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 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 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 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: зменшувалися тяжкість та частота нападів запаморочення.
Фармакокінетика.
Всмоктування. При пероральному застосуванні бетагістин швидко і практично повністю всмоктується в усіх відділах шлунково-кишкового тракту. Після всмоктування бетагістин швидко і майже повністю метаболізується з утворенням метаболіту 2-піридилоцтової кислоти. 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.
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 %.
Біотрансформація. Після всмоктування бетагістин швидко і майже повністю метаболізується в 2-піридилоцтову кислоту (яка не має фармакологічної активності).
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 3,5 години.
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 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.

Підвищена індивідуальна чутливість до бетагістину або до будь-якого з компонентів лікарського засобу.
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 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, 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 із цих препаратів.
Особливості застосування.
Під час лікування препаратом необхідно ретельно контролювати стан пацієнтів з бронхіальною астмою і/або виразковою хворобою шлунка та дванадцятипалої кишки в анамнезі.
Цей лікарський засіб містить маніт, тому може чинити м'яку проносну дію.
Застосування у період вагітності або годування груддю.
Вагітність. Немає достатніх даних щодо застосування бетагістину вагітним жінкам. Дослідження на тваринах не виявили прямих або непрямих шкідливих наслідків для репродуктивної системи при застосуванні бетагістину у дозах, що 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 в молоко щурів. Ефекти, що спостерігались у дослідженнях на тваринах після пологів, виникали тільки після застосування дуже високих доз.
Користь від застосування лікарського засобу 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, 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 всередину під час або після їди. Під час лікування можуть виникати незначні шлунково-кишкові розлади (див. розділ «Побічні реакції»), яких можна уникнути, приймаючи лікарський засіб разом з їжею.
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. Наявні 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 свідчить, 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 (віком до 18 років).
Передозування.
Описано кілька випадків передозування бетагістином. У деяких пацієнтів спостерігалися легкі і помірні симптоми (нудота, біль в епігастральній ділянці, сонливість) 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 інших лікарських засобів.
Лікування. Лікування передозування повинно включати стандартні підтримуючі заходи.
Побічні реакції.
Побічні реакції за частотою виникнення класифікують за такими категоріями: дуже часті (> 1/10), часті (≥ 1/100 і < 1/10), нечасті (≥ 1/1000 і < 1/100), рідкі (≥ 1/10000 і < 1/1000), дуже рідкі (< 1/10000), частота невідома (неможливо визначити за наявними 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, біль в абдомінальній ділянці, здуття та метеоризм). Ці побічні ефекти зазвичай зникають при прийомі препарату з їжею або після зменшення дози.
З боку нервової системи.
Часті: головний біль.
На додаток до даних клінічних досліджень, з досвіду постмаркетингового застосування та з наукової літератури відомо про нижчезазначені небажані явища.

З боку шкіри і підшкірної клітковини.
Частота невідома: реакції гіперчутливості з боку 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 ºС.
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 адреса місця провадження його діяльності.
Україна, 03124, м. Київ, бульвар Вацлава Гавела, 8.