

Вестінорм

Склад.

діюча речовина: betahistine;

1 таблетка містить бетагістину дигідрохлориду 8 мг або 16 мг, або 24 мг в перерахунку на 100% суху речовину;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, повідон, магнію стеарат.

Лікарська форма.

Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми з плоскою поверхнею з рискою та фаскою, білого або майже білого кольору. На поверхні таблеток допускається мармуровість (для таблеток по 8 мг і 16 мг).

Фармакотерапевтична група.

Засоби для лікування вестибулярних порушень.

Код АТС N07C A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Механізм дії бетагістину вивчений лише частково. Існує кілька достовірних гіпотез, які були підтверджені даними досліджень, проведених на тваринах і за участю людей.

Вплив бетагістину на гистамінергіческая систему.

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

Бетагістину може збільшувати кровотік в кохлеарної зоні, а також у всьому головному мозку.

Фармакологічні дослідження на тваринах продемонстрували поліпшення кровообігу в судинах stria vascularis внутрішнього вуха, можливо, за рахунок

розслаблення прекапілярних сфінктерів у системі мікроциркуляції внутрішнього вуха. Бетагістину також продемонстрував збільшення мозкового кровотоку в організмі людини.

Бетагістину сприяє вестибулярної компенсації.

Бетагістину 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 H₃-рецепторів. У людей під час лікування бетагістину також зменшувалася час відновлення вестибулярної функції після нейректомії.

Бетагістину змінює активність нейронів у вестибулярних ядрах.

Було також встановлено, що бетагістин має дозозависиме інгібуючий вплив на генерацію пікових потенціалів у нейронах латеральних і медіальних вестибулярних ядер.

Фармакодинамічні властивості бетагістину, як це було показано в тварин, можуть забезпечити позитивний терапевтичний ефект препарату в вестибулярній системі.

Ефективність бетагістину була показана під час досліджень у пацієнтів з вестибулярним запамороченням і хворобою Мен'єра, що було продемонстровано шляхом зменшення тяжкості і 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 в плазмі крові дуже низький. Тому все фармакокінетичні аналізи проводяться шляхом вимірювання концентрації метаболіту 2-піридилоцтової кислоти в плазмі та сечі.

При прийомі препарату з їжею максимальна концентрація (C_{max}) препарату нижче, ніж при прийомі натще. При цьому повне всмоктування бетагістину ідентичне в обох випадках, що вказує на те, що прийом їжі тільки сповільнює процес всмоктування препарату.

Розподіл.

Відсоток бетагістину, що зв'язується з білками плазми крові, становить менше 5%.

Біотрансформація.

Після всмоктування бетагистин швидко і майже повністю метаболізується в 2-піридилоцтової кислоти (яка не має фармакологічної активності).

Після прийому бетагістину всередину концентрація 2-піридилоцтової кислоти в плазмі крові (і в сечі) досягає свого максимуму через 1 годину після прийому препарату і зменшується з періодом напіввиведення близько 3,5 години.

Виведення.

2-піридилоцтової 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 незначно.

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 ненасищавою.

Клінічні характеристики.

Показання.

- Хвороба і синдром Мен'єра, які характеризуються трьома основними симптомами:
 - запамороченням, що іноді супроводжується нудотою і блювотою;
 - зниженням слуху (приглухуватістю);
 - шумом у вухах.
- Симптоматичне лікування вестибулярного запаморочення різного походження.

Протипоказання.

- Гіперчутливість до будь-якого з компонентів препарату.
- Феохромочитома.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження *in vivo*, спрямовані на вивчення взаємодії з іншими лікарськими засобами, не проводили. З огляду на дані досліджень *in vitro* не очікується пригнічення активності ферментів цитохрому P450 *in vivo*.

Дані, отримані в умовах *in vitro*, свідчать про пригнічення метаболізму бетагістину препаратами, які інгібують активність моноаміноксидази (MAO), в тому числі підтипу В MAO (наприклад селегіліном). Рекомендується дотримуватися обережності при одночасному застосуванні бетагістину та інгібіторів MAO (включаючи вибірково підтип В MAO).

Оскільки бетагистин 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 і / або на виразкову хворобу шлунка і дванадцятипалої кишки в анамнезі.

Рекомендується з обережністю застосовувати для лікування пацієнтів з виразковою хворобою (в т.ч. в анамнезі), оскільки періодично виникають випадки диспепсії у пацієнтів, що приймають бетагистин.

Слід з обережністю призначати бетагистин пацієнтам з наявною кропив'янкою, висипом або алергічний риніт, оскільки можливо наростання цих симптомів.

Слід з обережністю призначати препарат пацієнтам з тяжкою гіпотензією.

Застосування в період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Немає достатніх даних щодо застосування бетагістину вагітним жінкам.

Результати досліджень на тваринах недостатні для оцінки прямого або непрямого впливу на перебіг вагітності, розвиток ембріона / плода, пологи і постнатальний розвиток. Потенційний ризик для людини невідомий. Бетагістину не слід застосовувати в період вагітності, за винятком випадків незаперечною необхідності.

Період годування груддю. Невідомо, чи проникає бетагистин в грудне молоко людини. Дослідження на тваринах по проникненню бетагістину в молоко не проводилися. Бетагістину не слід застосовувати в період годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Запаморочення, зниження слуху, шум у вухах пов'язані з синдромом Мен'єра можуть негативно впливати на здатність керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами. Бетагістину за даними клінічних досліджень, не робить значного впливу або ефектів, які потенційно впливають на здатність керувати автомобілем або працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Добова доза для дорослих становить 24-48 мг, рівномірно розподілена для прийому протягом доби.

Дозу слід підбирати індивідуально, залежно від ефекту. Зменшення симптомів інколи спостерігається тільки після 2-3 тижнів лікування. Кращі результати іноді 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 похилого віку.

Хоча на даний час дані клінічних досліджень в цій групі пацієнтів обмежені, широкий досвід застосування препарату в післяреєстраційному період передбачає, що корекція дози для цієї категорії пацієнтів не потрібно.

Ниркова недостатність.

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

печінкова недостатність

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

Діти.

У зв'язку з недостатністю даних з безпеки та ефективності застосування препарату Вестіном, його не рекомендується призначати дітям (до 18 років).

Передозування.

Відомо кілька випадків передозування препарату. У деяких пацієнтів спостерігалися легкі та середнього ступеня тяжкості симптоми при прийомі в дозі до 640 мг (нудота, сонливість, біль у животі). Іншими симптомами передозування були блювота, диспепсія, атаксія і судоми. Серйозні ускладнення (судоми, ускладнення з боку серця і легенів) спостерігалися при навмисному прийомі підвищених доз бетагістину, особливо з одночасною передозуванням іншими лікарськими засобами.

Лікування: промивання шлунка та симптоматична терапія рекомендовані протягом однієї години після прийому препарату.

Побічні реакції.

- З боку шлунково-кишкового тракту: нудота та диспепсія, скарги на незначні розлади шлунка (блювання, гастроінтестинальна біль, здуття живота і метеоризм). Ці побічні ефекти зазвичай зникають при прийомі препарату з їжею або після зменшення дози.
- З боку нервової системи: головний біль.

- З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, наприклад анафілаксія.
- З боку шкіри і підшкірної клітковини: реакції гіперчутливості шкіри та підшкірної жирової клітковини, зокрема ангіоневротичний набряк, висип, свербіж і кропив'янка.

Термін придатності.

3 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати в захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток в блістері. Таблетки по 8 мг. По 3 блістери в пачці.

Таблетки по 16 мг і 24 мг. За 3 або 6 блістерів в пачці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ПАТ «Фармак».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 04080, м. Київ, вул. Фрунзе, 74.

Інструкція препарату Вестіноرم представлена виключно з ознайомчою метою. Кваліфіковану допомогу в призначенні Вестінорму з метою лікування, його дозування, схему лікування, протипоказання і сумісність з іншими медикаментами, може надати тільки ваш особистий лікар. Пам'ятайте, самолікування небезпечно для вашого здоров'я!