

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
15.08.2016 № 837
Реєстраційне посвідчення
№ UA/ 5027/01/01

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

БЕТАГІС
(BETAGIS)

Склад:

діюча речовина: бетагістину дигідрохлорид;

1 таблетка містить: бетагістину дигідрохлориду 16 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна; маніт (Е 421); кислота лимонна, моногідрат; кремнію діоксид колоїдний безводний; крохмаль картопляний; тальк.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми, з двоопуклою поверхнею, з рискою, білого або майже білого кольору.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування вестибулярних порушень.

Код АТХ N07C A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Механізм дії бетагістину вивчений лише частково. Існує декілька достовірних гіпотез, які були підтверджені даними досліджень, 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 у кохлеарній зоні, а також у всьому головному мозку.

Відомо, що фармакологічні дослідження на тваринах продемонстрували покращання 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 нейректомії у тварин, стимулюючи і сприяючи процесу центральної вестибулярної компенсації. Цей ефект характеризується посиленням регуляції обміну і вивільнення гістаміну та реалізується в результаті антагонізму H₃-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.

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 продемонстровано шляхом зменшення тяжкості та частоти нападів запаморочення.

Фармакокінетика.

Всмоктування. При внутрішньому прийомі бетагістину швидко абсорбується із травного тракту. Біодоступність препарату досягає 100 %. Після всмоктування бетагістину швидко і майже повністю метаболізується з утворенням метаболіту 2-піридилоцтової кислоти (яка не має фармакологічної активності). Рівень концентрації бетагістину в плазмі крові дуже низький, тому всі фармакокінетичні аналізи проводяться шляхом вимірювання концентрації метаболіту 2-піридилоцтової кислоти у плазмі крові та сечі.

Після прийому бетагістину всередину максимальна концентрація 2-піридилоцтової кислоти у плазмі крові (та в сечі) визначається через 1 годину після застосування та зменшується з періодом напіввиведення близько 3-4 годин.

При прийомі 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 препарату.

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

Виведення. З організму 2-піридилоцтова кислота швидко виводиться із сечею. При прийомі препарату 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 препарату, що вказує на лінійність фармакокінетики бетагістину і дає можливість припустити, що задіяний метаболічний шлях є ненасичуваним.

Клінічні характеристики.

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.

Противоказання.

Підвищена індивідуальна чутливість до бетагістину або до будь-якого з компонентів препарату.

Феохромоцитома.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження *in vivo*, направлені на вивчення взаємодії бетагістину з іншими лікарськими засобами, не проводилися. Дані дослідження *in vitro* дають змогу передбачити відсутність інгібування активності цитохромних ферментів 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 препаратом 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. Відомо, що результати досліджень бетагістину 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 нагальної потреби.

Період годування груддю. Невідомо, чи проникає бетагістин у грудне молоко людини. Відомо, що досліджень на тваринах щодо проникнення бетагістину в молоко не проводили. Користь від застосування препарату 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. За даними клінічних досліджень, бетагістин не впливав або мав несуттєвий вплив на здатність пацієнта до діяльності, що потребує підвищеної уваги та швидкості психомоторних реакцій.

Спосіб застосування та дози.

Таблетки Бетагіс приймати внутрішньо під час або після їди. Дозу препарату і тривалість курсу лікування визначає лікар індивідуально для кожного пацієнта залежно від показань та ступеня тяжкості захворювання.

Дорослим зазвичай призначати від 24 мг до 48 мг бетагістину на добу (по ½-1 таблетці 3 рази на добу).

Поліпшення стану відзначається через 2-3 тижні. Найкращі результати досягаються при курсі лікування Бетагісом протягом кількох місяців. Існуючі дані свідчать про те, що призначення препарату на початку захворювання запобігає його прогресуванню і/або втраті слуху на пізніх стадіях.

Пацієнти літнього віку.

Хоча на даний час дані досліджень у цій групі пацієнтів обмежені, широкий досвід застосування бетагістину припускає, що корекція дози для цієї популяції пацієнтів не потрібна.

Ниркова/печінкова недостатність.

У цій групі пацієнтів спеціальні клінічні випробування не проводили, але з огляду на досвід застосування бетагістину корекція дози не потрібна.

Діти.

У зв'язку з недостатністю даних щодо безпеки та ефективності застосування бетагістину в педіатричній практиці не рекомендується призначати препарат дітям.

Передозування.

Описано кілька випадків передозування бетагістином з виникненням помірних симптомів нудоти, блювання, болю в епігастральній ділянці, головного болю, сонливості після прийому препарату в дозі до 640 мг. Серйозні ускладнення – судоми, серцево-легеневі порушення – можливі при навмисному прийомі підвищених доз бетагістину, особливо у поєднанні з передозуванням іншими лікарськими засобами.

Лікування. Специфічні антидоти невідомі. Лікування симптоматичне, повинно включати стандартні підтримуючі заходи.

Побічні реакції.

Побічні реакції за частотою виникнення класифікують за такими категоріями: дуже часті ($> 1/10$), часті ($\geq 1/100$ і $< 1/10$), нечасті ($\geq 1/1000$ і $< 1/100$), рідкі ($\geq 1/10000$ і $< 1/1000$), дуже рідкі ($< 1/10000$), невідомо (частота не визначена за даними).

З боку імунної системи.

Реакції гіперчутливості (у т.ч. анафілаксія).

З боку шлунково-кишкового тракту.

Часті: нудота та диспепсія.

У деяких випадках можливі скарги на незначні розлади шлунка (блювання, відчуття дискомфорту, болю в абдомінальній ділянці внаслідок здуття та метеоризму), частіше – у пацієнтів з хронічними захворюваннями травного тракту. Ці побічні ефекти зазвичай зникають при прийомі препарату з їжею або після зменшення дози.

З боку нервової системи.

Часті: головний біль.

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 у недоступному для дітей місці, в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери в картонній пачці. По 18 таблеток у блістері; по 5 блістерів у картонній пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВ «Фарма Старт», Україна.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 03124, м. Київ, бул. І. Лепсе, 8.

Дата останнього перегляду. 15.08.2016 р.

У разі виникнення побічних ефектів та запитань щодо безпеки застосування лікарського засобу просимо звертатися до ТОВ «Фарма Старт» за адресою:

бул. І. Лепсе, 8, м. Київ, 03124

тел/факс: +38 044 281 2333