**甲硫酸新斯的明**

文章版本号：1

最后发布时间：2013-6-5 21:13:58

**【药物名称】**

中文通用名称：甲硫酸新斯的明

英文通用名称：Neostigmine Methylsulfate

其他名称：甲基硫酸普洛色林、甲基硫酸新斯的明、依定、Neoserin、Prostigmin、Prostigmine Methylsulfate。

**【药理分类】**

神经系统用药>>作用于自主神经系统药>>拟胆碱药>>胆碱酯酶抑制药

其它药物>>解毒药>>药物中毒解毒药

其它药物>>诊断用药>>器官功能检查用药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.用于重症肌无力。

2.用于手术后腹部胀气和尿潴留。

3.用于手术结束时拮抗非去极化肌肉松弛药的残留肌松作用。

**其他临床应用参考**

用于阵发性室上性心动过速、阿托品过量中毒、青光眼、外伤或炎症后引起的运动障碍。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·重症肌无力

1.皮下注射  一次0.25-1mg，一日1-3次。极量为一次1mg，一日5mg。

2.肌内注射  (1)诊断重症肌无力：注射本药0.5-1mg后20-30分钟，如肌力改善并持续1小时以上，则可确诊。应同时肌内注射阿托品0.5mg，以消除本药的M胆碱样不良反应。(2)治疗重症肌无力：同皮下注射项。(3)治疗重症肌无力危象：一次1mg，然后每30分钟1次，好转后改用口服溴新斯的明，分泌物增多时可用阿托品0.5-1mg肌内注射。

3.静脉注射  一次0.005-0.02mg/kg。

·手术后腹部胀气和尿潴留

1.皮下注射  同“重症肌无力”。

2.肌内注射  同皮下注射项。

·拮抗非去极化肌松药的肌松作用

1.皮下注射  同“重症肌无力”。

2.肌内注射  同皮下注射项。

3.静脉注射  静脉注射前应观察吸入或静脉全麻药的作用是否接近消失、肌张力是否有开始恢复的迹象等，以决定是否用药。用量依据肌松程度(一般按电刺激尺神经测定小鱼际肌的收缩强度)而定。首次静脉注射0.5-2mg，以5mg为极限，维持量为一次0.5mg，应与适量阿托品(一般为0.5-1mg)合用。

**儿童**

◆常规剂量

·拮抗非去极化肌松药的肌松作用

1.肌内注射  一次0.04mg/kg，同时给予阿托品0.02mg/kg。

2.静脉注射  同肌内注射项。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·重症肌无力

1.皮下注射  起始剂量一次0.5mg，随后剂量根据患者反应调整。一旦患者耐受，应尽快改为口服溴新斯的明。

2.肌内注射  同皮下注射项。

·手术后腹部胀气

1.皮下注射  (1)预防：一次0.25mg，术后立即注射，每4-6小时重复1次，连用2-3日。(2)治疗：一次0.5mg。

2.肌内注射  同皮下注射项。

·手术后尿潴留

1.皮下注射  (1)预防：一次0.25mg，术后立即注射，每4-6小时重复1次，连用2-3日。(2)治疗：起始剂量一次0.5mg。1小时后如患者无反应，应进行导尿并每3小时重复注射0.5mg，至少连用5剂。

2.肌内注射  同皮下注射项。

·拮抗非去极化肌松药的肌松作用

1.静脉注射  一次0.5-2mg，缓慢注射，同时给予硫酸阿托品。必要时重复，总量一般不超过5mg。

**【禁忌症】**

1.对本药过敏或过敏体质者。

2.哮喘患者。

3.心律失常(如窦性心动过缓、室性心动过速)者。

4.心绞痛患者。

5.低血压患者。

6.机械性肠梗阻或尿路梗阻患者。

7.癫痫患者。

8.迷走神经张力升高者。

9.腹膜炎患者(国外资料)。

**【慎用】**

1.甲状腺功能亢进者。

2.帕金森病患者。

3.胃肠道疾病(包括消化性溃疡)患者(国外资料)。

4.有癫痫史者(国外资料)。

**【特殊人群】**

**儿童**

儿童用药参见“用法与用量”项。

**老人**

尚无老年人使用本药的安全性资料。

**妊娠期妇女**

1.妊娠期妇女用药的安全性和有效性尚未确立。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为C级。

**哺乳期妇女**

哺乳期妇女用药的安全性和有效性尚未确立。

**【不良反应】**

1.神经系统  常见的不良反应主要由胆碱能神经过度兴奋引起，包括恶心、呕吐、腹泻、流泪、流涎等，严重时可出现焦虑不安、恐惧、言语不清、惊厥、共济失调、昏迷甚至心脏停搏。

2.皮肤  可见药疹。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.美维库铵：

结果：合用可使麻醉后的神经肌肉阻滞作用恢复延迟。

机制：本药可能抑制美维库铵的代谢。

2.干扰肌肉传递的药物(如奎尼丁)：

结果：合用可使本药作用减弱。

处理：不宜合用。

3.糖皮质激素：

结果：糖皮质激素单独应用可增强肌力，但与本药合用反而使肌力下降。

4.阿托品：

结果：合用时阿托品可掩盖本药过量导致的部分中毒症状。

处理：合用时应密切观察。

**【注意事项】**

**用药警示**

本药不宜与去极化型肌松药合用。

**【国外专科用药信息参考】**

**精神状况信息**

对精神状态的影响：本药极少引起嗜睡、不安或激动。

**护理注意事项**

1.对于膀胱括约肌无力的患者，用药前应评估膀胱充盈度。

2.监测患者是否出现出现胆碱能危象。

**【药物过量】**

**过量的表现**

用药过量可致胆碱能危象，甚至心脏停搏。

**过量的处理**

过量中毒时，可给予阿托品对抗。

**【药理】**

**药效学**

本药为新斯的明的甲硫酸盐，是可逆性的胆碱酯酶抑制药。本药通过抑制胆碱酯酶活性而发挥拟胆碱作用，可直接激动骨骼肌运动终板上的烟碱样受体(N2受体)，促进胃收缩和增加胃酸分泌，并促进小肠、大肠，尤其是结肠的蠕动，从而防止肠道弛缓、促进肠内容物向下推进。本药作用特点为对腺体、眼、心血管、支气管平滑肌及胃肠道平滑肌作用较弱，对骨骼肌作用较强。本药对中枢神经系统的毒性较毒扁豆碱小。

**药动学**

本药皮下及肌内注射吸收快，肌内和静脉注射后，起效时间分别为10-30分钟和4-8分钟，达峰时间分别为0.5小时和6分钟，作用持续时间为2-4小时。血浆蛋白结合率为15%-25%。本药既可被血浆中胆碱酯酶水解，亦可在肝脏中代谢。80%的药物于24小时内随尿排出，其中原形药物占给药量50%，15%以代谢物(3-羟基苯-3-甲基铵)形式排出。肌内和静脉注射后，半衰期分别为51-90分钟和47-60分钟。儿童消除半衰期明显较成人短，但其治疗作用持续时间未明显缩短。肾功能不全患者半衰期明显延长。

**【制剂与规格】**

甲硫酸新斯的明注射液  (1)1ml:0.25mg。(2)1ml:0.5mg。(3)1ml:1mg。(4)2ml:1mg。

注射用甲硫酸新斯的明  1mg。

**【贮藏】**

注射液：遮光、密闭保存。

粉针剂：遮光、密闭保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 92753 版本 1.0