

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА МЕДИЦИНСКИОТ ПРОИЗВОД

Неостигмин-Ротексмедика 0.5 mg/ml, раствор за инјектирање.

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Активна супстанција: Неостигмин метилсулфат
1 ml раствор за инјектирање содржи 0.5 mg неостигмин метилсулфат.

Погледнете Дел 6.1 за целосна листа на ексципиенси.

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Раствор за инјектирање.

4. КЛИНИЧКИ ОСОБЕНОСТИ

4.1. Терапевтски индикации

Антагонист на не-деполярирачката невромускулна блокада предизвикана од одредени мускулни релаксанти (антагонизирање на ефектот на мускулните релаксанти кои се употребуваат во хирургијата).

Миастенија гравис (нарушување кое предизвикува мускулна слабост).

4.2. Дозирање и начин на примена

Антагонист на не-деполярирачката неуромускулна блокада предизвикана од мускулни релаксанти

Кај пациенти со телесна тежина над 20 kg се администрираат 1 ml до 4 ml на Неостигмин-Ротексмедика 0.5 mg/ml (кои одговараат на 0.5 mg до 2 mg неостигмин метилсулфат). Доколку е потребно, може да се администрираат и до 10 ml Неостигмин-Ротексмедика 0.5 mg/ml (кои одговараат на 5 mg неостигмин метилсулфат).

Со цел да се избегнат мускаринските несакани ефекти, се препорачува истовремена интравенска администрација на 0.5 mg до 1 mg на атропин сулфат.

Кај деца со телесна тежина под 20 kg се даваат 50 µg неостигмин метилсулфат на килограм телесна тежина.

Миастенија гравис

Кај возрасни лица се администрираат 1 ml на Неостигмин-Ротексмедика 0.5 mg/ml неколку пати во текот на денот (кои одговараат на 0.5 mg неостигмин метилсулфат).

Тип и времетраење на примена

Антагонист на не-деполяризирачката неуромускулна блокада предизвикана од мускулни релаксанти

Интравенското инјектирање треба да биде бавно.

Миастенија гравис

Неостигмин-Ротексмедика 0.5 mg/ml се инјектира субкутано или интрамускулно. Доколку лекот е добро толериран, не постои временско ограничување за негова апликација.

4.3. Контраиндикации

НЕОСТИГМИН-РОТЕКСМЕДИКА не треба да се употребува во следниве случаи:

- хиперсензитивност на неостигмин или било која друга компонента на овој лек,
- администрација на деполаризирачки мускулни релаксанти (администрација на одредени мускулни релаксанти како што се соли на суксаметониум или декаметониум),
- воспаление на ирис (иритис),
- бронхијална астма (напади со отежнато дишење како резултат на хиперсензитивност),
- хиперфункција на тироидната жлезда,
- илеус, како и механичка опструкција или грчеви на цревниот, жолчниот или на уринарниот тракт,
- миотонија (мускулни грчеви предизвикани од волева контракција), паркинсонизам (трепетливо движење, состојба која што се карактеризира со неволев тремор, забавување на движењата и ригидност на мускулите),
- постоперативна кардиоваскуларна криза или шок (симптомите се појавуваат после операции, се карактеризираат со ненадеен пад на крвниот притисок и намалување на крвната циркулација).

Потребно е посебно внимание при администрација на НЕОСТИГМИН-РОТЕКСМЕДИКА во случаи на забавено отчукување на срцето, низок крвен притисок, срцева слабост и неодамнешен срцев удар. НЕОСТИГМИН-РОТЕКСМЕДИКА треба да се употребува само после консултација со Вашиот доктор.

4.4. Посебни предупредувања и мерки на претпазливост

Неостигмин-Ротексмедика содржи натриум, но помалку од 1 mmol (23 mg) натриум на една ампула; односно е речиси без натриум.

4.5. Интеракции со други медицински производи и други форми на интеракции

Администрацијата на Неостигмин-Ротексмедика може да резултира со:

- зголемување на ефектот на дериватите на морфинот (аналгетици) и барбитурати (лекови кои се употребуваат за грчеви, како анестетици и како лекови за спиење).
- холинергична криза предизвикана преку примена на директни или индиректни

парасимпатомиметички лекови кај пациенти со миастенија гравис (симптоми на предозирање кога се земаат медицински производи за интестинални и проблеми со мочниот меур кои го зголемуваат ефектот на НЕОСТИГМИН-РОТЕКСМЕДИКА),

- продолжено забавено отчукување на срцето после третман со бета рецепторни блокатори (медицински производи кои главно се употребуваат во случаи на зголемен крвен притисок, неправилно чукање на срцето и намалена крвна циркулација во срцето).

4.6. Бременост и доење

НЕОСТИГМИН-РОТЕКСМЕДИКА не се очекува да навлезе во плацентата или да се излучува во мајчиното млеко.

Интравенска администрација на Неостигмин-Ротексмедика треба да се избегнува за време на бременост поради ризикот од предвремено породување.

Доколку мајката била третирана со Неостигмин-Ротексмедика, новороденчињата треба да се мониторираат за евентуални симптоми на миастенија гравис во првите десет дена после раѓањето.

4.7. Влијание врз способноста за возење или за управување со машини

НЕОСТИГМИН-РОТЕКСМЕДИКА може да влијае на јасно гледање и гледање во темнина. Можно е да не бидете во можност да реагирате на неочекувани и ненадејни ситуации на брз и соодветен начин. Да не се вози кола или друго моторно возило. Да не се управува со било кои електрични апарати или машини. Да не се работи без соодветна заштита. Ве молиме имајте на ум дека алкохолот дополнително ја нарушува Вашата способност за возење.

4.8. Несакани дејства

Следнава скала за податоци за честота е основа за оценување на несакани дејства:

Многу чести:	Повеќе од 1 од 10 пациенти
Чести:	Помалку од 1 од 10 пациенти, но повеќе од 1 од 100 пациенти
Повремени:	Помалку од 1 од 100 пациенти, но повеќе од 1 од 1.000 пациенти
Ретки:	Помалку од 1 од 1.000 пациенти, но повеќе од 1 од 10.000 пациенти
Многу ретки:	Помалку од 1 од 10.000 пациенти
Не е познато:	Не може да се процени честотата врз основа на расположливите податоци.

Можни несакани дејства

Респираторни, торакални и медиастинални нарушувања:

Бронхоспазам (отежнато дишење предизвикано од спазам на малите бронхи).

Нарушувања на гастроинтестиналниот тракт:

Грчеви на гастроинтестиналниот тракт, дијареа.

После вештачко поврзување на делови од тенкото црево со ректумот (илеоректална анастомоза), има зголемен број на протекувања на споевите (анастомозно протекување).

Зголемена саливација.

Кардиоваскуларен систем:

Забавено отчукување на срцето како и намален крвен притисок и потенцијален циркулаторен колапс.

После операции многу често има намалено отчукување на срцето, многу ретко кардијален арест.

Скелетно-мускулни болести, болести на сврзните ткива и коските:

Тремор на мускулите (фасцикулации), мускулни грчеви (спазам) и мускулна слабост, парализа при повисоки дози.

Болести на кожа и хиподерма:

Зголемено потење.

4.9. Предозирање

а) Симптоми на предозирање

Може да доведе до дијареа, абдоминални колики, гадење, повраќање, потење, брадикардија, хипотензија, мускулна слабост и отежнато голтање; при многу високи дози: невромускулна блокада со респираторна инсуфициенција.

б) Терапевтски мерки после предозирање:

Мускаринските симптоми, особено гастро-интестиналните проблеми се ублажуваат со администрирање на атропин сулфат (2 mg до 4 mg интравенски или субкутано).

5. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА

5.1. Фармакодинамски својства

Фармакотерапевтска група: Холинестераза инхибитор
АТЦ код: N07AA01

Неостигмин е периферен реверзибилен холинестераза инхибитор. Тој предизвикува контракција на цилијарниот мускул на окото, миоза, инхибиција на акомодација и намалување на интраокуларниот притисок во окото, намалување на срцевата фреквенција и забрзана кондукција во срцевиот мускул, мускулна контракција и зголемена секреција на бронхиите, зголемена секреција на желудникот и тенкото црево во гастроинтестиналниот тракт, контракции на жолчното кесе, уретер, на мускул детрузор на мочниот меур и релаксација на уретралниот сфинктер и зголемено потење. Ниски дози предизвикуваат фасцикулации во скелетните мускули и високи дози резултираат во хиперполаризација (парализа). Неостигмин е тешко растворлив во масти и не ја поминува крвно-мозочната бариера, па така што нема ефекти врз централниот

нервен систем.

5.2. Фармакокинетски својства

Неостигмин е кватернерно амониумово соодиноение кое што слабо се абсорбира после орална администрација. Кога се администрира 1 до 50 mmol од ^{14}C -означен неостигмин кај стаорци, приближно 5% од дозата се абсорбира. Кај луѓето, после орална администрација на 30 mg на неостигмин бромид, се претпоставува средна биорасположливост од приближно 1% до 2%, меѓутоа може да постојат значителни варијации кај поединци.

После парентерална администрација, неостигмин бромид брзо се дистрибуира во екстрацелуларниот простор со полуживот на дистрибуција помеѓу 1 и 3 минути. Особено високи концентрации може да се најдат во мускулите и ткивата на црниот дроб.

Неостигмин најверојатно се метаболизира во црниот дроб. Метаболитите се хидроксифенил триметил амониумови јони, хидроксифенил триметил амин како и нивните глюкоронид конјугати. После интрамускулна администрација на неостигмин, околу 80% се екскретираат непроменети во урината или како метаболити во тек на 24 часа: приближно 50% непроменети, 15% како 3-хидроксифенил триметил амониумови јони и 15% како непознати метаболити.

Полувремето на елиминација после интравенска администрација е помеѓу 24 и 80 минути, клиренсот е помеѓу 9 и 14 ml/min на килограм телесна тежина. Полувремето на елиминација кај деца на возраст помеѓу 2 и 12 месеци е значително пониско. Во случај на нарушена функција на бубрезите, времето на елиминација е подолго.

5.3. Претклинички податоци за безбедноста на медицинскиот производ

а) Акутна токсичност

Акутниот LD_{50} на неостигмин метилсулфат кај глвци е $0.66 (0.56 \pm 0.80)$ mg/kg телесна тежина за субкутана администрација и 0.47 mg/kg телесна тежина за интравенска администрација. LD_{50} после пет дена од орална администрација на таблети неостигмин бромид е 7.95 ± 1.65 mg/kg телесна тежина и ден кај глвци, 154.5 ± 26.5 mg/kg телесна тежина и ден кај стаорци.

Види исто така дел 4.9 “Предозирање”

б) Хронична токсичност / субхронична токсичност

Студиите на субхронична токсичност кај стаорци и зајци покажуваат дека хроничната администрација на неостигмин резултира во развој на толеранција што се должи на намалување на ацетилхолинските рецептори.

ц) Мутаген и тумороген потенцијал

Неостигмин не е доволно анализиран за мутагеност. Истражувањата спроведени до сега не покажуваат докази за мутаген ефект. Не постојат долгорочни студии за тумороген потенцијал.

д) Репродуктивна токсичност

Неостигмин не е детално испитуван за токсиколошки ефекти врз репродукцијата. Во клиничка студија со 22 бремени жени, на кои им било администрирано неостигмин во

првото тромесечие од бременоста, се покажало дека не постои врска со конгенитални (вродени) дефекти.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ОСОБЕНОСТИ

6.1. Листа на ексципиенти

Натриум хлорид, вода за инјекции.
Инертен гас: азот

6.2. Инкомпатибилност

Не се познати со сега било какви инкомпатибилности.

6.3. Рок на траење

Рок на траење на растворот на неотворен контејнер е 3 години.
Растворот е наменет само за еднократна употреба. Растворот треба да се употреби веднаш после отварање на ампулата. Да се фрли содржината останата во ампулата.

Да не се употребува овој лек после истекот на рокот на употреба, назначен на надворешното пакување.

Да се употребуваат само бистри раствори во неоштетени контејнери.

6.4. Специјални мерки за чување

Да не се чува на температура повисока од 25°C.
Чувајте ги ампулите во надворешното пакување со цел да се заштити содржината од светлина.

6.5. Природа и содржина на амбалажата

Болничко пакување со 100 (10 x 10) ампули од 1 ml раствор за инјектирање.

6.6. Посебни мерки на претпазливост при употреба и ракување

Не се потребни посебни мерки.

7. НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕ ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕК ВО ПРОМЕТ

ЕЛБИЈОР ДОО увоз-извоз
ул. "Огњан Прица" бр. 41
1000 Скопје
Р. Македонија

8. БРОЈ И ДАТУМ НА РЕШЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ
9. ДАТУМ НА ПРВАТА РЕГИСТРАЦИЈА/ОБНОВА НА РЕГИСТРАЦИЈАТА
10. ДАТУМ НА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Јули, 2015