

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), кислоти лимонної 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.

Бетагістин – синтетичний аналог гістаміну. Механізм дії бетагістину вивчений лише частково. Встановлено, що бетагістин частково проявляє агоністичну активність щодо Н₁-рецепторів, а також антагоністичну активність щодо Н₃-рецепторів гістаміну в нервовій тканині та має незначну активність щодо Н₂-рецепторів гістаміну. Бетагістин збільшує обмін та вивільнення гістаміну шляхом блокування пресинаптичних Н₃-рецепторів та індукції процесу зниження кількості відповідних Н₃-рецепторів.

Препарат активізує органну мікроциркуляцію, зокрема збільшує кровотік у внутрішньому вусі та в базиліарних артеріях. Бетагістин пригнічує діаміноксидазу, блокуючи розпад ендогенного гістаміну, та стимулює Н₁-рецептори внутрішнього вуха. Результатом є вплив на прекапілярні сфінктери і збільшення прекапілярного кровотоку в лабіринті та завитці.

При стабілізації лабіринтного кровотоку відбувається нормалізація ендолімфатичного тиску як у лабіринті, так і в завитковому апараті внутрішнього вуха, внаслідок чого зменшується суб'єктивне відчуття запаморочення. Бетагістин також продемонстрував збільшення мозкового кровотоку в організмі людини.

Препарат купірує гострі напади вестибулярного запаморочення різної етіології, усуває кохлеарні розлади, шум та дзвін у вухах, попереджує розвиток глухоти. Профілактична та лікувальна ефективність системного застосування бетагістину проявляється при хворобі Мен'єра, до основних клінічних симптомів якої належать напади запаморочення (вертиго), які супроводжуються нудотою та блюванням; шум у вухах; прогресуюча туговухість. Найкращі результати спостерігалися при призначенні препарату на початкових стадіях хвороби Мен'єра, а саме зменшення тяжкості та частоти нападів запаморочення.

Бетагістин має також виражену центральну дію. Було також встановлено, що бетагістин має дозозалежний інгібуючий вплив на генерацію пікових потенціалів у нейронах латеральних і медіальних вестибулярних ядер. Блокуючи Н₃-рецептори, препарат нормалізує нейрональну трансмісію у полісинаптичних нейронах бічних ядер вестибулярного нерва на рівні моста стовбурової частини головного мозку. У пацієнтів під час лікування бетагістином також зменшується час відновлення вестибулярної функції після нейректомії.

Хоча бетагістин є гістаміноподібною речовиною, він не спричиняє порушень проникності капілярів, змін системного артеріального тиску, не впливає на тонус гладкої мускулатури внутрішніх органів та на секрецію шлункового соку.

Фармакокінетика.

Всмоктування. При внутрішньому прийомі бетагістин швидко абсорбується із травного тракту. Біодоступність препарату досягає 100 %. Після всмоктування бетагістин 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 в плазмі 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.

Протипоказання.

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 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).

При одночасному застосуванні з антигістамінними препаратами теоретично можливий антагонізм (зниження ефективності бетагістину).

Особливості застосування.

Хворим на бронхіальну астму (легкого ступеня) для контролю стану рекомендується застосовувати Бетагіс під постійним наглядом лікаря. З особливою обережністю призначають препарат хворим на виразкову хворобу шлунка та/або дванадцятипалої кишки в анамнезі.

Не рекомендується призначати Бетагіс одночасно з антигістамінними препаратами.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Немає достатніх даних щодо застосування бетагістину вагітним. Відомо, що 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 нагальної потреби.

Період годування груддю. Невідомо, чи проникає бетагістин у грудне молоко людини. Відомо, що дослідження на тваринах щодо проникнення бетагістину в молоко не проводились. 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 приймають внутрішньо під час або після їди. Дозу препарату і тривалість курсу лікування визначають індивідуально для кожного пацієнта залежно від показань та ступеня тяжкості захворювання.

При курсовому лікуванні дорослим зазвичай призначають від 24 мг до 48 мг бетагістину на добу (по ½-1 таблетці 3 рази на добу).

У більшості випадків 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 сьогодні 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 проводилися, але з огляду на досвід застосування бетагістину корекція дози не потрібна.

Діти.

У зв'язку з недостатністю даних щодо безпеки та ефективності застосування препарату Бетагіс 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. Необхідно терміново видалити препарат зі шлунка, викликати блювання або промити шлунок. Специфічні антидоти невідомі. Лікування симптоматичне.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості (у т.ч. анафілаксія).

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, 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: зрідка – головний біль.

З боку шкіри і підшкірної клітковини: зрідка – шкірні висипи, почервоніння та свербіж шкірних покривів, ангіоневротичний набряк, 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 пачці картонній. По 18 таблеток у блістері; по 5 блістерів у пачці картонній.

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.