

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Suxamethonium chloride Panpharma 50 mg/ml injekčný/infúzny roztok

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Každý ml injekčného/infúzneho roztoku obsahuje 50 mg suxametónium-chloridu (ako 55 mg dihydrátu suxametónium-chloridu).

Každá 2 ml ampulka obsahuje 100 mg suxametónium-chloridu (ako 110 mg dihydrátu suxametónium-chloridu).

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Injekčný/infúzny roztok.

Číry, bezfarebný až takmer bezfarebný roztok.

pH roztoku: 3,0 – 5,0

Osmolalita: 325 – 395 mOsmol/kg

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Suxamethonium chloride Panpharma je indikovaný na krátkodobú svalovú relaxáciu počas celkovej anestézie a na uľahčenie endotracheálnej intubácie počas uvedenia do celkovej anestézie alebo v naliehavých situáciách.

4.2 Dávkovanie a spôsob podania

Suxamethonium chloride Panpharma má podávať len anesteziológ, ktorý je oboznámený s jeho účinkom, vlastnosťami a rizikami, ktorý má skúsenosti s umelým dýchaním, alebo pod jeho prísny dohľadom, a to len v prípade, že sú k dispozícii vhodné zariadenia na okamžitú endotracheálnu intubáciu s podávaním kyslíka prostredníctvom prerušovanej pozitívnej tlakovej ventilácie.

Použitie intravenóznou injekciou

Dospelí

Dávka závisí od telesnej hmotnosti, požadovaného stupňa svalovej relaxácie, spôsobu podania a reakcie jednotlivých pacientov.

Na dosiahnutie endotracheálnej intubácie sa suxametónium-chlorid zvyčajne intravenózne podáva v dávke 1 mg/kg. Táto dávka zvyčajne vyvolá svalovú relaxáciu približne za 30 až 60 sekúnd a má trvanie účinku približne 2 až 6 minút. Väčšie dávky spôsobia dlhšiu svalovú relaxáciu, ale zdvojnásobenie dávky nemusí nevyhnutne zdvojnásobiť trvanie relaxácie.

Dodatočné dávky suxametónium-chloridu v množstve 50 % až 100 % počiatkovej dávky podávané v 5- až 10-minútových intervaloch udržia svalovú relaxáciu počas krátkych chirurgických zákrokov vykonávaných v celkovej anestézii.

Celková dávka suxametónium-chloridu podávaná opakovanou intravenóznou injekciou alebo kontinuálnou infúziou nemá prekročiť 500 mg za hodinu.

Použitie intravenóznou infúziou

Suxametónium-chlorid sa môže podávať intravenóznou infúziou ako 0,1 % až 0,2 % roztok zriedený v roztoku glukózy 50 mg/ml (5 %) alebo v infúznom roztoku chloridu sodného 9 mg/ml (0,9 %) rýchlosťou 2,5 až 4 mg za minútu. Rýchlosť infúzie sa má upraviť podľa reakcie jednotlivých pacientov.

Osobitné skupiny pacientov

Starší pacienti

Ako u dospelých. Starší pacienti môžu byť náchylnejší na srdcovú arytmiu, najmä ak užívajú aj lieky s obsahom digoxínu (pozri časť 4.4).

Poruchy funkcie obličiek:

Normálna jednorazová dávka injekcie suxametónia sa môže podať pacientom s renálnou insuficienciou pri absencii hyperkaliémie. Viacnásobné alebo väčšie dávky môžu spôsobiť klinicky významné zvýšenie sérového draslíka a nemajú sa používať (pozri časti 4.3 a 4.4).

Porucha funkcie pečene:

Ukončenie účinku suxametónia závisí od plazmatickej cholinesterázy, ktorá sa syntetizuje v pečeni. Hoci plazmatické hladiny cholinesterázy často klesajú u pacientov s ochorením pečene, s výnimkou ťažkého zlyhania pečene, sú hladiny zriedkavo dostatočne nízke na to, aby významne predĺžili apnoe vyvolané suxametóniom (pozri časť 4.4).

Pacienti so zníženou plazmatickou cholinesterázou:

U pacientov so zníženou aktivitou cholinesterázy v plazme môže po podaní suxametónia dôjsť k predĺženej a zosilnenej nervosvalovej blokáde. U týchto pacientov môže byť vhodné podať znížené dávky injekcie suxametónia (pozri časti 4.3, 4.4 a 4.5).

Pediatrická populácia

Použitie intravenóznou injekciou

Dospievajúci nad 12 rokov: dávkovanie je rovnaké ako u dospelých.

Dojčatá a malé deti sú v porovnaní s dospelými odolnejšie voči suxametóniu.

Deti od 1 do 12 rokov

1 – 2 mg/kg intravenóznou injekciou.

Dojčatá do 1 roka

2 mg/kg intravenóznou injekciou.

Spôsob podávania:

Intravenózne použitie

4.3 Kontraindikácie

- Precitlivosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.
- Suxametónium nemá žiadny vplyv na úroveň vedomia, a preto sa nemá podávať pacientovi, ktorý nie je v úplnej anestézii.
- Osobná alebo rodinná anamnéza malígnej hypertermie (pozri časť 4.4)
- Dedičná atypická aktivita plazmatickej cholinesterázy (pozri časť 4.4)
- Abnormálna aktivita pseudocholinesterázy v plazme

- Hyperkaliémia z akejkoľvek príčiny (pozri časť 4.4)
- Svalová dystrofia a iné myopatie, napr. Duchennova svalová dystrofia
- Osobná alebo rodinná anamnéza vrodených myotonických ochorení, ako sú myotonia congenita a dystrophia myotonica

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Suxamethonium chloride Panpharma paralyzuje dýchacie svaly, ako aj iné kostrové svaly, ale nemá žiadny účinok na vedomie.

Křížová citlivosť

Bola zaznamenaná vysoká miera skříženej citlivosti (viac ako 50 %) medzi nervovosvalovými blokátormi. Preto sa pred podaním suxametónia má podľa možnosti vylúčiť precitlivenosť na iné neuromuskulárne blokujúce lieky. Suxametónium sa má používať len v nevyhnutných prípadoch u citlivých pacientov. Pacienti, u ktorých sa pri celkovej anestézii vyskytne reakcia z precitlivenosti, majú byť následne testovaní na precitlivenosť na iné neuromuskulárne blokátory.

Dlhodobé podávanie

Počas dlhodobého podávania suxametónia sa odporúča, aby bol pacient plne monitorovaný periférnym nervovým stimulátorom s cieľom vyhodnotiť nervovosvalovú blokádu a zotavenie.

Znížená aktivita alebo nedostatok plazmatickej cholinesterázy

Suxametónium je rýchlo hydrolyzované plazmatickou cholinesterázou, čo obmedzuje intenzitu a trvanie nervovosvalovej blokády. U jedincov so zníženou aktivitou cholinesterázy v plazme sa prejavuje predĺžená odpoveď na suxametónium.

Približne 0,05 % populácie má dedičnú príčinu zníženej aktivity cholinesterázy.

Znížená aktivita cholinesterázy v plazme sa pozoruje pri nasledujúcich stavoch alebo patologických stavoch:

- fyziologické zmeny ako v tehotenstve a v období pôrodu (pozri časť 4.6),
- geneticky podmienená abnormálna plazmatická cholinesteráza (pozri časť 4.3),
- ťažký generalizovaný tetanus, tuberkulóza, iné ťažké alebo chronické infekcie,
- po ťažkých popáleninách,
- chronické vyčerpávajúce ochorenie, zhubné ochorenie, chronická anémia a podvýživa,
- konečné štádium zlyhania pečene, akútne alebo chronické zlyhanie obličiek (pozri časť 4.2),
- autoimunitné ochorenia: myxoedém, kolagénové ochorenia,
- iatrogénne: po výmene plazmy, plazmaferéze, kardiopulmonálnom bypasse a v dôsledku súbežnej farmakoterapie (pozri časť 4.5).

Hyperkaliémia:

Po podaní suxametónia sa u normálnych jedincov často vyskytuje akútny prechodný nárast sérového draslíka. Veľkosť tohto nárastu je rádovo 0,5 mmol/l. Pri určitých patologických stavoch alebo ochoreniach môže byť toto zvýšenie sérového draslíka po podaní suxametónia nadmerné a môže spôsobiť závažné srdcové arytmie a zástavu srdca:

- u pacientov, ktorí sa zotavujú po veľkom úraze, je obdobie najväčšieho rizika hyperkaliémie približne 5 až 70 dní po úraze a môže sa ďalej predĺžiť, ak dôjde k oneskorenému hojeniu v dôsledku pretrvávajúcej infekcie;

- u pacientov s neurologickým deficitom zahŕňajúcim poranenie miechy, periférnych nervov alebo akútne ochrnutie svalov (lézie horného a/alebo dolného motorického neurónu); potenciál uvoľňovania draslíka sa vyskytuje počas prvých 6 mesiacov po akútnom nástupe neurologického deficitu a koreluje so stupňom a rozsahom svalového ochrnutia. Podobné riziko hrozí aj pacientom, ktorí boli dlhší čas imobilizovaní;

- u pacientov s už existujúcou hyperkaliémiou (pozri časť 4.3). Ak nie je prítomná hyperkaliémia alebo neuropatia, zlyhanie obličiek nie je kontraindikáciou podania bežnej jednorazovej dávky injekcie suxametónia, ale viacnásobné alebo veľké dávky môžu spôsobiť klinicky významné zvýšenie sérového draslíka a nemajú sa používať;

- u pacientov s ťažkou sepsou sa zdá, že potenciál hyperkaliémie súvisí so závažnosťou a trvaním

infekcie.

Blokáda fázy II

Ak sa suxametónium-chlorid podáva dlhodobo, charakteristická depolarizujúca nervovosvalová blokáda (alebo fáza I) sa môže zmeniť na blokádu s vlastnosťami nedepolarizujúcej blokády (alebo fáza II). Hoci sa charakteristiky rozvíjajúcej sa blokády fázy II podobajú charakteristikám skutočnej nedepolarizujúcej blokády, prvú z nich nemožno vždy úplne alebo trvalo zvrátiť anticholínesterázovými látkami. Keď úplne nastane blokáda fázy II, jej účinky sú zvyčajne plne reverzibilné štandardnými dávkami neostigminu spolu s anticholínerným činidlom.

Bolesť svalov

Po podaní suxametónia sa často vyskytujú bolesti svalov, ktoré sa najčastejšie vyskytujú u ambulantných pacientov podstupujúcich krátke chirurgické zákroky v celkovej anestézii. Zdá sa, že neexistuje priama súvislosť medzi stupňom viditeľnej svalovej fascikulácie po podaní injekcie suxametónia a výskytom alebo závažnosťou bolesti.

Bradykardia

U zdravých dospelých osôb suxametónium občas spôsobuje mierne prechodné spomalenie srdcovej frekvencie pri prvom podaní. Bradykardie sa častejšie pozorujú u detí a pri opakovanom podávaní suxametónia u detí aj dospelých.

Predbežná liečba intravenóznym atropínom alebo glykopyrolátom významne znižuje výskyt a závažnosť bradykardie súvisiacej so suxametóniom.

Komorové arytmie

Pri absencii už existujúcej alebo vyvolanej hyperkaliémie sa po podaní suxametónia zriedkavo vyskytujú komorové arytmie. Pacienti užívajúci lieky s obsahom digoxínu sú však na takéto arytmie náchylnejší (pozri časť 4.5). Pôsobenie suxametónia na srdce môže spôsobiť zmeny srdcového rytmu vrátane zástavy srdca.

Myasténiá gravis

Pacientom s pokročilou myasténiou gravis nie je vhodné podávať injekciu suxametónia. Hoci sú títo pacienti rezistentní na suxametónium, vyvinie sa u nich stav blokády fázy II, ktorá môže mať za následok oneskorené zotavenie. Pacienti s myastenickým Lambertovým-Eatonovým syndrómom sú citlivejší na injekciu suxametónia, čo si vyžaduje zníženie dávky.

Otvorené poranenia oka/glaukóm:

Suxametónium spôsobuje mierne prechodné zvýšenie vnútroočného tlaku, a preto sa neodporúča pri otvorených poraneniach oka ani v prípadoch, keď je zvýšenie vnútroočného tlaku nežiaduce, pokiaľ potenciálny prínos nepreváži potenciálne riziko pre oko (pozri časť 4.3).

Tachyfyllaxia

Po opakovanom podaní suxametónia dochádza k tachyfyllaxii.

Hypertermia

Suxametónium je kontraindikované u pacientov s malígnou hypertermiou v osobnej alebo rodinnej anamnéze (pozri časť 4.3) a ak sa tento stav neočakávane vyskytne, musia sa okamžite vysadiť všetky anestetické lieky, o ktorých je známe, že sú spojené s jeho vznikom, vrátane suxametónia. Okamžite sa musia prijať všetky podporné opatrenia. Intravenóznym dantrolénom sodným je indikovaný na liečbu malígnej hypertermie.

Transfúzia krvi:

Transfúzie krvi môžu prispieť k zvýšeniu hladiny cholinesterázy v plazme, v dôsledku čoho môže byť terapeutický účinok suxametónia nepredvídateľne ovplyvnený.

Pediatrická populácia

Bradykardie sa častejšie pozorujú u detí a pri opakovanom podávaní suxametónia. Niektoré authority obhajujú rutinnú premedikáciu detských pacientov intravenóznym atropínom. Intramuskulárny atropín

nie je účinný. Predbežná liečba intravenóznym atropínom alebo glykopyrolátom významne znižuje výskyt a závažnosť bradykardie súvisiacej so suxametóniom.

U detských pacientov s nediagnostikovaným nervovosvalovým ochorením boli opísané prípady zástavy srdca, ktoré sa nedali liečiť. U dojčiat a detí, ktorým sa podáva suxametónium, sa musí venovať mimoriadna starostlivosť alebo monitorovanie vzhľadom na zvýšené riziko nediagnostikovaných svalových porúch alebo neznámej predispozície k malígnej hypertermii (pozri časti 4.3 a 4.8).

Tento liek obsahuje menej ako 1 mmol sodíka (23 mg v jednej ampulke), t. j. zanedbateľné množstvo sodíka.

4.5 Liekové a iné interakcie

Suxametónium môže interagovať s nasledujúcimi látkami:

Antiarytmiká:

Lidokaín, prokaín, prokaínamid, chlórprokaín, kokaín, chinidín a verapamil zvyšujú účinok svalového relaxancia.

Antibakteriálne látky:

Účinok svalových relaxancií zvyšujú aminoglykozidy, ako sú dibekacín, kanamycín, neomycín, ribostamycín a streptomycín, účinok suxametónia zvyšujú aj vankomycín, azlocilín, klindamycín, linkomycín, kolistín, piperacilín a polymyxín B.

Anticholinesterázy:

Cholinesteráza aj pseudocholinesteráza rozkladajú suxametónium. Preto anticholinesterázy zvýšia účinok suxametónia. Medzi anticholinesterázy patria napríklad donepezil, galantamín, rivastigmín, aprotinín, cyklofosfamid, dexpantenol, ekotiopát, metoklopramid (neselektívny liek), neostigmín, fenelzín (MAOI), promazín, chinín a chlorochín (antimalariká), takrín a trimetafán (liek blokujúci gangliá). Aktivitu pseudocholinesterázy môže tiež znížiť pôsobenie pesticídov, ako sú diazinón, malatión a prípravky na kúpeľ oviec.

Inhibítory ACE:

Súbežné užívanie liekov, ktoré môžu zvyšovať hladinu draslíka, ako sú ACE inhibítory, môže spôsobiť hyperkaliémiu (pozri časť 4.3).

Antiepileptiká:

Účinok svalových relaxancií antagonizovaný karbamazepínom a fenytoínom (urýchlené zotavenie z nervovosvalovej blokády).

Antineoplastické látky (lieky proti rakovine):

Cyklofosfamid, chlórmetín, tiotepa a tretamín znižujú aktivitu pseudocholinesterázy.

Benzodiazepíny:

Diazepam a midazolam môžu zmeniť hĺbku pôsobenia/trvanie suxametónia.

Blokátory vápnikových kanálov:

Nifedipín a verapamil zvyšujú účinok nedepolarizujúcich svalových relaxancií; pri intravenóznom podávaní dantrolénu a verapamilu bola hlásená hypotenzia, depresia myokardu a hyperkaliémia.

Srdcové glykozidy:

Arytmie, ak sa suxametónium podáva s digoxínom.

Cytotoxické látky:

Cyklofosfamid, tiotepa a irinotekan zvyšujú účinok suxametónia.

Všeobecné anestetiká:

Propofol môže spôsobiť závažnú bradykardiu, ak sa podáva so suxametóniom, a fentanyl citrát-droperidol (Innovar) zvyšuje účinok suxametónia. Suxametónium tiež interaguje s halotanom, izofluránom, enfluránom, cyklopropánom, propanididom a éterom.

Soli horčička:

Parenterálne podávané horčička zvyšuje účinok suxametónia.

Parasympatomimetiká:

Demekárium a ekotiopátové očné kvapky, neostigmín a pyridostigmín a prípadne donepezil zvyšujú účinok suxametónia, ale antagonizujú účinok nedepolarizujúcich svalových relaxancií.

Sympatomimetiká:

Bambuterol zvyšuje účinok suxametónia.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Suxametónium nepôsobí priamo na maternicu ani na iné štruktúry hladkého svalstva. V bežných terapeutických dávkach neprechádza placentárnou bariérou v takom množstve, aby ovplyvnil dýchanie dojčat'a.

Výhody použitia suxametónia ako súčasti rýchlej sekvencie pri celkovej anestézii zvyčajne prevažujú nad možným rizikom pre plod.

Hladina plazmatickej cholinesterázy klesá počas prvého trimestra tehotenstva na približne 70 až 80 % hodnoty pred tehotenstvom. Ďalší pokles na približne 60 až 70 % hodnoty pred tehotenstvom nastáva do 2 až 4 dní po pôrode.

Hladina plazmatickej cholinesterázy sa potom zvýši a počas nasledujúcich 6 týždňov dosiahne normálnu hodnotu. V dôsledku toho sa môže u vysokého podielu tehotných pacientok a pacientok v období pôrodu po injekcii suxametónia vyskytnúť mierne predĺžená neuromuskulárna blokáda. Suxametónium nie je embryotoxické ani teratogénne u dvoch druhov zvierat. V prípade potreby možno zvážiť použitie suxametónia počas tehotenstva.

Dojčenie

Nie je neznáme, či sa suxametónium alebo jeho metabolity vylučujú do ľudského mlieka. Keďže sa však účinná látka rýchlo hydrolyzuje plazmatickou cholinesterázou (pseudocholinesterázou) na neúčinný metabolit, nepredpokladajú sa žiadne účinky na dojčených novorodencov/dojčat'a.

Fertilita

Nie sú k dispozícii žiadne údaje o použití suxametónia na plodnosť. Keďže sa však účinná látka rýchlo hydrolyzuje plazmatickou cholinesterázou (pseudocholinesterázou) na neúčinný metabolit, po skončení farmakologického účinku sa nepredpokladajú žiadne účinky na plodnosť.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Suxametónium má veľký vplyv na schopnosť viesť motorové vozidlá a obsluhovať stroje.

Suxametónium sa vždy používa v kombinácii s celkovou anestéziou, a preto sa naň vzťahujú obvyklé bezpečnostné opatrenia týkajúce sa vykonávania úloh po celkovej anestézii.

4.8 Nežiaduce účinky

Nežiaduce reakcie sú uvedené nižšie podľa triedy orgánových systémov a frekvencie. Odhadované frekvencie boli stanovené na základe uverejnených údajov. Frekvencie sú definované takto: veľmi časté ($\geq 1/10$); časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), menej časté ($\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$); zriedkavé ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$); veľmi zriedkavé ($< 1/10\ 000$).

Trieda orgánových systémov	Frekvencia	Nežiaduce účinky
Poruchy imunitného systému	Veľmi zriedkavé	Anafylaktické reakcie
Poruchy oka	Časté	Zvýšený vnútroočný tlak.
Poruchy srdca a srdcovej činnosti	Časté	Bradykardia, tachykardia.
	Zriedkavé	Arytmie (vrátane komorových arytmií), zástava srdca ¹
Poruchy ciev	Časté	Sčervenenie kože.
	Neznáme	Hypertenzia a hypotenzia
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína	Zriedkavé	Bronchospazmus, predĺžená respiračná depresia ² , apnoe ²
Poruchy gastrointestinálneho traktu	Veľmi časté	Zvýšený intragastrický tlak
	Neznáme	Nadmerné slinenie
Poruchy kože a podkožného tkaniva	Časté	Vyrážka
Poruchy kostrovej a svalovej sústavy a spojivového tkaniva	Veľmi časté	Svalová fascikulácia, pooperačné bolesti svalov
	Časté	Myoglobínémia ³ , myoglobinúria ³
	Zriedkavé	Trizmus
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania	Veľmi zriedkavé	Malígna hypertermia
Laboratórne a funkčné vyšetrenia	Časté	Prechodné zvýšenie draslíka v krvi

- Existujú kazuistiky zástav srdca súvisiacich s hyperkaliémiou po podaní suxametónia pacientom s vrodenou mozgovou obrnou, tetanom, Duchennovou svalovou dystrofiou a uzavretým poranením hlavy. Takéto udalosti boli zriedkavo hlásené aj u detí s doteraz nediagnostikovanými svalovými poruchami.
- U jedincov so zníženou aktivitou cholinesterázy v plazme sa prejavuje predĺžená odpoveď na suxametónium. Približne 0,05 % populácie má dedičnú príčinu zníženej aktivity cholinesterázy (pozri časť 4.4).
- Bola hlásená aj rabdomyolýza.

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na [národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V](#).

4.9 Predávkovanie

Príznaky:

Hlboká, dlhotrvajúca svalová paralýza s depresiou dýchania sú prejavmi predávkovania suxametóniom. Je potrebná ventilačná podpora.

Liečba:

Treba sa vyhnúť použitiu neostigmínu a iných inhibítorov cholinesterázy, pretože predlžujú depolarizačný účinok suxametónium-chloridu.

Rozhodnutie o použití neostigmínu na zvrátenie blokády fázy II vyvolanej suxametóniom závisí od posúdenia konkrétneho prípadu lekárom. Cenné informácie týkajúce sa tohto rozhodnutia sa získajú monitorovaním nervovosvalovej funkcie. Ak sa použije neostigmín, jeho podávanie má byť sprevádzané vhodnými dávkami anticholinergného lieku, ako je atropín.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: myorelaxanciá, periférne pôsobiace myorelaxanciá; deriváty cholínu
ATC kód M03AB01

Suxametónium je svojou štruktúrou úzko príbuzné acetylcholínu. Suxametónium sa rýchlo hydrolyzuje plazmatickou cholinesterázou.

Suxametónium pôsobí na motorickú platničku kostrového svalu rovnako ako acetylcholín ako agonista a spôsobuje ochabnutie a paralýzu svalu (blokáda fázy 1).

Suxametónium pomaly difunduje ku koncovej platničke a jeho koncentrácia na platničke pretrváva dostatočne dlho na to, aby spôsobila stratu elektrickej excitability.

Depolarizáciou svalovej platničky sa vytvorí napäťový gradient a ten spôsobí otvorenie napäťovo závislých iónových kanálov svalu, čo vedie k prechodnej kontrakcii svalu. Hoci koncová platnička zostáva depolarizovaná, svalová membrána túto depolarizáciu zohľadňuje a zostáva ochabnutá.

Ak sa suxametónium počas infúzie udržiava nepretržite, junkčná membrána pomaly získava svoj pokojový potenciál s návratom nervovosvalového prenosu. Na udržanie účinku je potrebná vyššia rýchlosť infúzie (tachyfylaxia).

Pri pokračujúcej infúzii nervovosvalový prenos opäť zlyhá (blokáda fázy 2), hoci membránový potenciál koncovej platničky zostáva nezmenený a normálny alebo takmer normálny. Blokáda fázy 2 má klinické charakteristiky nedepolarizujúcej blokády. Blokáda fázy 2 môže byť spojená s predĺženou nervovosvalovou blokádou a apnoe. Mechanizmus tejto blokády nie je známy, ale prispieva k nemu blokovanie kanálov prienikom suxametónia do cytoplazmy subkoncovej platničky, intracelulárna akumulácia vápnika a sodíka, strata intracelulárneho draslíka a aktivácia Na,K-ATPázy.

Lieky sa podávajú intravenózne a pôsobia približne 30 až 60 sekúnd. Suxametónium pôsobí približne 2 až 6 minút, pričom je hydrolyzované plazmatickou cholinesterázou (pseudocholinesterázou).

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia/distribúcia

Po intramuskulárnej alebo intravenózne injekcii sa suxametónium-chlorid rýchlo distribuuje do extracelulárnych tekutín v celom tele.

Suxametónium-chlorid sa rýchlo hydrolyzuje plazmatickou cholinesterázou na sukcinylmonocholín (20 – 80 x menej aktívne nedepolarizujúce svalové relaxancium) a cholín. Sukcinylmonocholín sa potom pomaly hydrolyzuje na kyselinu jantárovú a cholín. Menej ako 10 % podanej dávky sa vylúči močom v nezmenenej forme. Plazmatický polčas suxametónium-chloridu je približne 3 minúty. Malé množstvo suxametónium-chloridu prechádza cez placentu. Nie je známe, či sa suxametónium-chlorid vylučuje do ľudského mlieka.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Genotoxicita: Neboli vykonané žiadne testy bakteriálnych mutácií.

Existujú určité údaje, ktoré naznačujú slabý klastogénny účinok u myší, ale nie u pacientov, ktorí dostali suxametónium-chlorid.

Karcinogenita: štúdie karcinogenity neboli vykonané.

Vývoj embrya a plodu:

Reprodukčné štúdie na zvieratách sa so suxametóniom nevykonali. Nie je tiež známe, či suxametónium môže ovplyvniť reprodukčnú schopnosť alebo spôsobiť poškodenie plodu, ak sa podá tehotnej žene.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

Kyselina chlorovodíková 10 % (na úpravu pH)
Hydroxid sodný (na úpravu pH)
Voda na injekcie

6.2 Inkompatibility

Tento liek sa nesmie miešať s inými liekmi okrem tých, ktoré sú uvedené v časti 6.6.
Suxametónium-chlorid je kyslé a nesmie sa miešať s vysoko alkalickými roztokmi, napr. barbiturátmi.

6.3 Čas použiteľnosti

Pred otvorením 2 roky.
Po prvom otvorení: liek sa musí použiť okamžite.

Chemická a fyzikálna stabilita pri používaní bola preukázaná počas 24 hodín pri teplote 2 – 8 °C, keď sa riedi infúznymi roztokmi uvedenými v časti 6.6.

Z mikrobiologického hľadiska sa má tento liek použiť okamžite. Ak sa liek nepoužije okamžite, jeho používateľ je zodpovedný za podmienky a dĺžku uchovávania pred použitím, ktorá by za normálnych okolností nemala presiahnuť 24 hodín pri teplote 2 °C – 8 °C.

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajú sa v chladničke (2 °C – 8 °C).

Podmienky uchovávania lieku po prvom otvorení nájdete v časti 6.3.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Bezfarebné OPC ampulky (one-point-cut) (typ I) s nominálnym objemom 2 ml.

Balenia po 5, 10 alebo 100 ampulkách

Na trh musia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Suxametónium-chlorid sa môže podávať intravenóznou infúziou ako 0,1 % až 0,2 % roztok zriedený v roztoku glukózy 50 mg/ml (5 %) alebo v infúznom roztoku chloridu sodného 9 mg/ml (0,9 %).

Len na jednorazové použitie.

Všetok nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCI

PANPHARMA
ZI du Clairay
35133 Luitré
Francúzsko

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLA

63/0039/24-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDLŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie:

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

02/2024