ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ВЕСТІБО

(VESTIBO)

Склад:

діюча речовина: betahistine;

1 таблетка містить бетагістину дигідрохлориду 8 мг або 16 мг, або 24 мг;

допоміжні речовини: повідон, целюлоза мікрокристалічна, лактози моногідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, кросповідон, кислота стеаринова.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 8 мг: циліндричні, плоскі, білі або майже білі таблетки, зі скошеними краями з двох сторін, на одній стороні – тиснення В8, зворотна сторона плоска;

таблетки по 16 мг: циліндричні, плоскі, білі або майже білі таблетки, зі скошеними краями з двох сторін, на одній стороні – тиснення В16, зворотна сторона з насічкою;

таблетки по 24 мг: круглі, двоопуклі, білі або майже білі таблетки (Snap-Tab) з лінією розлому на одній стороні.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування вестибулярних порушень. Бетагістин. Код АТХ N07C A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Механізм дії бетагістину вивчений лише частково. Існує декілька достовірних гіпотез, які були підтверджені даними досліджень, проведених 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 в 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 підтверджено зменшенням тяжкості та частоти нападів запаморочення.

Фармакокінетика.

Всмоктування. При пероральному застосуванні 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 загальна абсорбція бетагістину ідентична 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 у 2-піридилоцтову кислоту, яка не має фармакологічної активності.

Після перорального прийому бетагістину концентрація 2-піридилоцтової кислоти у плазмі крові (та в сечі) досягає свого максимуму через 1 годину після прийому та зменшується з періодом напіввиведення близько 3,5 години.

Виведення. 2-піридилоцтова кислота швидко виводиться з сечею. При прийомі препарату в дозі 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 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 діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин 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 моноамінооксидази (МАО), у тому числі підтипу В МАО (наприклад, селегілін). Рекомендується дотримуватися обережності при одночасному застосуванні бетагістину та інгібіторів МАО (включаючи селективні інгібітори МАО-В).

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.

Препарат містить лактозу, тому його не слід застосовувати пацієнтам з рідкісними спадковими проблемами непереносимості галактози, повним дефіцитом лактази або мальабсорбцією глюкози-галактози.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Немає достатніх даних щодо застосування бетагістину вагітним жінкам. Результати досліджень на тваринах не показали прямих або непрямих шкідливих наслідків стосовно репродуктивної токсичності у дозах, які відповідають дозам, застосовуваним у клінічній практиці. Бетагістин не слід застосовувати у період вагітності, за винятком випадків нагальної потреби.

Період годування груддю. Невідомо, чи проникає бетагістин у грудне молоко людини. Бетагістин проникає у молоко щурів. Ефекти, що спостерігалися після пологів у дослідженнях на тваринах, стосувалися тільки дуже високих доз. Користь від застосування препарату для матері слід співвідносити з перевагами годування груддю і потенційним ризиком для дитини.

Фертильність. Дослідження на щурах не виявили впливу на фертильність.

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

Бетагістин показаний для лікування синдрому Меньєра, 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, що вивчали вплив препарату на здатність керувати автомобілем і працювати з іншими механізмами, бетагістин не впливав або мав несуттєвий вплив на цю здатність.

Спосіб застосування та дози.

Добова доза для дорослих становить 24–48 мг, рівномірно розподілена для прийому протягом доби. Таблетки слід ковтати, запиваючи водою.

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 декількох тижнів лікування. Найкращі результати інколи досягаються при прийомі препарату протягом кількох місяців. За деякими даними, призначення лікування на початку захворювання запобігає його прогресуванню або втраті слуху на пізніх стадіях.

Бетагістин можна застосовувати незалежно від прийому їжі. Під час прийому препарату можуть виникати незначні шлунково-кишкові розлади (наведені у розділі «Побічні реакції»), які можуть бути усунені шляхом прийому препарату разом з їжею.

Пацієнти літнього віку

Хоча на даний час дані клінічних досліджень щодо цієї групи пацієнтів обмежені, широкий досвід застосування препарату у післяреєстраційному періоді дає змогу припустити, що корекція дози для пацієнтів літнього віку не потрібна.

Ниркова недостатність

У цій групі пацієнтів спеціальних клінічних випробувань не проводили, але відповідно до досвіду післяреєстраційного застосування корекція дози не потрібна.

Печінкова недостатність

У цій групі пацієнтів спеціальних клінічних випробувань не проводили, але відповідно до досвіду післяреєстраційного застосування корекція дози не потрібна.

Діти.

У зв’язку з недостатністю даних щодо безпеки та ефективності застосування бетагістину його не рекомендується призначати дітям (віком до 18 років).

Передозування.

Відомо кілька випадків передозування препарату. У деяких пацієнтів спостерігалися легкі і помірні симптоми (нудота, сонливість, біль у животі) після прийому препарату в дозах до 640 мг. Серйозніші ускладнення (судоми, серцево-легеневі ускладнення) спостерігалися при навмисному прийомі підвищених доз бетагістину, особливо у поєднанні з передозуванням інших лікарських засобів.

Лікування передозування. Лікування передозування повинно включати стандартні підтримуючі заходи.

Побічні реакції.

Нижчезазначені побічні реакції спостерігалися у пацієнтів, які застосовували

бетагістин під час плацебо-контрольованих досліджень, з такою частотою: дуже часто (≥1/10), часто (від ≥1/100 до <1/10), нечасто (від ≥1/1000 до <1/100), рідко (від ≥1/10000 до <1/1000), дуже рідко (<1/10000).

З боку шлунково-кишкового тракту

Часто: нудота та диспепсія.

З боку нервової системи

Часто: головний біль.

На додаток до випадків, про які повідомляли під час клінічних досліджень, про нижчезазначені небажані явища повідомляли спонтанно у ході післяреєстраційного застосування та відомо з наукової літератури. За наявними даними частоту не можна встановити, тому вона класифікована як невідома.

З боку імунної системи

Реакції гіперчутливості, наприклад анафілаксія.

З боку шлунково-кишкового тракту

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 шкіри і підшкірної клітковини

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

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 ºС.

Зберігати у місцях, недоступних для дітей.

Упаковка.

Таблетки по 8 мг: по 10 таблеток у блістері, по 3 блістери у коробці;

таблетки по 16 мг: по 10 таблеток у блістері, по 3 блістери у коробці;

таблетки по 24 мг: по 10 таблеток у блістері, по 2 блістери у коробці;

по 6 блістерів у коробці – **для виробника Балканфарма-Дупниця АТ;**

по 15 таблеток у блістері, по 4 блістери у коробці – **для виробника Каталент Німеччина Шорндорф ГмбХ, Німеччина.**

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробники.

Каталент Німеччина Шорндорф ГмбХ.

Балканфарма-Дупниця АТ.

Місцезнаходження виробників та адреси місця провадження їх діяльності.

Штайнбайштрассе 1 і 2, 73614 Шорндорф, Німеччина.

вул. Самоковське шосе 3, Дупниця, 2600, Болгарія.