

## **Склад**

*діюча речовина:* betahistine;

1 таблетка містить бетагістину дигідрохлориду 24 мг;

*допоміжні речовини:* повідон, целюлоза мікрокристалічна, лактози моногідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, кросповідон, кислота стеаринова.

## **Лікарська форма**

Таблетки.

*Основні фізико-хімічні властивості:*

таблетки по 24 мг: круглі, двоопуклі, білі або майже білі таблетки (Snap-Tab) з лінією розлому на одній стороні.

## **Фармакотерапевтична група**

Засоби для лікування вестибулярних порушень. Бетагістин.

Код АТХ N07C A01.

## **Фармакодинаміка**

Механізм дії бетагістину вивчений лише частково. Існує декілька достовірних гіпотез, які були підтверджені даними досліджень, проведених 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 у кохлеарній зоні, а також у всьому головному мозку. Фармакологічні дослідження на тваринах продемонстрували 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 односторонньої нейрехтомії 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 нейрехтомії.

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.

Фармакодинамічні властивості бетагістину, як це було показано у тварин, можуть забезпечити позитивний терапевтичний ефект препарату у вестибулярній системі.

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

## **Фармакокінетика**

*Всмоктування.* При пероральному введенні бетагістин швидко і практично повністю всмоктується в усіх відділах шлунково-кишкового тракту. Після всмоктування препарат 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 препарату з їжею максимальна концентрація (C<sub>max</sub>) препарату нижча, ніж при прийомі натще. При цьому загальна абсорбція бетагістину ідентична в обох випадках, що вказує на те, що прийом їжі лише уповільнює процес всмоктування препарату.

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

*Виведення.* 2-піридилоцтова кислота швидко виводиться з сечею. При прийомі препарату в дозі 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 препарату, що вказує 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 активної або до будь-якої з допоміжних речовин препарату. Феохромцитома (див. розділ «Особливості застосування»).

## **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій**

Дослідження *in vivo*, спрямовані 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 селегілін). Рекомендується дотримуватися обережності при одночасному застосуванні бетагістину та інгібіторів MAO (включаючи селективні інгібітори MAO-B).

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

## **Особливості застосування**

Під час лікування препаратом необхідно ретельно контролювати стан пацієнтів з бронхіальною астмою та/або виразковою хворобою шлунка і дванадцятипалої

кишки в анамнезі.

Бетагістин протипоказаний пацієнтам з феохромоцитомою. Оскільки бетагістин є синтетичним аналогом гістаміну, він може індукувати виділення пухлиною катехоламінів, що призводить до тяжкої артеріальної гіпертензії.

Препарат містить лактозу, тому його не слід застосовувати пацієнтам з рідкісними спадковими проблемами непереносимості галактози, дефіцитом лактази Лаппа або мальабсорбцією глюкози-галактози.

### **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. За даними клінічних досліджень, що вивчали вплив препарату на здатність керувати автомобілем і працювати з іншими механізмами, бетагістин не впливав або мав несуттєвий вплив на цю здатність.

### **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. Результати досліджень на тваринах не показали прямих або непрямих шкідливих наслідків стосовно репродуктивної токсичності у дозах, які відповідають дозам, застосовуваним у клінічній практиці. 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. Бетагістин проникає у молоко щурів. Ефекти, що спостерігалися після пологів у дослідженнях на тваринах, стосувалися тільки дуже високих доз. Користь від застосування препарату для матері слід співвідносити з перевагами годування груддю і потенційним ризиком для дитини.

*Фертильність.* Дослідження на щурах не виявили впливу на фертильність.

### **Спосіб застосування та дози**

Добова доза для дорослих становить 24-48 мг, рівномірно розподілена для прийому протягом доби. Таблетки слід ковтати не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю рідини під час або після їди.

Таблетки по 8 мг	Таблетки по 16 мг	Таблетки по 24 мг
1-2 таблетки 3 рази на добу	$\frac{1}{2}$ -1 таблетка 3 рази на добу	1 таблетка 2 рази на добу

Дозу слід підбирати індивідуально, залежно від ефекту. Зменшення симптомів інколи спостерігається тільки після декількох тижнів лікування.

#### *Літній вік*

Хоча на даний час дані клінічних досліджень щодо цієї групи пацієнтів обмежені, широкий досвід застосування препарату у післяреєстраційному періоді дає змогу припустити, що корекція дози для пацієнтів літнього віку не потрібна.

#### *Ниркова недостатність*

У цій групі пацієнтів спеціальних клінічних випробувань не проводили, але відповідно до досвіду післяреєстраційного застосування корекція дози не потрібна.

#### *Печінкова недостатність*

У цій групі пацієнтів спеціальних клінічних випробувань не проводили, але відповідно до досвіду післяреєстраційного застосування корекція дози не потрібна.

#### **Діти**

У зв'язку з недостатністю даних щодо безпеки та ефективності застосування бетагістину препарат не рекомендується призначати дітям (віком до 18 років).

## **Передозування**

Відомо кілька випадків передозування препарату. У деяких пацієнтів спостерігалися легкі і помірні симптоми (нудота, сонливість, біль у животі) після прийому препарату 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. Лікування передозування повинно включати стандартні підтримуючі заходи.

## **Побічні реакції**

Нижчезазначені побічні реакції спостерігалися у пацієнтів з такою частотою: дуже часто ( $\geq 1/10$ ), часто (від  $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ), нечасто (від  $\geq 1/1000$  до  $< 1/100$ ), рідко (від  $\geq 1/10000$  до  $< 1/1000$ ), дуже рідко ( $< 1/10000$ ), частота невідома (не можна визначити на основі доступних даних).

### *З боку шлунково-кишкового тракту*

Часто: нудота та диспепсія.

### *З боку нервової системи*

Часто: головний біль.

Частота невідома: сонливість.

### *З боку серця*

Рідко: відчуття серцебиття.

На додаток до випадків, про які повідомляли під час клінічних досліджень, про нижчезазначені небажані явища повідомляли спонтанно у ході післяреєстраційного застосування та відомо з наукової літератури. За наявними даними частоту не можна встановити, тому вона класифікована як невідома.

### *З боку імунної системи*

Частота невідома: реакції гіперчутливості, наприклад анафілаксія.

### *З боку шлунково-кишкового тракту*

Частота невідома: скарги на незначні розлади шлунка (блювання, гастроінтестинальний біль, здуття живота та метеоризм). Ці побічні ефекти зазвичай зникають при прийомі препарату з їжею або після зменшення дози.

*З боку шкіри і підшкірної клітковини*

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

### **Термін придатності**

3 роки.

### **Умови зберігання**

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у місцях, недоступних для дітей.

### **Упаковка**

По 10 таблеток у блістері, по 6 блістерів у коробці.

### **Категорія відпуску**

За рецептом.

### **Виробник**

Балканфарма-Дупниця АТ.

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

вул. Самоковське шосе 3, Дупниця, 2600, Болгарія.

### **Джерело інструкції**

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).