

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Суксаметониум Софарма 10 mg/ml инжекционен разтвор
Suxamethonium Sopharma 10 mg/ml solution for injection

Суксаметониум Софарма 20 mg/ml инжекционен разтвор
Suxamethonium Sopharma 20 mg/ml solution for injection

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20230079/80
Разрешение №	62217-8 12-04-2023
ВЗ/МА/МР	/
Одобрение №	/

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Суксаметониум Софарма 10 mg/ml инжекционен разтвор

1 ампула от 5 ml съдържа 50 mg суксаметониев хлорид (като суксаметониев хлорид дихидрат)/suxamethonium chloride (as suxamethonium chloride dihydrate) в изотоничен воден разтвор.

Суксаметониум Софарма 20 mg/ml инжекционен разтвор

1 ампула от 5 ml съдържа 100 mg суксаметониев хлорид (като суксаметониев хлорид дихидрат)/suxamethonium chloride (as suxamethonium chloride dihydrate) в изотоничен воден разтвор.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор

Бистър, безцветен разтвор, практически свободен от частици.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Процедури изискващи краткотрайна релаксация на скелетната мускулатура: ендотрахеална интубация при хирургични интервенции, наместване на фрактури и дислокации, облекчаване на крампите по време на електрощокова терапия.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Дозировката на суксаметониев хлорид зависи от възрастта, телесното тегло, желаната степен на мускулна релаксация, начина на приложение и от индивидуалния отговор на пациента.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага след началото на общата анестезия, защото парализата обичайно се предшества от болезнени мускулни фибрилации. Суксаметониев хлорид, както всички други релаксанти с периферно действие, може да се прилага само от лекари с опит в изкуствената респирация и ендо-трахеална интубация и имащи незабавен достъп до необходимото оборудване за позитивна хипербарна респирация, приложение на кислород и елиминиране на въглероден диоксид.

Възрастни

Интравенозно приложение:

Кратки процедури:

За ендотрахеална интубация и други кратки процедури



Обичайната доза на суксаметониев хлорид е 0,6 mg/kg телесно тегло (диапазон от 0,3 до 1,1 mg/kg телесно тегло) приложена интравенозно за 10 до 30 секунди. Дозата може да се повтори ако е необходимо.

Електро-конвулсивна терапия

Интравенозна доза суксаметониев хлорид от 0,5 до 0,75 mg/kg телесно тегло може да се приложи за отслабване на мускулните контракции при електро-конвулсивна терапия.

Продължителни процедури:

Суксаметониев хлорид може да се прилага чрез постоянна интравенозна инфузия при продължителни процедури. Обичайно се прилага 0,1% или 0,2 % разтвор на суксаметониев хлорид с приблизителна скорост от 2,5 mg до 4 mg/min (диапазон от 0,5 mg до 10 mg/min). Също може да се прилагат периодични интравенозни инжекции, водещи до продължителна мускулна релаксация. Общата доза не трябва да надвишава 500 mg/h.

Интрамускулно приложение

Ако интравенозно приложение не е възможно, суксаметониев хлорид може да се приложи и интрамускулно в доза от 3 mg до 4 mg/kg телесно тегло (общата доза не трябва да надвишава 150 mg).

Дозирание при специални групи пациенти

Дозирание при пациенти с чернодробна недостатъчност

Дозата на суксаметониев хлорид трябва да се редуцира при пациенти с тежки чернодробни заболявания или цироза, тъй като при тях плазмената псевдо-холинестеразна активност е намалена (вж. точка 4.4).

Дозирание при пациенти с бъбречна недостатъчност

Не се налага промяна на дозата на суксаметониев хлорид при пациенти с бъбречна недостатъчност или на хемодиализа, ако нивото на серумния калий е нормално. При ниво на серумния калий над 5,5 mmol/l има повишен риск от фатални сърдечни нарушения при приложението на суксаметониев хлорид.

Педиатрична популация

Интравенозното приложение на суксаметониев хлорид може да предизвика сърдечни аритмии, като рискът се повишава при повторно приложение и при налична хипоксия. Вероятността от настъпване на брадикардия може би намалява при предшестващо прилагане на атропин.

При децата има особен риск от сърдечен арест, свързан с хипокалиемия. Продължително интравенозно приложение не се препоръчва поради риск от малигнена хипертермия.

Приложение при кърмачета и деца до 1 годишна възраст

Интравенозно приложение:

При кърмачета и малки деца се изисква по-висока доза суксаметониев хлорид на kg телесно тегло отколкото при възрастни, поради по-голямото процентно съдържание на екстра-целуларна течност на kg телесно тегло.

Обичайната интравенозна доза суксаметониев хлорид е 2 mg/kg телесно тегло.

Интрамускулно приложение:

Когато интравенозното приложение е невъзможно суксаметониев хлорид може да се приложи интрамускулно. Дозата на суксаметониев хлорид е от 4 mg до 5 mg/kg телесно тегло (общата доза не трябва да надвишава 150 mg).

Деца на възраст от 1 до 12 години

Интравенозно приложение:

Обичайната интравенозна доза на суксаметониев хлорид е 1 mg/kg телесно тегло

Интрамускулно приложение:



При невъзможност за интравенозно приложение суксаметониев хлорид може да се приложи интрамускулно в доза от 3 mg до 4 mg/kg телесно тегло (общата доза не трябва да надвишава 150 mg).

При деца се употребява само в случай на спешност (виж точка 4.4 "Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба").

Дозирание при пациенти в старческа възраст

Дозовите изисквания при приложение на суксаметониев хлорид при пациенти в старческа възраст са подобни на тези при възрастни.

Доза от приблизително 0,1 mg/kg телесно тегло обикновено води до релаксация на скелетната мускулатура без значително действие върху респираторната активност. Доза от 0,2 до 1,0 mg/kg телесно тегло води до тотална релаксация на коремната стена и скелетната мускулатура и до редуциране или пълно подискане на спонтанното дишане.

Начин на приложение

Интравенозно (както и като инфузия), при необходимост - интрамускулно.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към някоя от съставките на продукта изброени в точка 6.1.

Тежка чернодробна дисфункция, белодробен оток, малигнена хипертермия (хиперпирексия) при пациента или фамилна анамнеза за такава, дефицит на холинестеразата, хиперкалиемия или риск от хиперкалиемия след политравма (5-90 ден).

Невро-мускулни заболявания и неврологични разстройства, мускулна ригидност.

Пациенти с тежки наранявания и тежки изгаряния.

Пенетриращи очни наранявания.

Да се прилага с внимание при пациенти страдащи от сърдечни заболявания, тесногъгла глаукома, деца и юноши (виж точка 4.4 "Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба").

Суксаметониев хлорид не се препоръчва при пациенти с уремия, особено ако са налице повишени серумни нива на калия.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

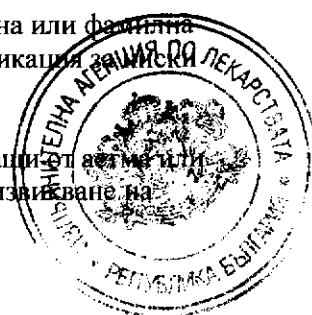
Специални предупреждения:

Тъй като отговора на суксаметониев хлорид е непредсказуем при пациенти с лична или фамилна анамнеза за нервно-мускулни заболявания, при тези пациенти суксаметониев хлорид трябва да се прилага много внимателно.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с предпазливост при пациенти с придобита ниска активност на плазмената холинестераза: пациенти с малнутриция или чернодробни заболявания, новородени (плазмена холинестеразна активност 50% от нормалната активност при възрастни), пациенти с неопластични заболявания, пациенти с изгаряния, пациенти подложени на плазморефуса (отделяне на холинестеразата от плазмата), пациенти лекувани с лекарства, понижаващи плазмената активност или синтеза на холинестераза.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти с лична или фамилна анамнеза за предишна реакция към анестетици, тъй като това може да е индикация за псевдо-холинестеразни нива или повишен риск за малигнена хипертермия.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти страдащи от астма или анамнеза за алергия, тъй като суксаметониев хлорид има потенциал за предизвикване на алергични реакции и бронхоспазм.



Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти с пенетриращи очни наранявания или остра тесноъгълна глаукома (тъй като повишава вътреочното налягане).

Пациенти с отвореноъгълна глаукома или риск за затваряне на ъгъла трябва да се премедикират с 1 или 2 капки пилокарпин.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти с фрактури или мускулни спазми, тъй като началните фибрилации последващи прилагането на продукта може да предизвикат травми.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти, при които, повишаването на кръвното налягане може да утежни състоянието им (напр. мозъчна аневризма, повишено интракраниално налягане).

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти с повишен риск от регургитация на стомашно съдържимо, както и при бременни жени, пациенти с хиатална херния, стомашна и чревна дилатация, асцит и интра-абдоминални тумори, тъй като суксаметониев хлорид повишава интрастомашното налягане.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти лекувани с дигиталис, тъй като при тях рискът от аритмии е повишен.

Суксаметониев хлорид, като всички други релаксанти на скелетната мускулатура с периферно действие, може да се прилага само от лекари с опит в изкуствената респирация и ендотрахеалната интубация, имащи незабавен достъп до необходимото оборудване за ресусцитация.

Суксаметониев хлорид може да бъде използван само след начална анестезия.

Препоръчва се прилагането на атропин преди суксаметониев хлорид с цел избягване на ексцесивна брадикардия, бронхиална секреция или други мускариноподобни ефекти.

Педиатрична популация

Случаи на невъзвратим сърдечен арест са били наблюдавани при деца и юноши след употреба на суксаметониев хлорид. Те са страдали от нервномускулни заболявания, които не са били диагностицирани до тогава. Поради тежестта на нежеланите реакции се препоръчва, дори при очевидно здрави деца и юноши, да се използва суксаметониев хлорид само при спешни случаи, при които се налага незабавна интубация или респираторният тракт трябва да се поддържа свободен.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Сърце и циркулация

Дигиталис (дигоксин)

Усилване на дигиталис-индуцираната камерна възбудимост и ефекти върху проводимостта и/или напускането на калия от мускулните клетки на дигитализирания миокард. Повишена сърдечна възбудимост, водеща до повишен риск от сърдечни дисритмии.

Антиинфекционни лекарства

Аминогликозиди (гентамицин, неомицин, канамицин, стрептомицин).

Адитивен нервно-мускулен блокиращ ефект.

Усилване на нервно-мускулната блокада и удължаване на действието на суксаметониев хлорид.

Мускули, стави и кости

Местни анестетици (прокаин, лидокаин).

Местните анестетици се хидролизират от плазмената холинестераза. Конкурентно усилване на действието, водещо да пролонгирано действие на суксаметониев хлорид. Неостигмин, физостигмин, такрин и други холинестеразни инхибитори блокират плазмените холинестерази.



и ацетилхолинестераза. Пролонгирано действие, ако ацетилхолинестеразните инхибитори са приложени след приложението на суксаметониев хлорид.

Централна нервна система

Общи анестетици

Енфлуранс, десфлуранс, изофлуранс.

Нервно-мускулната блокада се потенцира дозозависимо при инхалиране на анестетика десфлуранс.

Метоклопрамид (антисеметик)

Редуцира активността на плазмената холинестераза, водещо да пролонгиране на действието на суксаметониев хлорид.

Магнезиев сулфат

Инхибира освобождаването на ацетилхолин и намалява чувствителността на постсинаптичната мембрана. Удължаване на действието на суксаметониев хлорид. Прилагането на магнезий трябва да се прекрати 20-30 минути преди приложението на мускулен релаксант.

Дихателни органи

Тербуталин, бамбутерол (продукт на тербуталин)

Инхибира обратимо плазмената холинестеразна активност. Пролонгиране на действието на суксаметониев хлорид.

Цитостатици

Циклофосфамид

Необратимо инхибира холинестеразната активност, възможно чрез алкилизиране на ензима, водещо до забавен метаболизъм на суксаметониев хлорид. Пролонгирано действие на суксаметониев хлорид.

Други

Паратион и малатион (фосфоорганични инсектициди, съдържащи етиопат)

Етиопат инхибира активността на ацетилхолинестеразата и псевдо-холинестеразата. Пролонгирано действие на суксаметониев хлорид поради понижените свободни холинестеразни нива.

Предшестващо приложение на суксаметониев хлорид усилва действието на недеполяризиращите релаксанти. Предшестващо приложение на недеполяризиращи релаксанти облекчава или предотвратява нежеланите реакции на суксаметониев хлорид. Нежеланите лекарствени реакции от страна на сърцето и циркулацията се усилват от халогенизирани наркотици (халотан), и се отслабват от тиопентал и атропин.

Блокиращото нервно-мускулно действие на суксаметониев хлорид се усилва от полипептидни антибиотици, амфотерицин В, циклопропан, пропанидид, кванидин, тиотепа, парасимпатикомиметици, включително холинестеразни инхибитори, аймалин, β блокери, блокери на калциевите канали, фенелзин, тиофосфамид, окситоцин, циметидин, перфеназин, фенотиазин, литий и орални контрацептиви.

Под въздействието на алкохол и лекарства, потискащи активността на централната нервна система, симптомите на предозиране се усилват.

Съвместното приложение с летливи анестетици трябва да се избягва поради повишаване на риска от настъпване на малигнена хипертермия и увеличаване на мускулните увреждания предизвикани от суксаметониев хлорид.

Съвместна инфузия на кръв или плазма отслабва ефекта на суксаметониев хлорид.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност



Суксаметониев хлорид трябва да се прилага по време на бременност само при крайна необходимост. Псевдо-холинестеразните нива може да бъдат понижени до 25% по време на бременност. Това може да доведе до удължен ефект на суксаметониев хлорид, особено при прилагането на повторни дози. Нормалните нива на псевдо-холинестеразната активност се достигат 6-8 седмици след раждането.

Кърмене

Екскрецията на суксаметониев хлорид в майчиното мляко е неизвестна и последствията за кърмачето не са известни. Суксаметониев хлорид не трябва да се прилага по време на кърмене.

Фертилитет

Експериментални проучвания относно въздействието на суксаметониев хлорид върху ово- и сперматогенезата не са провеждани.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Специално внимание трябва да се обърне при шофиране и работа с машини до 24 часа след приложение.

Това е необходимо поради съвместното приложение с анестетици.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са групирани съгласно класификацията на MedDRA за честота: много чести ($\geq 1/10$); чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечести ($\geq 1/1\,000$ до $< 1/100$); редки ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1\,000$); много редки ($< 1/10\,000$); с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

При всяко групиране в зависимост от честотата, нежеланите лекарствени реакции се изброяват в низходящ ред по отношение на тяхната сериозност.

Суксаметониев хлорид има тежки и потенциално опасни нежелани лекарствени реакции. Най-чести неопасни нежелани лекарствени реакции са: мускулни болки (60%) и мускулни фибрилации (90%), нефатално остро повишаване на серумния калий (100%), лекостепенна брадикардия (50% от децата, при възрастните по-рядко) и миоглобинемия (20% от децата) са много чести. Чести са повишено вътреочно и интрастомашно налягане и реакции на свръхчувствителност, като екхимози.

Следните нежелани лекарствени реакции са най-опасни и рядко наблюдавани, но трябва да се имат в предвид, когато се прилага суксаметониев хлорид: фатално повишаване на серумния калий с развитие на аритмии и сърдечен арест, малигнена хипертермия, анафилактичен шок, рабдомиолиза и миоглобинемия, с развитие на бъбречна недостатъчност и продължителни парализи.

Нарушения на кръвта и лимфната система

Много чести: нефатално повишаване на серумния калий в 100% от случаите (леко повишаване с $0,5\text{ mmol/l}$ най-често). Миоглобинемия (20% от децата-получили суксаметониев хлорид интравенозно развиват миоглобинемия, при възрастните по-рядко). Реакцията не е дозозависима и може да се наблюдава със или без фибрилации.

Много редки: камерни фибрилации и сърдечен арест, предизвикани от хиперкалиемията.

Нарушения на имунната система

Чести: реакции на свръхчувствителност (екхимози, уртикария).

Редки: бронхоспазм.

Много редки: анафилактичен шок с екхимоза, със или без бронхоспазм и хипотензия, преминаващ в пълен шок.



Нарушения на ендокринната система

Много редки: малигнена хипертермия (в 0,002% от възрастните и 0,006% от децата, или веднъж на всеки 15 000 - 150 000 анестезии) със или без мускулен хипертонус (упорит спазъм на челюстните мускули), сърдечно-съдови усложнения (хипервентиляция, нестабилно кръвно налягане) и повишена температура, тежка ацидоза, хиперкалиемия, хемоглобинурия и миоглобинурия.

Нарушения в метаболизма и храненето

Много редки: животозастрашаваща хиперкалиемия при пациенти с повишен риск от фатално повишаване на серумния калий, след приложение на суксаметониев хлорид.

Нарушения на очите

Чести: повишено интраочно налягане (може би дължащо се на контрахиране на екстра-окуларните мускули и повишаване на хориоидалния кръвен обем).

Сърдечни нарушения

Много чести: аритмии (лекостепенна брадикардия, нодален ритъм, ектопии) се наблюдават при 50% от децата и при 20% от възрастните, след първата интравенозна инжекция. Най-често инцидентите се наблюдават при кърмачета и малки деца. Инцидентите се повишават независимо от възрастта, ако се приложи повторна доза до 15 минути от първоначалната доза. Инцидентите с брадикардия може би се намаляват при премедикация с атропин.

Нечести: преходна хипертензия, тахикардия.

Много редки: камерни аритмии, камерни фибрилации дължащи се на хиперкалиемия, хиперкалциемия (виж точка 4.8 "Нарушения на кръвта и лимфната система"). Сърдечен арест предизвикан от суксаметониев хлорид индуцирана хиперкалиемия, по-специално при деца с недиагностицирани скелетно-мускулни миопатии (мускулна дистрофия на Дюшен). Тежка хипотензия дължаща се на анафилактични реакции (виж точка 4.8 "Нарушения на имунната система").

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения

Редки: продължителна апнея при пациенти с дефект на плазмената псевдо-холинестераза (виж точка 4.4 "Бронхоспазъм").

Много редки: късна дихателна недостатъчност при мускулна дистрофия на Дюшен. Вторичен бронхоспазъм като анафилactoидна реакция (виж точка 4.8 "Нарушения на имунната система"). Оток на ларинкса и белодробен оток.

Нарушения на храносмилателната система

Чести: повишено интрастомашно налягане (риск от регургитация при бременни жени, пациенти с хиатална херния, стомашна или чревна дилатация, асцит и интраабдоминални тумори, виж точка 4.4).

Нечести: повишена слюнчена секреция.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Чести: зачервяване на кожата поради освобождаване на хистамин.

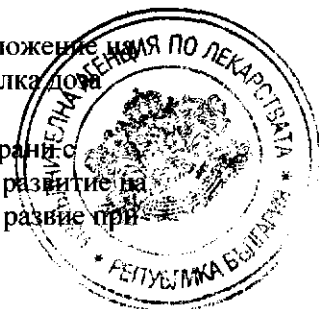
Много редки: анафилactoидни реакции.

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан

Много чести: мускулни болки след мускулни фибрилации, наблюдавани при около 60% от пациентите. Най-често във врата, областта на гръдния кош, рамената и гърба, най-често при жени между 20 и 50 годишна възраст. Мускулни фибрилации (90%).

Нечести: леко повишаване на челюстното налягане (до 60 секунди), след приложение на суксаметониев хлорид. Може да се понижи чрез приложение на пропофол и малка доза недеполяризиращ мускулен релаксант.

Редки: мускулни контракции вместо обичайната релаксация (най-често асоциирани с дистрофична миотония и вродена миотония). Продължителна парализа поради развитие на двоен блок може да се наблюдава при нервно-мускулни заболявания или да се развие при



идеосинкретизъм (виж точка 5.2 "Наследствени варианти на плазмената холинестераза"), при предозиране или при понижено ниво на плазмената холинестераза.

Много редки: остра рабдомиолиза при пациенти с диагностицирани или недиagnostицирани нервно-мускулни заболявания.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Редки: миоглобинурия или повишени СРК (креатинкиназа) нива, най-често наблюдавани при деца третирани със суксаметониев хлорид и халотан.

Много редки: миоглобинурия предизвикваща бъбречна недостатъчност. Най-често при пациенти с (латентна) мускулна дистрофия.

По-продължителна релаксация, с възможна апнея, може да се дължи на: "атипична" серумна холинестераза, вроден дефицит на серумната холинестераза или временно намаляване на серумната холинестераза: при чернодробни заболявания, тежка анемия, след продължително гладуване, кахексия, дехидратация, фебрилни състояния, след остри отравяния, хронична експозиция или поглъщане на блокиращи холинестеразата инсектициди или лекарства (фосфохолин, демекариум, неостигмин, физостигмин, дистигмин) и съпътстващо приложение на лекарства, конкуриращи се с ензима разграждащ сукцинилхолин (например прокаин i.v.). Двоен блок (виж "Фармакокинетични свойства").

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез: Изпълнителна агенция по лекарствата ул. „Дамян Груев“ № 8, 1303 София, тел.: +359 2 8903417, уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

При предозиране със суксаметониев хлорид могат да се наблюдават сериозни симптоми като апнея и продължителна мускулна парализа. Следователно поддържането на свободни дихателни пътища и адекватната вентилация, докато настъпи възстановяване на спонтанното дишане е от съществено значение. Неостигмин и други антихолинестеразни лекарствени продукти не са антидоти на суксаметониев хлорид, но биха засилили деполяризиращия ефект. Въпреки това, в някои случаи, когато действието на суксаметониев хлорид е удължено, деполяризиращия блок (фаза I) може да се промени в недеполяризиращ блок (фаза II). Решението да се използва неостигмин за преодоляването на индуцирания от суксаметониев хлорид недеполяризиращ блок (фаза II) зависи от преценката на лекаря в конкретния случай. Ползена информация за вземането на това решение може да бъде получена от проследяването на нервно-мускулната функция. Ако се използва неостигмин, приложението му трябва да бъде съвместно с антихолинестергичен лекарствен продукт като атропин. Впоследствие пациентът трябва да бъде наблюдаван внимателно и ако апнеята се повтори, е показана допълнителна доза неостигмин. Преливането на кръв, замразена плазма или друг източник на псевдохолинестераза ще спомогне за разграждането на суксаметониевия хлорид.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Мускулни релаксанти, периферно действащи агенти, производни. Суксаметоний.
АТС код: M03AB01

Механизъм на действие

Суксаметониев хлорид е периферен мускулен релаксант и действа чрез деполяризация на постсинаптичните мембрани. Той действа като ацетилхолин агонист на нервно-мускулните



синапси, като свързвайки се с моторните плочки предизвиква деполяризация, което може да доведе до преходни фаскуляции.

Фармакодинамични ефекти

Суксаметониев хлорид е устойчив на разграждане от ацетилхолинестеразата, деполяризацията е продължителна и рефрактерния период на моторните плочки удължен. Това предотвратява реполяризацията и последващата деполяризация и настъпва вяла мускулна парализа. Този инициален деполяризационен блок е общоизвестен като блок I фаза.

Клинична ефективност и безопасност

Мускулите извършващи финни бързи движения, като тези на лицето, се повлияват първо, следвани от мускулите на крайниците, корема и гърдите. Диафрагмата се повлиява последна. Възстановяването настъпва в обратна последователност.

Педиатрична популация

Поради тежестта на нежеланите реакции се препоръчва, дори при очевидно здрави деца и юноши, да се използва суксаметониев хлорид само при спешни случаи, при които се налага незабавна интубация или респираторния тракт трябва да се поддържа свободен.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

След интравенозно приложение: суксаметониев хлорид действа след 30 до 60 секунди с продължителност на действието 2 до 6 минути.

След интрамускулно приложение: суксаметониев хлорид действа след 75 секунди до 3 минути при възрастни, 3,5 минути при деца и 4 минути при кърмачета. Продължителността на действието е до 30 минути при възрастни, 21 минути при деца и 15 минути при кърмачета.

Метаболизъм

По голямата част от инжектираната доза суксаметониев хлорид нормално се инактивира незабавно от плазмената псевдо-холинестераза (псевдо-холинестеразата не присъства в нервно-мускулните синапси) преди да достигне до нервно-мускулните синапси.

Суксаметониев хлорид нормално (за атипичен метаболизъм виж по-долу) се хидролизира бързо (елиминационен полуживот под 1 минута) в плазмата от плазмената псевдо-холинестераза до холин и сукцинил монохолин, недеполяриращ миорелаксант с 20 до 50 пъти по-малка активност от изходното вещество. В следствие метаболизма се забавя и сукцинил монохолин се разгражда до сукцинилна киселина (неактивна) и холин (неактивен).

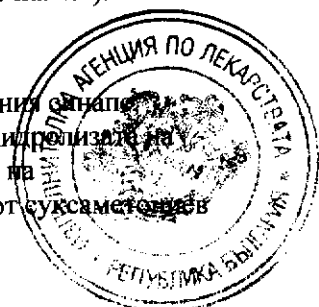
Пациенти с вроден дефицит на плазмената холинестераза:

Генетично детерминирани плазмено псевдо-холинестеразни варианти хидролизират суксаметониев хлорид по-бавно. Около 96% от популацията са хомозиготи по нормалния ген, но 1 на 25 е с хетерозиготен (типичен/атипичен) ген и проявява леко удължен (2-4 пъти нормалното) отговор на суксаметониев хлорид. Един на 2 000 -3 000 е хомозиготен по атипичния ген и проявява значително удължен отговор (2-3 часа). Непроявеният ген е много по-рядък (приблизително 0,0006%), няма плазмена холинестеразна активност и пълната парализа след приложение на суксаметониев хлорид продължава много часове.

Суксаметониев хлорид трябва да се прилага с внимание при пациенти които са диагностицирани като хетерозиготи или хомозиготи по атипичния ген (виж точка 4.4).

Елиминиране

Когато останалото количество суксаметониев хлорид попадне в нервно-мускулния синапс, суксаметониев хлорид дифундира извън нервно-мускулния синапс. След това хидролизата на суксаметониев хлорид от плазмената псевдо-холинестераза определя скоростта на елиминиране, като хидролизата е главен фактор на елиминацията. Около 10% от суксаметониев хлорид се екскретира непроменен с урината.



5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните изпитвания на острата токсичност при мишки и плъхове показват LD₅₀ от 0,4 и съответно 0,24 mg/kg. Респираторен арест се очаква след интрамускулно инжектиране на 40 mg при здрави възрастни.

Изпитвания за хроничната токсичност, мутагенност и репродуктивна токсичност не са провеждани.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Натриев хлорид
Вода за инжекции

6.2 Несъвместимости

Смесването на Суксаметониум Софарма инжекционен разтвор с алкални субстанции, например барбитурати, може напълно да неутрализира ефекта му.

6.3 Срок на годност

2 години.

Химическата и физическата стабилност на разтвора след разреждане е доказана за 24 часа, при температура 25°C и за 24 часа при температура от 2°C до 8°C.

От микробиологична гледна точка, продуктът трябва да се използва веднага. Ако не се използва веднага, времето и условията на съхранение преди употреба са отговорност на прилагачия.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява в хладилник при температура от 2 до 8 °C.

За условията на съхранение след разтваряне на лекарствения продукт вижте точка 6.3.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Безцветни стъклени ампули с вместимост 5 ml с маркировка за отваряне на ампулата.
5 (пет) ампули са опаковани в блистер от PVC фолио.
1 (един) блистер и листовка с инструкции за употреба са поставени в картонена кутия.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Неизползваният продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

Съвместимости

Суксаметониум Софарма е съвместим със следните инфузионни разтвори: 0.9 % натриев хлорид, 5% декстроза, 5% фруктоза, 6% декстран и Рингер.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА



Софарма АД
ул. Илиенско шосе 16
1220 София
България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Рег. №

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване:

Дата на последно подновяване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Февруари 2023 г.

