

# 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 рискою, 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 однієї нейректомії у тварин, стимулюючи і сприяючи процесу центральної вестибулярної компенсації. Цей ефект характеризується посиленням регуляції обміну і вивільнення гістаміну та реалізується в результаті антагонізму H<sub>3</sub>-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<sub>max</sub>) 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 В MAO (наприклад селегіліном). Рекомендується дотримуватися обережності при одночасному застосуванні бетагістину та інгібіторів MAO (включаючи вибірково підтип В 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.** АТ «Київський вітамінний завод».

**Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.**

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

**Web-сайт:** [www.vitamin.com.ua](http://www.vitamin.com.ua).

*Дата останнього перегляду.* 22.02.2019

