

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, з двосторонньою фаскою, тиснення В8 з однієї сторони, зворотна сторона – плоска;

таблетки по 16 мг: циліндричні, плоскі, білі або майже білі таблетки, з двосторонньою фаскою, тиснення В16 з однієї сторони, зворотна сторона – з насічкою;

таблетки по 24 мг: круглі, двоопуклі білі або майже білі таблетки, з заглибленою насічкою з однієї сторони.

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, проведених на тваринах та за 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 в 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 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 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 в вестибулярній системі.

Ефективність бетагістину була показана під час досліджень у пацієнтів з вестибулярним запамороченням та хворобою Мен'єра, що було підтверджено зменшенням тяжкості та частоти нападів запаморочення.

Фармакокінетика.

Всмоктування. При пероральному введенні бетагістину 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 бетагістину швидко і майже повністю метаболізується в 2-піридилоцтову кислоту, яка не має фармакологічної активності (див. інформацію вище).

Після прийому бетагістину всередину концентрація 2-піридилоцтової кислоти в 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 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 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 чутливість до активної або до будь-якої з допоміжних речовин препарату. Феохромоцитома.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження *in vivo*, направлені на вивчення взаємодії з іншими лікарськими засобами, не проводилися. З огляду на дані дослідження *in vitro* не очікується пригнічення активності ферментів цитохрому P450 *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 та дванадцятипалої кишки в анамнезі.

Препарат містить лактозу, тому його не застосовувати при спадковій непереносимості галактози, дефіциті лактази Лаппа або порушенні мальабсорбції глюкози-галактози.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Немає достатніх даних щодо застосування бетагістину вагітним жінкам.

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 безперечної потреби.

Період годування груддю. Невідомо, чи проникає бетагістин у грудне молоко людини. 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, 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.

<i>Таблетки по 8 мг</i>	<i>Таблетки по 16 мг</i>	<i>Таблетки по 24 мг</i>
1–2 таблетки 3 рази на добу	$\frac{1}{2}$ 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 двох-трьох 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 і/або втраті слуху на пізніх стадіях.

Літній вік

Хоча на сьогодні дані клінічних досліджень щодо цієї групи пацієнтів обмежені, широкий досвід застосування препарату у післяреєстраційному періоді припускає, що корекція дози для цієї популяції пацієнтів не потрібна.

Ниркова недостатність

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

Печінкова недостатність

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

Діти.

У зв'язку з недостатністю даних щодо безпеки та ефективності застосування бетагістину, препарат 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 з такою частотою: дуже часті ($\geq 1/10$), часті (від $\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасті (від $\geq 1/1000$ до $<1/100$), поодинокі (від $\geq 1/10000$ до $<1/1000$), рідкісні ($<1/10000$).

З боку шлунково-кишкового тракту

Часті: нудота та диспепсія.

З боку нервової системи

Часті: головний біль.

Побічні реакції, частота яких 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 шкіри та підшкірної жирової клітковини, зокрема ангіоневротичний набряк, висипання, свербіж і кропив'янка.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °C.

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 15 таблеток у блістері, по 4 блістери у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Каталент Джермані Шорндорф ГмбХ/Catalent Germany Schorndorf GmbH.

Балканфарма-Дупниця АД/Balkanpharma-Dupnitsa AD.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Штенбейштрассе 1 і 2, D-73614 Шорндорф, Німеччина/

Steinbeisstr. 1 und 2, 73614 Schorndorf, Germany.

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

3 Samokovsko Shosse Street, Dupnitsa, 2600, Bulgaria.