ИНСТРУКЦИЯ
(информация для специалистов)
по медицинскому применению препарата
ПРОЗЕРИН

Регистрационный номер: ЛС-000262
Торговое название препарата: Прозерин
Международное непатентованное название (МНН): неостигмина метилсульфат
Лекарственная форма: раствор для внутривенного и подкожного введения
Состав: 1 мл раствора содержит в качестве активного вещества 0,5 мг неостигмина метилсульфата, вспомогательное вещество - вода для инъекций.
Описание: прозрачная бесцветная жидкость
Фармакотерапевтическая группа: холинэстеразы ингибитор
Код АТХ: [N07AA01]
Фармакологическое действие
Синтетическое антихолинэстеразное средство. Обратимо блокирует холинэстеразу, что приводит к накоплению и усилению действия ацетилхолина на органы и ткани и восстановлению нервно-мышечной проводимости. Вызывает урежение частоты сердечных сокращений, повышает секрецию желез (слюнных, бронхиальных, потовых и желудочно-кишечного тракта) и способствует развитию гиперсаливации, бронхореи, повышению кислотности желудочного сока, вызывает сужение зрачка, спазм аккомодации, снижает внутриглазное давление (у больных с закрытоугольной глаукомой), усиливает тонус гладкой мускулатуры кишечника и мочевого пузыря, вызывает спазм бронхов, повышает тонус скелетной мускулатуры. После внутривенного введения максимальный эффект наблюдается через 5-15 минут. Продолжительность эффекта – 2,5-4 часа.
Фармакокинетика
Являясь четвертичным аммониевым основанием, плохо проникает через гематоэнцефалический барьер и не оказывает центрального действия. Связь с белками плазмы крови - 15-25%. Период полувыведения при внутривенном введении – 53 минуты. Метаболизируется в печени микросомальными ферментами с образованием неактивных метаболитов. Выведение: 80% введенной дозы выводится почками в течение 24 часов (из них 50% в неизмененном виде и 30% - в виде метаболитов).
Показания к применению
Миастения; двигательные нарушения после травм мозга; параличи; восстановительный период после перенесенного менингита, полиомиелита, энцефалита; атрофия зрительного нерва; невриты; профилактика и лечение атонии кишечника и мочевого пузыря; стимуляция родовой деятельности.
В качестве антидота после анестезии с применением антидеполяризующих и деполяризующих (если они начинают действовать по типу антидеполяризующих «двойной блок») миорелаксантов при мышечной слабости и угнетении дыхания.

Противопоказания

Повышенная чувствительность, эпилепсия, гиперкинезы, ваготомия, ишемическая болезнь сердца, брадикардия, аритмии, стенокардия, бронхиальная астма, выраженный атеросклероз, гипертиреоз, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, перитонит, механическая обструкция желудочно-кишечного тракта и мочевыводящих путей, гиперплазия предстательной железы, интоксикации у резко ослабленных детей, беременность, период лактации.

Способ применения и дозы

Подкожно и внутривенно.

Взрослым обычно назначают под кожу по 0,5 мг (1 мл раствора) 1-2 раза в день.

При лечении миастении Прозерин можно назначать в сочетании с антагонистами альдостерона. Лечение миастении проводят длительно. При развитии миастенического криза у взрослых вводят внутривенно (с 0,9% раствором натрия хлорида) – 0,5 - 1 мл раствора, затем под кожу в обычных дозах с небольшими интервалами. Для усиления действия Прозерина иногда вводят под кожу дополнительно эфедрин - 1 мл 5% раствора. При других заболеваниях длительность лечения составляет 25-30 дней, при необходимости курс лечения повторяют после 3-4 недельного перерыва.

Для стимулирования родов можно вводить под кожу по 0,5 мг (1 мл раствора) 1-2 раза с промежутками 1 час, одновременно с первой инъекцией вводят однократно под кожу 1 мг (1 мл 0,1% раствора) атропина.

Для купирования действия миорелаксантов предварительно внутривенно вводят атропина сульфат в дозе 0,5-0,7 мг (0,5-0,7 мл 0,1% раствора), ожидают учащения пульса и через 1,5-2 минуты вводят внутривенно 1,5 мг (3 мл раствора) Прозерина. Если эффект этой дозы оказался недостаточным, повторно вводят такую же дозу (при появлении брадикардии делают дополнительную инъекцию атропина). Всего можно ввести 5-6 мг (10-12 мл раствора) Прозерина в течение 20-30 минут. Во время процедуры обеспечивают адекватную вентиляцию легких.

Детям под кожу назначают по 0,05 мг (0,1 мл раствора) на 1 год жизни, но не больше 0,75 мл 0,05% раствора на одну инъекцию. Обычно детям Прозерин назначают 1 раз в сутки, однако при необходимости суточную дозу препарата можно разделить на 2-3 приема.

Побочное действие

Гиперсаливация; спастическое сокращение и усиление перистальтики кишечника; тошнота; рвота; метеоризм; диарея; головная боль; головокружение; слабость; потеря сознания; сонливость; миоз; нарушения зрения; аритмии; бради- или тахикардия; атриовентрикулярная блокада; узловой ритм; неспецифические изменения на электрокардиограмме; остановка сердца; снижение артериального давления; одышка; угнетение дыхания вплоть до остановки; бронхоспазм; тремор; спазмы и подергивание скелетной мускулатуры, включая фасцикуляции мышц языка, судороги; дизартрия; артралгия; учащение мочеиспускания; обильное потоотделение; аллергические реакции (покраснение лица, сыпь, зуд, анафилаксия).

Для снятия побочных явлений уменьшают дозу или прекращают применение препарата, при необходимости вводят атропин (1 мл 0,1% раствора), метоциния йодид или другие холинолитические препараты.

Передозировка

В случае передозировки возникает холинергический криз (брадикардия, гиперсаливация, миоз, бронхоспазм, тошнота, боль в животе, усиление перистальтики желудочно-кишечного тракта, диарея, учащенное мочеиспускание, проливной пот, затруднение дыхания, цианоз, фибрилляция скелетных мышц и языка, общая слабость, снижение АД).

Лечение: прием препарата следует прекратить и немедленно ввести атропина сульфат (1 мл 0,1% раствора под кожу) или другие холинолитики. В случаях тяжелого отравления Прозерином, вводят атропина сульфат с интервалами 10 минут до 3 раз (до появления сухости во рту). При возникновении судорог назначают амобарбитал – внутримышечно

(5-10 мл 10% раствора) или гексобарбитал (10 мл 10% раствора), или хлоралгидрат ректально.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Прозерин и деполяризующие мышечные релаксанты (суксаметония йодид и др.) фармакологически несовместимы, так как при непосредственном взаимодействии усиливается эффект суксаметония йодида. Однако в случае применения деполяризующих мышечных релаксантов в больших дозах после деполяризующего действия развивается антидеполяризующий эффект ("двойной блок"), поэтому назначать Прозерин целесообразно.

М-холиноблокаторы (атропин, гоматропина гидробромид, платифиллин и др.), ганглиоблокаторы (пахикарпина гидройодид), хинидин, новокаинамид, местные анестетики являются фармакологическими антагонистами Прозерина.

Между трициклическими антидепрессантами, противоэпилептическими и противопаркинсоническими средствами существует относительный антагонизм.

Цианокобаламин в больших дозах ослабляет действие Прозерина.

Снижает активность пиридоксина.

Прозерин хорошо сочетается с аденозинтрифосфатом и кальция глюконатом при мышечных дистрофиях; с тиамином - при невритах; с никетамидом - при сердечно-сосудистых расстройствах.

Антихолинэстеразные вещества в сочетании со стрихнином значительно повышают тонус блуждающего нерва; со слабительными - усиливают их действие; с противоаритмическими препаратами (β-адреноблокаторами) являются синергистами (усугубление брадикардии).

Эфедрин усиливает действие Прозерина, поэтому при миастенических кризах их вводят вместе.

При миастении целесообразно сочетать с антагонистами альдостерона.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и подкожного введения 0,5 мг/мл по 1 мл в ампулах, 10 ампул вместе со скарификатором и инструкцией по применению в коробку; или по 5ампул в контурную ячейковую упаковку, по 2 контурных упаковки вместе со скарификатором и инструкцией по применению в пачку.

Условия хранения

Список А. В защищенном от света и недоступном для детей месте, при температуре от 18° до 25° С.

Срок годности

4 года. Не использовать по истечению срока годности.

Условия отпуска из аптек

по рецепту.

Производитель

ФГУП «Мосхимфармпрепараты» им. Н.А.Семашко. 115172 Москва, ул. Большие Каменщики, 9, тел/факс (095) 912-71-61.

Директор ИДКЭЛС, профессор **В.В.Чельцов**

Представитель фирмы
Заместитель генерального директора ФГУП «Мосхимфармпрепараты» имени Н. А. Семашко **Н.Н. Чадова**

Московское производственное химико-фармацевтическое объединение имени Н.А. Семашко