Состав

действующее вещество: бетагистина дигидрохлорид;

1 таблетка содержит бетагистина дигидрохлорида 16 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, манит (Е 421), кислота лимонная, кремния диоксид коллоидный, тальк.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: круглые, двояковыпуклые, делимые, белые или почти белые таблетки со скошенными краями, с одной стороны с насечкой и маркировкой «267» по обе стороны от насечки; таблетку можно разделить на две равные части.

Фармакотерапевтическая группа

Средства для лечения вестибулярных нарушений. Бетагистин. Код АТХ N07C A01.

Фармакодинамика

Механизм действия бетагистина изучен лишь частично. Существует несколько достоверных гипотез, были подтверждены данными исследований, проведенных на животных и с участием людей.

Влияние бетагистина на гистаминергическими систему.

Установлено, что бетагистин частично проявляет агонистической активностью в отношении Н1-рецепторов, а также антагонистической активностью в отношении Н3-рецепторов гистамина в нервной ткани и имеет незначительную активность в отношении Н2-рецепторов гистамина. Бетагистин увеличивает обмен и высвобождение гистамина путем блокировки пресинаптических Н3-рецепторов и индукции процесса снижения количества соответствующих Н3-рецепторов.

Бетагистин может увеличивать кровоток в кохлеарной зоне, а также во всем головном мозге.

Фармакологические исследования на животных продемонстрировали улучшение кровообращения в сосудах striae vascularis внутреннего уха, возможно, за счет расслабления прекапиллярных сфинктеров в системе микроциркуляции внутреннего уха. Бетагистин также продемонстрировал увеличение мозгового кровотока в организме человека.

Бетагистин способствует вестибулярной компенсации.

Бетагистин ускоряет восстановление вестибулярной функции после односторонней нейректомии у животных, стимулируя и способствуя процессу центральной вестибулярной компенсации. Этот эффект достигается усилением регуляции обмена и высвобождения гистамина и реализуется в результате антагонизма Н3-рецепторов. У людей во время лечения Бетагистин также уменьшался время восстановления вестибулярной функции после нейректомии.

Бетагистин изменяет активность нейронов в вестибулярных ядрах.

Было также установлено, что бетагистин имеет дозозависимый ингибирующее влияние на генерацию пиковых потенциалов в нейронах латеральных и медиальных вестибулярных ядер.

Фармакодинамические свойства бетагистина, как это было показано в животных, могут обеспечить положительный терапевтический эффект в вестибулярной системе.

Эффективность бетагистина была показана во время исследований у пациентов с вестибулярным головокружением и болезнью Меньера, что было продемонстрировано уменьшением тяжести и частоты приступов головокружения.

Фармакокинетика

Всасывания.

При пероральном применении бетагистин быстро и практически полностью всасывается во всех отделах желудочно-кишечного тракта. После всасывания препарат быстро и почти полностью метаболизируется с образованием метаболита 2-пиридилуксусной кислоты. Уровень концентрации бетагистина в плазме крови очень низкий. Поэтому все фармакокинетические анализы проводятся путем измерения концентрации метаболита 2-пиридилуксусной кислоты в плазме и моче.

При приеме препарата с пищей максимальная концентрация (Cmax) препарата ниже, чем при приеме натощак. При этом общая абсорбция бетагистина

идентична в обоих случаях, что указывает на то, что прием пищи только замедляет процесс всасывания препарата.

Распределение.

Процент бетагистина, что связывается с белками плазмы крови составляет менее 5%.

Метаболизм.

После всасывания бетагистин быстро и почти полностью метаболизируется в 2-пиридилуксусной кислоту (которая не имеет фармакологической активности).

После приема бетагистина концентрация 2-пиридилуксусной кислоты в плазме крови (и в моче) достигает своего максимума через 1 час после приема и уменьшается с периодом полувыведения около 3,5 часа.

Вывод.

2-пиридилуксусной кислота быстро выводится с мочой. При приеме препарата в дозе 8-48 мг около 85% начальной дозы обнаруживается в моче. Вывод бетагистина почками или с калом незначительно.

Линейность.

Скорость восстановления остается постоянной при пероральном приеме препарата в дозе 8-48 мг, указывая на линейность фармакокинетики бетагистина, и дает возможность предположить, что задействован метаболический путь является ненасыщаемой.

Показания

Болезнь и синдром Меньера, характеризующиеся тремя основными симптомами:

- головокружением, иногда сопровождается тошнотой и рвотой;
- снижением слуха (тугоухостью);
- шумом в ушах.

Симптоматическое лечение вестибулярного головокружения различного происхождения.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата.

Феохромоцитома.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследования *in vivo,* направленные на изучение взаимодействия с другими лекарственными средствами, не проводились. Учитывая данные исследования *in vitro* не ожидается подавление активности ферментов цитохрома P450 *in vivo.*

Данные, полученные в условиях *in vitro,* свидетельствуют об угнетении метаболизма бетагистина препаратами, которые ингибируют активность моноаминоксидазы (МАО), в том числе подтипа B МАО (например, селегилин). Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном применении бетагистина и ингибиторов МАО (включая B-селективные ингибиторы МАО).

Поскольку бетагистин является аналогом гистамина, взаимодействие бетагистина с антигистаминными препаратами теоретически может повлиять на эффективность одного из этих препаратов.

Особенности применения

Во время лечения необходимо тщательно контролировать состояние пациентов с бронхиальной астмой и/или язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Бетагистин показан для лечения синдрома Меньера, что характеризуется триадой основных симптомов: головокружением, снижением слуха, шумом в ушах, а также для симптоматического лечения вестибулярного головокружения. Оба состояния могут негативно влиять на способность управлять автомобилем и работать с механизмами. По данным клинических исследований, изучавших влияние на способность управлять автомобилем и работать с другими механизмами, бетагистин не влиял или имел несущественное влияние на эту способность.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Нет достаточных данных относительно применения бетагистина беременным женщинам.

Результаты исследований на животных не показали прямых или косвенных вредных последствий в отношении репродуктивной токсичности в дозах, соответствующих дозам, применяемым в клинической практике. Бетагистин не следует применять в период беременности, за исключением случаев крайней необходимости.

Период кормления грудью. Неизвестно, проникает бетагистин в грудное молоко. Бетагистин проникает в молоко крыс. Ефекты, которые наблюдались после родов в исследованиях на животных, касались только очень высоких доз. Польза от применения препарата для матери следует соотносить с преимуществами кормления грудью и потенциальным риском для ребенка.

Фертильность. Исследования на крысах не выявили влияния на фертильность.

Способ применения и дозы

Суточная доза для взрослых составляет 24-48 мг, равномерно распределяют для приема в течение суток. Таблетки следует глотать, запивая водой.

Таблетки по 8 мг	**Таблетки по 16 мг**	**Таблетки по 24 мг**
1–2 таблетки 3 раза в сутки	½–1 таблетка 3 раза в сутки	1 таблетка 2 раза в сутки

Дозу следует подбирать индивидуально, в зависимости от эффекта. Уменьшение симптомов иногда наблюдается только после нескольких недель лечения. Наилучшие результаты иногда достигаются при приеме препарата в течение нескольких месяцев. По некоторым данным, назначение лечения в начале заболевания предотвращает его прогрессирование или потере слуха на поздних стадиях.

Бетасерк® можно применять независимо от приема пищи. Во время приема препарата могут возникать незначительные желудочно-кишечные расстройства (приведены в разделе «Побочные реакции»), которые могут быть устранены путем приема препарата вместе с пищей.

Пациенты пожилого возраста

Хотя на сегодняшний день данные клинических исследований в этой группе пациентов ограничены, широкий опыт применения препарата в послерегистрационный период позволяет предположить, что коррекция дозы для пациентов пожилого возраста не требуется.

Почечная недостаточность

В этой группе пациентов специальные клинические испытания не проводились, но в соответствии с опытом послерегистрационного применения коррекция дозы не требуется.

Печеночная недостаточность

В этой группе пациентов специальные клинические испытания не проводились, но в соответствии с опытом послерегистрационного применения коррекция дозы не требуется.

Дети

В связи с недостаточностью данных по безопасности и эффективности применения препарата Бетасерк® его не рекомендуется назначать детям (в возрасте до 18 лет).

Передозировка

Известно несколько случаев передозировки препарата. У некоторых пациентов наблюдались легкие и умеренные симптомы (тошнота, сонливость, боль в животе) после приема препарата в дозе до 640 мг. Более серьезные осложнения (судороги, сердечно-легочные осложнения) наблюдались при намеренном приеме повышенных доз бетагистина, особенно в сочетании с передозировкой других лекарственных средств.

Лечение передозировки

Лечение передозировки должно включать стандартные поддерживающие мероприятия.

Побочные реакции

Нижеприведенные побочные реакции наблюдались у пациентов, получавших Бетасерк® во время плацебо-контролируемых исследований, с такой частотой: очень часто (≥ 1/10), часто (≥1/100 до <1/10), нечастые (от ≥1/1000 до <1/100), редкие (от ≥1/10000 до <1/1000), очень редко (<1/10000).

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота и диспепсия.

Со стороны нервной системы

Часто: головная боль.

В дополнение к случаям, о которых сообщалось в ходе клинических исследований, о нижеприведенные побочные эффекты сообщалось спонтанно в ходе постмаркетингового применения и известно из научной литературы. По имеющимся данным частоту нельзя установить, поэтому она классифицирована как неизвестна.

Со стороны иммунной системы

Реакции гиперчувствительности, например анафилаксия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Жалобы на незначительные расстройства желудка (рвота, гастроинтестинальный боль, вздутие живота и метеоризм). Эти побочные эффекты обычно исчезают при приеме препарата с пищей или после уменьшения дозы.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки

Наблюдались реакции гиперчувствительности со стороны кожи и подкожной жировой клетчатки, в частности ангионевротический отек, крапивница, сыпь и зуд.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Не требует особых условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 15 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной упаковке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Майлан Лабораториз САС, Франция/Mylan Laboratories SAS, France.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Рут де Бельвиль, Льйо ди Мелара, 01400, Шатийон-сюр-Шаларон, Франция/Route de Belleville, Lieu dit Maillard, 01400, Chatillon-sur-Chalaronne, France.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.