

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ЭТАЦИЗИН

Торговое наименование препарата: Этацизин

Международное непатентованное или группировочное наименование:
диэтиламинопропионилэтоксикарбониламинофенотиазин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой

Состав на одну таблетку:

действующее вещество: этацизин

(диэтиламинопропионилэтоксикарбониламинофенотиазина гидрохлорид) 50,00 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный 9,57 мг, сахара 19,30 мг, метилцеллюлоза 0,33 мг, кальция стеарат 0,80 мг;

состав оболочки:

сахара 37,695 мг, повидон К-25 0,753 мг, краситель хинолиновый желтый (Е104) 0,025 мг, краситель солнечный закат желтый (Е110) 0,003 мг, кальция карбонат 6,308 мг, магния гидроксикарбонат 3,678 мг, титана диоксид (Е171) 0,665 мг, кремния диоксид 0,827 мг, воск карнаубский 0,046 мг.

Описание: круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой желтого цвета. На поперечном разрезе видны ядро почти белого цвета и оболочка.

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения заболеваний сердца; антиаритмические средства, классы I и III; антиаритмические средства, класс IC.

Код АТХ: C01BC09.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Этацин является антиаритмическим средством класса IC (мембранные стабилизаторы). Этацин угнетает быстрый входящий натриевый поток через натриевые каналы клеточной мембраны, воздействует на натриевые каналы как на внешней, так и на внутренней поверхности клеточной мембраны. Такие дополнительные места связывания обеспечивают более

длительную активность этацизина. В меньшей степени этацизин угнетает медленный входящий кальциевый поток. Отрицательный инотропный эффект этацизина связан с блокадой медленного кальциевого потока.

Этацизин замедляет проведение возбуждения по предсердным волокнам, желудочковым волокнам, волокнам Пуркинье, а также АВ-узлу и дополнительным путям проведения, например, пучку Кента. На ЭКГ появляется удлинение интервалов PQ, PR и комплекса QRS; интервал ST, отражающий реполяризацию желудочков, не изменяется или имеет тенденцию к укорачиванию. Этацизин угнетает скорость нарастания фронта потенциала действия ($V_{\max}$), не изменяет потенциал покоя.

Этацизин не вызывает достоверного снижения частоты сердечного ритма или удлинения продолжительности интервала QT на ЭКГ. Существенно не влияет на артериальное давление.

Этацизин обладает холинолитическими свойствами и поэтому эффективен при лечении аритмий, связанных с активацией блуждающего нерва.

Этацизин имеет местно-анестезирующую и умеренную антиишемическую активность.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на всасывание этацизина. Максимальная концентрация в плазме крови достигается примерно через 2,5 часа после однократного перорального приема 100 мг активного вещества. Биодоступность – 40 %. Продолжительность действия от 6 до 8 часов.

Распределение

Примерно 90 % связывается с белками плазмы крови. Этацизин имеет большой объем распределения - примерно 400 л.

Этацизин проникает через плацентарный барьер. Выделяется с грудным молоком.

Метаболизм

Интенсивно метаболизируется при первом прохождении в печени путем N-деэтилирования, сульфоксидации, гидролиза N-10 амида, ароматического гидроксирования и конъюгация с образованием несколько метаболитов. Основной метаболит М4 (моно-N-де-этилированный этацизин) структурно схож с этацизином и поэтому, предположительно, является фармакологически активным.

Выведение

Период полувыведения составляет 2,5 часа. Из организма Этацизин выводится почками в виде метаболитов. После длительного применения препарата кумуляция не наблюдалась.

Показания к применению

Профилактика и лечение нарушений сердечного ритма: наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия, пароксизмы фибрилляции и трепетания предсердий, желудочковая и наджелудочковая тахикардия, в том числе и при синдроме Вольфа-Паркинсона-Уайта

(WPW) у взрослых пациентов без органического поражения сердца.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к этацизину или к любому из вспомогательных веществ в составе препарата.
- Нарушения проводимости (в т.ч. синоатриальная блокада, атриовентрикулярная (AV) блокада II и III степени при отсутствии электрокардиостимулятора), нарушение внутрижелудочковой проводимости (полная блокада ножек пучка Гиса).
- Выраженная гипертрофия миокарда левого желудочка.
- Острый коронарный синдром (острый инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия).
- Постинфарктный кардиосклероз.
- Выраженное расширение сердечных полостей.
- Кардиогенный шок.
- Выраженная артериальная гипотензия (артериальное давление ниже 90/60 мм ртутного столба с появлением таких клинических симптомов, как тахикардия, головокружение, спутанность сознания, беспокойство, холодная, липкая, бледная или цианотичная кожа, обморок).
- Хроническая сердечная недостаточность III-IV функционального класса по классификации NYHA.
- Снижение фракции выброса левого желудочка.
- Выраженные нарушения функций печени (класс C по Чайлд-Пью (10-15 баллов)) и/или почек (скорость клубочковой фильтрации (СКФ) < 30 мл/мин/1,73 м²).
- Беременность, период грудного вскармливания.
- Детский возраст до 18 лет.
- Одновременное применение ингибиторов моноаминоксидазы (МАО).
- При одновременном применении с антиаритмическими средствами IC (морацизин, пропафенон, лапаконитина гидробромид) и IA класса (хинидин, прокаинамид, дизопирамид, аймалин).
- Органические поражения сердца.
- Синдром Бругада.

С осторожностью

С особой осторожностью при синдроме слабости синусового узла, брадикардии, AV блокаде I степени, ишемической болезни сердца, тяжелых нарушениях периферического кровообращения, хронической сердечной недостаточности I ФК, неполной блокаде ножек пучка Гиса, закрытоугольной форме глаукомы, доброкачественной гиперплазии предстательной железы, кардиомегалии (т.к. повышается риск развития аритмогенного действия), нарушении электролитного баланса (гипокалиемии, гиперкалиемии,

гипомагниемии), при легких или умеренных нарушениях функции печени (класс А-В по Чайлд-Пью) и/или почек (СКФ 30-90 мл/мин/1,73 м²), при применении имплантированных электрокардиостимуляторов/кардиовертеров-дефибрилляторов, с препаратами, вызывающими полиморфную желудочковую тахикардию типа «пируэт» и/или увеличивающими продолжительность интервала QT на ЭКГ.

Этализин не оказывает существенного влияния на интервал QT, однако следует соблюдать осторожность при одновременном приеме с препаратами, вызывающими полиморфную желудочковую тахикардию типа «пируэт» и/или увеличивающими продолжительность интервала QT на ЭКГ.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Исследования на животных не указывают на прямое или косвенное вредное воздействие на беременность, развитие эмбриона/плода. Тем не менее клинические данные о безопасности этализина во время беременности весьма ограничены, поэтому препарат противопоказан к применению во время беременности.

Этализин выделяется с грудным молоком. Поэтому применение в период грудного вскармливания противопоказано.

Способ применения и дозы

Таблетки следует проглатывать целиком, не разжевывая и не рассасывая. Принимать внутрь, независимо от приема пищи, начиная с 50 мг (1 таблетка) 2-3 раза в сутки. При недостаточном клиническом эффекте дозу увеличивают (под обязательным контролем ЭКГ) до 50 мг 4 раза в сутки (200 мг). По достижении стойкого антиаритмического эффекта проводят поддерживающую терапию в индивидуально подобранных минимальных эффективных дозах.

Максимальная суточная доза – 200 мг.

Продолжительность курса лечения определяет лечащий врач.

При недостаточном антиаритмическом эффекте возможно комбинированное применение этализина и бета-адреноблокаторов.

Пациенты пожилого возраста

При назначении Этализина пожилым пациентам, следует соблюдать осторожность. Лечение необходимо начинать с меньшей дозировки осторожно увеличивая дозу.

При нарушении работы печени

Пациентам с нарушениями работы печени, в случае длительной терапии, Этализин необходимо принимать с осторожностью, ввиду возможного гепатотоксического эффекта. При тяжелом нарушении работы печени (класс С по Чайлд-Пью (10-15 баллов)) применение препарата противопоказано.

При нарушении работы почек

Пациентам с нарушениями работы почек следует соблюдать осторожность. При тяжелом

нарушении работы почек (СКФ < 30 мл/мин/1,73 м²) применение препарата противопоказано.

Если Вы забыли принять препарат Этацизин

Не принимайте двойную дозу, чтобы компенсировать пропущенную дозу.

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата у детей в возрасте до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Побочное действие

Побочные действия указаны соответственно группам системы органов классификации MedDRA и частотой встречаемости: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редко ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10\ 000$); неизвестно (невозможно определить по доступным данным).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головокружение, нарушение аккомодации (в начале лечения), нарушение поддержания равновесия.

Редко: головная боль.

Неизвестно: пошатывание при ходьбе или поворотах головы, сонливость, в отдельных случаях отмечена диплопия.

Нарушения со стороны сердца

Редко: атриовентрикулярная блокада, нарушение внутрижелудочковой проводимости, снижение сократимости миокарда.

Неизвестно: остановка синусового узла, уменьшение коронарного кровотока, аритмия, аритмогенное действие.

Желудочно-кишечные нарушения

Редко: тошнота, боль в верхних отделах живота.

Лабораторные и инструментальные данные

Неизвестно: удлинение интервала PQ, уплощение зубца Р на ЭКГ и удлинение комплекса QRS.

Передозировка

Этацизин имеет малую терапевтическую широту, поэтому легко может возникнуть тяжелая интоксикация (особенно при одновременном применении других антиаритмических средств).

Симптомы: удлинение интервалов PR и расширение комплекса QRS, увеличение амплитуды зубцов Т, брадикардия, синоатриальная и АВ блокада, асистолия, пароксизмы полиморфной и мономорфной желудочковой тахикардии, снижение сократимости миокарда, стойкое снижение артериального давления, головокружение, затуманенность зрения, головная боль, желудочно-кишечные расстройства.

Передозировка этацизина может нарушить жизненно важные функции пациента и вызвать смерть, поэтому лечение передозировки должно проводиться в отделении интенсивной терапии.

Лечение: симптоматическое; для лечения желудочковой тахикардии не применять антиаритмические средства IA и IC классов; натрия гидрокарбонат способен устранить расширение комплекса QRS, брадикардию и артериальную гипотензию. Гемодиализ малоэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Противопоказано применение с антиаритмическими средствами IC (морацизин, лаппаконитина гидробромид, пропафенон) и IA класса (хинидин, прокаинамид, дизопирамид, аймалин).

Этацизин нельзя назначать одновременно с ингибиторами MAO.

Комбинация бета-адреноблокаторов с Этацизином может усиливать противоаритмический эффект, в особенности по отношению к аритмиям, провоцируемым физической нагрузкой или стрессом. Такое комбинированное применение позволяет снизить дозу этацизина, что снижает риск побочных эффектов. Эта комбинация желательна для лечения и профилактики пароксизмальной тахикардии.

Совместное применение Этацизина с дигоксином увеличивает антиаритмический эффект препаратов и улучшает сократимость миокарда. В результате такого комбинированного применения возможна тошнота, потеря аппетита, что вызвано увеличением концентрации дигоксина в крови. В таком случае снижают дозу дигоксина.

Этацизин можно принимать совместно с амиодароном (III класс), что позволяет снизить дозы обоих препаратов.

Нет данных о взаимодействии этацизина с препаратами, вызывающими полиморфную желудочковую тахикардию типа «пируэт» и/или увеличивающими продолжительность интервала QT на ЭКГ. Этацизин не оказывает существенного влияния на интервал QT, однако следует соблюдать осторожность при одновременном приеме с этими препаратами.

Особые указания

Проаритмогенное действие

Как и другие антиаритмические средства, препарат Этацизин может вызывать новые или ухудшить существующие нарушения сердечного ритма. Такое проаритмогенное действие варьирует от увеличения частоты преждевременных желудочковых сокращений (желудочковых экстрасистол) до развития желудочковой тахикардии (включая полиморфную желудочковую тахикардию типа «пируэт») и фибрилляции желудочков. Некоторые из этих аритмий опасны для жизни и могут потребовать проведения реанимационных мероприятий для того, чтобы предотвратить смертельный исход. Поэтому каждый пациент, которому планируется назначить или который уже получает препарат

Этализин должен проходить электрокардиографическое и клиническое обследование до начала терапии и в период ее проведения для раннего выявления побочного действия, оценки эффективности препарата и целесообразности продолжения терапии.

Поэтому при назначении Этализина следует:

- 1) строго учитывать противопоказания к применению препарата;
- 2) заранее выявить и устранить нарушения водно-электролитного баланса (например, гипокалиемию);
- 3) избегать применения Этализина в сочетании с антиаритмиками IA и IC класса;
- 4) при подборе курсового лечения, в первые 3-5 дней приема препарата, проводить контроль динамики на основе данных ЭКГ после начальной и повторных доз Этализина или данных мониторинга ЭКГ;
- 5) немедленно прекратить лечение при учащении эктопических желудочковых комплексов, появлении блокад или брадикардии. Лечение Этажином надо также прекратить при расширении желудочковых QRS комплексов более чем на 25 %, уменьшении их амплитуды, увеличении продолжительности зубца Р на ЭКГ более 0,12 сек, увеличении интервала QT более 20% от исходного или при скорректированном QT интервале > 450 мс (по формуле Bazett).

Проаритмогенный эффект напрямую не зависит от дозы. Для его уменьшения рекомендуется совместное применение Этализина и небольших доз бета-адреноблокаторов.

Препарат Этализин предназначен для длительной профилактической антиаритмической терапии и не должен применяться для купирования пароксизмов наджелудочковой и желудочковой тахикардии.

При подборе дозы препарата Этализин для лечения пароксизмальной желудочковой тахикардии пациент должен находиться под тщательным кардиологическим наблюдением (включая мониторинг ЭКГ и контроль артериального давления) в условиях специализированного отделения, оснащенного дефибриллятором и прочим оборудованием для оказания экстренной медицинской помощи.

Влияние этализина на выживаемость пациентов с наджелудочковыми и желудочковыми нарушениями сердечного ритма не изучалось в клинических исследованиях.

Синдром Бругада

Установлено неблагоприятное влияние других антиаритмических препаратов IC класса на электрофизиологические показатели и клинические проявления при синдроме Бругада. В связи с отсутствием опыта применения этализина при синдроме Бругада применение препарата Этализин у пациентов с синдромом Бругада противопоказан (см. раздел «Противопоказания»).

Влияние на порог кардиостимуляции

Антиаритмические препараты могут влиять на пороги стимуляции и детекции имплантированных электрокардиостимуляторов/кардиовертеров-дефибрилляторов. Этацизин может увеличить порог стимуляции эндокарда, поэтому необходимо контролировать параметры имплантированных электрокардиостимуляторов/кардиовертеров-дефибрилляторов при приеме препарата Этацизин.

Кроме того, следует соблюдать осторожность у пациентов с заболеваниями печени, поскольку он может оказывать токсическое действие на гепатоциты.

Во время терапии необходимо регулярно контролировать состояние пациента и функции сердечно-сосудистой системы (ЭКГ, АД, эхокардиография).

Применение Этацизина при лечении аритмии, вызванной инфарктом миокарда, необходимо начинать с осторожностью не ранее, чем через три месяца после инфаркта миокарда, после оценки наличия у пациента постинфарктного кардиосклероза.

Вспомогательные вещества

Препарат Этацизин содержит сахарозу. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией или дефицитом сахаразы-изомальтазы не следует принимать этот препарат.

Препарат Этацизин содержит краситель солнечный закат желтый (Е 110), который может вызывать аллергические реакции.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Из-за риска развития головокружения и расстройства зрения не рекомендуется управлять транспортными средствами или обслуживать сложные механизмы, требующие повышенного внимания, способности к концентрации.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой, 50 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки ПВХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

На пачку из картона может быть нанесена наклейка (стикер), обеспечивающая контроль первого вскрытия.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

АО «Олайнфарм».

Адрес: ул. Рупницу 5, Олайне, LV-2114, Латвия.

Организация, принимающая претензии потребителей:

ООО «Олайнфарм Рус» по адресу: 125212, г. Москва, Головинское шоссе, дом 5, корпус 1, этаж 2, помещение 2137 А.

Эл.почта: olainfarm.rus@olainfarm.com



ГЕНЕРАЛЬНЫЙ ДИРЕКТОР
ООО «ОЛАЙНФАРМ РУС»
МОСКВИЧ А,Ю,

МИНЗДРАВ РОССИИ

07.06.2024

СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

Регистрационное удостоверение № П N015386/01

Дата регистрации 07.10.2008 г.

АО «Олайнфарм», Латвия
Rupnicu 5, Olaine, LV-2114, Latvia

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Этализин

таблетки, покрытые оболочкой, 50 мг

ИЗМЕНЕНИЕ № 1

Дата внесения Изменения с «___» 07.06.2024 202___ г.

Старая редакция	Новая редакция
Организация, принимающая претензии потребителей: ООО «Олайнфарм Рус» по адресу: 125212, г. Москва, Головинское шоссе, дом 5, корпус 1, этаж 2, помещение 2137 А. Эл.почта: olainfarm.rus@olainfarm.com	Организация, принимающая претензии потребителей: ООО «ТЕЛЕРА-Фарма» по адресу: 125212, г. Москва, Головинское шоссе, дом 5, корпус 1, этаж 2, помещение 2137 А. Эл.почта: info@telerapharma.ru

