

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Бетагистин, 8 мг, таблетки.

Бетагистин, 16 мг, таблетки.

Бетагистин, 24 мг, таблетки.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: бетагистина дигидрохлорид.

Бетагистин, 8 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 8 мг бетагистина дигидрохлорида.

Бетагистин, 16 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 16 мг бетагистина дигидрохлорида.

Бетагистин, 24 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 24 мг бетагистина дигидрохлорида.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Бетагистин, 8 мг, таблетки

Круглые двояковыпуклые таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

Допускается легкая мраморность.

Бетагистин, 16 мг, таблетки

Круглые плоскоцилиндрические таблетки от белого до светло-коричневого цвета с фаской и риской. Допускается легкая мраморность.

Таблетку можно разделить на равные дозы.

Бетагистин, 24 мг, таблетки

Круглые плоскоцилиндрические таблетки от белого до светло-коричневого цвета с фаской

и рисклой. Допускается легкая мраморность.

Линия разлома (риска) предназначена лишь для разламывания с целью облегчения проглатывания, а не для деления на равные дозы.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Бетагистин показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет:

- При синдроме Меньера, характеризующимся следующими основными симптомами:
 - головокружение (сопровождающееся тошнотой/рвотой);
 - снижение слуха (тугоухость);
 - шум в ушах.
- Для симптоматического лечения вестибулярного головокружения (вертиго).

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

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

Бетагистин, 8 мг, таблетки

По 1–2 таблетки 3 раза в день.

Бетагистин, 16 мг, таблетки

По 1/2 – 1 таблетке 3 раза в день. Таблетку можно разделить на две равные части, поместив таблетку на твердую поверхность риской вверх и надавив на нее большим пальцем.

Бетагистин, 24 мг, таблетки

По 1 таблетке 2 раза в день. Для облегчения проглатывания таблетку можно разделить на две равные части, поместив таблетку на твердую поверхность риской вверх и надавив на нее большим пальцем.

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 коррекции дозы у этой группы пациентов не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек

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

Пациенты с нарушением функции печени

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

Дети

Безопасность и эффективность бетагистина у детей в возрасте от 0 до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутрь, во время еды.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ.
- Феохромоцитомы.

Безопасность и эффективность препарата Бетагистин у детей в возрасте от 0 до 18 лет не установлены. Данные отсутствуют.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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

Вспомогательные вещества

Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

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.

Лактация

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.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с 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.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота возникновения нежелательных реакций определялась в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения: 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.

Желудочно-кишечные нарушения

Часто: тошнота и диспепсия.

Описание отдельных нежелательных реакций

Кроме 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.

Желудочно-кишечные нарушения: 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.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

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

Код АТХ: N07CA01.

Механизм действия

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

Фармакодинамические эффекты

Влияние на гистаминергическую систему

Частичный агонист H₁-гистаминовых и антагонист H₃-гистаминовых рецепторов вестибулярных ядер центральной нервной системы, обладает незначительной активностью в отношении H₂-рецепторов. Бетагистин увеличивает обмен гистамина и его высвобождение путем блокирования пресинаптических H₃-рецепторов и снижения количества H₃-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 H₃-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.

5.2. Фармакокинетические свойства

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 в 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.

5.3. 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.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Целлюлоза микрокристаллическая (МКЦ-101)

Лактозы моногидрат

Кросповидон

Повидон (К-30)

Магния стеарат

Кремния диоксид коллоидный

6.2. Несовместимость

Неприменимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

10 или 12 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной/поливинилиденхлоридной и фольги алюминиевой.

1, 2, 3, 4, 5 или 6 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки по 12 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

АО «Рафарма»

399540, Липецкая обл., Тербунский район, с. Тербуны, ул. Дорожная, д. 6А

Тел.: +7 (47474) 2-16-72

Электронная почта: rafarma@rafarma.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей следует направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «Рафарма»

399540, Липецкая обл., Тербунский район, с. Тербуны, ул. Дорожная, д. 6А

Тел.: +7 (47474) 2-16-72

Электронная почта: pharmacovigilance@sotex.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Бетагистин доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://ees.eaeunion.org/>