



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

CLORURO DE SUXAMETONIO (SUCCINILCOLINA)

2. VIA DE ADMINISTRACION

INTRAMUSCULAR (IM), INTRAVENOSA (IV)

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Agentes relajantes musculares de acción periférica. Derivados de la colina.

Código ATC: M03AB01.

3.1. Farmacodinamia

Cloruro de suxametonio es un agente bloqueante neuromuscular de acción ultracorta. Es un análogo de acetilcolina, inhibe la transmisión neuromuscular despolarizando las placas motoras terminales en el músculo esquelético. Se puede observar la despolarización como una fasciculación. Se inhibe la posterior transmisión neuromuscular siempre que permanezca una concentración adecuada de suxametonio en el lugar del receptor. La aparición de parálisis flácida tiene lugar en los 30 - 60 segundos siguientes a la inyección intravenosa y con una administración única, persiste durante 2 a 6 minutos.

La parálisis que sigue a la administración de suxametonio es progresiva, siendo diferentes las sensibilidades de los distintos músculos. Este hecho inicialmente implica los músculos elevadores de la cara, músculos de la glotis y finalmente los intercostales y el diafragma y todos demás músculos esqueléticos.

Se piensa que la corta duración de acción de suxametonio se debe a su rápido metabolismo en la sangre. Suxametonio se hidroliza rápidamente por acción de la colinesterasa plasmática a succinilcolina (cuyas propiedades despolarizantes relajantes musculares son poco significativas desde el punto de vista clínico) y, luego, más lentamente a ácido succínico y colina.

3.2. Farmacocinética

Se ha estudiado la farmacocinética de una dosis en bolus de suxametonio en pacientes adultos anestesiados, mediante un análisis por cromatografía de líquidos. Los parámetros farmacocinéticos de 1 mg/kg y 2 mg/kg de suxametonio respectivamente son: volumen aparente de distribución $16,4 \pm 14,7$ y $5,6 \pm 6,8$ mL/kg; aclaramiento corporal total $40,5 \pm 38,7$ y $15,0 \pm 14,8$ L/min; Área bajo la curva de concentración plasmática frente al tiempo $124,3 \pm 163,2$ y $695 \pm 1008,9$ min/ μ g/mL y vida media de eliminación $16,6 \pm 4,8$ y $11,7 \pm 4,5$ segundos. La concentración en sangre arterial de suxametonio a los 30 y 120 segundos tras la inyección de 1 mg/kg de suxametonio tiene un valor de $79,5 \pm 108,4$ y $3,3 \pm 6,7$ μ g/mL y, tras la administración de 2 mg/kg





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

de suxametonio de $336,2 \pm 512,5$ y $7,2 \pm 13,0$ $\mu\text{g/mL}$, respectivamente. No se pudo detectar suxametonio 150 segundos después de la administración tanto de 1 mg/kg como de 2 mg/kg de suxametonio.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

No se han realizado ensayos de mutación bacteriana.

Se ha examinado *in vivo* la inducción de alteraciones cromosómicas, en la prueba de la médula ósea y del sistema meiótico en ratón macho, así como en los leucocitos de pacientes tratados con 100 mg del compuesto. También se ha realizado un estudio citogenético *in vitro* en leucocitos humanos a diferentes concentraciones de exposición. Los resultados indican que cloruro de suxametonio no causa lesión cromosómica *in vivo*, o *in vitro* a niveles terapéuticos de dosis y sugieren que ni éste ni sus metabolitos representan un riesgo genético para el paciente en condiciones de uso normales.

No se han realizado estudios de carcinogenicidad.

No se han realizado estudios de reproducción animal con suxametonio. También se desconoce si suxametonio puede afectar la capacidad de reproducción o causar daño fetal cuando se administra a mujeres embarazadas.

4. INDICACIONES

Coadyuvante de la anestesia general para inducir la relajación del músculo esquelético.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos

0,3 mg a 1,1 mg/kg en dosis única o por infusión, vía intravenosa.

3 mg a 4 mg/kg, vía intramuscular.

5.2. Dosis máxima

Por vía intravenosa, la dosis total no debe exceder los 500 mg por hora. Por vía intramuscular, la dosis máxima es de 150 mg/dosis. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

Se puede administrar una dosis normal única de suxametonio a pacientes con insuficiencia renal en ausencia de hiperpotasemia. Dosis múltiples o mayores pueden originar elevaciones clínicamente significativas en el potasio sérico y no se deben utilizar.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Insuficiencia hepática

La finalización de la acción de suxametonio depende de la colinesterasa plasmática, que se sintetiza en el hígado. Aunque los niveles de colinesterasa plasmática a menudo disminuyen en pacientes con enfermedad hepática, éstos apenas son lo suficientemente bajos como para prolongar de forma significativa la apnea inducida por suxametonio.

Pacientes con la colinesterasa plasmática reducida: Los pacientes con actividad reducida de la colinesterasa plasmática pueden experimentar un prolongado e intenso bloqueo neuromuscular tras la administración de suxametonio. En estos pacientes, puede ser aconsejable administrar dosis reducidas de suxametonio.

Edad avanzada (≥ 65 años)

Los pacientes de edad avanzada pueden ser más susceptibles a las arritmias cardíacas transitorias, especialmente cuando están bajo tratamiento al mismo tiempo con fármacos de tipo digitálico. Sin embargo, los requerimientos de dosis de suxametonio en pacientes de edad avanzada se pueden comparar con los de adultos más jóvenes.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

La dosis de suxametonio depende de la edad, peso corporal, grado de relajación muscular requerida y vía de administración.

El método usual de administración es por inyección intravenosa en bolus.

Para procedimientos quirúrgicos prolongados, suxametonio puede administrarse por perfusión intravenosa como solución al 0,1% (1 mg/mL) o 0,2% (2 mg/mL) en solución estéril de glucosa al 5% o solución salina estéril al 0,9% p/v.

La velocidad de perfusión deberá ajustarse de acuerdo con la respuesta de cada paciente individual. Los requerimientos de dosis de suxametonio pueden incrementarse con el tiempo durante la perfusión intravenosa. Durante la administración de suxametonio por perfusión intravenosa, la dosis total no debe exceder los 500 mg por hora.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante uso post-comercialización y en datos de laboratorio)





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Trastornos del sistema inmunológico

Muy raras: Reacción anafiláctica.

Trastornos oculares

Frecuentes: Presión intraocular moderada.

Trastornos cardiacos

Frecuentes: Bradicardia, taquicardia.

Poco frecuentes: Arritmias, incluyendo arritmias ventriculares y paro cardíaco.

Trastornos vasculares

Frecuentes: Rubor.

Frecuencia no conocida: Hipertensión, hipotensión.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Raras: Broncoespasmo, depresión respiratoria prolongada, apnea.

Trastornos gastrointestinales

Muy frecuentes: Presión intragástrica elevada, salivación excesiva.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Frecuentes: Exantema.

Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo

Muy frecuentes: Fasciculación muscular, dolores musculares post-operatorios.

Frecuentes: Mioglobinemia, mioglobinuria, rabdomiólisis.

Raras: Trismo.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Muy raras: Hipertermia maligna.

Exploraciones complementarias

Frecuentes: Aumento transitorio del potasio sérico.

“Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene “Rafael Rangel”, a través de la página web: <http://www.inhrr.gob.ve/ram1.php>”.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Ciertos fármacos o sustancias químicas son conocidos como agentes que reducen la actividad normal de la colinesterasa plasmática y, por lo tanto, pueden prolongar los efectos de bloqueo neuromuscular de cloruro de suxametonio. Dichos fármacos son:

Insecticidas organofosforados y metrifonato.

Gotas oftálmicas de Ecotiopato.

Agentes anticolinesterásicos específicos incluyendo: neostigmina, piridostigmina, fisostigmina, edrofonio e hidrocloreto de tacrina.

Compuestos citotóxicos incluyendo: ciclofosfamida, mecloretamina, trietilen-melamina y tiotepa.

Trimetafan.

Fármacos utilizados en psiquiatría: incluyendo fenelzina, promazina y clorpromazina

Anestésicos incluyendo: ketamina, morfina y antagonistas de la morfina, petidina.

Algunos bloqueantes neuromusculares, incluyendo pancuronio.

Otros fármacos con efectos potencialmente nocivos para la actividad de la colinesterasa plasmática incluyendo aprotinina, difenhidramina, prometacina, estrógenos, esteroides a dosis altas, anticonceptivos orales, terbutalina y metoclopramida.

Ciertos fármacos o sustancias pueden aumentar o prolongar los efectos neuromusculares de cloruro de suxametonio por mecanismos no relacionados con la actividad de la colinesterasa plasmática. Éstos incluyen:

Agentes anestésicos volátiles por inhalación como halotano, enflurano, desflurano, isoflurano, dietil éter y metoxiflurano tienen poco efecto en el bloqueo en Fase I de cloruro de suxametonio, pero acelerarán el comienzo y aumentarán la intensidad de un bloqueo en Fase II inducido por suxametonio.

Antibióticos tales como aminoglucósidos, clindamicina y polimixinas.

Fármacos antiarrítmicos como quinidina, procainamida, verapamilo, beta-bloqueantes, lignocaína y procaína.

Sales de magnesio.

Carbonato de litio.

Azatioprina.

Los pacientes tratados con digitálicos son más sensibles a los efectos de hiperpotasemia exacerbada por suxametonio.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gov.ve>

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Suxametonio carece de efecto sobre la consciencia. Suxometonio se debe administrar sólo bajo anestesia general adecuada y únicamente con la estrecha supervisión de un anestesista experimentado que disponga de instalaciones adecuadas para intubación traqueal y ventilación artificial inmediatas.

Monitoreo del paciente durante y después de la intervención quirúrgica.

En pacientes con sepsis grave, la potencial aparición de hiperpotasemia parece estar relacionada con la gravedad de la infección y con su duración.

Suxametonio se hidroliza rápidamente en el organismo por la colinesterasa plasmática. Este es el mecanismo único más importante de eliminación del fármaco y es responsable de la recuperación rápida y espontánea de la función neuromuscular después de la administración de suxametonio en individuos normales.

Se suelen experimentar frecuentemente dolores musculares 1 - 2 días después de la administración de suxametonio y se produce más comúnmente en pacientes ambulatorios que se someten a intervenciones quirúrgicas cortas bajo anestesia general. Parece no haber conexión directa entre el grado de fasciculación muscular visible tras la administración de suxametonio y la incidencia o gravedad del dolor.

Puede producirse bloqueo neuromuscular prolongado e intensificado secundario a una actividad colinesterásica plasmática reducida en los siguientes estados patológicos o enfermedades:

Variación fisiológica como en caso de embarazo o puerperio.

Anormalidades de la colinesterasa plasmática determinadas genéticamente.

Tétanos grave generalizado, tuberculosis u otras infecciones graves o crónicas.

Después de quemaduras graves.

Enfermedad crónica debilitante, malignidad, anemia crónica y malnutrición.

Enfermedades autoinmunes, mixoedema, enfermedades del colágeno.

Insuficiencia hepática en fase terminal, insuficiencia renal aguda o crónica.

latrogénicos: tras el intercambio plasmático, plasmaféresis, bypass cardiopulmonar y como resultado de una terapia paralela con fármacos.

Si se va a administrar suxametonio en dosis acumulativas relativamente grandes, durante un período de tiempo relativamente corto (particularmente por perfusión), se recomienda la monitorización de la función neuromuscular para adaptar la dosis a 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.

No es aconsejable administrar suxametonio a pacientes con miastenia gravis avanzada. Aunque estos pacientes son resistentes a suxametonio, pueden desarrollar





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

fácilmente un estado de bloqueo en Fase II que puede dar lugar a un retraso en la recuperación. Los pacientes que presenten el síndrome miasténico de Eaton-Lambert son más sensibles de lo normal a suxametonio, y la dosis se deberá reducir en esos pacientes.

En adultos sanos, suxametonio ocasionalmente provoca una deceleración transitoria leve de la frecuencia cardíaca cuando se inicia la administración. Las bradicardias se observan más comúnmente en niños, y en la administración repetida de suxametonio, tanto en niños como en adultos.

El pretratamiento intravenoso con atropina o con glucopirrolato reduce significativamente la incidencia y gravedad de la bradicardia relacionada con suxametonio.

En ausencia de hiperpotasemia preexistente o inducida, raramente se observan arritmias ventriculares tras la administración de suxametonio; los pacientes que tomen fármacos del tipo de los digitálicos son, sin embargo, más susceptibles a tales arritmias.

Suxametonio no debe ser mezclado con ningún otro fármaco antes de su administración.

Suxametonio tiene carácter ácido y no se debe mezclar con soluciones con un alto grado de alcalinidad, como por ejemplo las de barbituratos.

La administración por vía IV rápida o en dosis superiores a las recomendadas ocasiona la aparición de alteraciones del sistema cardiovascular, respiratorio, muscular e hipertermia maligna.

De ser necesario se puede administrar por vía IM, si no se tiene acceso a la vía IV.

Monitoreo del sistema cardiorespiratorio durante y después de la intervención quirúrgica. Monitoreo de las concentraciones plasmáticas de potasio. En pacientes con traumatismo ocular, glaucoma, pacientes con disminución de la actividad de la colinesterasa y/o pseudocolinesterasa.

No se administre a neonatos prematuros.

En pacientes con traumatismo ocular, glaucoma y con actividad de la pseudo-colinesterasa reducida.

8.2. Embarazo

Suxametonio carece de acción directa sobre el útero o sobre otras estructuras musculares blandas. A dosis terapéuticas normales no atraviesa la barrera placentaria en cantidades suficientes como para afectar la respiración del feto. Los beneficios del uso de suxametonio como parte de una inducción de secuencia rápida de anestesia





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gov.ve>

general, normalmente compensan el posible riesgo para el feto. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que a criterio médico el balance beneficio/riesgo sea favorable.

8.3. Lactancia

Se desconoce si suxametonio o sus metabolitos se excretan en la leche humana. En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes.
En pacientes con historia personal o familiar de hipertermia maligna.
Pacientes que se estén recuperando de traumatismo grave, quemaduras graves.
Pacientes con déficit neurológico que implique lesión de la médula espinal, lesión de los nervios periféricos, pérdida muscular aguda importante (lesiones de neuronas motoras superiores y/o inferiores).
Pacientes que hayan estado inmovilizados durante períodos prolongados de tiempo.
Pacientes con hiperpotasemia preexistente.
Lesiones oculares abiertas o aumento de la presión intraocular.
Pacientes con antecedentes personales o familiares de enfermedades miotónicas congénitas, tales como miotonía congénita y distrofia miotónica.
Pacientes con miopatías musculares esqueléticas, p.ej. distrofia muscular de Duchenne, ya que su administración puede estar asociada con hipertermia maligna, arritmia ventricular y paro cardíaco secundario a rabdomiólisis aguda con hiperpotasemia.
Pacientes con colinesterasa plasmática atípica hereditaria conocida.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

Los efectos más graves de una sobredosis de cloruro de suxametonio son apnea y parálisis muscular prolongada.

10.2. Tratamiento

En tales casos es esencial mantener una vía aérea permeable con ventilación asistida hasta que retorne la respiración espontánea.

La decisión de utilizar neostigmina para invertir el bloqueo de Fase II inducido por suxametonio, depende del juicio del clínico en cada caso individual.

El control de la función neuromuscular proporcionará valiosa información con respecto a esta decisión. Si se utiliza neostigmina, su administración se debe acompañar por dosis apropiadas de un agente anticolinérgico como atropina.





**Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"**
Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

USO HOSPITALARIO

VIA DE ADMINISTRACION: Intravenosa. Intramuscular.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Junio de 2017



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel "

