Состав

действующее вещество: betahistine;

1 таблетка содержит бетагистина дигидрохлорида 16 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактоза, кремния диоксид коллоидный, кросповидон, стеариновая кислота.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства:

таблетки по 16 мг цилиндрические, плоские, белые или почти белые таблетки, со скошенными краями с двух сторон, на одной стороне - тиснение B16, обратная сторона с насечкой.

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 гистаминергическую систему. Установлено, что бетагистин частично проявляет агонистической активностью в отношении H1-рецепторов, а также антагонистической активностью в отношении H3-рецепторов гистамина в нервной ткани и имеет незначительную активность в отношении H2-рецепторов гистамина. Бетагистин увеличивает обмен и высвобождение гистамина путем блокировки пресинаптических H3-рецепторов и индукции процесса снижения количества соответствующих H3-рецепторов.

Бетагистин может увеличивать кровоток в кохлеарной зоне, а также во всем головном мозге. Фармакологические исследования на животных продемонстрировали улучшение кровообращения в сосудах stria 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 подтверждено уменьшением тяжести и частоты приступов головокружения.

Фармакокинетика

Всасывания. При пероральном введении 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, не обладает

фармакологической активностью.

После приема бетагистина концентрация 2-пиридилуксусной кислоты в плазме крови (и в моче) достигает своего максимума через 1 час после приема препарата 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 8-48 мг, что указывает 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 активному или к любой из вспомогательных веществ препарата. Феохромоцитома (см. Раздел «Особенности применения»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследования in vivo, направленные на изучение взаимодействия с другими лекарственными средствами, не проводили. 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 В МАО (например селегилин). Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном применении бетагистина и ингибиторов МАО (включая селективные ингибиторы МАО-В).

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.

Бетагистин противопоказан пациентам с феохромоцитомой. Поскольку бетагистин является синтетическим аналогом гистамина, он может индуцировать выделение опухолью катехоламинов, что приводит к тяжелой артериальной гипертензии.

Препарат содержит лактозу, поэтому его не следует применять пациентам с редкими наследственными проблемами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы Лаппа или мальабсорбцией глюкозы-галактозы.

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 недостаточны для оценки влияния на течение беременности, развитие эмбриона / плода, роды и постнатальное развитие. Результаты исследований на животных не показали прямых или косвенных вредных последствий в отношении репродуктивной токсичности в дозах, соответствующих дозам, применяемым в клинической практике. Потенциальный риск для человека неизвестен. Бетагистин не следует применять в период беременности, за исключением случаев несомненной необходимости.

Период кормления грудью. Неизвестно, проникает бетагистин в грудное молоко. Бетагистин проникает в молоко крыс. Ефекты, наблюдавшиеся 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 распределенная для приема в течение суток. Таблетки следует глотать не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости во время или после еды.

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.

Пожилой возраст

Хотя в настоящее время данные клинических исследований по этой группы пациентов ограничены, широкий опыт применения препарата в пострегистрационный период позволяет предположить, что коррекция дозы для пациентов пожилого возраста не требуется.

Почечная недостаточность

В этой группе пациентов специальных клинических испытаний не проводили, но в соответствии с опытом послерегистрационного применения коррекция дозы не требуется.

Печеночная недостаточность

В этой группе пациентов специальных клинических испытаний не проводили, но в соответствии с опытом послерегистрационного применения коррекция дозы не требуется.

Дети

В связи с недостаточностью данных по безопасности и эффективности применения бетагистина препарат 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 с такой частотой: очень часто (≥1 / 10), часто (от ≥1 / 100 до <1/10), нечасто (от ≥1 / 1000 до <1/100), редко (от ≥1 / 10000 до <1/1000), очень редко (<1/10000), частота неизвестна (нельзя определить на основе доступных данных).

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто тошнота и диспепсия.

Со стороны нервной системы

Часто головная боль.

Частота неизвестна: сонливость.

Со стороны сердца

Редко: сердцебиение.

В дополнение к случаям, о которых сообщали во время клинических исследований, о нижеприведенные побочные эффекты сообщали спонтанно в

ходе послерегистрационного применения и известно из научной литературы. По имеющимся данным частоту нельзя установить, поэтому она классифицирована как неизвестна.

Со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: реакции гиперчувствительности, например анафилаксия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Частота неизвестна: 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

Частота неизвестна: наблюдались реакции гиперчувствительности кожи и подкожной жировой клетчатки, в частности ангионевротический отек, сыпь, зуд и крапивница.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 3 блистера в коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Каталент Германия Шорндорф ГмбХ.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Штайнбайштрассе 1 и 2, 73614 Шорндорф, Германия.

Источник инструкции

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