

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

**БЕТАСЕРК®
(BETASERC®)**

Склад:

діюча речовина: бетагістину дигідрохлорид;

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

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, маніт (Е 421), кислоти лимонної моногідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, тальк.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 8 мг: круглі, плоскі, білі або майже білі таблетки зі скошеними краями, з маркуванням «256» з одного боку таблетки;

таблетки по 16 мг: круглі, двоопуклі, ділимі, білі або майже білі таблетки зі скошеними краями, з одного боку з насічкою і маркуванням «267» по обидва боки від насічки; таблетку можна розділити на дві рівні дози;

таблетки по 24 мг: круглі, двоопуклі, ділимі, білі або майже білі таблетки зі скошеними краями, з одного боку з насічкою і маркуванням «289» по обидва боки від насічки; насічка призначена тільки для полегшення розламування таблетки з метою полегшення її проковтування і не призначена для поділу таблетки на дві рівні дози.

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 за участю людей.

Вплив бетагістину на гістамінергічну систему.

Встановлено, що бетагістин частково проявляє агоністичну активність щодо H₁-рецепторів, а також антагоністичну активність щодо H₂-рецепторів гістаміну в нервовій тканині та має незначну активність щодо H₂-рецепторів гістаміну. Бетагістин збільшує обмін та вивільнення гістаміну шляхом блокування пресинаптичних H₃-рецепторів та індукції процесу зниження кількості відповідних H₁-рецепторів.

Бетагістин може збільшувати кровотік в кохлеарній зоні, а також у всьому головному мозку

Фармакологічні дослідження на тваринах продемонстрували покращення кровообігу в судинах *trixia 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 одnobічної нейректомії у тварин, стимулюючи і сприяючи процесу центральної вестибулярної компенсації. Цей ефект характеризується посиленням регуляції обміну і вивільнення гістаміну та реалізується в результаті антагонізму H₁-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 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 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 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 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.

Гіперчутливість до будь-якого з компонентів 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 (MAO), у тому числі підтипу B MAO (наприклад селегіліном).

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

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 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.

Пацієнти літнього віку

Хоча на сьогодні дані клінічних досліджень у цій групі 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 препарату Бетасерк® 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 у 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 Бетасекс[®] під час плацебо-контрольованих досліджень, 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.

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 ігеміневротичний набряк, висипання, свербіж і кропив'янка.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °C. Зберігати в недоступному для дітей місці

Упаковка.

Таблетки по 8 мг: по 15 таблеток у блістері, по 2 блістери в картонній упаковці; по 30 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній упаковці; по 25 таблеток у блістері, по 4 блістери в картонній упаковці
таблетки по 16 мг: по 15 або 21 таблетці у блістері, по 2 блістери в картонній упаковці; по 20 таблеток у блістері, по 3 блістери в картонній упаковці
таблетки по 24 мг: по 10 таблеток у блістері, по 1 або 5 блістерів у картонній упаковці; по 20 таблеток у блістері, по 1, 3 або 5 блістерів у картонній упаковці; по 25 таблеток у блістері, по 2 або 4 блістери в картонній упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Абботт Хелскеа САС, Франція/Abbott Healthcare SAS France.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Рут де Бельвіль, Лью ді Мелар, 01400, Шатийон-сюр-Шаларон, Франція/Route de Belleville, Lieu dit Maillard, 01400, Chatillon-sur-Chalarnon, France.