

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Вестикап®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Вестикап®

Международное непатентованное наименование: бетагистин

Лекарственная форма: капсулы

Состав:

1 капсула 8 мг содержит:

Действующее вещество: бетагистина дигидрохлорид – 8,0 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) – 43,0 мг, целлюлоза микрокристаллическая – 23,5 мг, крахмал картофельный – 10,0 мг, коповидон – 9,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 5,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,5 мг, магния стеарат – 1,0 мг.

Состав корпуса капсулы: индигокармин – 0,0312 %, титана диоксид – 4,0000 %, желатин – до 100 %.

Состав крышечки капсулы: индигокармин – 0,0471 %, титана диоксид – 1,0000 %, желатин – до 100 %.

1 капсула 16 мг содержит:

Действующее вещество: бетагистина дигидрохлорид – 16,0 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) – 86,0 мг, целлюлоза микрокристаллическая – 47,0 мг, крахмал картофельный – 20,0 мг, коповидон – 18,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 10,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 1,0 мг, магния стеарат – 2,0 мг.

Состав корпуса капсулы: краситель азорубин – 0,0200 %, индигокармин – 0,1800 %, титана диоксид – 2,0000 %, желатин – до 100 %.

Состав крышечки капсулы: индигокармин – 0,0471 %, титана диоксид – 1,0000 %, желатин – до 100 %.

Описание:

Дозировка 8 мг

Твердые желатиновые капсулы № 2. Корпус светло-голубого цвета, непрозрачный, крышка голубого цвета, непрозрачная.

Дозировка 16 мг

Твердые желатиновые капсулы № 2. Корпус темно-голубого цвета, непрозрачный, крышка голубого цвета, непрозрачная.

Содержимое капсул – смесь порошка и гранул белого или белого с желтоватым оттенком цвета. Допускается уплотнение содержимого капсулы по форме капсулы, распадающееся при легком нажатии стеклянной палочкой.

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний нервной системы; препараты для лечения головокружения.

Код АТХ: N07CA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм действия бетагистина известен только частично. Существует несколько возможных гипотез, подтвержденных доклиническими и клиническими данными.

- Влияние на гистаминергическую систему

Частичный агонист H_1 -гистаминовых и антагонист H_3 -гистаминовых рецепторов вестибулярных ядер центральной нервной системы (ЦНС), обладает незначительной активностью в отношении H_2 -рецепторов. Бетагистин увеличивает обмен гистамина и его высвобождение путем блокирования пресинаптических H_3 -рецепторов и снижения количества H_3 -рецепторов.

- Усиление кровотока кохлеарной области, а также всего головного мозга

Согласно доклиническим исследованиям бетагистин улучшает кровообращение в сосудистой полоске внутреннего уха за счет расслабления прекапиллярных сфинктеров сосудов внутреннего уха. Также показано, что бетагистин усиливает кровоток головного мозга у человека.

- Облегчение процесса центральной вестибулярной компенсации

Бетагистин ускоряет восстановление вестибулярной функции у животных после односторонней вестибулярной нейрэктомии, ускоряя и облегчая центральную вестибулярную компенсацию за счет антагонизма с H_3 -гистаминовыми рецепторами.

Время восстановления после вестибулярной нейрэктомии у человека при лечении бетагистином также уменьшается.

- Возбуждение нейронов в вестибулярных ядрах

Дозозависимо снижает генерацию потенциалов действия в нейронах латеральных и медиальных вестибулярных ядер.

Фармакодинамические свойства, выявленные на животных, обеспечивают положительный терапевтический эффект бетагистина в вестибулярной системе.

Клиническая эффективность и безопасность

Эффективность бетагистина была продемонстрирована у пациентов с вестибулярным головокружением и синдромом Меньера, что проявлялось уменьшением выраженности и частоты головокружений.

Фармакокинетика

Абсорбция

При пероральном приеме бетагистин быстро и практически полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. После всасывания препарат быстро и почти полностью метаболизируется с образованием метаболита 2-пиридилуксусной кислоты. Концентрация бетагистина в плазме крови очень низкая. Таким образом, фармакокинетические анализы основаны на измерении концентрации метаболита 2-пиридилуксусной кислоты в плазме и моче.

При приеме препарата с пищей максимальная концентрация ($C_{\max}$) препарата в крови ниже, чем при приеме натощак. Однако суммарная абсорбция бетагистина одинакова в обоих случаях, что указывает на то, что прием пищи лишь замедляет всасывание бетагистина.

Распределение

Связывание бетагистина с белками плазмы крови составляет менее 5 %.

Биотрансформация

После всасывания бетагистин быстро и почти полностью метаболизируется с образованием метаболита 2-пиридилуксусной кислоты (который не обладает фармакологической активностью). Максимальная концентрация 2-пиридилуксусной кислоты в плазме крови (или моче) достигается через час после приема. Период полувыведения составляет приблизительно 3,5 часа.

Элиминация

2-пиридилуксусная кислота быстро выводится с мочой. При приеме препарата в дозе 8–48 мг около 85 % начальной дозы обнаруживается в моче. Выведение бетагистина почками или через кишечник незначительно.

Линейность (нелинейность)

Скорость выведения остается постоянной при пероральном приеме 8–48 мг препарата, указывая на линейность фармакокинетики бетагистина, и позволяет предположить, что задействованный метаболический путь остается ненасыщенным.

Данные доклинической безопасности

Хроническая токсичность

Нежелательные реакции со стороны нервной системы наблюдались у собак и бабуинов после внутривенного введения собакам и бабуинам в дозах от 120 мг/кг и выше.

Исследования хронической токсичности бетагистина дигидрохлорида продолжались 18 месяцев у крыс и 6 месяцев у собак. Введение препарата крысам в дозе 500 мг/кг и собакам в дозе 25 мг/кг не приводило к отклонениям биохимических и гематологических показателей и не сопровождалось гистологическими изменениями. После повышения дозы до 300 мг/кг у собак наблюдалась рвота. Согласно литературным данным в экспериментальном исследовании введение бетагистина крысам в дозах от 39 мг/кг и выше в течение 6 месяцев приводило к появлению гиперемии в некоторых тканях. Данная публикация содержит ограниченный объем данных. В связи с этим значение описанного в исследовании наблюдения неясно.

Мутагенный и канцерогенный потенциал

Бетагистин не обладает мутагенным потенциалом.

Специфические исследования канцерогенного действия бетагистина дигидрохлорида не проводились. Однако в исследованиях хронической токсичности препарата у крыс продолжительностью 18 месяцев при гистопатологическом исследовании не было выявлено признаков каких-либо опухолей, новообразований или гиперплазии. Таким образом, в данном исследовании с ограниченной продолжительностью (18 месяцев) не было получено доказательств того, что бетагистина дигидрохлорид в дозах до 500 мг/кг обладает канцерогенным потенциалом.

Репродуктивная токсичность

Бетагистин не влиял на фертильность самцов и самок крыс и не проявлял тератогенный эффект у крыс и кроликов в дозах до 1000 мг/кг для крыс и до 75 мг/кг для кроликов. В

исследовании токсического воздействия на пре- и постнатальное развитие у крыс при введении препарата в токсичной для материнского организма дозе 1000 мг наблюдались такие эффекты, как уменьшение массы тела детенышей, уменьшение численности помета, снижение выживаемости животных поколения F1, а также повышение постимплантационных потерь у животных поколения F1. У животных поколения F1 из групп введения препарата в дозах 300 и 1000 мг/кг отмечалось уменьшение средней силы реакции в ходе пробы с оценкой рефлекса вздрагивания. Препарат в дозе 100 мг/кг не оказывал влияния на пре- и постнатальное развитие. Значимость изменений, наблюдаемых при введении препарата в высоких дозах, по отношению к человеку неясна.

Показания к применению

- Синдром Меньера, характеризующийся следующими основными симптомами:
 - головокружение (сопровожающееся тошнотой/рвотой);
 - снижение слуха (тугоухость);
 - шум в ушах.
- Симптоматическое лечение вестибулярного головокружения (вертиго).

Противопоказания

- гиперчувствительность к бетагистину и/или другим компонентам препарата;
- феохромоцитома;
- детский возраст до 18 лет;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы и синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Имеющихся данных о применении бетагистина беременными женщинами недостаточно. Исследования на животных не выявили прямой или непрямой репродуктивной токсичности. Бетагистин не должен использоваться во время беременности за исключением случаев очевидной необходимости.

Период грудного вскармливания

Неизвестно выделяется ли бетагистин с грудным молоком у человека. Бетагистин выделяется с грудным молоком у крыс. Исследования на животных были ограничены применением препарата в очень высоких дозах. Вопрос о назначении лекарственного препарата матери должен приниматься только после сопоставления пользы грудного вскармливания с потенциальным риском для грудного ребенка.

Фертильность

В исследованиях на животных (крысах) влияния на фертильность не выявлено.

Способ применения и дозы

Внутрь. Во время еды.

Максимальная суточная доза препарата для взрослых составляет 48 мг бетагистина в день.

Препарат Вестикап[®], 8 мг следует принимать по 1–2 капсулы 3 раза в день.

Препарат Вестикап[®], 16 мг следует принимать по 1 капсуле 3 раза в день.

Дозу следует подбирать индивидуально в зависимости от реакции на лечение. Улучшение иногда наблюдается только через несколько недель лечения. Наилучшие результаты иногда достигаются после нескольких месяцев лечения. Имеются данные о том, что назначение лечения в начале заболевания предотвращает его прогрессирование и/или потерю слуха на более поздних стадиях.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Несмотря на ограниченность данных клинических исследований, обширный пострегистрационный опыт предполагает, что коррекция дозы у этой группы пациентов не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек и/или печени

Специальные клинические исследования в этой группе пациентов не проводились, однако пострегистрационный опыт дает основания предполагать, что коррекция дозы у данной группы пациентов не требуется.

Побочное действие

Частота побочных реакций приведена в виде следующей градации: *очень часто* ($\geq 1/10$); *часто* ($\geq 1/100$, но $< 1/10$); *нечасто* ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); *редко* ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$); *очень редко* ($< 1/10000$); *частота неизвестна* (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головная боль.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота, диспепсия.

Описание отдельных нежелательных реакций

Кроме этих эффектов, выявленных при проведении клинических исследований, в процессе пострегистрационного применения и в научной литературе сообщалось о нижеследующих нежелательных эффектах. Имеющихся данных недостаточно, чтобы оценить их частоту.

Нарушения со стороны иммунной системы: реакция гиперчувствительности, в том числе анафилактическая реакция.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: умеренные расстройства, такие как рвота, желудочно-кишечные боли, вздутие живота. Эти эффекты обычно исчезают после приема препарата одновременно с пищей или после снижения дозы.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: реакции гиперчувствительности, в особенности ангионевротический отек, крапивница, зуд и сыпь.

Передозировка

Симптомы

Известно несколько случаев передозировки препарата. У некоторых пациентов наблюдались легкие и умеренные симптомы (тошнота, сонливость, боль в животе) после приема препарата в дозах до 640 мг. Более серьезные осложнения (судороги, сердечно-легочные осложнения) наблюдались при преднамеренном приеме повышенных доз бетагистина, особенно в сочетании с передозировкой других лекарственных средств.

Лечение

Рекомендуется симптоматическое лечение.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Если в настоящее время или в недавнем прошлом Вы принимали другие лекарственные средства, в том числе без назначения врача, сообщите об этом, пожалуйста, своему лечащему врачу.

Исследования *in vivo*, направленные на изучение взаимодействия с другими лекарственными препаратами, не проводились. Основываясь на данных *in vitro*, можно предположить отсутствие ингибирования активности изоферментов цитохрома P450 *in vivo*.

Данные *in vitro* показали ингибирование метаболизма бетагистина под действием препаратов, которые ингибируют моноаминоксидазу (МАО), включая МАО подтипа В (например, селегилин). Следует соблюдать осторожность при одновременном назначении бетагистина и ингибиторов МАО (включая МАО-В).

Бетагистин является аналогом гистамина, взаимодействие бетагистина с блокаторами H₁-гистаминовых рецепторов теоретически может влиять на эффективность одного из этих лекарственных средств.

Особые указания

Пациенты с бронхиальной астмой, язвенной болезнью желудка и/или двенадцатиперстной кишки требуют тщательного наблюдения в период лечения.

Вспомогательные вещества

Препарат Вестикап® содержит лактозу. Данный лекарственный препарат не следует принимать пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

Данный лекарственный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на одну капсулу, то есть по сути, «не содержит натрия».

Препарат Вестикап® в дозировке 16 мг содержит краситель азорубин, который может вызывать аллергические реакции. Может оказывать отрицательное влияние на активность и внимание детей.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Бетагистин не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. В клинических исследованиях нежелательные реакции, которые могли бы повлиять на такую способность, не выявлены.

Форма выпуска

Капсулы 8 мг и 16 мг.

По 10, 30 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 60 или 100 капсул в банки из полиэтилентерефталата для лекарственных средств или полипропиленовые для лекарственных средств, закупоренные крышками из полиэтилена высокого давления с контролем первого вскрытия, или крышками полипропиленовыми с системой «нажать-вернуть» или крышками из полиэтилена низкого давления с контролем первого вскрытия.

Свободное пространство в банке заполняют ватой медицинской гигроскопической.

На банку наклеивают этикетку.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5 или 6 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению (листок-вкладыш) помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения

ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, зд. 11.

Производитель

ООО «Озон»

Россия, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru