

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	SUCCINILCOLINA-1
Forma farmacéutica:	Inyección IM, IV.
Fortaleza:	50,0 mg/mL
Presentación:	Estuche por 20 bulbos de vidrio incoloro con 20 mL cada uno.
Titular del Registro Sanitario, país:	Empresa Laboratorios AICA, Cuba.
Fabricante, país:	Empresa Laboratorios AICA Unidad Empresarial de Base "Laboratorios Liorad", Cuba.
Número de Registro Sanitario:	M-14-204-A11
Fecha de Inscripción:	26 de septiembre 2014.
Composición:	
Cada mL contiene:	
Cloruro de succinilcolina (eq. a 55,0 mg de cloruro de succinilcolina dihidratado).	50,0 mg
Alcohol bencílico 5,0 mg	
Plazo de validez:	24 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar de 2 a 8 °C. Protéjase de la luz.

Indicaciones terapéuticas:

Como coadyuvante de la anestesia para inducir una relajación muscular breve pero profunda.

Es particularmente útil para las intervenciones quirúrgicas de corta duración, especialmente en la región abdominal; si se emplea una infusión intravenosa se puede obtener una relajación muscular prolongada en la cirugía abdominal.

Reducción de fracturas y luxaciones.

Se emplea en anestesia como relajante muscular para facilitar la intubación endotraqueal y la ventilación asistida en una extensa variedad de procedimientos quirúrgicos: Endoscopías: laringoscopías, broncoscopías, citoscopías, etc.

Exámenes e intervenciones ginecológicas, intervenciones obstétricas. Convulsiterapia. También se usa para reducir la intensidad de las contracciones musculares de las convulsiones inducidas farmacológica o eléctricamente.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad conocida al fármaco.

No debe ser empleado en la disfunción hepática, insuficiencia renal descompensada y en edema del pulmón.

No tiene ningún efecto sobre el nivel de conciencia y no debe administrarse a un paciente que no esté totalmente anestesiado.

Miotonía o rigidez muscular.

Pacientes con antecedentes genéticos de problemas en pseudocolinesterasa plasmática. Miastenia grave avanzada, trastornos neurológicos o feocromocitoma.

Edades pediátricas (Niños hasta los 15 años de edad): Se contraindica su uso rutinario por riesgo de paro cardíaco por rabdomiolisis hiperpotasémica cardíaca su uso solo queda restringido a situaciones de emergencia o instancias donde es necesario asegurar la vía aérea de inmediato.

Precauciones:

Producto de uso delicado que solo debe ser administrado bajo vigilancia médica. El cloruro de succinilcolina debe manejarse exclusivamente por anestesista. Se requiere la disponibilidad de equipos de oxigenoterapia, sangre fresca o plasma para uso eventual.

Solo se pueden usar las soluciones de Cloruro de Succinilcolina recién preparadas y que estén transparentes

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Niños: Categoría de riesgo: C. Más susceptible a mioglobinemia, miogloburia, bradicardia, hipotensión y arritmias cardíacas.

Geriatría: Los ancianos pueden ser más susceptibles a sufrir arritmias cardíacas transitorias, especialmente con el uso concomitante de fármacos digitálicos. Tienen mayor probabilidad de presentar cierto grado de insuficiencia renal con la consiguiente disminución del aclaramiento renal del fármaco. Ajustar dosis según función renal, hepática y enfermedades concomitantes.

En caso de hipercalemia y estado que pueden llevar a hipercalemia (por ejemplo quemaduras extensas, politraumatismo, inmovilización prolongada) debería ser empleado sólo cuando no están disponibles o no pueden ser administrados otros relajantes musculares.

Produce elevación leve y transitoria de la presión intraocular por lo que no deberá emplearse en presencia de lesiones abiertas de los ojos o donde un incremento de la presión intraocular sea indeseable, a menos que el beneficio potencial de su uso supere en importancia al posible riesgo para el ojo.

Debe evaluarse la relación riesgo-beneficio en casos de: Traumatismo grave, carcinoma broncogénico, disfunción cardiovascular, tara hereditaria recesiva, desequilibrio electrolítico, fracturas o espasmos musculares, hipotermia y uremia. Miotonía o rigidez muscular. En pacientes con distrofia muscular de Duchenne, pacientes con miastenia grave avanzada y desórdenes metabólicos.

Se recomienda la pre medicación con atropina o escopolamina para evitar la producción excesiva de saliva.

Puede desencadenar hipertermia maligna en individuos susceptibles, por lo que su empleo está contraindicado en pacientes con antecedentes (personales o familiares).

Pacientes con antecedentes personales o hereditarios de actividad atípica de la colinesterasa plasmática.

Se recomienda el uso de dosis bajas de relajantes no depolarizantes administradas minutos antes del Cloruro de Succinilcolina para reducir la incidencia e intensidad de dolores musculares asociados con el uso de Cloruro de Succinilcolina. Esta técnica puede requerir el empleo de Cloruro de Succinilcolina a dosis mayores de 1.0 mg/kg para lograr condiciones satisfactorias para la intubación endotraqueal.

Siempre que sea posible deben corregirse los trastornos electrolíticos graves.

Insuficiencia hepática: Puede incrementarse el efecto por disminución de la actividad de la pseudocolinesterasa.

Insuficiencia renal: En pacientes con potasio sérico mayor de 5 mmol ⁻¹ no es prudente su empleo. En caso de insuficiencia renal, si el paciente ha sido correctamente dializado no existe contraindicación para utilizarlo.

Durante la administración repetida o prolongada del Succinilcolina, el bloqueo despolarizante característico producido por su administración inicial (Fase I) podría cambiar gradualmente a un bloqueo neuromuscular con características semejantes a las del bloqueo producido por los miorrelajantes no despolarizantes. (Fase II).

Si se va a administrar el Cloruro de Succinilcolina en dosis acumulativas relativamente grandes, durante un período de tiempo corto (particularmente por infusión), se recomienda la monitorización de la función neuromuscular para ajustar la dosis según las necesidades individuales del paciente y para suministrar información sobre la posibilidad o necesidad de la inversión farmacológica de un bloqueo en fase II con agentes anticolinesterásicos.

A dosis repetidas se produce taquifilaxia.

Efectos indeseables:

Puede producir bradicardia transitoria acompañada de hipotensión, arritmias cardíacas (taquicardia) y posiblemente un corto período de parada sinusal debido a la estimulación vagal. Ocasionalmente puede producir fasciculaciones musculares, rabdomiólisis, mioglobinemias y mioglobinuria, especialmente en niños. Aumento de la presión intraocular y presión intracraneal dolor muscular y rigidez, hipertermia y presión intragástrica elevada.

Raramente pueden presentarse hipersalivación y espasmos musculares, reacciones anafilácticas y de hipersensibilidad por liberación de histamina (rash, broncoespasmo), depresión respiratoria prolongada y apnea prolongada en pacientes con enzima pseudocolinesterasa atípica o con actividad de colinesterasa reducida.

También se han reportado hipertermia maligna, de la presión intragástrica y sialorrea.

Se han reportado paros cardíacos relacionados con hipercalemia en pacientes con parálisis cerebral congénita, tétanos, distrofia muscular de Duchenne y lesión craneal cerrada. Tales eventos han sido descritos raramente con alteraciones musculares no diagnosticadas. Existen algunos reportes de enrojecimiento facial. Puede provocar mialgia

Posología y método de administración:

El inicio de la relajación muscular después de la administración intramuscular es de aproximadamente 3 minutos. La dosis depende del peso corporal, del grado requerido de relajación muscular y de la vía de administración.

Las dosis mayores únicas podrían acelerar ligeramente la velocidad en la que se presenta la parálisis neuromuscular y producirán duración más prolongada de relajación muscular clínicamente útil, pero no directamente dependiente de la dosis; la duplicación de la dosis no prolonga necesariamente la duración de la relajación.

Para el mantenimiento de la relajación muscular durante los procedimientos quirúrgicos cortos o aquellos practicados bajo anestesia general, pueden administrarse dosis suplementarias del 50 a 100 % de la dosis inicial, a intervalos de 5 a 10 minutos, según sea necesario.

Adultos:

Para intervenciones quirúrgicas breves: Intravenosa, inicialmente 0,3 a 1,1 mg por kg de peso corporal. Se pueden administrar dosis repetidas si es necesario, calculadas en base a la respuesta a la primera dosis. La parálisis máxima puede durar aproximadamente 2 minutos. La recuperación tiene lugar en 4 a 6 minutos.

Para intervenciones quirúrgicas prolongadas: Igual a la dosis anterior pero se prefiere la infusión intravenosa continua como una solución del 0,1 al 0,2 %, administrándolo a una velocidad de 0,5 mg a 10 mg por minuto, dependiendo de la respuesta del paciente y del grado de relajación necesaria, durante un período de hasta una hora. Esto se debe realizar mediante una

monitorización cuidadosa de la función neuromuscular con un estimulante nervioso periférico para evitar la sobredosis y para detectar el desarrollo de un bloqueo de tipo no polarizante.

Terapia de electroshock:

Intravenosa, de 10 a 30 mg administrado aproximadamente un minuto antes del shock.

Intramuscular, hasta 2,5 mg por kg de peso corporal, sin sobrepasar una dosis total de 150 mg.

Relajación muscular prolongada: Se puede lograr con administraciones intermitentes intravenosas, con una dosis inicial que puede variar de 0.3 a 1.1 mg/kg, y luego puede administrarse de 0.04 a 0.07 mg/kg en intervalos apropiados para obtener el grado de relajación deseado.

Los requerimientos posológicos en los pacientes de edad avanzada son comparables a los requerimientos de los adultos de menor edad.

En el adulto de 70 kg de peso corporal, se recomienda una velocidad de infusión de 2.5 a 4 mg/minuto.

Pediatría:

Los niños son más resistentes al Suxametonio que los adultos, necesitando dosis de 1-2 mg/μg para facilitar la intubación. Es conveniente además administrar Atropina para evitar la bradicardia que se observa frecuentemente con su empleo.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Cuando se usa con aminoglucósidos, anestésicos locales, Capreomicina, Sangre anticoagulada con Citrato, Clindamicina, Lidocaína, Lincomicina, Polimixina, Procaína y Trimetofano, la actividad bloqueante neuromuscular puede ser aditiva.

Los efectos depresores respiratorios centrales de los analgésicos opiáceos pueden potencializarse cuando se administra el Cloruro de Succinilcolina, sin embargo, la liberación de histamina inducida por el Cloruro de Succinilcolina puede ser aditivo a los efectos inducidos por muchos analgésicos opiáceos, dando lugar a un aumento del riesgo de hipotensión.

Los anestésicos hidrocarbonados halogenados (Cloroformo, Ciclopropano, Enflurano, Éter, Halotano, Isoflurano, Metoxiflurano y Tricloroetileno), también pueden potenciar el bloqueo neuromuscular inducido por el Cloruro de Succinilcolina.

El uso simultáneo de fisostigmina con el Cloruro de Succinilcolina no se recomienda, ya que dosis elevadas de fisostigmina pueden producir fasciculación muscular y finalmente, un bloqueo despolarizante.

Los antimiasténicos (Neostigmina, Piridostigmina) y Edrofonio pueden prolongar el bloqueo de la fase I cuando se usan simultáneamente con el Cloruro de Succinilcolina ya que puede producirse depresión respiratoria aumentada o prolongada o parálisis respiratoria, pero esto puede reducirse si el paciente está siendo ventilado mecánicamente, sin embargo, si se ha usado el Cloruro de Succinilcolina durante un período de tiempo prolongado y el bloqueo despolarizante ha cambiado a bloqueo no polarizante, Edrofonio, Neostigmina o Piridostigmina pueden revertir el bloqueo no despolarizante.

El uso simultáneo de glucósidos digitálicos con el Cloruro de Succinilcolina pueden aumentar los efectos cardíacos, originando posiblemente arritmias cardíacas, fundamentalmente bradicardias.

Cuando se usa simultáneamente Cloruro de Succinilcolina con sales de Magnesio, Procaínamida o Quinidina éstos pueden potenciar o prolongar el bloqueo neuromuscular del Succinilcolina.

Algunos agentes pueden prolongar su actividad como los insecticidas organofosforados y el Metrifonato, las gotas oftálmicas de Ecotipato; fármacos anticolinesterasa específicos, compuestos citotóxicos (Ciclofosfamida, Mecloroetamina, Trietileno-melamina, Thiotepa y Trimetafán); medicamentos psiquiátricos (Fenelcina, Promacina y Clorpromazina); anestésicos como Ketamina, Morfina y sus antagonistas; Petidina y Pancuronio; otros fármacos con efectos potencialmente deletéreos sobre la actividad de colinesterasa plasmática como; Aprotinina, Difenhidramina, Prometazina, estrógenos esteroideos en dosis elevadas y los anticonceptivos orales.

Existen interacciones con el Clorhidrato de Tacrina, Terbutalina y Metoclopramida con esta última prolonga el bloqueo por lo que se recomienda regular el tiempo de recuperación del bloqueo.

Anfotericina B: Debido a la hipocalcemia producida por la misma.

Antagonistas del Calcio (Nifedipina): Por posible disminución de la liberación de Acetilcolina al disminuir la cantidad de calcio presente en las terminaciones nerviosas.

Antiarrítmicos (Procainamida, Lidocaína, Quinidina): Por alargamiento del período refractario retrasando por ello la respuesta muscular al impulso nervioso o al estímulo de la acetilcolina, pudiendo ocasionar depresión respiratoria.

Betabloqueadores: Por disminución de la transmisión de los impulsos a las terminaciones nerviosas motoras.

Cimetidina: Por posible inhibición del metabolismo hepático del Cloruro de Succinilcolina.

Diuréticos depletores de Potasio (Furosemida), debido a la hipocalcemia que producen pueden ocasionar alteraciones en el bloqueo neuromuscular.

Sales de Litio (Carbonato de Litio): Por alteración del balance electrolítico provocado por el Litio, que puede provocar descenso en la liberación de Acetilcolina.

Antiepilépticos (Carbamazepina, Fenitoína): disminución del bloqueo neuromuscular, por posible antagonismo a nivel de la placa neuromotriz o bien por inducción del metabolismo hepático del bloqueante neuromuscular.

Corticosteroides (Hidrocortisona, Prednisona, Prednisolona): Posible inhibición del bloqueo neuromuscular.

Teofilina: Posible inhibición del efecto bloqueante neuromuscular, por aumento de la liberación de neurotransmisores provocado por Teofilina al aumentar los niveles de AMPc. Ciclosporina.

Tiopental: Coagulación intravascular diseminada.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo: No debe administrarse a mujeres embarazadas a menos que el beneficio potencial de su uso supere en importancia los posibles riesgos para el feto. Las concentraciones plasmáticas de colinesterasa disminuyen durante el primer trimestre del embarazo y 2 – 4 días después del parto. Consecuentemente se puede presentar bloqueo neuromuscular prolongado después de la administración del Cloruro de Succinilcolina. En dosis terapéuticas normales no tiene efecto directo sobre el útero u otras estructuras con músculo liso. A las dosis habituales no cruza la barrera placentaria en cantidades suficientes para afectar la respiración del feto. El Cloruro de Succinilcolina puede usarse para relajación muscular durante cesárea, no obstante, atraviesa la placenta en bajas cantidades, pudiendo dar bloqueo residual neuromuscular (apnea, flaccidez) en el neonato después de la administración repetida o por niveles atípicos de pseudocolinesterasa en la madre. El Cloruro de Succinilcolina puede usarse en anestesia obstétrica en mujeres con actividad de colinesterasa plasmática normal.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No se ha encontrado ningún informe sobre este aspecto

Sobredosis:

Signos: Los principales efectos graves, de la sobredosificación, son apnea y prolongación de la parálisis muscular.

Tratamiento: En estos casos es necesario, mantener la permeabilidad de las vías aéreas, junto con ventilación asistida hasta que vuelva la respiración espontánea.

El empleo de Neostigmina para revertir el bloqueo de fase II inducido por Succinilcolina depende de cada caso individual, mediante la monitorización de la función neuromuscular. Si se utiliza Neostigmina, su administración deberá acompañarse por dosis apropiadas de un agente anticolinérgico como atropina.

Propiedades farmacodinámicas:

Es el análogo de la Acetilcolina que inhibe la transmisión neuromuscular por despolarización de los receptores colinérgicos de la placa neuromotriz de los músculos esqueléticos.

Los bloqueantes neuromusculares producen parálisis del músculo esquelético por bloqueo de la transmisión neural en la unión neuromuscular. La parálisis inicialmente es selectiva y generalmente aparece en los siguientes músculos de forma consecutiva; músculos elevadores de los párpados, músculos mandibulares, músculos de los miembros, músculos abdominales, músculos de los glotis y finalmente los músculos intercostales y el diafragma. Los bloqueantes neuromusculares no tienen efectos conocidos sobre el nivel de conciencia o el umbral para el dolor.

Mecanismo de acción: Es un bloqueador neuromuscular despolarizante, por lo que compite con la Acetilcolina para ocupar los receptores colinérgicos de la placa motora, y como la Acetilcolina, se combina con estos receptores para producir la despolarización, sin embargo, debido a su elevada afinidad por los receptores colinérgicos y su resistencia a la acetilcolinesterasa, produce una despolarización más prolongada que la de la Acetilcolina. Esto inicialmente da lugar a contracciones musculares transitorias, generalmente, visibles como fasciculaciones, seguido por inhibición de la transmisión neuromuscular. Este tipo de bloqueo neuromuscular puede incluso potenciarse por los anticolinesterásicos.

Con el uso prolongado o repetido de los bloqueadores neuromusculares despolarizantes puede producirse un bloqueo neuromuscular que remedia el bloqueo de un no despolarizante, ocasionando una depresión respiratoria prolongada o apnea.

El Cloruro de Succinilcolina también puede producir liberación de histamina

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Absorción: El comienzo de la acción inicial y de la relajación eficaz del músculo esquelético es dependiente de la dosis.

Distribución: Su acción comienza de 1 a 2 minutos después de su administración, persistiendo esta máxima relajación durante unos dos minutos y retomando generalmente el tono muscular a lo normal al cabo de unos seis minutos de la inyección. El Cloruro de Succinilcolina no tiene acción directa sobre el músculo liso, incluyendo el músculo uterino, pequeñas cantidades de Succinilcolina cruzan la placenta pero la experiencia clínica indica que el recién nacido no es afectado, cuando es usado durante la cesárea.

Después de 30 a 60 segundos siguientes a su aplicación intravenosa se presenta parálisis flácida que persiste durante 2 a 6 minutos.

Los músculos son afectados en la siguiente frecuencia; párpados, músculos mandibulares, de los brazos, piernas, abdomen, intercostales superiores, siendo el último en afectarse el diafragma. El tono muscular se restablece en el orden inverso.

Metabolismo: Es rápidamente hidrolizada por la colinesterasa plasmática y forma metabolitos no activos como la Succinilmonocolina (este es un bloqueador neuromuscular no despolarizante, débil y es veinte veces menos potente que el Cloruro de Succinilcolina) y después más lentamente a Ácido succínico y Colina. El gen responsable de la expresión de la colinesterasa plasmática exhibe polimorfismo y la actividad enzimática varía de un individuo a otro.

Excreción: Aproximadamente el 10 % se excreta como metabolitos inalterados por la orina.

Semivida de Eliminación: 47 seg

El Succinilcolina provoca un discreto aumento en la presión sanguínea y puede producir bradicardia por estimulación vagal.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:

Los productos elaborados en nuestro laboratorio son clasificados según la Resolución 32/2005 y Resolución 4/2006 como pertenecientes a la Clase I, es decir sin impacto significativo sobre el medio ambiente, por otro lado el análisis de nuestro residuales por el CIMAB, en la revisión inicial para la implantación del sistema de Gestión ambiental, no evidencia efecto sobre las aguas examinadas en los puntos de muestreo, no obstante como medida de nuestra entidad se decidió la colecta de las muestras residuales y su posterior disposición final, por encapsulamiento o cualquier otro método aprobado por la legislación ambiental en vigencia. La entidad cuenta con licencia para el manejo de los desechos peligrosos y permiso de bioseguridad.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 26 de septiembre 2014.