

# Lokalanästhetika in der Zahnheilkunde

## Wirkungsmechanismus der Lokalanästhetika

*Die lokale Anästhesie unterbricht reversibel den Informationsweg zwischen dem Ort der Schmerzentstehung und dem Zentralnervensystem. Dies geschieht durch Eingriff in die Physiologie der Nervenerregung. Im Inneren einer ruhenden Nervenzelle besteht eine hohe Konzentration an Kaliumionen und eine geringe Konzentration an Natriumionen. Außerhalb der Zelle sind die Verhältnisse umgekehrt.*

DR. HERBERT WILMS/FRANKFURT AM MAIN

Die Kaliumionenkonzentration ist niedrig, die Natriumionenkonzentration hoch. Die unterschiedliche Verteilung der Ionen wird durch „Ionenpumpen“ aktiv aufrecht erhalten und führt zu einem Ruhepotenzial an der Nervenmembran. Bei der Erregung des Nervs treten Natriumionen in die Zellen ein, Kaliumionen treten im Gegenzug aus. Es kommt zur Depolarisation der Membran. Diese als Aktionspotenzial bezeichnete Potenzialänderung wird an den Nervenfasern entlang weitergeleitet und bildet die Schmerzleitung. Lokalanästhetika verändern die Permeabilität der Nervenmembran für Natriumionen und verhindern deren Einstrom in die Nervenzellen. Es kommt kein Aktionspotenzial mehr zustande (Abb. 1).

### Chemie der Lokalanästhetika

Chemisch gilt für alle heute verwendeten Injektionsanästhetika ein bestimmtes Strukturschema. Eine aromatische Ringstruktur (Benzol- oder Thiophenring) ist über eine Säureamidbrücke verbunden mit einer Aminogruppe.

Man bezeichnet diese Substanzen daher als Lokalanästhetika vom Amidtyp. Ältere – heute nicht mehr zur Injektion in der Zahnheilkunde verwendete Substanzen – hatten statt der Säureamidbrücke eine Esterbindung. Man nennt sie daher Lokalanästhetika vom Estertyp.

### Physikochemische Eigenschaften der Lokalanästhetika

Wichtige Substanzeigenschaften der Lokalanästhetika sind Lipidlöslichkeit und Proteinbindung (Tab. 1). Eine hohe Lipidlöslichkeit führt zu stärkerer Wirksamkeit, steigert durch die höhere Affinität zum Zentralnervensystem aber auch die Toxizität. Die Proteinbindung gibt den prozentualen Anteil des Lokalanästhetikums an, der an Serumproteine gebunden ist. Eine höhere Proteinbindung korreliert mit einer stärkeren Wirkung. Die systemische Toxizität ist

jedoch vermindert, da nur der ungebundene Anteil für die mögliche Auslösung unerwünschter Wirkungen im ZNS oder im Herz-Kreislauf-System zur Verfügung steht.

### Übersicht über die einzelnen Lokalanästhetika

#### Kokain

Der erstmals 1884 bei einer Augenoperation eingesetzte Naturstoff Kokain erwies sich bald wegen seiner Toxizität und suchterzeugenden Wirkung als ungeeignet für die Anwendung in der Zahnheilkunde. Kokain hat allerdings eine Eigenschaft, die allen spä-

Physikalisch-chemische Parameter einiger Lokalanästhetika (nach BORCHARD, 1990)					
	Articain	Bupivacain	Lidocain	Mepivacain	Prilocain
Molekulargewicht	284	288	234	246	220
pK <sub>a</sub>	7,8	8,1	7,7	7,8	7,7
Verteilungskoeffizient	17,0 <sup>a</sup>	27,5 <sup>b</sup>	46,4 <sup>a</sup>	19,3 <sup>a</sup>	20,5 <sup>a</sup>
Proteinbindung	94 % <sup>e</sup>	95 % <sup>e</sup>	77 % <sup>e</sup>	78 % <sup>e</sup>	55 % <sup>e</sup>
Relative Wirksamkeit*	5	16	4	4	4
Relative Toxizität*	1,5	8	2	1,8	1,5
Wirksamkeit/Toxizität	3,3	2	2	2,2	2,7
Halbwertszeit in Min.	20	162	96	114	93
Maximale Dosis in mg (Erwachsene)	500	90	500	400	600

\* Procain = 1                      <sup>a</sup> Oktanol/Puffer pH 7,4  
<sup>b</sup> n-Heptan/Puffer pH 7,4      <sup>e</sup> Bindung an Plasmaeiweiß (2 mg/ml)

Tab. 1: Eigenschaften der Lokalanästhetika.