

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
28.03.12 № 211
Регистрационное удостоверение
№ UA/6356/01/01
UA/6356/01/02
UA/6356/01/03

ИЗМЕНЕНИЯ ВНЕСЕНЫ
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
03.08.12 № 610

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата

ВЕСТИНОРМ
(VESTINORM)

Состав:

действующее вещество: betahistine;

1 таблетка содержит бетагистина дигидрохлорида 8 мг или 16 мг, или 24 мг в пересчете на 100 % сухое вещество;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия крахмалгликолят (тип А), кремния диоксид коллоидный безводный, повидон, магния стеарат.

Лекарственная форма. Таблетки.

Фармакотерапевтическая группа. Средства для лечения вестибулярных нарушений.
Код АТС N07C A01.

Клинические характеристики.

Показания. Болезнь и синдром Меньера, характеризующиеся такими основными симптомами как головокружение, сопровождающееся иногда тошнотой и рвотой, снижением слуха (тугоухостью), шумом в ушах.

Симптоматическое лечение вестибулярного головокружения.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к действующему веществу и к другим компонентам препарата. Феохромоцитомы.

Способ применения и дозы.

Назначают взрослым внутрь. Суточная доза составляет 24-48 мг, равномерно распределенная для приема на протяжении суток.

| Таблетки по 8 мг | Таблетки по 16 мг | Таблетки по 24 мг |
|-----------------------------|-----------------------------|---------------------------|
| 1-2 таблетки 3 раза в сутки | ½-1 таблетка 3 раза в сутки | 1 таблетка 2 раза в сутки |

Таблетки принимают после еды, не разжевывая.

Дозу и длительность терапии определяет врач индивидуально в зависимости от эффективности терапии. Уменьшение симптомов иногда наблюдается только после 2-3 недель лечения. Наилучшие результаты наблюдаются при приеме препарата на

КОНТРОЛЬНЫЙ

протяжении нескольких месяцев. Если лечение назначить в начале заболевания, можно предупредить прогрессирование его и/или потерю слуха на поздних стадиях.

Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы для пациентов этой группы не требуется.

Почечная недостаточность

Коррекция дозы не требуется.

Печеночная недостаточность

Коррекция дозы не требуется.

Побочные реакции.

Со стороны пищеварительного тракта: часто – тошнота, диспепсия; частота неизвестна – жалобы на незначительные расстройства желудка (рвота, боль в животе, вздутие живота и метеоризм). Эти побочные эффекты обычно исчезают при приеме препарата с пищей или после уменьшения дозы.

Со стороны нервной системы: часто – головная боль.

Со стороны иммунной системы: частота неизвестна – реакции гиперчувствительности, например анафилаксия.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: частота неизвестна – наблюдались реакции гиперчувствительности кожи и подкожной жировой клетчатки, в частности ангионевротический отек, сыпь, зуд и крапивница.

Передозировка.

При передозировке могут наблюдаться тошнота, боль в животе, сонливость. Были сообщения о появлении судорог и сердечно-легочных осложнений при намеренном приеме повышенных доз бетагистина, особенно в сочетании с передозировкой другими препаратами.

Лечение: симптоматическая терапия.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Нет данных относительно применения бетагистина беременными. Препарат можно принимать только в случае крайней необходимости и под непосредственным наблюдением врача.

Проникновение бетагистина в грудное молоко не изучалось. Пользу от применения препарата определяют соотношением преимущества кормления грудью/потенциального риска для ребенка.

Дети. Опыт применения препарата для лечения детей отсутствует, поэтому не следует назначать его этой возрастной категории.

Особенности применения.

Пациенты с бронхиальной астмой, язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе требуют тщательного медицинского наблюдения во время лечения Вестинормом.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Бетагистин согласно данным клинических исследований, не оказывает значительного влияния или эффектов, которые потенциально влияют на способность управлять автомобилем или работать с другими механизмами.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий. На основе данных исследования *in vitro* не ожидается угнетения

КОНТРОЛЬНЫЙ

активности ферментов цитохрома P450 *in vivo*.

Данные, полученные в условиях *in vitro*, свидетельствуют об угнетении метаболизма бетагистина препаратами, которые ингибируют активность моноаминоксидазы (МАО), включая подтип В МАО (например селегилин). Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном применении бетагистина и ингибиторов МАО (включая избирательно подтип В МАО).

Поскольку бетагистин является аналогом гистамина, взаимодействие бетагистина с антигистаминными препаратами может теоретически повлиять на эффективность одного из этих препаратов.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика. Механизм действия бетагистина изучен только частично. Существует несколько достоверных гипотез, подтверждающих данные исследований на животных и при участии людей.

Влияние бетагистина на гистаминергическую систему: установлено, что бетагистин частично проявляет антагонистическую активность относительно H_1 -рецепторов, а также антагонистическую активность относительно H_3 -рецепторов гистамина в нервной ткани и проявляет незначительную активность относительно H_2 -рецепторов гистамина. Бетагистин увеличивает обмен и высвобождение гистамина путем блокирования пресинаптических H_3 -рецепторов и индукции процесса снижения количества соответствующих H_3 -рецепторов.

Бетагистин может увеличить кровоток в кохлеарной зоне, а также во всем головном мозге: фармакологические исследования на животных продемонстрировали улучшение кровообращения в сосудах *stria vascularis* внутреннего уха, возможно, за счет расслабления прекапиллярных сфинктеров в системе микроциркуляции внутреннего уха. Бетагистин также продемонстрировал увеличение мозгового кровотока у человека.

Бетагистин способствует вестибулярной компенсации: бетагистин ускоряет восстановление вестибулярной функции после односторонней нейрэктомии у животных, ускоряя и способствуя центральной вестибулярной компенсации. Этот эффект характеризуется усилением регуляции обмена и высвобождения гистамина и реализуется в результате антагонизма H_3 -рецепторов. У людей во время лечения бетагистином также уменьшалось время восстановления вестибулярной функции после нейрэктомии.

Бетагистин изменяет активность нейронов в вестибулярных ядрах: было также установлено, что бетагистин имеет дозозависимое ингибирующее влияние на генерацию пиковых потенциалов в нейронах латеральных и медиальных вестибулярных ядер.

Фармакодинамические свойства бетагистина, как это было показано на животных, могут обеспечить положительный терапевтический эффект препарата в вестибулярной системе.

Эффективность бетагистина показали исследования с участием пациентов с вестибулярным головокружением и болезнью Меньера, во время которых наблюдалось уменьшение тяжести и частоты приступов головокружения.

Фармакокинетика.

Всасывание

При пероральном введении бетагистин быстро и практически полностью всасывается в пищеварительном тракте. После всасывания препарат быстро и почти полностью метаболизируется с образованием метаболита 2-пиридилуксусной кислоты. Уровень концентрации бетагистина в плазме крови очень низкий.

Поэтому все фармакокинетические анализы проводятся путем измерения концентрации метаболита 2-пиридилуксусной кислоты в плазме крови и мочи.

При приеме препарата с пищей максимальная его концентрация (C_{max}) ниже, чем при приеме натощак. При этом полное всасывание бетагистина идентично в обоих случаях, что указывает на то, что прием пищи только замедляет всасывание препарата.

Распределение

КОНТРОЛЬНЫЙ

Процент бетагистина, который связывается с белками плазмы крови, составляет меньше 5 %.

Биотрансформация

После всасывания бетагистин быстро и почти полностью метаболизируется в 2-пиридилуксусную кислоту (которая не проявляет фармакологической активности).

После приема бетагистина внутри концентрация 2-пиридилуксусной кислоты в плазме крови (и в моче) достигает своего максимума через 1 час после приема препарата и уменьшается с периодом полувыведения около 3,5 часа.

Выведение

2-пиридилуксусная кислота быстро выводится с мочой. При приеме препарата в дозировке 8-48 мг около 85 % начальной дозы обнаруживается в моче. Выведение бетагистина почками или с калом является незначительным.

Линейность

Скорость восстановления остается постоянной при пероральном приеме 8-48 мг препарата, что указывает на линейность фармакокинетики бетагистина и позволяет предположить, что задействованный метаболический путь остается неинтенсивным.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы с плоской поверхностью с риской и фаской, белого или почти белого цвета. На поверхности таблеток допускается мраморность (для таблеток по 8 мг и 16 мг).

Срок годности. 3 года. Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения. Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка. По 10 таблеток в блистере. Таблетки по 8 мг. По 3 блистера в пачке. Таблетки по 16 мг и 24 мг. По 3 или 6 блистеров в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ПАО «Фармак».

Местонахождение. Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 63.

Дата последнего пересмотра. 03.08.12 года

КОНТРОЛЬНИЙ