

## Medikamente

# Ofloxacin

### Synonym:

9-Fluor-2,3-dihydro-3-methyl-10-(4-methyl-1-piperazinyl)-7-oxo-7H-pyrido-(1,2,3-de)-1,4-benzoxacin-6-caronsäure

### Chemische Formel:

C<sub>18</sub> H<sub>20</sub> F<sub>3</sub> N<sub>4</sub> O<sub>4</sub>

### Beschaffenheit:

Kristalle oder kristallines Pulver, geruchlos, bitterer Geschmack; leicht löslich in Eisessig, mäßig löslich in Chloroform, schwer löslich in Wasser, Methanol, Ethanol und Aceton, praktisch unlöslich in Ethylacetat oder Benzol. Molekulargewicht 361,37.

### Handelspräparate:

*Mann:*

Floxal Augensalbe

Floxal Augentropfen

Floxal EDO Augentropfen

*Hoechst Marion Roussel:*

Tarivid 200/400 Filmtabletten

Tarivid i.v. 100/200/400 Infusionslösung

Uro-Tarivid 100 Filmtabletten

### Vorkommen im Trinkwasser:

Über den Urin der Anwender gelangen alljährlich große Mengen der Reinsubstanz über das Abwasser in das Grundwasser und von dort in manches Trinkwasser.

### Wirkungscharakter:

Ofloxacin ist ein überbrücktes Chinoloncarbonsäurederivat mit bakterizider Wirkung. Die Wirkung beruht auf Hemmung der bakteriellen DNS-Gyrase.

Ofloxacin besitzt ein breites Wirkungsspektrum, das sowohl grampositive und gramnegative aerobe und anaerobe Keime als auch Mykoplasmen und Chlamydien umfaßt.

### Indikationen:

Infektionen der Niere, der ableitenden Harnwege, der Geschlechtsorgane, Gonorrhoe; Infektionen der Atemwege einschließlich Hals, Nase und Ohren; Infektionen des Bauchraumes, einschließlich des kleinen Beckens (Ausnahme: bakteriell bedingte Enteritiden); Infektionen der Weichteile und der Haut; Infektionen des vorderen Augenabschnittes durch ofloxacinempfindliche Erreger, Chlamydien, Gerstenkorn.

### Kontraindikationen:

Überempfindlichkeit gegen Ofloxacin; nicht bei Kindern und Jugendlichen in der Wachstumsphase; nicht bei Schwangeren und Stillenden; bei zerebralen Anfallsleiden nur, wenn ausreichende anticonvulsive Therapie besteht.

### Stoffwechselverhalten:

Ofloxacin wird oral nahezu vollständig resorbiert. Nach <sup>1</sup>/<sub>2</sub>–1 Stunde wird das Maximum des Serumspiegels erreicht (2,6 mg/l).

Die maximale Konzentration in den Geweben (vor allen Dingen der Niere) war höher als im Serum. Nach oralen Gaben von 100 bis 600 mg Ofloxacin wurde im Serum eine Dosislinearität ermittelt. Die Serumeliminationshalbwertszeit beträgt etwa 6 Stunden. Die Eiweißbindung lag bei 6%.

*Ausscheidung:*

In unveränderter Form hauptsächlich renal, die Ausscheidung über die Galle liegt unter 1%.

*Biotransformation:*

Desmethyl-Ofloxacin und Ofloxacin-N-oxid haben zusammen einen Anteil von weniger als 2,5% im Urin. Beide Derivate weisen dem Ofloxacin vergleichbare antibakterielle Aktivität auf. Wechselwirkungen mit anderen Mitteln sind nicht bekannt.

**Toxizität:**

*Akute Toxizität:*

Tab. 1: LD<sub>50</sub>-Werte von Ofloxacin

Spezies	Applikationsart	LD <sub>50</sub> (mg/kg KG)	
		weiblich	männlich
Maus	per os	5.450	5.290
Maus	s.c.	10.000	
Maus	i.v.	208	233
Ratte	per os	3.590	3.750
Ratte	s.c.	7.070	9.000
Ratte	i.v.	273	276

Bislang ist ein Fall einer Intoxikation nach Infusion von ca. 3 g Ofloxacin innerhalb von 45 Min. bekannt. Die Serumspiegel betragen 39,3 mg/l 15 Min. nach Infusionsende, 16,2 mg/l nach 7 h und 2,7 mg/l nach 24 h. Die Symptome waren Schwindel, Schläfrigkeit, Übelkeit, Hitzewallungen, subjektives Gefühl der Gesichtsschwellung, undeutliche Sprache und schwach bis mäßig eingeschränkte Orientierung. Mit Ausnahme des Schwindels verschwanden alle Beschwerden ca. 1 Std. nach Infusionsende. Der Schwindel dauerte ca. 9 Std. Am nächsten Morgen fühlte sich die Patientin wieder normal. Bei bestimmten Risikokonstellationen (z.B. Epileptikern, Patienten mit Vorschädigung des ZNS) kann es zu zentralnervösen Erregungszuständen, Myoklonien und Krämpfen kommen.

*Subchronische undchronische Toxizität:*

Ab 90 mg/kg KG traten bei erwachsenen Tieren am Femurkopf osteochondroseähnliche Veränderungen auf; ab 270 mg/kg KG waren histologische Organschäden nachweisbar; bei jugendlichen Ratten traten Veränderungen an den Gelenken ab Dosen mit mehr als 10 mg/kg KG auf; ototoxische, nephrotoxische und okulotoxische Wirkungen sind hier nicht festgestellt worden; ab 90 mg/kg KG waren bei der Ratte und ab 160 mg/kg KG beim Kaninchen embryotoxisch.

*Nebenwirkungen:*

Haut: Photosensibilisierung (z.B. bullöse Exantheme an den belichteten Stellen); Exantheme, Hautausschlag, Juckreiz, Nesselsucht; anaphylaktische Reaktionen, Erythema multiforme, Stevens-Johnson-Syndrom, toxische epidermale Nekrolyse (selten)

Muskel und Skelett: Muskelschwäche, muskuläre Koordinationsstörungen, Muskelschmerzen; Gelenksbeschwerden; Sehnscheidenentzündung, Sehnenbeschwerden; Parästhesien

Nervensystem und Psyche: zentralnervöse Störungen wie Schwindel, Kopfschmerzen, Schlaflosigkeit, Erregungszustände (bis zu Halluzinationen), Depressionen (selten); Verwirrheitszustände, akute Angstzustände, psychotische Symptome; zerebrale Krampfanfälle (Einzelfälle)

Augen: Sehstörungen

Ohren: Hörstörungen, Ohrensausen; Gleichgewichtsstörungen

## Medikamente

Geschmack und Geruch: Geschmacks- und Geruchsstörungen

Gastrointestinaltrakt: gastrointestinale Störungen (Appetitlosigkeit, Übelkeit, Erbrechen, Bauchschmerzen und selten Durchfälle)

Leber: Beeinflussung der Leberfunktion (Erhöhung v. SGOT, SGPT, AP); Hepatitis

Stoffwechsel: Hyperglykämie

Herz, Kreislauf: Tachykardie, Blutdruckabfall, Angioödem; Kreislaufkollaps; Herzklopfen

Gefäße: allergische Vaskulitis, Ödeme; i.v.: Phlebitis

Blut: Anämie, Leukozytopenie, Agranulozytose

Atemwege: Eosinophilie; Pneumonitis

Urogenitaltrakt: tubuläre Nierenschädigung; interstitielle Nephritis

Immunsystem: Überempfindlichkeitsreaktionen wie Hautausschlag, Juckreiz, Nesselsucht, Eosinophilie, Ödeme, Kreislaufkollaps, Atemnot und Bewußtlosigkeit (gelegentlich); anaphylaktische Reaktionen,

Erythema multiforme, Stevens-Johnson-Syndrom oder toxische epidermale Nekrolyse (selten); allergische Vaskulitis; Überempfindlichkeitsreaktionen wie Hautreaktionen, Arzneimittelfieber, Quincke-Ödem, interstitielle Nephritis, Pneumonitis, Hepatitis

Sonstiges: Superinfektion durch Bakterien bzw. Sproßpilze, z.B. Mundsoor, Vulvovaginitis (bei langfristiger oder wiederholter Anwendung)

### Symptome bei Überdosierung:

Gastrointestinale Symptome wie Magenbeschwerden, Bauchschmerzen, Appetitlosigkeit, Übelkeit und Durchfall sowie seltener Kopfschmerzen, Schlafstörungen, Erregtheit und allergische Hautreaktionen.

### Therapie:

Primäre Giftentfernung durch Magenspülung, Gabe von Medizinalkohle und Glaubersalz. Erfahrungen mit der Hämodialyse liegen noch nicht vor.

Ein spezielles Antidot ist nicht bekannt. Bei Krämpfen Sedierung mit Diazepam. Bei anaphylaktischen Reaktionen sind die üblichen Sofortmaßnahmen, möglichst mit den ersten Anzeichen des Schocks, einzuleiten. Magenspülung zur Entfernung noch nicht resorbierter Substanz. Anschließend reichlich Gabe von medizinischer Kohle. Diuresetherapie zur Förderung der Ausscheidung bereits resorbierter Substanz. Mineralische Antazida zur Resorptionsverzögerung und Schutz der Magenschleimhaut.