

REZUMATUL CARACTERISTICILOR PRODUSULUI

1. DENUMIREA COMERCIALĂ A MEDICAMENTULUI

Suxametonium clorură Aguettant 10 mg/ml soluție injectabilă în seringă preumplută

2. COMPOZIȚIA CALITATIVĂ ȘI CANTITATIVĂ

Fiecare ml de soluție injectabilă conține clorură de suxametoniu anhidră 10 mg (echivalent cu suxametoniu dihidrat 11 mg).

Fiecare seringă preumplută de 10 ml conține clorură de suxametoniu anhidră 100 mg (echivalent cu clorură de suxametoniu dihidrat 110 mg).

Excipient cu efect cunoscut:

Fiecare ml de soluție injectabilă conține 2,79 mg echivalent cu 0,12 mmol de sodiu.

Fiecare seringă preumplută de 10 ml conține 27,9 mg echivalent cu 1,2 mmol de sodiu.

Pentru lista tuturor excipienților, vezi pct. 6.1.

3. FORMA FARMACEUTICĂ

Soluție injectabilă (injecție).

Soluție limpede și incoloră.

pH: 3,0 - 4,5

Osmolalitate: 250-350 mOsm/kg

4. DATE CLINICE

4.1 Indicații terapeutice

Suxametonium clorură Aguettant este indicat ca relaxant muscular pentru a facilita intubația endotraheală în timpul inducerii anesteziei generale sau în situații de urgență în calitate de relaxant muscular pentru a facilita intubația endotraheală, la adulți, copii și adolescenți cu vârsta de peste 12 ani.

4.2 Doze și mod de administrare

Suxametonium trebuie să fie administrat numai de către sau sub atenta supraveghere a unui clinician cu experiență (anestezist, specialist în terapia intensivă, medic de medicină de urgență) familiarizat cu acțiunea, caracteristicile și pericolele sale, care este calificat în managementul intubației și al respirației artificiale și numai în cazul în care există dotări adecvate pentru intubarea endotraheală imediată cu administrarea de oxigen prin ventilație cu presiune pozitivă intermitentă. Se administrează intravenos după ce a fost indusă anestezia și nu trebuie administrat pacientului conștient.

Doze

Adulți

Pentru a realiza intubarea endotraheală, clorura de suxametoniu se administrează, de obicei, prin injecție intravenoasă în bolus în doză de 1 mg/kg greutate corporală. Această doză produce, de obicei, relaxarea musculară în aproximativ 30-60 de secunde și are o durată de acțiune de aproximativ 2-6 minute. Dozele mai mari vor produce o relaxare musculară prelungită, însă dublarea dozei nu va dubla neapărat durata relaxării.

Suxametonium clorură Aguetant este limitat la o singură administrare.

Utilizarea de doze mici de relaxante musculare nedepolarizante administrate cu câteva minute înainte de administrarea de suxametoniu a fost recomandată pentru reducerea incidenței și severității durerii musculare asociate cu suxametoniu. Aceasta tehnică poate necesita utilizarea unor doze suplimentare de 1 mg/kg de clorură de suxametoniu pentru a obține condiții satisfăcătoare pentru intubația endotraheală (vezi pct. 4.4).

Grupe speciale de pacienți

Vârstnici

Dozele de suxametoniu la vârstnici sunt comparabile cu cele pentru adulți.

Insuficiență renală

O singură doză de suxametoniu poate fi administrată pacienților cu insuficiență renală în absența hiperkaliemiei. Dozele multiple sau mai mari pot determina creșteri semnificative clinice ale nivelului de potasiu seric și nu trebuie folosite.

Insuficiență hepatică

Nu este necesară ajustarea dozei la pacienții cu insuficiență hepatică. Întreruperea acțiunii suxametonului este dependentă de colinesteraza plasmatică, care este sintetizată la nivel hepatic. Deși la pacienții cu boli hepatice nivelurile colinesterazei plasmatice de multe ori scad, ele sunt rareori suficient de scăzute pentru a prelungi în mod semnificativ apneea indusă de suxametoniu (vezi pct. 4.4).

Copii și adolescenți

Adolescenți cu vârsta de peste 12 ani: doza este similară cu cea pentru adulți.

Suxametonium clorură Aguetant nu este recomandat copiilor cu vârsta sub 12 ani, deoarece subgradarea seringii preumplute nu permite o administrare exactă a medicamentului la această populație.

Mod de administrare

Suxametonium clorură Aguetant este destinat utilizării intravenoase. Seringa preumplută nu este indicată pentru utilizare în injectomat.

4.3 Contraindicații

- Hipersensibilitate la substanța activă sau la oricare dintre excipienții enumerați la pct. 6.1.
- Suxametoniu nu are efect asupra stării de conștiență și nu trebuie administrat la pacienții care nu se află sub anestezie generală (vezi pct. 4.2).
- Antecedente personale sau familiale de hipertermie malignă. Suxametoniu poate declanșa contracții miofibrilare prelungite la persoanele sensibile (vezi pct. 4.4).
- Pacienții cunoscuți ca având o activitate atipică ereditară a colinesterazei plasmatice (butirilcolinesterazei) (istoric al răspunsului anterior prelungit și/sau intensificat – vezi pct. 4.4)
- Pacienți cu hiperkaliemie sau care sunt predispuși la aceasta (vezi pct. 4.4). Suxametoniu este contraindicat la pacienții:

- cu hiperkaliemie preexistentă. În absența hiperkaliemiei și neuropatiei, insuficiența renală nu constituie o contraindicație pentru administrarea unei doze unice normale de suxametoniu injectabil, însă dozele multiple sau mari pot determina creșteri semnificative clinic ale nivelului de potasiu seric și nu trebuie utilizate.
 - În perioada de recuperare după traume majore sau arsuri severe. Perioada cu cel mai mare risc de hiperkaliemie poate fi prelungită dacă există o infecție persistentă cu vindecare întârziată.
 - Cu deficite neurologice acute și pierderi importante ale masei musculare (de exemplu, leziuni ale neuronilor motori superiori și/sau inferiori); potențialul de eliberare de potasiu apare în primele 6 luni după debutul acut al deficitului neurologic și se corelează cu gradul de extindere a paraliziei musculare. Pacienții imobilizați pentru perioade prelungite de timp pot prezenta un risc similar.
- Pacienții cu miopatii musculare scheletice (de exemplu, distrofia musculară Duchenne), întrucât administrarea de suxametoniu se poate asocia cu hipertermie malignă, aritmii ventriculare și stop cardiac secundar rabdmiolizei acute asociate cu hiperkaliemie.
 - Antecedente personale sau familiale de boli miotonice congenitale, cum ar fi miotonia congenitală și distrofia miotonică (risc de spasme miotonice severe și rigiditate).
 - Suxametoniu determină o creștere tranzitorie semnificativă a tensiunii intraoculare și prin urmare, nu trebuie utilizat în prezența leziunilor oculare deschise sau în cazul în care o creștere a tensiunii intraoculare este nedorită, cu excepția cazului în care beneficiul potențial al utilizării sale depășește riscul potențial pentru ochi.

4.4 Atenționări și precauții speciale pentru utilizare

Suxametoniu paralizează mușchii respiratori, precum și alți mușchi scheletici, dar nu are niciun efect asupra conștienței.

Se recomandă utilizarea unei tehnici adecvate de monitorizare neuromusculară pentru evaluarea blocului neuromuscular și a recuperării.

Reacție anafilactică

În timpul inducției anestezice sunt raportate uneori reacții anafilactice alergice sau nealergice, la pacienții care nu au fost niciodată expuși la curara. Cele mai frecvente manifestări sunt erupția cutanată (de tip eritem) sau erupția cutanată tranzitorie, generalizată sau limitată la locul injectării, care poate evolua la șoc anafilactic și/sau bronhospasm. În anumite cazuri, bronhospasmul și/sau șocul anafilactic nu sunt asociate cu manifestări cutanate. De asemenea a fost raportat și edemul Quincke.

Apariția primului semn impune întreruperea definitivă a Suxametonium clorură Aguetant, dacă administrarea nu a fost complet efectuată ca și administrarea de tratament simptomatic.

În caz de reacție alergică, trebuie administrat tratament simptomatic. De asemenea, trebuie efectuate testele alergologice (proba imediată, apoi testul cutanat) (vezi pct. 4.8).

Sensibilitate încrucișată

Au fost raportate rate mari de sensibilitate încrucișată (mai mare de 50 %) între medicamentele blocante neuromusculare. De aceea, dacă este posibil, înainte de administrarea suxametonului, trebuie exclusă hipersensibilitatea la alte medicamente blocante neuromusculare. La pacienții susceptibili, suxametoniu trebuie utilizat numai atunci când este absolut necesar. Pacienții care prezintă o reacție de hipersensibilitate sub anestezie generală trebuie testați ulterior pentru hipersensibilitate la alte blocante neuromusculare.

Reducerea activității sau deficit de colinesterază plasmatică

Suxametoniu este hidrolizat rapid de colinesteraza plasmatică, ceea ce limitează intensitatea și durata blocajului neuromuscular. Persoanele cu activitate scăzută a colinesterazei plasmatică prezintă un răspuns prelungit la suxametoniu. Aproximativ 0,05 % din populație are o cauză ereditară a activității

reduse a colinesterazei, determinând o durată prelungită de acțiune a suxametonului cu mai mult de 1 oră. În cazul curarizării prelungite, trebuie continuată ventilația controlată până la apariția respirației spontane și normalizarea funcției musculare.

Blocajul neuromuscular prelungit și intensificat după injectarea suxametonului poate apărea ca urmare a reducerii activității colinesterazei plasmatice în următoarele stări sau afecțiuni patologice:

- variație fiziologică, așa cum este în timpul sarcinii și în perioada post-natală (vezi pct. 4.6);
- colinesterază plasmatică anormală determinată genetic (vezi pct. 4.3);
- tetanos generalizat sever, tuberculoză, alte infecții severe sau cronice;
- arsuri severe (vezi pct. 4.3);
- afecțiuni debilitante cronice, tumori maligne, anemie cronică și malnutriție;
- insuficiență hepatică în stadiu final, insuficiență renală acută sau cronică (vezi pct. 4.2);
- boli autoimune: mixedem;
- boli de colagen;
- iatrogene: după schimbul de plasmă, plasmafereză, bypass cardio-pulmonar și ca urmare a terapiei concomitente cu medicamente (vezi pct. 4.5).

Hipertermie malignă

Deoarece suxametonul poate fi utilizat concomitent cu alte medicamente anestezice (halogenate) și întrucât hipertermia malignă poate apărea în timpul anesteziei, chiar și în absența factorului declanșator cunoscut, medicii trebuie să fie familiarizați cu semnele precoce, cu diagnosticarea și cu tratamentul hipertermiei maligne. Spasmul izolat al maseterului poate apărea și poate împiedica intubarea în timp ce alți mușchi sunt relaxați, dar acesta ar putea fi, de asemenea, un semn precoce de hipertermie malignă, astfel încât trebuie să fie căutate alte semne de criză hipertermică malignă.

Dacă apare hipertermie malignă, toate medicamentele anestezice despre care se știe că sunt asociate cu aceasta (inclusiv suxametonul) trebuie să fie întrerupte și trebuie puse imediat în aplicare măsuri complete de susținere a funcțiilor vitale. Principalul medicament terapeutic specific este dantrolen sodic cu administrare intravenoasă, care trebuie administrat cât mai curând posibil după stabilirea diagnosticului.

Dureri musculare

După administrarea de suxametoniu apar deseori dureri musculare; acestea se întâlnesc cel mai frecvent la pacienții ambulatorii supuși unor proceduri chirurgicale de scurtă durată sub anestezie generală (vezi pct. 4.8). Se pare că nu există nicio legătură directă între gradul de fasciculație musculară vizibilă după administrarea suxametonului și incidența sau severitatea durerii.

Suxametonul trebuie utilizat cu precauție la pacienții cu fracturi sau spasme musculare, întrucât fasciculațiile musculare inițiale pot provoca traumatisme suplimentare.

Hiperkaliemie

O creștere tranzitorie a potasiului seric apare adesea după administrarea suxametonului la persoanele sănătoase; amplitudinea acestei creșteri este de ordinul a 0,5 mmol/litru. În anumite stări sau afecțiuni patologice, această creștere a potasiului seric după administrarea de suxametoniu poate fi excesivă și poate determina aritmii cardiace grave și stop cardiac. La pacienții cu sepsis sever, potențialul de hiperkaliemie pare să fie legat de severitatea și durata infecției.

Miastenia gravis și alte sindroame miastenice

Nu se recomandă administrarea de suxametoniu pacienților cu miastenia gravis în stadiu avansat. Cu toate că acești pacienți sunt rezistenți la suxametoniu, ei dezvoltă o stare de bloc de fază II care poate duce la o recuperare întârziată. Pacienții cu sindromul miastenic Lambert-Eaton sunt mai sensibili la suxametoniu decât persoanele sănătoase, necesitând reducerea dozei.

Bradycardie și alte tulburări de ritm cardiac

Suxametonul nu are efect direct asupra miocardului, dar atât prin stimularea ganglionilor autonomi, cât și a receptorilor muscarinici suxametonul poate determina modificări ale ritmului cardiac, inclusiv stop cardiac.

La adulții sănătoși, suxametonul determină ocazional o ușoară încetinire tranzitorie a frecvenței cardiace la administrarea inițială. Bradycardia se observă mai frecvent la copii și la administrarea repetată de suxametoniu atât la copii, cât și la adulți. De asemenea, suxametonul poate potența

bradicardia determinată de halotan sau de alte medicamente. Acest lucru trebuie avut în vedere atunci când în timpul procedurilor anestezice sunt utilizate ambele medicamente. Tratamentul anterior cu atropină sau glicopirilat intravenos reduce semnificativ incidența și severitatea bradicardiei asociate cu suxametoniu.

În absența hiperkaliemiei preexistente sau determinate, rareori se observă aritmii ventriculare în urma administrării de suxametoniu. Cu toate acestea, pacienții care iau medicamente digitale sunt mai predispuși la astfel de aritmii.

Efecte muscarinice

Efectele muscarinice ale suxametonului, de exemplu creșterea secrețiilor bronșice și salivare, pot fi prevenite prin administrarea profilactică de atropină.

Creșterea tensiunii intraoculare

Administrarea de suxametoniu nu este recomandată la pacienții supuși unei intervenții chirurgicale deschise pe globul ocular.

Conținutul în sodiu

Acest medicament conține 27,9 mg de sodiu per 10 ml, echivalent cu 1,4 % din doza zilnică maximă recomandată de OMS de 2 g sodiu pentru un adult.

Copii și adolescenți

Acest medicament nu este recomandat copiilor cu vârsta sub 12 ani, deoarece sub-gradarea seringii preumplute nu permite o administrare exactă a medicamentului la această populație. În cazul utilizării la populația cu vârsta de peste 12 ani, este necesară prudență, întrucât pacienții mai tineri sunt mult mai susceptibili de a avea o miopatie nedagnosticată sau o predispoziție necunoscută la hipertermia malignă și rhabdomioliză, care îi plasează în grupul de risc crescut de reacții adverse grave în urma administrării de suxametoniu (vezi punctele 4.3 și 4.8).

4.5 Interacțiuni cu alte medicamente și alte forme de interacțiune

Anumite medicamente sau substanțe chimice **sunt cunoscute pentru reducerea activității normale a colinesterazei plasmatice și** prin urmare, pot **prelungi efectele blocante neuromusculare** ale suxametonului:

- *Antipsihotice*: fenelzină, promazină
- *Citotoxice*: ciclofosfamidă, tiotepa, irinotecan
- *Medicamente anestezice generale*: ketamină
- *Antagoniști ai histaminei*: concentrațiile mari de cimetidină pot inhiba pseudocolinesteraza
- *Anestezice locale și/sau antiaritmice*: procaină, clorprocaină, lidocaină și procainamidă
- *Metoclopramid*
- *Parasimpatice*: donepezil, galantamină, neostigmină, piridostigmină, rivastigmină, edrofoniu, clorhidrat de tacrin
- *Simptomimetice (beta-agoniste)*: bambuterol și terbutalină
- *Substanțe organofosforice*: diazinon, malation, clorpirifos, diclorvos, propetamfos, dimpilat
- *Picături oftalmice ecotiopate*
- *Inhibitori selectivi ai recaptării serotoninei (ISRS)*

• *Alte medicamente cu efect potențial dăunător asupra activității colinesterazei plasmatice:* aprotinină, clorpromazină, estrogeni și contraceptive orale care conțin estrogeni, oxitocină, steroizi în doză mare.

Anumite medicamente sau substanțe **pot intensifica** sau **prelungi** efectele blocante neuromusculare ale suxametonului prin mecanisme **care nu au legătură cu activitatea colinesterazei plasmatice:**

- *Antiaritmice:* chinidină, verapamil
- *Antibacteriene* (efecte intensificate ale suxametonului): aminoglicozide, lincosamide (cum ar fi clindamicina și lincomicina), polimixine (cum ar fi colistina și polimixina B) și vancomicina
- *Anticonvulsivante:* carbamazepină, fenitoină
- *Beta-blocante* (bloc neuromuscular intensificat/prelungit): esmolol
- *Imunomodulatoare* (bloc neuromuscular prelungit): azatioprină
- *Carbonat de litiu*
- *Chinină și clorochină*
- *Magneziu:* magneziu parenteral (bloc neuromuscular intensificat)
- *Medicamente inhalatorii volatile:* halotanul, enfluranul, desfluranul, izofluranul, eterul dietilic și metoxifluranul au efect redus asupra fazei I de blocare a injecției de suxametoniu, dar vor accelera debutul și vor spori intensitatea fazei II a blocului indus de suxametoniu

Anumite medicamente sau substanțe **pot exacerba unele reacții adverse** ale suxametonului:

- *Glicozide cardiotonice:* pacienții cărora li se administrează medicamente de tip digitalice sunt mai predispuși la efectele hiperkaliemiei exacerbate de suxametoniu.
- *Medicamente anestezice generale:* propofol (risc crescut de depresie miocardică și bradicardie)

Alte interacțiuni

• *Blocante neuromusculare competitive:* asocierea blocantelor neuromusculare competitive poate avea efecte adiționale sau sinergice. Cu toate acestea, succesiunea de administrare, de asemenea, poate afecta interacțiunea. Utilizarea anterioară a unei doze mici de blocant neuromuscular competitiv (de exemplu vecuroniu), în general, reduce efectele suxametonului, dar dacă suxametoniu este administrat în timpul recuperării după un blocant neuromuscular competitiv, pot să apară antagonism, amplificare sau o combinație a acestor două efecte. Efectele unui blocant competitiv pot crește dacă acesta este administrat după suxametoniu.

4.6 Fertilitatea, sarcina și alăptarea

Sarcina

Suxametoniu nu are acțiune directă asupra uterului sau a altor structuri musculare netede. În doze terapeutice normale, acesta nu traversează bariera placentară în cantități suficiente pentru a afecta mișcările respiratorii fetale.

Beneficiile utilizării suxametonului ca parte a unei secvențe rapide de inducție a anesteziei generale depășesc în mod normal riscul posibil pentru făt.

Nivelurile de colinesterază plasmatică se încadrează în timpul primului trimestru de sarcină la aproximativ 70 - 80% din valorile anterioare sarcinii; o scădere ulterioară la aproximativ 60-70 % din valorile anterioare sarcinii se produce în termen de la 2 până la 4 zile după naștere. Nivelurile de colinesterază plasmatică cresc apoi pentru a atinge valoarea normală în următoarele 6 săptămâni. În consecință, o proporție mare de paciente gravide și puerperale poate prezenta un bloc neuromuscular

ușor prelungit după injectarea de suxametoniu (vezi pct. 4.4). Suxametoniu nu este embriotoxic sau teratogen la două specii de animale. Dacă este necesar, se poate lua în considerare utilizarea de suxametoniu în timpul sarcinii. Cu toate acestea, este necesară prudență în urma administrării suxametonului la pacientele gravide și în perioada post-natală.

Alăptarea

Nu se cunoaște dacă suxametoniu sau metaboliții săi sunt excretați în laptele uman. Cu toate acestea, întrucât suxametoniu este hidrolizat de către colinesteraza plasmatică (pseudocolinesteraza) într-un metabolit inactiv, nu se anticipează efecte asupra nou-născuților/sugarilor alăptați la sân.

Fertilitatea

Nu există date privind efectul utilizării suxametonului asupra fertilității. Cu toate acestea, deoarece suxametoniu este hidrolizat rapid de colinesteraza plasmatică (pseudocolinesteraza) într-un metabolit inactiv, nu se anticipează efecte asupra fertilității după încetarea efectului farmacologic.

4.7 Efecte asupra capacității de a conduce vehicule și de a folosi utilaje

Suxametoniu clorură Aguettant are influență majoră asupra capacității de a conduce vehicule și de a folosi utilaje.

Suxametoniu va fi utilizat întotdeauna în asociere cu un anesteziec general și prin urmare, se aplică precauțiile obișnuite legate de îndeplinirea sarcinilor după anestezia generală.

4.8 Reacții adverse

Reacțiile adverse sunt enumerate mai jos în funcție de clasele de sisteme, organe și de frecvență. Frecvențele estimate au fost determinate pe baza datelor publicate. Frecvențele sunt definite după cum urmează: foarte frecvente ($\geq 1/10$), frecvente ($\geq 1/100$ și $< 1/10$), mai puțin frecvente ($\geq 1/1000$ și $< 1/100$), rare ($\geq 1/10000$ și $< 1/1000$), foarte rare ($< 1/10000$).

<i>Tulburări ale sistemului imunitar</i>	
Frecvente	Reacții anafilactice alergice sau nealergice (eliberare nespecifică de histamină), prurit, tulburări cardiovasculare, bronhospasm, șoc anafilactic grav (ar putea fi letal) (vezi pct. 4.4).
Cu frecvență necunoscută	Edem Quincke
<i>Tulburări ale sistemului nervos</i>	
Frecvente	Creșterea tranzitorie a presiunii intracraniene*
<i>Tulburări oculare</i>	
Frecvente	Creșterea tensiunii intraoculare*
<i>Tulburări cardiace</i>	
Frecvente	Aritmii (inclusiv aritmii ventriculare), bradicardie, tahicardie.
Cu frecvență necunoscută	Stop cardiac.
<i>Tulburări vasculare</i>	
Frecvente	Înroșirea pielii, hipotensiune arterială
Cu frecvență necunoscută	Hipertensiune arterială
<i>Tulburări respiratorii, toracice și mediastinale</i>	
Rare	Bronhospasm, deprimare respiratorie prelungită
Cu frecvență necunoscută	Secreție bronșică excesivă, apnee
<i>Tulburări gastrointestinale</i>	
Frecvente	Creșterea presiunii intragastrice*
Cu frecvență necunoscută	Secreție gastrică excesivă Mărirea glandei salivare
De asemenea, a fost raportată hipersalivație.	
<i>Tulburări cutanate și ale țesutului subcutanat</i>	
Frecvente	Erupecții cutanate tranzitorii
<i>Tulburări musculo-scheletice și ale țesutului conjunctiv</i>	
Foarte frecvente	Fasciculații musculare, dureri musculare postoperatorii (vezi pct. 4.4)
Frecvente	Mioglobinemie, mioglobinurie
Rare	Trismus
Cu frecvență necunoscută	Rabdomioliză (vezi punctele 4.3 și 4.4)
<i>Tulburări generale și la nivelul locului de administrare</i>	
Frecvente	Eritem la nivelul locului de injectare
Rare	Hipertermie malignă (vezi pct. 4.4)
<i>Investigații diagnostice</i>	
Frecvente	Creșterea tranzitorie a nivelului de potasiu în sânge

*Creșterea inițială a presiunii intracraniene, intraoculare și intragastrice se normalizează în câteva minute.

Descrierea reacțiilor adverse selectate

Există raportări de cazuri de stop cardiac legate de hiperkaliemie în urma administrării suxametonului la pacienții cu paralizie cerebrală congenitală, tetanos, leziuni ale măduvei spinării, distrofie musculară și leziuni închise la nivelul capului. Astfel de evenimente au fost raportate rar la copiii cu tulburări musculare nediagnosticate anterior.

Raportarea reacțiilor adverse suspectate

Raportarea reacțiilor adverse suspectate după autorizarea medicamentului este importantă. Acest lucru permite monitorizarea continuă a raportului beneficiu/risc al medicamentului. Profesioniștii din domeniul sănătății sunt rugați să raporteze orice reacție adversă suspectată la

Agenția Națională a Medicamentului și a Dispozitivelor Medicale din România

Str. Aviator Sănătescu nr. 48, sector 1

București 011478- RO

e-mail: adr@anm.ro

Website: www.anm.ro

4.9 Supradozaj

Apneea și paralizia musculară prelungită reprezintă principalele efecte grave ale supradozajului. Prin urmare, este esențial să se mențină căile respiratorii și ventilația adecvată până la apariția respirației spontane.

Neostigmina și alte medicamente anticolinesterazice nu sunt antidoturi pentru suxametoniu, dar în mod normal ar intensifica efectul de depolarizare. Cu toate acestea, în unele cazuri, atunci când acțiunea suxametonului este prelungită, blocul caracteristic de depolarizare (faza I) se poate schimba într-un bloc cu caracteristici de nedepolarizare (faza II). Decizia de a utiliza neostigmină pentru a inversa un bloc indus de suxametoniu de fază II depinde de raționamentele clinicianului în funcție de cazul individual. Informații valoroase cu privire la această decizie vor fi obținute prin monitorizarea funcției neuromusculare. Dacă se utilizează neostigmină, administrarea sa trebuie însoțită de doze adecvate de medicament anticolinergic, cum ar fi atropina.

5. PROPRIETĂȚI FARMACOLOGICE

5.1 Proprietăți farmacodinamice

Grupa farmacoterapeutică: sistemul musculo-scheletic; relaxante musculare, agenți cu acțiune periferică; derivați de colină, codul ATC: M03AB01

Mecanism de acțiune

Suxametoniu este o substanță depolarizantă de blocare neuromusculară cu acțiune ultra-scurtă.

Efecte farmacodinamice

Structura suxametonului este strâns legată de acetilcolină. Similar cu acetilcolina, suxametoniu acționează asupra plăcii motorii a musculaturii scheletice, determinând paralizia flască (bloc de fază I). Suxametoniu difuzează încet până la placa motorie și concentrația la nivelul plăcii motorii persistă suficient de mult pentru a cauza pierderea excitabilității electrice. Depolarizarea plăcii motorii musculare stabilește un gradient de tensiune, ceea ce determină deschiderea canalelor ionice voltaj-dependente ale mușchiului, ducând la contracții tranzitorii ale mușchiului. Deși placa motorie rămâne depolarizată, membrana musculară ia în considerare această depolarizare și rămâne flască.

Dacă suxametoniu este perfuzat continuu, membrana joncțională își recapătă lent potențialul de repaus cu revenirea transmisiei neuromusculare (tahifilaxie); prin urmare, pentru a menține efectul, este necesară o rată de perfuzare mai mare. Odată cu continuarea perfuziei, transmisia neuromusculară va eșua din nou (bloc de fază II), chiar dacă potențialul membranal al plăcii rămâne relativ neschimbat. Un bloc de fază II prezintă caracteristicile clinice ale unui bloc nedepolarizant. Un bloc de fază II poate fi asociat cu bloc neuromuscular prelungit și apnee. Mecanismul acestui bloc nu este cunoscut, dar la blocarea canalelor prin pătrunderea suxametonului în citoplasma de sub placa motorie contribuie acumularea intracelulară de calciu și sodiu, pierderea de potasiu intracelular și activarea ATP-azei de Na/K.

Se consideră că durata scurtă de acțiune a suxametonului se datorează metabolizării sale rapide în sânge. Suxametoniu este hidrolizat rapid de către colinesteraza plasmatică în succinilmonocolină, care are proprietăți depolarizante relaxante nesemnificative clinic.

5.2 Proprietăți farmacocinetice

După injectarea intravenoasă, suxametoniul acționează în termen de la 30 până la 60 de secunde și are o durată de acțiune de la 2 la 6 minute, fiind hidrolizat de colinesteraza plasmatică (pseudocolinesterază). O moleculă de colină se desprinde rapid pentru a forma succinilmonocolină (un relaxant muscular slab), care este apoi hidrolizată lent în acid succinic și colină. Doar o mică parte din suxametoniul este excretat nemodificat în urină.

Gena care controlează expresia colinesterazei plasmatică prezintă polimorfism și activitatea enzimatică variază în funcție de individ. S-a raportat că pacienții ocazionali prezintă apnee prelungită după administrarea suxametoniului. Majoritatea acestor pacienți prezentau deficit atipic de colinesterază plasmatică sau colinesterază din cauza variațiilor alelice, a afecțiunilor hepatice sau renale sau a tulburărilor nutriționale care afectează clearance-ul substanței active. Unele medicamente pot inhiba sinteza enzimelor sau pot altera activitatea (vezi pct. 4.5).

5.3 Date preclinice de siguranță

Nu există date preclinice relevante pentru medicul curant care să fie suplimentare față de cele deja incluse în alte secțiuni ale Rezumatului caracteristicilor produsului.

6. PROPRIETĂȚI FARMACEUTICE

6.1 Lista excipienților

Clorură de sodiu,
Acid succinic,
Hidroxid de sodiu sau acid clorhidric (pentru ajustarea pH-ului),
Apă pentru preparate injectabile.

6.2 Incompatibilități

În absența studiilor de compatibilitate, acest medicament nu trebuie amestecat cu alte medicamente.

6.3 Perioada de valabilitate

2 ani.
După deschidere, medicamentul trebuie utilizat imediat.

Acest medicament poate fi păstrat pentru o perioadă scurtă de timp la temperaturi care nu depășesc 25 °C. În toate cazurile, odată scos din frigider, medicamentul trebuie aruncat după 30 de zile.

6.4 Precauții speciale pentru păstrare

A se păstra la frigider (2° C - 8° C). A nu se congela.
A se păstra seringă preumplută în blisterul nedeschis până la momentul utilizării.
Pentru condițiile de păstrare după prima deschidere a medicamentului, vezi pct. 6.3.

6.5 Natura și conținutul ambalajului

10 ml soluție injectabilă în seringă preumplută (din polipropilenă), cu piston cu dop (din clorobutil), fără ac, cu etichetă transparentă autoadezivă gradată (gradații intermediare de 0,5 ml de la 0 până la 10 ml). Un capac de protecție (din polipropilenă) protejează vârful seringii. Seringa preumplută este ambalată individual într-un blister transparent. Disponibil în cutii de carton cu 1 sau 10 seringi preumplute. Este posibil ca nu toate mărimile de ambalaj să fie comercializate.

6.6 Precauții speciale pentru eliminarea reziduurilor și alte instrucțiuni de manipulare

Instrucțiuni de utilizare:

Pregătiți seringă cu atenție, după cum urmează:

Seringa preumplută este destinată doar unui singur pacient. Aruncați seringă după utilizare. Nu o reutilizați.

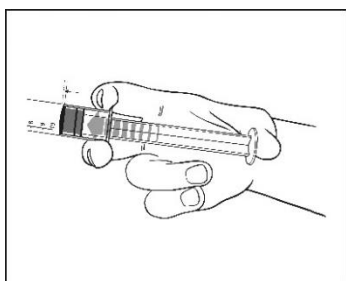
Înainte de administrare, medicamentul trebuie examinat vizual pentru detectarea eventualelor particule sau modificări de culoare. Trebuie utilizate numai soluțiile limpezi, incolore, fără particule sau precipitate.

Medicamentul nu trebuie utilizat dacă sigiliul de siguranță de pe seringă este rupt.

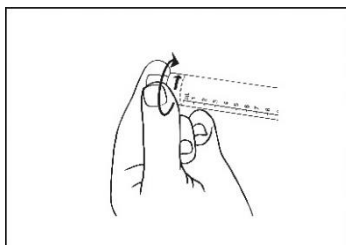
Până la deschiderea blisterului suprafața externă a seringii este sterilă. Blisterul nu trebuie să fie deschis până la utilizare.

Când este manipulat utilizând o metodă aseptică, acest medicament poate fi plasat pe un câmp steril după ce a fost scos din blister.

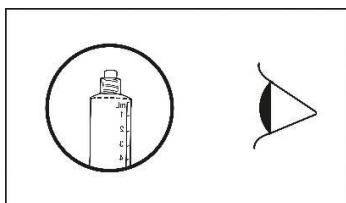
1) Scoateți seringă preumplută sterilă din blister.



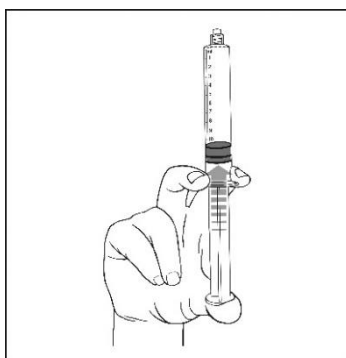
2) Apăsăți pistonul pentru a elibera dopul. Este posibil ca procesul de sterilizare să fi cauzat aderența dopului la corpul seringii.



3) Răsuciți capacul de protecție pentru a rupe sigiliile. Pentru a evita contaminarea, nu atingeți conectorul luer expus.



4) Verificați ca vârful de sigilare al seringii să fi fost complet îndepărtat. Dacă nu este complet îndepărtat, puneți la loc capacul și răsuciți din nou.



5) Scoateți aerul apăsând lent pe piston.

6) Conectați seringă la un dispozitiv de acces sau la ac. Apăsați pistonul încet pentru a injecta volumul necesar.

Orice medicament neutilizat sau material rezidual trebuie eliminat în conformitate cu reglementările locale.

7. DEȚINĂTORUL AUTORIZAȚIEI DE PUNERE PE PIAȚĂ

Laboratoire Aguetant
1, rue Alexander Fleming
69007, Lyon
Franța

8. NUMĂRUL(ELE) AUTORIZAȚIEI DE PUNERE PE PIAȚĂ

15275/2024/01-02

9. DATA PRIMEI AUTORIZĂRI SAU A REÎNNOIRII AUTORIZAȚIEI

Data primei autorizări : Septembrie 2019

10. DATA REVIZUIRII TEXTULUI

Ianuarie 2024