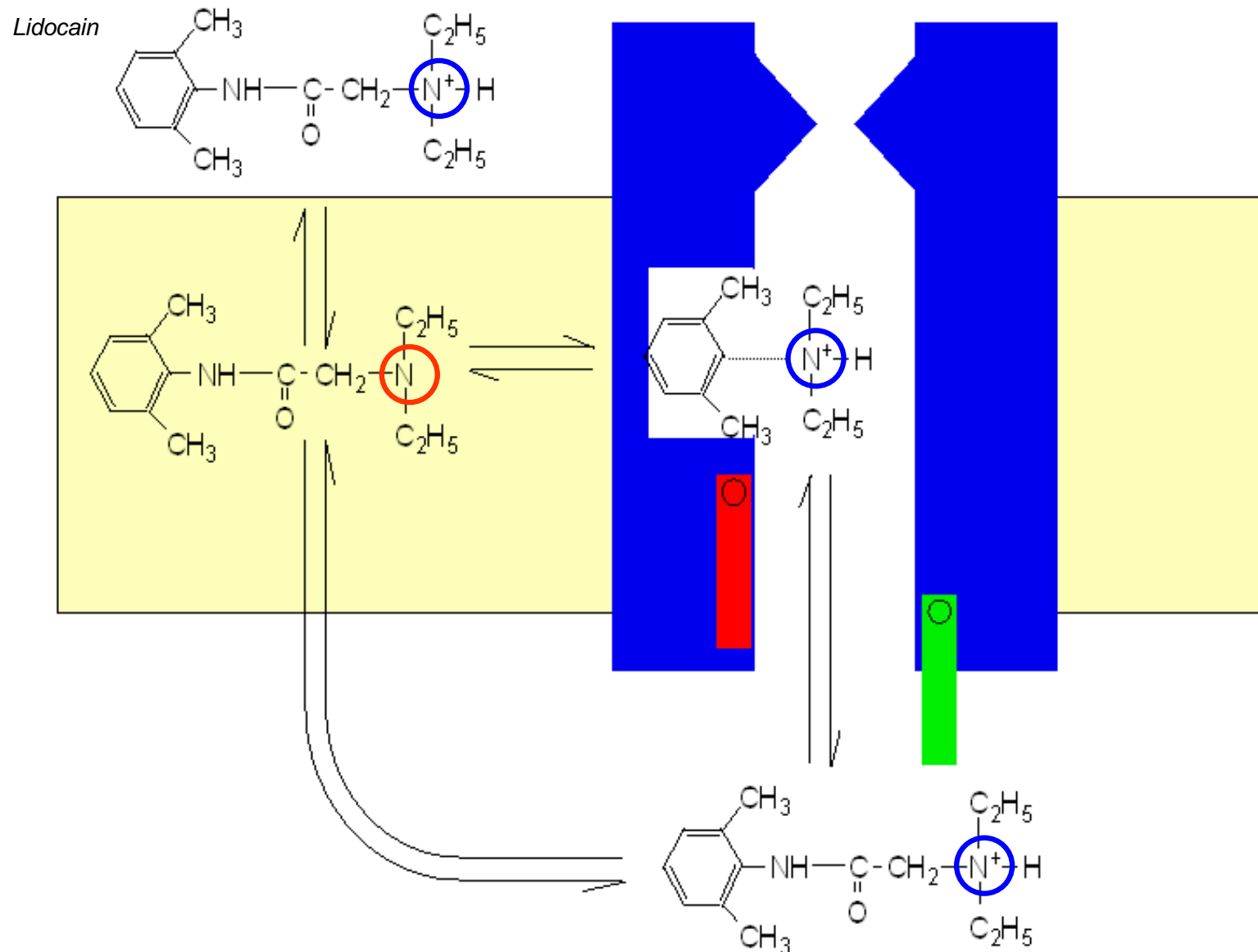
# Lokalanästhetika: Strukturen







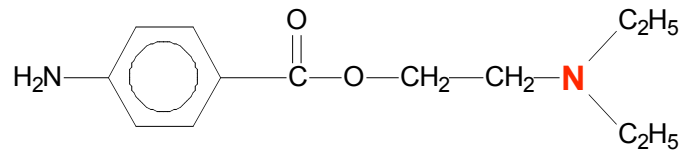
# Penetrationsform und Wirkform



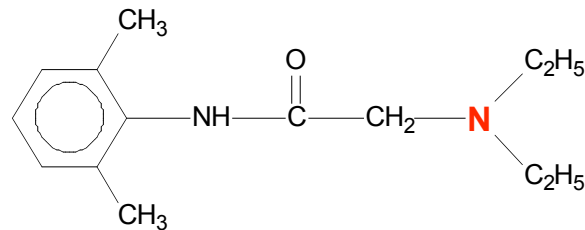
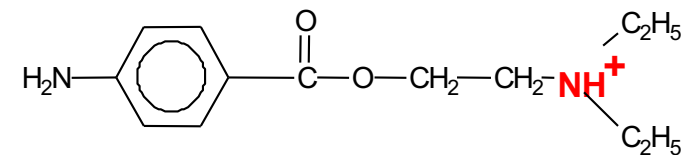
# Penetrationsform und Wirkform

Penetrationsform

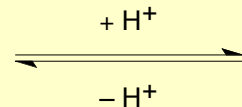
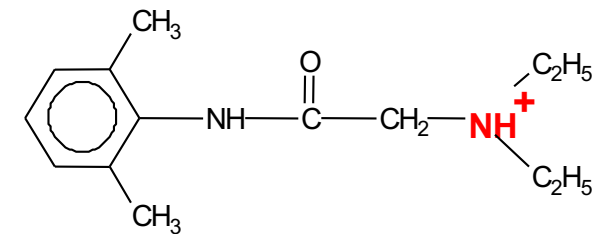
Wirkform



Procain



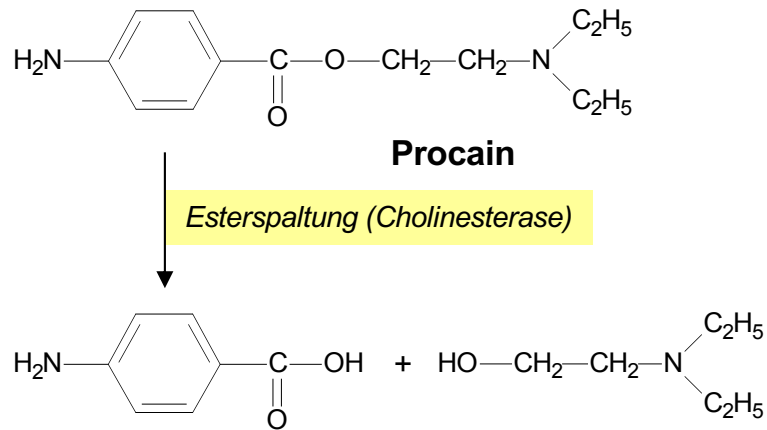
Lidocain



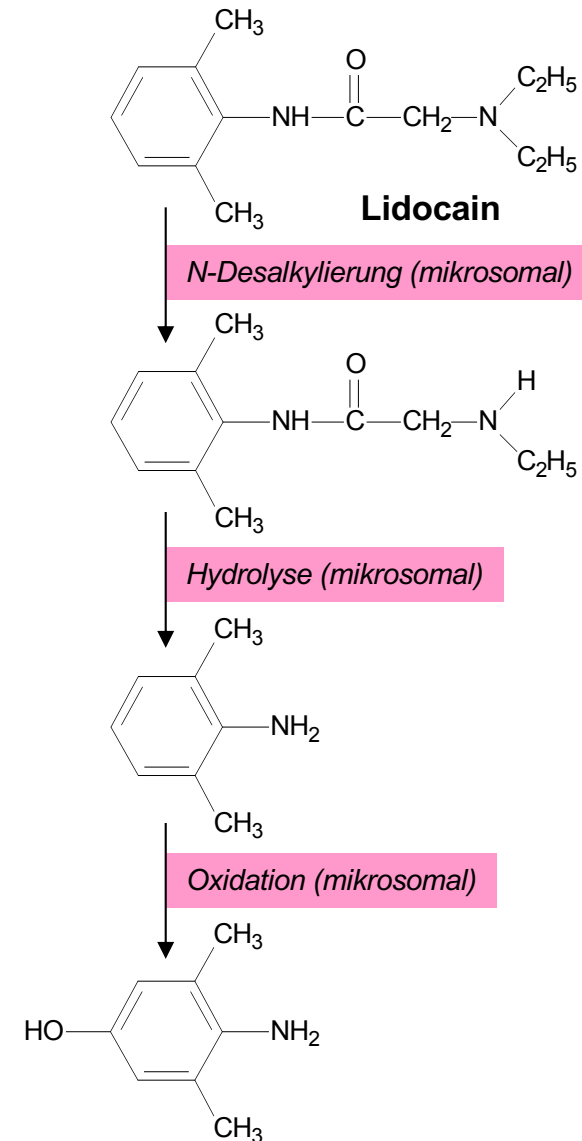
Gleichgewicht beeinflusst durch pH

# Lokalanästhetika: Metabolismus

## Estertyp

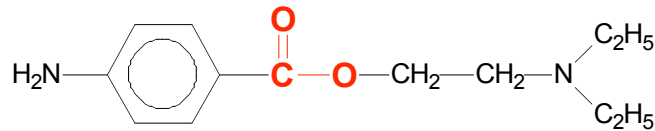


## Säureamidtyp



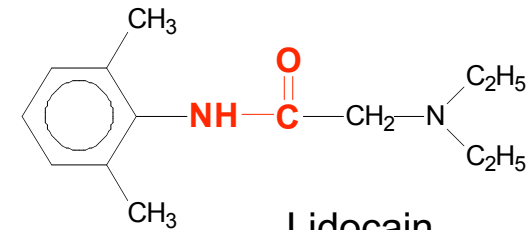
# Estertyp und Säureamidtyp

## Estertyp

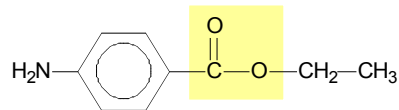


Procain

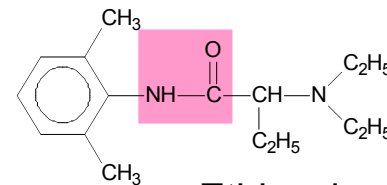
## Säureamidtyp



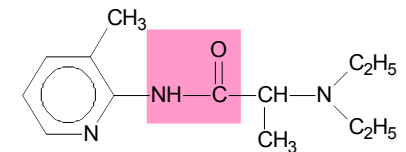
Lidocain



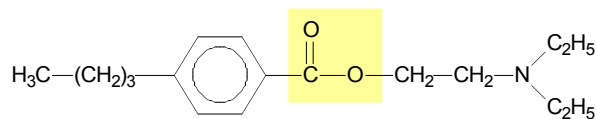
Benzocain



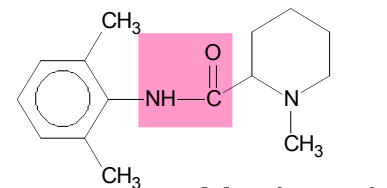
Etidocain



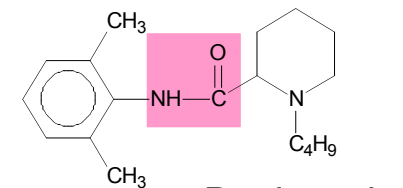
Prilocain



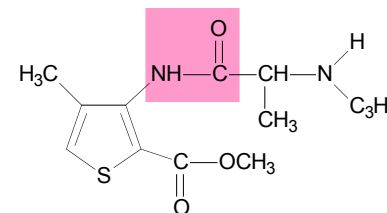
Tetracain



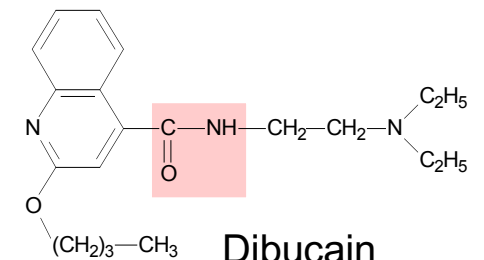
Mepivacain



Bupivacain



Articain



Dibucain

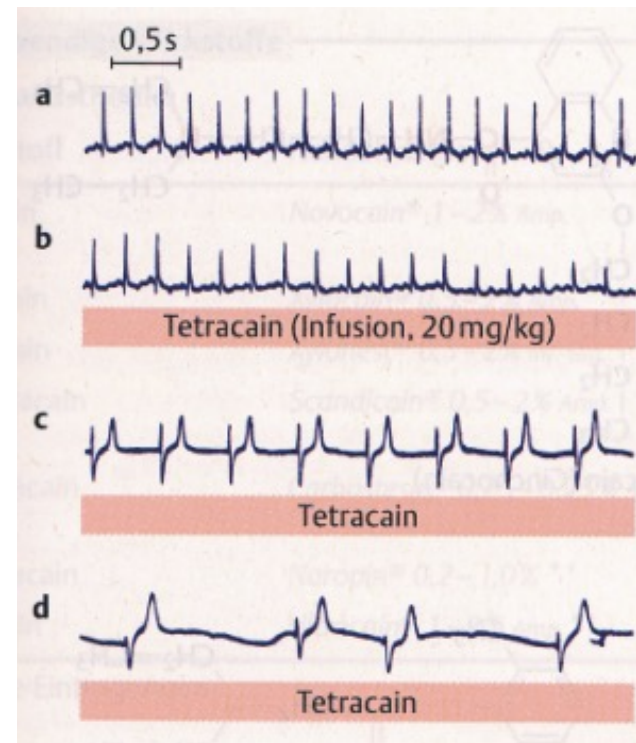
# Unerwünschte Wirkungen: Kardiotoxizität

- Erregungsleitung ↓
- Erregbarkeit ↓
- Kontraktionskraft ↓

verstärkt durch

Hypoxie ( $pO_2$  ↓)

Membranpotential ↑  
inaktivierte  $Na^+$ -Kanäle ↑



aus: Lüllmann, 1999

# Unerwünschte Wirkungen: ZNS Toxizität

---

- Hemmung inhibitorischer Neurone

- Ruhelosigkeit, Tremor
- Angstzustände

- Krämpfe
- Atemdepression

verstärkt durch:

- Hypoxie ( $pO_2 \downarrow$ )

Membranpotential  $\uparrow$   
inaktivierte  $Na^+$ -Kanäle  $\uparrow$

- Hyperkapnie ( $pCO_2 \uparrow$ )

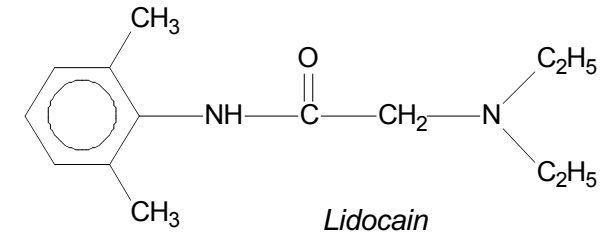
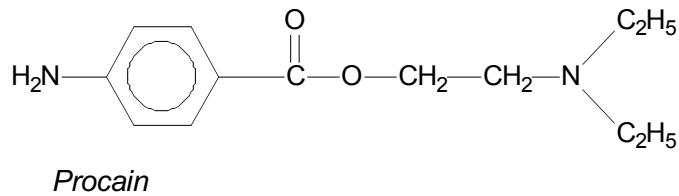
Durchblutung im ZNS  $\uparrow$

- Krämpfe

$\Rightarrow pCO_2 \uparrow$  , metabol. Acidose

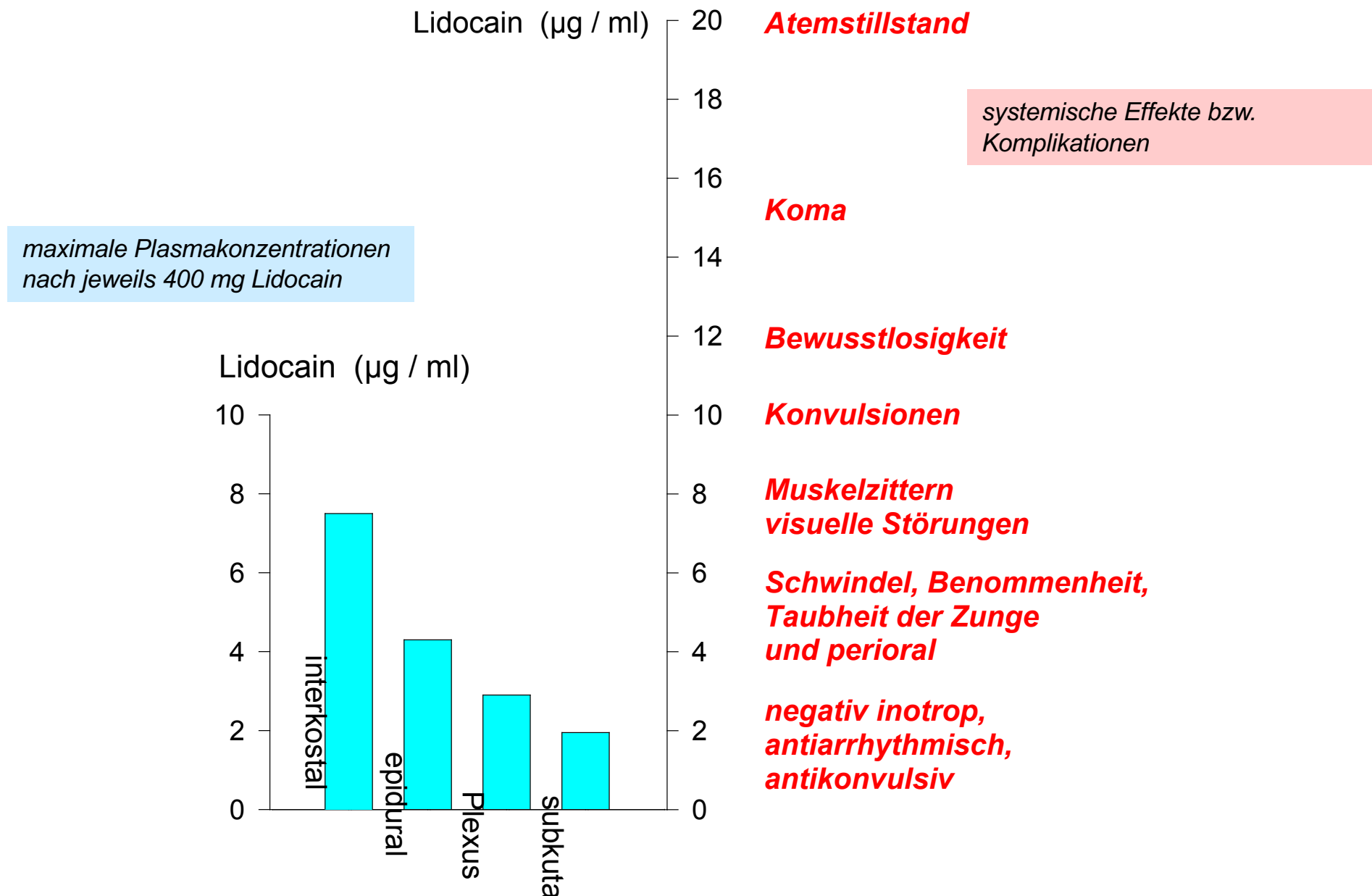
$\Rightarrow$  reduzierte Atmung,  $pO_2 \downarrow$

# Unerwünschte Wirkungen: Allergien



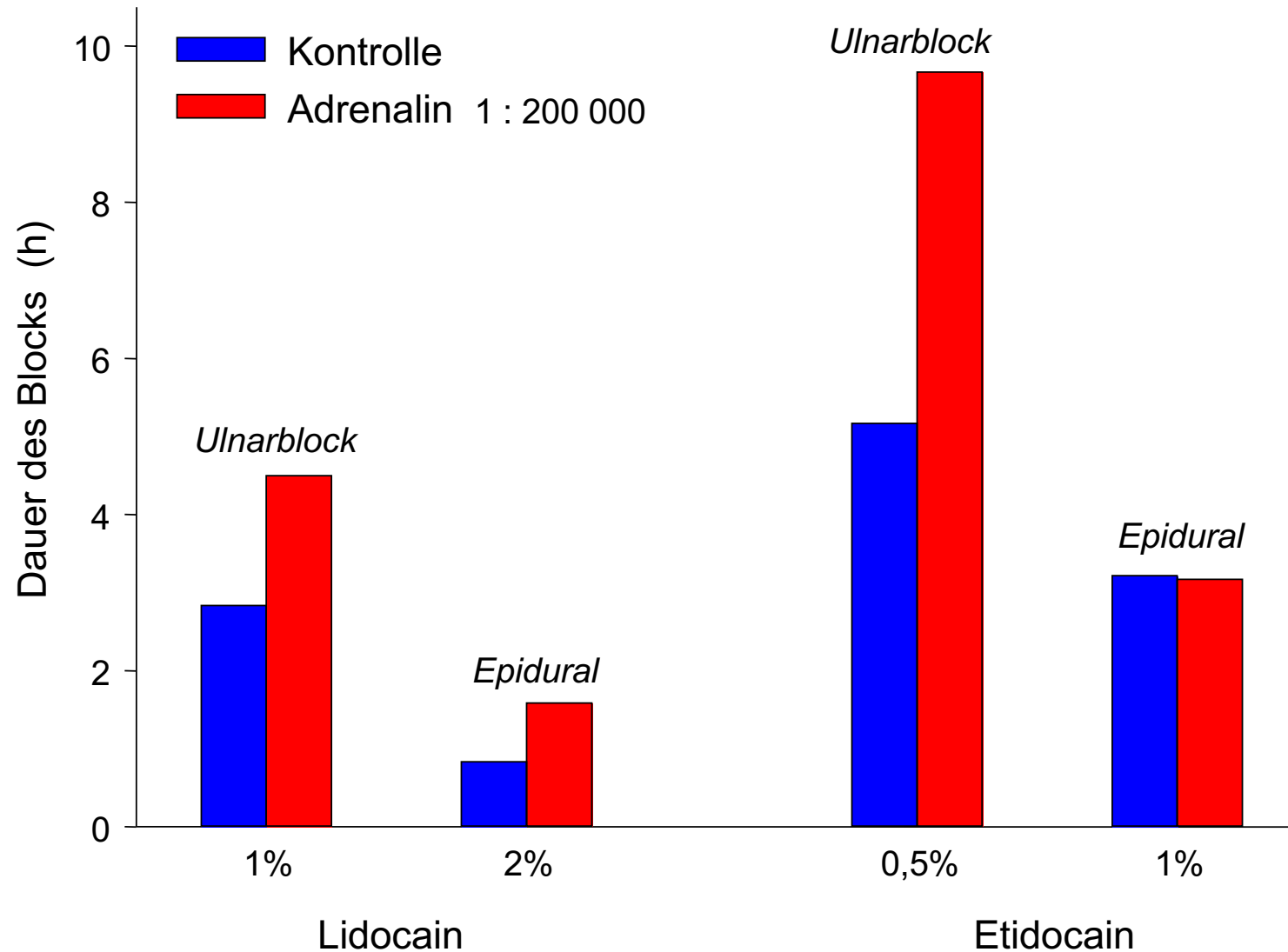
- Reaktionen auf Lokalanästhetikum
  - Estertyp > Säureamidtyp  
(keine Kreuzallergie)
  - CAVE: Procain als Zusatz  
(z.B. Depot-Präparate, Penicillin, Glucocorticoide!)
- Reaktionen auf Zusatzstoffe
  - Paragruppen (z.B. Methyl-4-Hydroxybenzoat)
  - Natriumdisulfit ( $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_5$ )

# Resorption von Lokalanästhetika





# Effekt von Vasokonstriktoren



# Effekt von Vasokonstriktoren

---

Adrenalin (Epinephrin)

$\alpha_1$

0,05 mg/ml

0.005%

1 : 20.000

0,02 mg/ml

0.002%

1 : 50.000

0,01 mg/ml

0.001%

1 : 100.000

0,005 mg/ml

0.0005%

1 : 200.000

Noradrenalin (Norepinephrin)

$\alpha_1$

0,04 mg/ml

0.004%

1 : 25.000

Felypressin

$V_1$

0,03 I.E./ml

*Phe<sup>2</sup>-Lys<sup>8</sup>-Vasopressin*

Ornipressin

$V_1$

max. 0,15 I.E./ml

*Orn<sup>8</sup>-Vasopressin*

# Vasokonstriktoren: Unerwünschte Wirkungen

---

## *Anwendungsbeschränkungen:*

- Versorgungsbereiche von Endarterien
- koronare Herzkrankheit; Herzrhythmusstörungen, Hypertonie etc.
- NA-Reuptake-Inhibitoren (trizyklische Antidepressiva)