

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ПРОЗЕРИН

Регистрационный номер:

Торговое наименование лекарственного средства: Прозерин

МНН или группировочное название: Неостигмина метилсульфат

Химическое наименование:

3-[[[(диметиламино)карбонил]окси] - N, N, N – триметилбензоламиния
метилсульфат

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и подкожного введения

Состав

Активное вещество: неостигмина метилсульфат (прозерин) - 0,5 мг.

Вспомогательное вещество: вода для инъекций – до 1 мл.

Описание

Бесцветная прозрачная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа лекарственного препарата:

холинэстеразы ингибитор

Код АТХ: [N07AA01]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Синтетический ингибитор холинэстеразы. 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, суживает зрачок, спазм аккомодации, снижает внутриглазное давление, усиливает тонус гладкой мускулатуры кишечника (усиливает перистальтику и расслабляет сфинктеры) и мочевого пузыря, вызывает спазм бронхов, повышает тонус скелетной мускулатуры.

Фармакокинетика

Являясь четвертичным аммониевым основанием, плохо проникает через гематоэнцефалический барьер и не оказывает центрального действия. Биодоступность неостигмина метилсульфата составляет 1-2 %. При внутримышечном введении время достижения максимальной концентрации в плазме крови – 30 минут.

Связь с белками плазмы крови - 15-25 %. Период полувыведения при внутримышечном введении препарата равен 51-90 мин, при внутривенном – 53 мин. Метаболизируется в печени микросомальными ферментами с образованием неактивных метаболитов.

Выведение: 80 % введенной дозы выводится почками в течение 24 ч (из них 50 % в неизменном виде и 30 % в виде метаболитов).

После внутримышечного введения максимальный эффект наблюдается через 10-30 мин, а после внутривенного - через 5-15 мин. Продолжительность эффекта - 2,5-4 ч.

Показания к применению

Миастения; двигательные нарушения после травм мозга; параличи; восстановительный период после перенесенного менингита, полиомиелита, энцефалита; невриты; предупреждение и лечение атонии желудочно-кишечного тракта и мочевого пузыря; слабость родовой деятельности (редко). В качестве антидота после анестезии с применением недеполяризующих миорелаксантов при мышечной слабости и угнетении дыхания.

В детской практике применяют только при миастении gravis.

Противопоказания

Гиперчувствительность, эпилепсия, гиперкинезы, 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.

Применение препарата противопоказано в период острых инфекционных заболеваний, интоксикации у резко ослабленных детей.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата противопоказано при беременности и в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Препарат обычно назначают подкожно. Взрослым под кожу вводят по 0,5 мг (1 мл 0,05% раствора) 1-2 раза в день, максимальная разовая доза – 2 мг, суточная – 6 мг.

При развитии миастенического криза у взрослых препарат вводят внутривенно (с 0,9 % раствором натрия хлорида) – 0,5-1 мл раствора 0,5 мг/мл, затем под кожу в обычных дозах с небольшими интервалами.

Для потенцирования действия неостигмина метилсульфата иногда вводят под кожу дополнительно эфедрин – 1 мл 5 % раствора. Лечение миастении проводят длительно. При других заболеваниях курс лечения продолжается 25-30 дней, при необходимости курс лечения повторяют после 3-4 недельного перерыва.

При слабости родовой деятельности можно вводить препарат под кожу по 0,5 мг (1 мл раствора 0,5 мг/мл) 1-2 раза с промежутками 1 час, одновременно с первой инъекцией вводят однократно под кожу 1 мг (1 мл 0,1 % раствора) атропина. При применении препарата для купирования действия миорелаксантов предварительно вводят атропина сульфат внутривенно 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 5 мг/мл) препарата. Если эффект этой дозы оказался недостаточным, вводят повторную такую же дозу препарата (при появлении брадикардии делают дополнительную инъекцию атропина). Всего можно ввести 5-6 мг (10-12 мл раствора 0,5 мг/мл) препарата в течение 20-30 минут.

Лечение задержки мочи – подкожно 0.5 мг (1 мл раствора) 1-3 раза с промежутками час, если в течение часа моча не отходит, проводят катетеризацию и после опорожнения мочевого пузыря вводят каждые 3 часа, всего 5 инъекций. Для профилактики послеоперационной атонии кишечника и мочевого пузыря подкожно вводят по 0,25 мг (0,5 мл раствора).

У детей применяют только при миастении gravis (только в условиях стационара!) подкожно по 0,05 мг (0,1 мл 0,05% раствора) на 1 год жизни в день, но не более 3,75 мг (0,75 мл 0,05% раствора) на одну инъекцию.

Обычно детям препарат назначают один раз в сутки, однако при необходимости суточную дозу можно разделить на два-три приема.

Побочное действие

Со стороны нервной системы и органов чувств: головная боль, головокружение, судороги, слабость, потеря сознания, сонливость, миоз, нарушение зрения, дизартрия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы и крови (кроветворение, гемостаз): аритмия, бради- или тахикардия, атриовентрикулярная блокада, узловой ритм, неспецифические изменения на электрокардиограмме, синкопе, остановка сердца, снижение артериального давления (преимущественно при парентеральном введении).

Со стороны респираторной системы: усиление фарингеальной и бронхиальной секреции, одышка; угнетение дыхания вплоть до остановки, бронхоспазм (преимущественно при парентеральном введении).

Со стороны органов желудочно-кишечного тракта: гиперсаливация, спастическое сокращение и усиление перистальтики кишечника, тошнота, рвота, метеоризм, диарея.

Прочие: тремор, спазмы и подергивания скелетной мускулатуры, включая фасцикуляции мышц языка, судороги, дизартрия, артралгия; учащение мочеиспускания; обильное потоотделение; аллергические реакции (гиперемия 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 холиноблокаторы.

Передозировка

В случае передозировки (гиперсаливация, проливной пот, боль в животе, понос, затруднение дыхания, брадикардия, цианоз, миоз, подергивание скелетных мышц, мышечная слабость) прием препарата следует прекратить и немедленно ввести атропин (1 мл 0,1 % раствора под кожу) или другие холиноблокаторы. В случаях тяжелого отравления прозеринум, атропина сульфат вводят с интервалами 10 минут до 3 раз (до появления сухости во рту). При возникновении судорог внутривенное введение тиопентала натрия под наблюдением врача.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Неостигмина метилсульфат является антагонистом недеполяризующих миорелаксантов, восстанавливает нарушенную нервно-мышечную проводимость. Поэтому, если после окончания анестезии недеполяризующими миорелаксантами мышечная слабость и угнетение дыхания остаются, неостигмина метилсульфат применяют в качестве антидота этой группы миорелаксантов (атракурии безилат, рокурония бромид, тубокурарина хлорид и др.).

Неостигмина метилсульфат и деполяризующие мышечные релаксанты (суксаметония йодид и др.) фармакологически несовместимы, так как при непосредственном взаимодействии усиливается эффект суксаметония йодида.

M-холиноблокаторы (атропин, гоматропина гидробромид, платифиллин и др.), ганглиоблокаторы (пахикарпина гидройодид), хинидин, новокаинамид,

местные анестетики являются фармакологическими антагонистами неостигмина метилсульфата.

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

Цианокобаламин в больших дозах ослабляет действие неостигмина метилсульфата.

При взаимодействии неостигмина метилсульфата с пиридоксином снижается активность последнего.

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

Эфедрин потенцирует действие неостигмина метилсульфата, поэтому при миастенических кризах его вводят вместе с неостигмином метилсульфатом.

Возможное влияние лекарственного препарата на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими особого внимания и быстроты реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и подкожного введения 0,5 мг/мл.

По 10 ампул с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в коробку из картона.

По 5 или 10 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной или ленты полиэтилентерефталатной.

По 1 или 2 контурные ячейковые упаковки с инструкцией по применению и скарификатором ампульным в пачку из картона.

При упаковке ампул с кольцом излома или точкой надлома скарификатор ампульный не вкладывают.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре от 15 до 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения:

ОАО «Новосибхимфарм»

630028, Россия, г. Новосибирск, ул. Декабристов, 275

тел. (383) 363-32-44;

факс (383) 363-32-55.

Производитель/Организация, принимающая претензии:

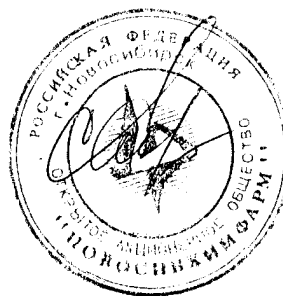
ОАО «Новосибхимфарм»

630028, Россия, г. Новосибирск, ул. Декабристов, 275

тел. (383) 363-32-44;

факс (383) 363-32-55.

Руководитель отдела регистрации
лекарственных средств в РФ
ОАО «Новосибхимфарм»



Гудим С.В.