

Holzer Angelika, Schreiner Ursula, Arif Tara
Vergiftungsinformationszentrale Wien, Österreich

Einleitung

Sarolaner ist ein Akarizid und Insektizid aus der Gruppe der Isoxazoline. Die Summenformel lautet $C_{23}H_{18}Cl_2F_4N_2O_5S$ und das Molekulargewicht beträgt 581,4 g/mol (NCBI 2011 cont.).

Sarolaner blockiert GABA- und Glutamat-gesteuerte Chloridkanäle im zentralen Nervensystem von Insekten und Milben. Die Störung dieser Rezeptoren verhindert die Aufnahme von Chloridionen durch GABA- und Glutamat-gesteuerte Ionenkanäle, was zu einer erhöhten Nervenstimulation und letztlich zum Tod der Zielparasiten führt. Sarolaner besitzt eine höhere funktionelle Potenz zur Blockade von Rezeptoren von Insekten und Milben im Vergleich zu Säugerrezeptoren.

Sarolaner ist wirksam gegen adulte Flöhe sowie gegen mehrere Arten von Zecken und wird deshalb in der Veterinärmedizin als Antiparasitikum für Hunde verwendet. Die Dosierung beim Hund ist 2-4 mg pro kg KG, die Wirkdauer ein Monat. Die Substanz wird nach oraler Anwendung rasch und gut resorbiert.

- maximale Plasmakonzentration: nach 3 Stunden
- mittlere orale Halbwertszeit: 10-12 Tage
- mittlere Verteilungsvolumen: 2,81 l/kg
- hohe Proteinbindung: > 99,9%.

Es dürfte beim Hund nur minimal metabolisiert werden, der Haupteliminationsweg ist biliäre Exkretion mit Ausscheidung über die Fäces. Es werden keine Kontraindikationen angegeben.

Fallbericht

Der 2-jährige, 12 kg schwere Sohn einer Tierärztin hatte 2 Sarolaner-Kautabletten zu je 80 mg für Hunde (entsprechend der Dosis für einen 80 kg-Hund) verschluckt (13,3 mg/kg), nachdem sein größerer Bruder den Blister mit einer Schere aufgeschnitten hatte. Nach ca. 50 Minuten fiel der Mutter auf, dass das Kind eine Gangunsicherheit sowie eine Fallneigung entwickelt hatte und sie konsultierte den Vergiftungsnotruf. Da für die Substanz Sarolaner in den verfügbaren toxikologischen Datenbanken keine Daten vorhanden waren, wurde geraten, das Kind im Krankenhaus vorzustellen. Nach zirka 2 Stunden konnte der Kinderarzt im Krankenhaus das Kind untersuchen, es zeigte einen Tremor, war sehr agitiert, schreckhaft und schien zu halluzinieren, es erhielt insgesamt 2x 1,5 mg Midazolam i.v.. In der Folge war keine weitere Medikation nötig und am Abend (10 Stunden später) war das Kind noch minimal ataktisch, aber spielte bereits. Es konnte am nächsten Tag beschwerdefrei nach Hause entlassen werden.

Das Labor war bland bis auf folgende Werte: minimal erhöhte LDH (312 U/L; Normbereich: <300 U/L), GPT (26 U/L; Normbereich: <21 U/L).

Diskussion

Die Substanz ist erst ungefähr 3 Jahre in Verwendung und wir konnten keine publizierten Humaningestionsfälle finden. In einer Sicherheitsstudie wurden Hunden verschiedene Dosen Sarolaner alle 28 Tage 10 mal verabreicht und zwar die normale Dosis, das 3-fache und das 5-fache der maximalen Behandlungsdosis von 4 mg/kg Körpergewicht. Bei der 3-fachen Dosis wurden leichte selbstlimitierende neurologische Symptome (Tremor) beobachtet, bei der 5-fachen Dosis Konvulsionen, die sich bei allen Tieren ohne Behandlung rückbildeten.

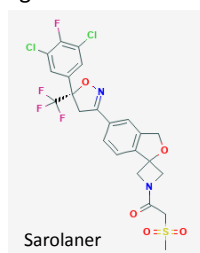
Das betroffene Kind hatte etwas mehr als die (auf den Hund bezogen) 3-fache Maximaldosis eingenommen, die Symptome entsprachen etwa denen im Tierversuch, da das Kind aber doch beeinträchtigt war (Schreckhaftigkeit, Halluzinationen) wurde es zur Linderung der Symptome sediert.

Bei weiteren Recherchen fällt auf, dass es im amerikanischen Beipacktext noch einen Fallbericht eines Hundes aus einer Pharmakokinetikstudie gibt, der 2 Tage nach der 3-fachen Dosierung (im 3. Monat) so schwere Nebenwirkungen entwickelte (Lethargie, Anorexie und multiple neurologische Symptome, wie Ataxie, Tremor, Verwirrtheit, Hypersalivation, verringerte Propriozeption, fehlende Reaktion auf Bedrohung), dass das Tier nicht behandelt werden konnte und schließlich euthanasiert werden musste. In diesem Fall waren die Plasmaspiegel 7 Stunden nach der 3. Dosis rasch auf den 2,5-fachen Normalwert angestiegen, und innerhalb von 41 Stunden hatte der Wert mehr als das 7-fache der maximalen Konzentration bei maximaler therapeutischer Dosis erreicht.

Im Internet findet man Erfahrungsberichte von Hundebesitzern, deren Hunde, die an Epilepsie litten, sehr schwere Nebenwirkungen wie tagelange Krampfanfälle hatten. Diese Nebenwirkungen werden im Beipacktext nicht angeführt.

Conclusio

Kindliche Ingestionen von Veterinärpharmaka, die erst kurz in Verwendung sind und für die es keinerlei verfügbare Humandaten gibt, sollten unbedingt ernstgenommen werden, da auch schwerere oder bedrohliche Nebenwirkungen nicht ausgeschlossen werden können und spezifische therapeutische Möglichkeiten fehlen.



Vergiftungsinformationszentrale (ViZ)
Gesundheit Österreich GmbH
Wien, Österreich

Notrufnummer: 0-24h: +43 1 406 43 43

viz@goeg.at