

ІНСТРУКЦІЯ ДЛЯ МЕДИЧНОГО ЗАСТОСУВАННЯ ПРЕПАРАТУ БЕТАГІСТИН-КВ

Склад:

діюча речовина: бетагістину дигідрохлорид;

1 таблетка містить бетагістину дигідрохлориду у перерахуванні на 100 % речовину 8 або 16, або 24 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, маніт (Е 421), кремнію діоксид колоїдний безводний, тальк, кислоти лимонної моногідрат, кислота стеаринова.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки 8 мг: таблетки плоскоциліндричної форми, з фаскою, білого або майже білого кольору. На поверхні таблеток допускається наявність мармуровості;

таблетки 16 мг або 24 мг: таблетки плоскоциліндричної форми, з фаскою та рисою, білого або майже білого кольору. На поверхні таблеток допускається наявність мармуровості.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування вестибулярних порушень.

Код АТХ N07C A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Механізм дії бетагістину вивчений лише частково. Відомо, що існує декілька достовірних гіпотез, які були підтверджені дослідженнями, проведеними на тваринах та з участю людей.

Вплив бетагістину на гістамінергічну систему.

Встановлено, що бетагістин частково проявляє агоністичну активність щодо H1-рецепторів, а також антагоністичну активність щодо H3-рецепторів гістаміну в нервовій тканині та має незначну активність щодо H2-рецепторів гістаміну. Бетагістин збільшує обмін та вивільнення гістаміну шляхом блокування пресинаптичних H3-рецепторів та індукції процесу зниження кількості відповідних H3-рецепторів.

Бетагістин може збільшувати кровотік в кохлеарній зоні, а також у всьому головному мозку.

Наявна інформація щодо покращення кровообігу в судинах stria vascularis внутрішнього вуха, можливо, за рахунок розслаблення прекапілярних сфінктерів у системі мікроциркуляції внутрішнього вуха. Бетагістин також продемонстрував збільшення мозкового кровотоку в організмі людини.

Бетагістин сприяє вестибулярній компенсації.

Бетагістин прискорює відновлення вестибулярної функції після одnobічної нейректомії у тварин, стимулюючи і сприяючи процесу центральної вестибулярної компенсації. Цей ефект характеризується посиленням регуляції обміну і вивільнення гістаміну та реалізується в результаті антагонізму Н3-рецепторів. У людей під час лікування бетагістином також зменшувався час відновлення вестибулярної функції після нейректомії.

Бетагістин змінює активність нейронів у вестибулярних ядрах.

Було також встановлено, що бетагістин має дозозалежний інгібуючий вплив на генерацію пікових потенціалів у нейронах латеральних і медіальних вестибулярних ядер.

Відомо, що фармакодинамічні властивості бетагістину можуть забезпечити позитивний терапевтичний ефект лікарського засобу у вестибулярній системі.

Ефективність бетагістину була показана під час досліджень у пацієнтів з вестибулярним запамороченням та хворобою Мен'єра, що було продемонстровано шляхом зменшення тяжкості та частоти нападів запаморочення.

Фармакокінетика.

Всмоктування. При пероральному введенні бетагістин швидко і практично повністю всмоктується в усіх відділах шлунково-кишкового тракту. Після всмоктування лікарський засіб швидко і майже повністю метаболізується з утворенням метаболіту 2-піридилоцтової кислоти. Рівень концентрації бетагістину у плазмі крові дуже низький. Тому всі фармакокінетичні аналізи проводяться шляхом вимірювання концентрації метаболіту 2-піридилоцтової кислоти у плазмі і сечі.

При прийомі лікарського засобу з їжею максимальна концентрація (C_{max}) препарату нижча, ніж при прийомі натще. При цьому повне всмоктування бетагістину ідентичне в обох випадках, що вказує на те, що прийом їжі лише уповільнює процес всмоктування лікарського засобу.

Розподіл. Відсоток бетагістину, що зв'язується з білками плазми крові, становить менше 5 %.

Біотрансформація. Після всмоктування бетагістин швидко і майже повністю метаболізується у 2-піридилоцтову кислоту (яка не має фармакологічної

активності).

Після прийому бетагістину всередину концентрація 2-піридилоцтової кислоти у плазмі крові (та в сечі) досягає свого максимуму через 1 годину після прийому лікарського засобу та зменшується з періодом напіввиведення близько 3,5 години.

Виведення. 2-піридилоцтова кислота швидко виводиться з сечею. При прийомі лікарського засобу в дозуванні 8-48 мг близько 85 % початкової дози виявляється в сечі. Виведення бетагістину нирками або з калом є незначним.

Лінійність. Швидкість відновлення залишається постійною при пероральному прийомі 8-48 мг лікарського засобу, вказуючи на лінійність фармакокінетики бетагістину, і дає можливість припустити, що задіяний метаболічний шлях є ненасичуваним.

Показання.

Хвороба і синдром Мен'єра, які характеризуються трьома основними симптомами:

- запамороченням, що іноді супроводжується нудотою і блюванням;
- зниженням слуху (туговухістю);
- шумом у вухах.

Симптоматичне лікування вестибулярного запаморочення різного походження.

Протипоказання.

Гіперчутливість до будь-якого з компонентів лікарського засобу.
Феохромоцитома.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Досліджень *in vivo*, спрямованих на вивчення взаємодії з іншими лікарськими засобами, не проводили. З огляду на дані дослідження *in vitro* не очікується пригнічення активності ферментів цитохрому P450 *in vivo*.

Дані, отримані в умовах *in vitro*, свідчать про пригнічення метаболізму бетагістину препаратами, що інгібують активність моноаміноксидази (MAO), у тому числі підтипу B MAO (наприклад селегіліном). Рекомендується дотримуватися обережності при одночасному застосуванні бетагістину та інгібіторів MAO (включаючи вибірково підтип B MAO).

Оскільки бетагістин є аналогом гістаміну, взаємодія бетагістину з антигістамінними препаратами теоретично може вплинути на ефективність одного з цих препаратів.

Особливості застосування.

Під час лікування лікарським засобом необхідно ретельно контролювати стан пацієнтів з бронхіальною астмою та/або виразковою хворобою шлунка та дванадцятипалої кишки в анамнезі.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Немає достатніх даних щодо застосування бетагістину вагітним жінкам.

Результати досліджень на тваринах є недостатніми для оцінки впливу на перебіг вагітності, розвиток ембріона/плода, пологи та постнатальний розвиток. Потенційний ризик для людини невідомий. Бетагістин не слід застосовувати у період вагітності, за винятком випадків безперечної потреби.

Період годування груддю. Невідомо, чи проникає бетагістин у грудне молоко людини. Досліджень на тваринах щодо проникнення бетагістину в молоко не проводили. Користь від застосування лікарського засобу для матері слід співвідносити з перевагами годування груддю і потенційним ризиком для дитини.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Бетагістин показаний для лікування синдрому Мен'єра, що характеризується тріадою основних симптомів: запамороченням, зниженням слуху, шумом у вухах, – а також для симптоматичного лікування вестибулярного запаморочення. Обидва стани можуть негативно впливати на здатність керувати автомобілем та працювати з іншими механізмами. Відомо, що бетагістин на здатність керувати автомобілем і працювати з механізмами не впливав або мав несуттєвий вплив на цю здатність.

Спосіб застосування та дози.

Добова доза для дорослих становить 24-48 мг, рівномірно розподілена для прийому протягом доби.

Таблетки по 8 мг Таблетки по 16 мг Таблетки по 24 мг

1-2 таблетки	½ -1 таблетка	1 таблетка
3 рази на добу	3 рази на добу	2 рази на добу

Дозу слід підбирати індивідуально, залежно від ефекту. Зменшення симптомів інколи спостерігається тільки після двох-трьох тижнів лікування. Найкращі результати інколи досягаються при прийомі лікарського засобу протягом кількох місяців. Існують дані про те, що призначення лікування на початку захворювання запобігає його прогресуванню і/або втраті слуху на пізніх стадіях.

Пацієнти літнього віку

Досвід застосування лікарського засобу у післяреєстраційному періоді припускає, що корекція дози для цієї популяції пацієнтів не потрібна.

Ниркова недостатність

Досвід післяреєстраційного застосування свідчить, що корекція дози не потрібна.

Печінкова недостатність

Досвід післяреєстраційного застосування свідчить, що корекція дози не потрібна.

Діти. У зв'язку з недостатністю даних щодо безпеки та ефективності застосування даного лікарського засобу його не рекомендується призначати дітям (віком до 18 років).

Передозування.

Відомо кілька випадків передозування лікарського засобу. У деяких пацієнтів спостерігалися легкі і помірні симптоми (нудота, сонливість, біль у животі) після прийому лікарського засобу в дозах до 640 мг. Серйозніші ускладнення (судоми, серцево-легеневі ускладнення) спостерігалися при навмисному прийомі підвищених доз бетагістину, особливо у поєднанні з передозуванням інших лікарських засобів.

Лікування передозування повинно включати стандартні підтримуючі заходи.

Побічні реакції.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота та диспепсія, незначні розлади шлунка (блювання, гастроінтестинальний біль, здуття живота та метеоризм). Ці побічні ефекти зазвичай зникають при прийомі лікарського засобу з їжею або після зменшення дози.

З боку нервової системи: головний біль.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, наприклад анафілаксія.

З боку шкіри і підшкірної клітковини: спостерігалися реакції гіперчутливості шкіри та підшкірної жирової клітковини, зокрема ангіоневротичний набряк, висипання, свербіж і кропив'янка.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в захищеному від вологи та світла місці при температурі від 15 °С до 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, по 3 блістери у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ПАТ «Київський вітамінний завод».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

04073, Україна, м. Київ, вул. Копилівська, 38.

Web-сайт: www.vitamin.com.ua.

