Zeitschrift: Verhandlungen der Schweizerischen Naturforschenden Gesellschaft. Wissenschaftlicher und administrativer Teil = Actes de la Société Helvétique des Sciences Naturelles. Partie scientifique et administrative = Atti della Società Elvetica di Scienze Naturali

Herausgeber: Schweizerische Naturforschende Gesellschaft

Band: 144 (1964)

Artikel: Physikalisch-chemische Eigenschaften und chemische Reaktivität der Lokalanästhetica

Autor: Büchi, Jakob

DOI: https://doi.org/10.5169/seals-90622

Nutzungsbedingungen

Die ETH-Bibliothek ist die Anbieterin der digitalisierten Zeitschriften auf E-Periodica. Sie besitzt keine Urheberrechte an den Zeitschriften und ist nicht verantwortlich für deren Inhalte. Die Rechte liegen in der Regel bei den Herausgebern beziehungsweise den externen Rechteinhabern. Das Veröffentlichen von Bildern in Print- und Online-Publikationen sowie auf Social Media-Kanälen oder Webseiten ist nur mit vorheriger Genehmigung der Rechteinhaber erlaubt. Mehr erfahren

Conditions d'utilisation

L'ETH Library est le fournisseur des revues numérisées. Elle ne détient aucun droit d'auteur sur les revues et n'est pas responsable de leur contenu. En règle générale, les droits sont détenus par les éditeurs ou les détenteurs de droits externes. La reproduction d'images dans des publications imprimées ou en ligne ainsi que sur des canaux de médias sociaux ou des sites web n'est autorisée qu'avec l'accord préalable des détenteurs des droits. En savoir plus

Terms of use

The ETH Library is the provider of the digitised journals. It does not own any copyrights to the journals and is not responsible for their content. The rights usually lie with the publishers or the external rights holders. Publishing images in print and online publications, as well as on social media channels or websites, is only permitted with the prior consent of the rights holders. Find out more

Download PDF: 02.07.2025

ETH-Bibliothek Zürich, E-Periodica, https://www.e-periodica.ch

damit ausgedrückt werden, dass es sich um täglich wiederkehrende, hundertfältige und doch sich gleichbleibende Arbeiten handelt. Wir nehmen die fast erdrückenden Abzähl- und Nachleseprüfungen, die Dosierungsvergleiche, die jederzeitigen Anfragen und Auskünfte auf uns. Eine Sichtung der Fehler führt zu den Fehlerquellen (Zählfehler, Dezimalfehler, Verwechslungen). Die lebensgefährlichen Irrtümer sind selten, hängen aber immer am Apotheker oder diplomierten Personal (es muss ja so sein), die administrativen Fehler sind sehr häufig (z.B. Fakturafehler 5–8%) und verschlingen dadurch innerbetrieblich viele Kräfte. Der tägliche Kleinkrieg um die zugunsten des Kunden postulierte Perfektion darf jedoch nicht nur als Last empfunden werden, sondern auch als Erfüllung. Gewinn liegt ebenfalls im besseren Erkennen der Grössenordnungen: wichtig – unwichtig. Die regelmässigen Kontrollen erstrecken sich auch auf Gebiete, die über den Tag hinausgehen: Wie steht es mit der Verantwortlichkeit als Apotheker (Nachwuchs), als Akademiker (Schulen), als Bürger (Wehrbereitschaft), als Mensch (Familie)?

Gerade das tägliche Herumnörgeln an hundert Kleinigkeiten zeigt erst recht die Grösse jener Kräfte, denen wir als Naturforscher nicht nur analytisch zerfasernd, sondern still anschauend und dankbar annehmend, denen wir als tastend Zusammenhänge suchender Mensch begegnen wollen.

9. Jakob Büchi (Zürich) – *Physikalisch-chemische Eigenschaften und chemische Reaktivität der Lokalanästhetica.*

Als Einleitung für die nachfolgenden Referate von *F. Müller*, *X. Perlia*, *S. Studach* und *K. Müller* über ihre Untersuchungen bei den Lokalanästhetica wird die Problemstellung und die Planung dieser Arbeiten besprochen.

Da zwischen der chemischen Konstitution und der lokalanästhetischen Wirkung keine Gesetzmässigkeiten bestehen und entsprechende Zusammenhänge höchstens bei chemisch sehr nahe verwandten Stoffen (therapogene Gruppen, homologe Reihen und isostere Verbindungen) vorhanden sind, ist es notwendig, alle jene Stoffeigenschaften kennenzulernen, welche sich hinsichtlich Resorption, Verteilung, Biotransformation, Ausscheidung und Wirkungsmechanismus auswirken. Die Betrachtung dieser Vorgänge bei den Lokalanästhetica lässt erkennen, dass von den *physikalisch-chemischen Eigenschaften* die Wasserlöslichkeit, das Lösungsverhalten hinsichtlich Dissoziation, Ionisationsgrad sowie Assoziation, das Diffusionsvermögen, die Oberflächen- und Grenzflächenaktivität, die Adsorbierbarkeit an Grenzflächen, das Penetrations- und Permeationsvermögen in und durch Membranen, der Verteilungskoeffizient Öl/Wasser, ferner bei den *chemischen Eigenschaften* die Reaktivität gegenüber den Eiweissstoffen der Gewebsflüssigkeiten und Zelloberflächen, die Stabilität hinsichtlich Biotransformation sowie die Reaktionsfähigkeit gegenüber

den spezifischen Reaktionsstellen (Rezeptoren) der Nervmembran von Bedeutung sind.

Die vortragende Arbeitsgruppe des Pharmazeutischen Institutes der ETH stellte sich zur Aufgabe, die wichtigsten der aufgeführten physikalischen und chemischen Eigenschaften bei einigen homologen Reihen (Anästhesine, Novocaine und Cinchocaine) zu untersuchen, um die Zusammenhänge mit der lokalanästhetischen Wirkung aufzuzeigen.

10. F. Müller, P. Speiser (Zürich) – *Esterhydrolyse von einigen Procainhomologen.*

Ziel der Arbeit ist, festzustellen, ob zwischen Hydrolysegeschwindigkeit einiger Lokalanästheticaster der Procainreihe bzw. der diese beeinflussenden Substituenteneffekte und der Wirksamkeit ein Zusammenhang besteht. Die Substituenteneffekte werden kurz besprochen, soweit möglich deren Grösse bestimmt und mit dem lokalanästhetischen Index verglichen.

Ein direkter Zusammenhang konnte nicht sicher festgestellt werden.

11. X. Perlia (Zürich) – *Untersuchungen in der Anästhesin- und Intracainreihe.*

In den beiden homologen Reihen der Anästhesine (4-Amino-benzoesäure-alkylester) und der Intracaine (4-Alkoxy-benzoesäure-diäthylamino-äthylester) wurden verschiedene physikalisch-chemische Eigenschaften sowie die chemische Reaktionsfähigkeit dieser Verbindungen untersucht, um abzuklären, ob zwischen diesen Eigenschaften und der lokalanästhetischen Wirkung Beziehungen bestehen. Die Summierung gegenteiliger Effekte physikalisch-chemischer Natur (Wasserlöslichkeit, Lipoidlöslichkeit, Verteilungskoeffizient, Oberflächenaktivität) kann sich auf die Wirksamkeit ausüben und deren Zunahme bzw. Abnahme erklären. Unterschiede in der chemischen Reaktivität dieser Verbindungen sind kaum vorhanden, und somit lässt sich eine unterschiedliche Beeinflussung der Wirkstoffrezeptoren kaum postulieren.

12. S. Studach (Zürich) – *Untersuchungen in der Novocainreihe.*

Zwei Reihen homologer Novocainderivate wurden auf das Bestehen einiger Zusammenhänge zwischen physikalisch-chemischen Eigenschaften, chemischer Reaktivität und lokalanästhetischer Wirkung untersucht.

Für die Zunahme der lokalanästhetischen Wirkung in beiden Reihen sind bestimmte physikalisch-chemische Eigenschaften, wie Basizität, Wasserlöslichkeit, Lipophilität und Oberflächenaktivität, wesentlicher als die chemische Reaktivität der Wirkstoffmoleküle, für welche wir kaum Unterschiede namhaft machen konnten.