

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ

Фелкарид/Felkarid 50 mg или 100 mg таблети

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Една таблета содржи 50 mg или 100 mg флекаинид ацетат.

За целосна листа на помошните супстанции видете го делот 6.1.

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Таблета

Фелкарид 50 mg таблети

Бели до белузлави, тркалезни, биконвексни таблети.

Фелкарид 100 mg таблети

Бели до белузлави, тркалезни, биконвексни таблети со разделна линија на едната страна. Таблетата може да се подели на две еднакви дози.

4. КЛИНИЧКИ ОСОБЕНОСТИ

4.1 Терапевтски индикации

Терапија за

- AV нодална реципрочна тахикардија; аритмии поврзани со синдромот Wolff-Parkinson-White и слични состојби со акцесорни патишта.
- Симптоматска одржлива вентрикуларна тахиаритмија.
- Предвремени вентрикуларни контракции и/или неодржлива вентрикуларна тахикардија, коишто предизвикуваат онеспособувачки симптоми, коишто се отпорни на друга терапија или кога пациентот не ги толерира другите можни терапевтски пристапи.
- Пароксизмални атријални аритмии (атријална фибрилација, флатер и тахикардија) кај пациенти со онеспособувачки симптоми кога е утврдено дека е потребна терапија.

Структурната срцева болест и/или нарушената лево вентрикуларна функција треба да се исклучат поради зголемиениот ризик од појава на проаритмични симптоми.
Таблетите Флекаинид ацетат може да се користат за одржување нормален ритам по конверзија постигната со друга терапија.

4.2. Дозирање и начин на употреба



Дозирање

Започнувањето на терапијата со флекаинид ацетат и приспособувањето на дозите треба да се изврши под медицински надзор и со помош на ЕКГ и со следење на нивото на флекаинид во плазмата.

За време на таквите процедури може да биде неопходна хоспитализација за одредени пациенти, особено за пациенти со вентрикуларни аритмии коишто се опасни по животот. Овие одлуки треба да ги направи специјалист.

Кај пациенти со основна органска кардиомиопатија, а особено кај оние со историја на миокарден инфаркт, терапијата со флекаинид треба да се започне само кога другите антиаритмици, кои не спаѓаат во класата IC (особено амиодарон), се неефикасни или не се толерираат и кога нефармаколошката терапија (операција, аблација или имплантиран дефибрилатор) не е индициран. Потребен е внимателен медицински надзор на ЕКГ и на концентрацијата на флекаинид во плазмата за време на терапијата.

Возрасни

Суправентрикуларни аритмии: препорачаната почетна доза е 50 mg двапати дневно. Доколку е потребно, дозата може да се зголеми до максимум 300 mg дневно.

Вентрикуларни аритмии: препорачаната почетна доза е 100 mg двапати дневно. Максималната доза е 400 mg на ден и таа е резервирана за пациенти со крупна телесна градба или кога е потребна брза контрола на аритмијата. По 3 – 5 дена се препорачува дозата постепено да се приспособува до најниското ниво што ќе ја контролира аритмијата. За време на долготрајна терапија кај некои пациенти можно е да се намали дозата.

Постари пациенти

Елиминацијата на флекаинид од плазмата може да е намалена кај постарите лица. Ова треба да се земе предвид при приспособување на дозата.

Педијатриски пациенти

Нема доволно податоци за употребата на флекаинид кај деца. Безбедноста и ефикасноста не се утврдени и затоа флекаинид не треба да се употребува кај деца под 12 години.

Концентрација во плазмата

Врз основа на супресијата на предвремените вентрикуларни контракции, се чини дека може да биде потребно нивото во плазмата да стигне до 200 – 1000 ng/ml за да се добие максимален терапевтски одговор. Концентрацијата во плазмата над 700 – 1 000 ng/ml е поврзана со зголемена веројатност за појава на несакани дејства.

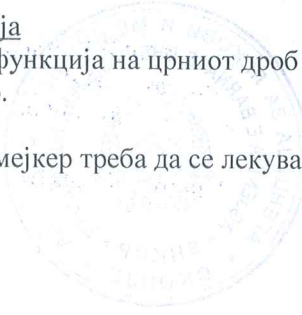
Бубрежна инсуфициенција

Кај пациентите со значајни бубрежни нарушувања (клиренс на креатинин $35 \text{ ml/min/1.73 m}^2$ или помал), максималната почетна доза треба да биде 100 mg дневно (или 50 mg двапати дневно). Кај овие пациенти потребно е постојано следење на состојбата.

Хепатална инсуфициенција

Пациентите со намалена функција на црниот дроб треба внимателно да се следат и дозата не треба да надминува 100 mg дневно.

Пациентите со траен пејсмејкер треба да се лекуваат со претпазливост. Дозата не треба да надминува 200 mg дневно.



Кај пациенти кои истовремено примаат циметидин или амиодарон потребно е внимателно следење. Кај некои пациенти дозата можеби ќе треба да се намали и да не надминува 200 mg дневно. Овие пациенти треба да се надгледуваат за време на започнувањето на терапијата и понатаму откако ќе се одреди терапијата на одржување.

Мониторинг на нивото на флекаинид во плазмата и контрола со ЕКГ се препорачуваат во редовни интервали (ЕКГ-контрола еднаш месечно и долготрајно ЕКГ на секои 3 месеци) за време на терапијата. Во периодот од започнувањето на терапијата сè до определување на дозата на одржување, ЕКГ треба да се изведува на секои 2 – 4 дена.

Кога флекаинид се користи кај пациенти со ограничување на дозата, треба да се прави честа контрола со ЕКГ (дополнително на регуларниот мониторинг на концентрацијата на флекаинид во плазмата). Приспособување на дозата треба да се врши во интервали од 6 до 8 дена. Кај тие пациенти ЕКГ треба да се направи во 2-та и во 3-та недела за да се контролира индивидуалната доза.

Начин на употреба

За орална употреба.

Таблетите треба да се земат со мало количество течност.

4.3 Контраиндикации

- Преосетливост на активната супстанција или на некој од ексципиентите наведени во делот 6.1.
- Флекаинид е контраиндициран при срцева слабост и кај пациенти со историја на миокарден инфаркт кои имаат или асимптоматски вентрикуларни ектопии или асимптоматска не-одржлива вентрикуларна тахикардија.
- Пациенти со долготрајна атријална фибрилација кај кои немало обид за враќање во синус ритам.
- Пациенти со нарушена вентрикуларна функција, кардиоген шок, тешка брадикардија (помалку од 50 отчукувања во минута) и тешка хипотензија.
- Употреба во комбинација со антиаритмици од класа I (блокатори на натриумски канали).
- Кај пациенти со хемодинамски значајна валвуларна срцева болест.
- Доколку не е достапна опрема за враќање во синус ритам, флекаинид не смее да се дава на пациенти со нарушена функција на синусен јазол, со нарушена атријална спроводливост, на пациенти со атриовентрикуларен блок од втор или од повисок степен, со блок на гранка или со дистален блок.
- Пациенти со асимптоматски или со вентрикуларни аритмии со благи симптоми не треба да користат флекаинид.
- Познат синдром Brugada.

4.4 Посебни предупредувања и мерки на претпазливост при употреба

Лекувањето со орален флекаинид треба да се спроведува под специјалистички надзор во болница:

- кај пациенти со AV-нодална реципрочна тахикардија; со аритмии поврзани со синдромот Wolff-Parkinson-White и со слични состојби со акцесорни патишта;
- при пароксизмална атријална фибрилација кај пациенти со онеспособувачки симптоми.

Почетокот на лекувањето со флекаинид и приспособувањето на дозата треба да се врши под



медицински надзор и при што е потребно и следење преку ЕКГ и мерење на концентрацијата во плазмата. Кај одредени пациенти може да биде потребна хоспитализација за време на овие постапки најчесто за пациенти со вентрикуларни аритмии потенцијално опасни за животот. Флекаинид, како и другите антиаритмици, може да предизвика проаритмични ефекти, односно може да предизвика појава на потежок тип аритмија, зголемување на фреквенцијата на постоечката аритмија или на сериозноста на симптомите (видете го делот 4.8).

Флекаинид треба да се избегнува кај пациенти со структурни срцеви заболувања или со абнормална лево вентрикуларна функција (видете го делот 4.8).

Треба да се коригираат нарушувањата во рамнотежата на електролитите (на пр. хипо- и хиперкалемија) пред да се употреби флекаинид (видете го делот 4.5 за лековите што предизвикуваат електролитни нарушувања).

Хипокалемијата или хиперкалемијата може да влијаат на дејството на антиаритмиците од класа I. Хипокалемија може да се појави кај пациенти кои користат диуретици, кортикостероиди и лаксативи.

Тешка брадикардија или тешка хипотензија треба да се коригираат пред употреба на флекаинид.

Бидејќи елиминацијата на флекаинид од плазмата може да биде значително побавна кај пациентите со тешко оштетување на црниот дроб, флекаинид не треба да се користи кај нив, освен ако потенцијалните придобивки јасно ги надминуваат ризиците. Во овие околности се препорачува мониторинг на нивото во плазмата.

Флекаинид треба да се употребува со претпазливост кај пациенти со нарушена бубрежна функција (клиренс на креатинин $\leq 35\text{ml/min/1,73 m}^2$) и се препорачува следење на концентрацијата на лекот во плазмата.

Елиминацијата на флекаинид од плазмата може да се намали кај постарите лица. Ова треба да се земе предвид при приспособување на дозата.

Флекаинид не се препорачува кај деца под 12-годишна возраст бидејќи нема доволно податоци за употребата на флекаинид кај деца.

Познато е дека флекаинид ја намалува осетливоста на ендокардот на импулсите. Овој ефект е реверзибилен и е повеќе означен на акутниот праг на импулсот отколку на хроничниот. Флекаинид треба да се користи со претпазливост кај сите пациенти со постојани пејсмејкери или со привремена електростимулација на срцето и не треба да се употребува кај пациенти кои имаат низок праг за надразнување или пејсмејкери што не може да се програмираат, освен ако не е достапна соодветна опрема за враќање во синус-ритам.

Општо земено, двојно зголемување на ширината на пулсот или на напонот е доволно за да се поврати импулсот, но може да биде тешко да се добие вентрикуларен праг на надразливост помал од 1 Волт при иницијална имплантација во присуство на флекаинид.

Флекаинид има мал негативен инотропен ефект што може да биде важно при употребата кај пациенти кои се предиспонирани за срцева слабост. Забележани се тешкотии при дефибрилација на некои пациенти. Повеќето од пријавените случаи имале претходно постоечко срцево заболување со кардијално проширување, историја на миокарден инфаркт, артериосклеротично срцево заболување и срцева слабост.

Флекаинид треба да се користи со претпазливост кај пациенти со акутен почеток на атријална



фибрилација по операција на срцето.

Се покажало дека флекаинид го зголемува ризикот од морталитет кај пациентите со асимптоматска вентрикуларна аритмија по миокарден инфаркт. Забрзување на вентрикуларниот степен на атријална фибрилација може да се појави доколку лекувањето е неуспешно. Флекаинид го продолжува QT-интервалот и го проширува QRS-комплексот за 12 – 20 %. Ефектот врз JT-интервалот е незначителен.

Синдромот Бругада може да биде демаскиран поради терапијата со флекаинид. Во случај на појава на ЕКГ-промени за време на лекувањето со флекаинид коишто може да укажат на синдромот Бругада (Brugada), треба да се размисли за прекинување на терапијата.

Флекаинид не е одобрен за употреба кај деца на возраст под 12 години, меѓутоа, пријавена е токсичност од флекаинид кај деца кои го намалиле внесот на млеко и кај доенчиња кои биле префрлени од формула на декстроза. Млечните производи (млеко, формула и евентуално јогурт) може да ја намалат апсорпцијата на флекаинид кај деца и кај доенчиња. За понатамошни предупредувања и мерки на претпазливост, видете го делот 4.5.

Важна информација поврзана со екипиентите

Овој лек содржи помалку од 1 mmol натриум (23 mg) во една таблета, т.е. би можело да се каже дека е „без натриум“.

4.5 Интеракција со други медицински производи и други форми на интеракција

Антиаритмици од класа I: Флекаинид не треба да се користи истовремено со други антиаритмични лекови од класа I (како што е кинидин).

Антиаритмици од класа II: Треба да се има предвид можноста за адитивен негативен инотропен ефект при истовремена употреба на флекаинид со антиаритмици од класа II, како што се бета-блокаторите.

Антиаритмици од класа III: Ако флекаинид се дава истовремено со амиодарон, вообичаената доза на флекаинид треба да се намали за 50 % и пациентот треба внимателно да се следи во случај да се појават негативни ефекти. Во оваа околност се препорачува следење на нивото во плазмата.

Антиаритмици од класа IV: Потребна е голема претпазливост при употребата на флекаинид со други блокатори на калциумовите канали, на пр. верапамил. Може да се појават несакани дејства опасни за животот или дури и смртоносни несакани дејства поради интеракцијата којашто може да предизвика зголемена концентрација во плазмата (видете го делот 4.9). Флекаинид во голема мера се метаболизира со CYP2D6 и истовремената употреба на лекови што го инхибираат (на пр. антидепресиви, неуролентици, пропранолол, ритонавир, некои антихистаминици) или што го индуцираат (на пр. фенитоин, фенобарбитал, карбамазепин) овој изоензим може да ја зголеми или да ја намали плазматската концентрација на флекаинид, соодветно (видете подолу).

Зголемување на концентрацијата во плазмата, може да резултира и со бубрежно оштетување поради намален клиренс на флекаинид (видете го делот 4.4).



Хипокалемијата, но исто така и хиперкалемијата или други електролитни нарушувања, треба да се коригираат пред да почне да се употреба флекаинид. Хипокалемијата може да е резултат на истовремена употреба на диуретици, кортикостероиди или лаксативи со ризик за кардиотоксичност.

Антихистаминици: Зголемен ризик од вентрикуларни аритмии со мизоластин, астемизол и со терфенадин (избегнување на истовремената употреба).

Антивирусни лекови: Концентрацијата во плазмата се зголемува со ритонавир, лопинавир и со индинавир (зголемен ризик од вентрикуларни аритмии) (избегнување на истовремената употреба).

Антидепресивни лекови: Пароксетинот, флуоксетинот и другите антидепресиви ја зголемуваат концентрацијата на флекаинид во плазмата; зголемен ризик од аритмии при употреба на трициклични антидепресиви.

Антиепилептични лекови: Ограничените податоци од пациенти кои примале познати ензимски индуктори (фенитоин, фенобарбитал, карбамазепин) покажуваат само 30 % зголемување на стапката на елиминација на флекаинид.

Анти-психотични лекови: Клозапин, халоперидол и рисперидон – зголемен ризик од аритмии.

Антималарични лекови: Кинин и халофантрин ја зголемуваат плазматската концентрација на флекаинид.

Антифунгални лекови: Терабинафинот може да ја зголеми плазматската концентрација на флекаинид како резултат на неговата инхибиција на активноста на CYP2D6.

H₂-антихистаминици: H₂-антагонистот циметидин го инхибира метаболизмот на флекаинид. Кај здрави доброволци кои примале циметидин (1 g дневно) една недела, AUC на флекаинид се зголемил за околу 30 %, а полуживотот се зголемил за околу 10 %.

Лекови што служат како помошни средства при откажување од пушење: Треба внимателно да се пристапи со истовремената употреба на бупропион (метаболизиран од CYP2D6) со флекаинид и треба да се започне со пониските дози. Ако бупропион се додава во режимот на третман на пациент кој веќе прима флекаинид, треба да се разгледа потребата за намалување на дозата на флекаинид.

Кардиотонични гликозиди: Флекаинид може да предизвика зголемување на нивото на дигоксин во плазмата за околу 15 %, што е малку веројатно да биде од клиничко значење за пациентите со плазматска концентрација во терапевтскиот опсег. Се препорачува нивото на дигоксин во плазмата во дигитализираните пациенти да се мери не помалку од шест часа по секоја доза на дигоксин, пред или по употребата на флекаинид.

Антикоагулантни лекови: Третманот со флекаинид е компатибилен со употребата на орални антикоагуланти.

4.6. Плодност, бременост и лактација



Бременост

Нема докази за безбедна употреба на лекот во текот на бременоста. Кај новозеландски бели зајаци флекаинидот употребен во големи дози предизвикал некои фетални абнормалности, но овие ефекти не биле забележани кај холандски зајаци или кај стаорци (видете го делот 5.3). Важноста на овие наоди за човекот не е утврдена. Податоците покажуваат дека флекаинидот ја преминува плацентата на фетусот кај пациентите кои земале флекаинид за време на бременоста. Флекаинид може да се користи во бременоста само ако користа ги надминува ризиците.

Доене

Флекаинид се излучува во мајчиното млеко. Концентрацијата во плазмата добиена кај доенчиња е 5 – 10 пати пониска од терапевтската концентрација на лекот (видете го делот 5.2). Иако ризикот од несакани ефекти кај доенчето е многу мал, флекаинидот треба да се користи за време на лактацијата само ако користа од неговата употреба ги надминува ризиците.

4.7 Влијание врз способноста за возење и за ракување со машини

Флекаинид ацетатот има незначително умерено влијание врз способноста за возење и за ракување со машини. Способноста за возење, за ракување со машини и работоспособноста може да бидат засегнати доколку се појават несакани ефекти како што се вртоглавица и визуелни нарушувања.

4.8 Несакани дејства

Како и другите антиаритмици, и флекаинид може да предизвика аритмија.

Постоечката аритмија може да се влоши или може да се развие нова аритмија. Ризикот од проаритмичен ефект е поголем кај пациентите со структурни срцеви заболувања и/или со значително влошена функција на левата комора.

Најчестите кардиоваскуларни несакани ефекти се AV-блок од втор и од трет степен, брадикардија, срцева слабост, болка во градите, миокарден инфаркт, хипотензија, синусен арест, тахикардија (AT и VT) и палпитации.

Најчести несакани ефекти се вртоглавица и визуелни нарушувања коишто се појавуваат кај околу 15 % од лекуваните пациенти. Овие несакани ефекти обично се минливи и исчезнуваат по прекинување на терапијата или по намалување на дозата.

Следната листа на несакани ефекти се заснова врз искуствата од клиничките студии и врз искуствата по промоцијата на лекот.

Несаканите ефекти се наведени подолу според органските класи и според фреквенцијата на појавување. Фреквенцијата на појавување е дефинирана како:

Многу често ($\geq 1 / 10$)

Често ($\geq 1/100$ и $< 1/10$)

Поврмено ($\geq 1/1\ 000$ и $< 1/100$)

Ретко ($\geq 1/10\ 000$ и $< 1/1\ 000$)

Многу ретко ($< 1/10\ 000$)

Непознато (не може да се утврди од достапните податоци)

Нарушувања на крвта и на лимфниот систем

Повремено: намален број на еритроцити, намален број на бели крвни клетки и намален број на тромбоцити.



Нарушувања на имуниот систем

Многу ретко: зголемен број на антинуклеарни антитела со или без системско воспаление.

Психијатриски нарушувања

Ретко: халуцинации, депресија, конфузија, анксиозност, амнезија, несоница.

Нарушувања на нервниот систем

Многу често: вртоглавица, зашеметеност и слабост, обично минливи.

Ретко: парестезија, атаксија, хипоестезија, хиперхидроза, синкопа, тремор, вцрвенување, сомноленција, главоболка, периферна невропатија, конвулзии, дискинезија.

Нарушувања на очите

Многу често: нарушување на видот, како што е диплопија и заматен вид.

Многу ретко: корнеални депозити.

Нарушувања на увото и на лавиринтот

Ретко: тинитус, вертиго.

Срцеви нарушувања

Чести: проаритмија (најверојатно кај пациенти со структурно срцево заболување).

Повремено: пациенти со атријална фибрилација може да развијат 1 : 1 AV спроводливост со зголемен срцев ритам.

Непознато: може да се појават промени на PR- и на QRS-интервалите поврзани со големината на дозата (видете го делот 4.4). Променет праг кај пациенти со пејсмејкер (видете го делот 4.4). AV-блок од втор и од трет степен, срцев удар, брадикардија, срцева слабост/конгестивна срцева слабост, болка во градите, хипотензија, миокарден инфаркт, палпитации, синусен арест и тахикардија (AT или VT или вентрикуларна фибрилација).

Демаскирање на постоечки синдром Бругада.

Респираторни, торакални и медијастинални нарушувања

Често: диспнеја.

Ретко: пневмонитис.

Непознато: пулмонална фиброза, интерстицијална белодробна болест.

Гастроинтестинални нарушувања

Повремено: гадење, повраќање, опстипација, абдоминална болка, намален апетит, дијареја, диспепсија, гасови.

Хепатобилијарни нарушувања

Ретко: зголемено ниво на хепаталните ензими со или без жолтица.

Непознато: хепатална дисфункција.

Нарушувања на кожата и на поткожното ткиво

Повремено: алергиски дерматитис, вклучувајќи исип, алопеција.

Ретко: тешка уртикарија.

Многу ретко: фотосензитивна реакција.



Нарушувања на мускулноскелетниот систем и на сврзните ткива
Непознато: артралгија и мијалгија.

Општи нарушувања и состојби на местото на апликација
Често: астенија, замор, пирексија, едем, чувство на непријатност.

Пријавување несакани дејства

Несаканите реакции од лековите можете да ги пријавите во Националниот центар за фармаковигиланца при Агенцијата за лекови и медицински средства (ул. „Св. Кирил и Методиј“ бр. 54, кат 1) или електронски, преку веб-страницата на Агенцијата, на <http://malmed.gov.mk/>.

4.9 Предозирање

Предозирањето со флекаинид е итна медицински состојба потенцијално опасна за животот.

Интеракциите на лекови, исто така, може да доведат до зголемена чувствителност на флекаинид и до повисока концентрација на флеканид од терапевтските нивоа (видете го делот 4.5).

Предозирањето може да предизвика хипотензија, напади, брадикардија, доцнење на спроведувањето (синаотријален или AV-блок) и асистолија. QRS- и QT-интервалите се проширени и може да се појават вентрикуларни аритмии. Флекаинид може да ја забави атријалната фибрилација или да ја претвори во флатер на атриумот со брза спроводливост.

Не постои познат начин за брзо отстранување на флекаинидот од системот. Дијализата и хемоперфузијата не се ефикасни. Ако е можно, треба да се отстрани неапсорбираниот лек од гастроинтестиналниот систем. Присилната диуреза со ацидификација на урината теоретски ја зголемува екскрецијата на лекот. Интравенозното аплицирање на липидна емулзија може да ја намали ефективната слободна фракција на флекаинид во крвотокот.

Не е позната супстанција којашто може да го неутрализира ефектот на флекаинид. Интравенозен натриум бикарбонат 8,4 % често ја намалува активноста на флекаинидот на ниво на рецепторите во рок од неколку минути.

Понатамошните мерки мора да бидат поддржувачки и може да се состојат од употреба на инотропни агенси или на срцеви стимуланси како допамин, добутамин или изопротеренол, како и механичка вентилација и циркулаторна асистенција (на пример, балон-пумпа).

Треба да се разгледа привремено вметнување на трансвенозен пејсмејкер, во случај на блок на спроводливоста. Во поединечни случаи, треба да се земе предвид екстракорпорална мембранска оксигенација (ЕСМО). Ако се претпостави дека полувремето на елиминација на флеканид е приближно 20 часа, можеби би било потребно овие мерки за поддршка да се спроведуваат подолг временски период.

5. ФАРМАКОЛОШКИ ПОДАТОЦИ

5.1 Фармакодинамски својства



Фармакотерапевтска група: антиаритмични лекови, класа Ic, флекаинид
АТС код: C01BC04.

Флекаинид спаѓа во класата Ic антиаритмици коишто се користат за лекување тешки симптоматски вентрикуларни и суправентрикуларни аритмии. Не треба да се користи при супресија на асимптоматски вентрикуларни аритмии кај пациенти со историја на миокарден инфаркт. Повеќето несакани дејства се на централниот нервен систем.

Електрофизиолошки, флекаинид е антиаритмичко соединение (класа Ic) со дејство на локален анестетик. Тој е локален анестетик од амиден тип, којшто е структурно поврзан со прокаинамид и со енкаинид, бидејќи тие се, исто така, деривати на бензамид.

Карактеризацијата на флекаинид како соединение од класа Ic се базира на три карактеристики: значајно инхибиторно дејство на брзите натриумови канали во срцето; бавна кинетика на почеток и завршување на инхибицијата на натриумовите канали (рефлектирајќи бавно прикачување и дисоцијација од натриумовите канали); и диференцијалниот ефект на лекот немајќи ефект врз времетраењето на акциониот потенцијал во вентрикуларниот мускул значително скратувајќи го во Пуркиниевите влакна.

Овој состав на својства доведува до значително намалување во брзината на спроводливоста кај влакна зависни од брзо каналските влакна за деполаризација, но покажува мало зголемување на ефективниот рефракторен период кога се тестира во изолирано срцево ткиво. Овие електрофизиолошки својства на флекаинидот може да доведат до пролонгирање на PR-интервалот и до проширување на QRS-комплексот на ЕКГ. Во многу високи концентрации, флекаинидот има слаб инхибиторен ефект врз бавните канали во миокардот. Ова е придружено со негативен инотропен ефект. Флекаинидот нема значајна интеракција со автономниот нервен систем. Лекот нема мерлив ефект врз коронарните, врз белодробните или врз другите регионални циркулациони системи.

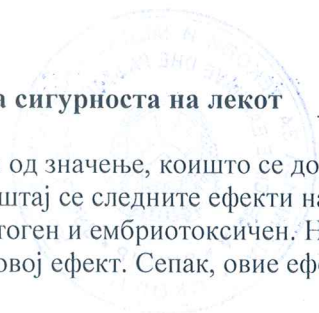
5.2 Фармакокинетски својства

Флекаинид ацетат речиси целосно се апсорбира по орална употреба и не се подложува обемен метаболизам од прв ред. Биорасположливоста на флекаинид ацетат внесен преку таблети е околу 90 %. Метаболизмот на флекаинид е подложен на генетски полиморфизам, а двата главни метаболити се m-O-деалкилиран флекаинид и m-O-деалкилиран лактам на флекаинид, и и двата имаат некоја активност. Во голема мера се излачува во урината, околу 30 % како непроменет флекаинид, а остатокот како метаболити. Околу 5 % се излачува во фецесот.

Екскрецијата на флекаинид се намалува при ренална инсуфициенција, при срцева слабост и во алкална урина. Со хемодијализа се отстранува околу 1 % од непроменетиот флекаинид. Опсегот на терапевтските концентрации во плазмата е од 200 до 1 000 ng/ml. Времето на полуживот на елиминација на флекаинид е околу 20 часа и е околу 40 % врзан за протеините во плазмата. Флекаинид ја минува плацентата и се излачува во мајчиното млеко.

5.3 Претклинички податоци за сигурноста на лекот

Единствени претклинички податоци од значење, коишто се додаток на оние веќе вклучени во другите делови на Збирниот извештај се следните ефекти на репродукцијата: кај еден вид зајаци флекаинидот бил откриен како тератоген и ембриотоксичен. Немало доволно податоци за да се воспостави безбедносна граница за овој ефект. Сепак, овие ефекти не беа забележани кај други видови



зајаци, стаорци и глумци.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1 Листа на помошни супстанции

Прежелатинизиран скроб
Кроскармелоза натриум
Микрокристална целулоза
Хидрогенизирано растително масло
Магнезиум стеарат

6.2 Инкомпатибилност

Не е применливо.

6.3 Рок на употреба

2 години.

6.4 Начин на чување

Лекот не бара посебни услови за чување.

6.5 Природа и содржина на амбалажата

Таблетите се спакувани во блистер (PVC/PVDC/Al фолија). Секој блистер содржи 10 таблети.
Кутијата содржи 30 таблети (3 блистери) и упатство за корисникот.

6.6 Посебни мерки на претпазливост при отстранување на неискористениот лек или на отпадните материјали

Нема посебни барања.
Неискористениот лек или отпадните материјали треба да се отстранат во согласност со законските барања.

7. ПРОИЗВОДИТЕЛ И НОСИТЕЛ НА ОДОВРЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

АЛКАЛОИД АД Скопје
бул. Александар Македонски бр.12,
1 000 Скопје, Република Северна Македонија
тел.: +389 2 31 04 000



факс: +389 2 31 04 021

www.alkaloid.com.mk

8. БРОЈ И ДАТУМ НА РЕШЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

9. ДАТУМ НА ПРВАТА РЕГИСТРАЦИЈА/ОБНОВА НА РЕГИСТРАЦИЈАТА

10. ДАТУМ НА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Ноември 2021 г.

