

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ВАЗОСЕРК ФОРТ
(VASOSERC FORT)

Склад:

діюча речовина: betahistine

1 таблетка містить бетагістину дигідрохлориду 16 мг;

допоміжні речовини: маніт (Е 421), целюлоза мікрокристалічна, поліпласдонXL, кислота лимонна моногідрат, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний, кислота стеаринова

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі таблетки білого кольору з лінією розлому з одного боку.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування вестибулярних порушень.

Код АТХ N07C A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Механізм дії бетагістину вивчений лише частково. Існує кілька гіпотез, що підтверджуються даними досліджень, проведеними з тваринами 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_2 -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_1 -рецепторів.

Бетагістин може збільшити кровотік до кохлеарної зони, а також до всього головного 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 виявив збільшення мозкового кровотоку в організмі людини.

Бетагістин сприяє вестибулярній компенсації

Бетагістин прискорює відновлення вестибулярної функції після односторонньої нейректомії у тварин, прискорюючи 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 у дослідженнях у пацієнтів з вестибулярним запамороченням та хворобою Мен'єра, що було продемонстровано шляхом зменшення тяжкості та зменшення частоти нападів запаморочення.

Фармакокінетика.

Всмоктування

При пероральному введенні бетагістин швидко і практично повністю всмоктується в шлунково-кишковому тракті. 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 виявляється нижче, ніж при прийомі натще. При цьому повне всмоктування бетагістину ідентичне в обох випадках, вказуючи на те, що прийом їжі лише уповільнює процес всмоктування препарату.

Розподіл

Відсоток бетагістину, що пов'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 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 у 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 дозволяє припустити, що задіяний метаболічний шлях залишається неінтенсивним.

Клінічні характеристики.

Показання.

Хвороба і синдром Мен'єра, що 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 форми взаємодій.

Досліджень *in vivo* щодо вивчення взаємодії з іншими лікарськими засобами не проводили. 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 (MAO), у тому числі підтипу В MAO (наприклад селегіліном).

Рекомендується дотримуватися обережності при одночасному застосуванні бетагістину та інгібіторів MAO (включаючи вибірково підтип В MAO).

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.

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 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 по ½ -1 таблетці 3 рази на добу.

Препарат бажано приймати під час їжі або протягом короткого проміжку часу після приймання їжі. Дозу слід підбирати індивідуально залежно від ефекту. Зменшення симптомів інколи спостерігається тільки після 2-3 тижнів лікування. Найкращі результати 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.

Пацієнти літнього віку

Хоча на даний момент дані клінічних досліджень у цій групі пацієнтів обмежені, досвід застосування препарату у післяреєстраційному періоді дозволяє припустити, що корекція дози у цій 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 препарату Вазосерк 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 препаратів 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 ($\geq 1/10$), часто (від $\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто (від $\geq 1/1000$ до $<1/100$), поодинокі (від $\geq 1/10000$ до $<1/1000$), рідкісні ($<1/10000$).

З боку шлунково-кишкового тракту

Часто: нудота та диспепсія.

З боку нервової системи

Часто: головний біль.

На додаток до випадків, про які повідомлялося під час клінічних досліджень, про нижчезазначені небажані явища повідомлялося спонтанно у ході постмаркетингового 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 шкіри та підшкірної жирової клітковини, зокрема ангіоневротичний набряк, висипання, свербіж і кропив'янка.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 30 °C в захищеному від вологи та недоступному для дітей місці.

Упаковка.

15 таблеток у блістері; по 2 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

АБДІ ІБРАХІМ Ілач Санаї ве Тіджарет А.Ш.

ABDI İBRAHİM İlaç Sanayi ve Ticaret A.Ş.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Санаї Махаллеші Тунч Джаддесі №3, Есенюрт/Стамбул, Туреччина.

Sanayi Mahallesi Tunc Caddesi №3: Esenyurt/Istanbul Turkey.