ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ВЕСТІНОРМ®

(VESTINORM)

Склад:

діюча речовина: betahistine;

1 таблетка містить бетагістину дигідрохлориду 8 мг або 16 мг, або 24 мг у перерахуванні на 100 % суху речовину;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, повідон, магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми з плоскою поверхнею з рискою та фаскою, білого або майже білого кольору. На поверхні таблеток допускається мармуровість (для таблеток по 8 мг та 16 мг).

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 H_1-рецепторів, а також антагоністичну активність щодо H_3-рецепторів гістаміну у нервовій тканині та має незначну активність щодо H_2-рецепторів гістаміну. Бетагістин збільшує обмін та вивільнення гістаміну шляхом блокування пресинаптичних H_3-рецепторів та індукції процесу зниження кількості відповідних H_3-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 однобічної нейректомії у тварин, стимулюючи і сприяючи процесу центральної вестибулярної компенсації. Цей ефект характеризується посиленням регуляції обміну і вивільнення гістаміну та реалізується в результаті антагонізму H_3-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 Меньєра, що було продемонстровано шляхом зменшення 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_{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 %.

Біотрансформація.

Після всмоктування бетагістин швидко і майже повністю метаболізується в 2-піридилоцтову кислоту (яка не має фармакологічної активності).

Після прийому бетагістину всередину 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 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, вказуючи на лінійність фармакокінетики бетагістину, і дає можливість припустити, що задіяний метаболічний шлях є ненасичуваним.

Клінічні характеристики.

Показання.

Хвороба і синдром Меньєра, 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 будь-якого з компонентів препарату.

Феохромоцитома.

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 Р450 *in vivo.*

Дані, отримані в умовах *in vitro,* свідчать про пригнічення метаболізму бетагістину препаратами, що інгібують активність моноаміноксидази (МАО), у тому числі підтипу В МАО (наприклад селегіліном). Рекомендується дотримуватися обережності при одночасному застосуванні бетагістину та інгібіторів МАО (включаючи вибірково підтип В МАО).

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.

Рекомендується з обережністю застосовувати для лікування у пацієнтів з виразковою хворобою (в т.ч. в анамнезі), оскільки періодично виникають випадки диспепсії у пацієнтів які приймають бетагістин.

Слід з обережністю призначати бетагістин пацієнтам з наявною кропив'янкою, висипом або алергічним ринітом, оскільки можливо наростання цих симптомів.

Слід з обережністю призначати препарат пацієнтам з тяжкою гіпотензією.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Немає достатніх даних щодо застосування бетагістину вагітним жінкам.

Результати досліджень на тваринах є недостатніми для оцінки прямого чи непрямого 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 безперечної потреби.

Період годування груддю. Невідомо, чи проникає бетагістин у грудне молоко людини. Дослідження на тваринах щодо проникнення бетагістину в молоко не проводили. Бетагістин не слід застосовувати в період годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Запаморочення, зниження слуху, шум у вухах пов'язані з синдромом Меньєра можуть негативно впливати на здатність керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами. Бетагістин згідно з даними клінічних досліджень, не чинить значного впливу або ефектів, які потенційно впливають на здатність керувати автомобілем або працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Добова доза для дорослих становить 24–48 мг, рівномірно розподілена для прийому протягом доби.

Таблетки по 8 мг	*Таблетки по 16 мг*	*Таблетки по 24 мг*
1–2 таблетки 3 рази на добу	½–1 таблетка 3 рази на добу	1 таблетка 2 рази на добу

Дозу слід підбирати індивідуально, залежно від ефекту. Зменшення симптомів інколи спостерігається тільки після 2-3 тижнів лікування. Найкращі результати інколи досягаються при прийомі препарату протягом кількох місяців. Існують дані про те, що призначення лікування на початку захворювання запобігає його прогресуванню та/або втраті слуху на пізніх стадіях.

Пацієнти літнього віку

Хоча на даний час дані клінічних досліджень у цій групі пацієнтів обмежені, широкий досвід застосування препарату у післяреєстраційному періоді припускає, що корекція дози для цієї категорії пацієнтів не потрібна.

Ниркова недостатність

У цій групі пацієнтів спеціальні клінічні випробування не проводили, але відповідно до досвіду післяреєстраційного застосування корекція дози не потрібна.

Печінкова недостатність

У цій групі пацієнтів спеціальні клінічні випробування не проводили, але відповідно до досвіду післяреєстраційного застосування корекція дози не потрібна.

Діти. У зв'язку з недостатністю даних щодо безпеки та ефективності застосування препарату Вестінорм®, його не рекомендується призначати дітям (віком до 18 років).

Передозування.

Відомо кілька випадків передозування препарату. У деяких пацієнтів спостерігалися легкі та середнього ступеня тяжкості симптоми при прийомі в дозі до 640 мг (нудота, сонливість, біль у животі). Іншими симптомами передозування були блювота, диспепсія, атаксія і судоми. Серйозніші ускладнення (конвульсії, ускладнення з боку серця і легень) спостерігалися при навмисному прийомі підвищених доз бетагістину, особливо з одночасним передозуванням іншими лікарськими засобами.

Лікування: промивання шлунка і симптоматична терапія рекомендовані протягом однієї години після прийому препарату.

Побічні реакції.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота та диспепсія, 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 нервової системи: головний біль.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, наприклад анафілаксія.

З боку шкіри і підшкірної клітковини: реакції гіперчутливості шкіри та підшкірної жирової клітковини, зокрема ангіоневротичний набряк, висипання, свербіж і кропив'янка.

Термін придатності.

3 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, вказаного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати у захищеному від світла місці при температурі не вище 25 ºС.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері. Таблетки по 8 мг. По 3 блістери у пачці.

Таблетки по 16 мг та 24 мг. По 3 або 6 блістерів у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

АТ «Фармак».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 04080, м. Київ, вул. Кирилівська, 74.