

УТВЕРЖДАЮ
Первый заместитель директора
Департамента лекарственного
обеспечения и медицинской техники
Министерства здравоохранения
Кыргызской Республики
Дуйшеналиев Н.К.
« 22 » февраля 2018г

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

ВЕСТИНОРМ (VESTINORM)

Торговое название
ВЕСТИНОРМ
(VESTINORM)

Международное непатентованное название
Бетагистин

Состав

1 таблетка содержит

Действующее вещество: бетагистина дигидрохлорида 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.

Описание

Таблетки круглой формы с плоской поверхностью с риской и фаской, белого или почти белого цвета. На поверхности таблеток допускается мраморность (для таблеток по 16 мг).

Фармакотерапевтическая группа

Средства для лечения вестибулярных нарушений.
Код АТХ N07C A01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Механизм действия бетагистина изучен лишь частично. Существует несколько достоверных гипотез, которые были подтверждены данными исследований, проведенных на животных и с участием людей.

Влияние бетагистина на гистаминергическую систему.

Установлено, что бетагистин частично проявляет агонистическую активность в отношении H₁-рецепторов, а также антагонистическую активность в отношении H₃-рецепторов гистамина в нервной ткани и имеет незначительную активность в отношении H₂-рецепторов гистамина. Бетагистин увеличивает обмен и высвобождение гистамина

путем блокировки пресинаптических H₃-рецепторов и индукции процесса снижения количества соответствующих H₃-рецепторов.

Бетагистин может увеличивать кровоток в кохlearной 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 в организме человека.

Бетагистин способствует вестибулярной компенсации.

Бетагистин ускоряет восстановление вестибулярной функции после односторонней нейректомии у животных, стимулируя и способствуя процессу центральной вестибулярной компенсации. Этот эффект характеризуется усилением регуляции обмена и высвобождение гистамина и реализуется в результате антагонизма H₃-рецепторов. У людей во время лечения бетагистином также уменьшалось время восстановления вестибулярной функции после нейректомии.

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 в животных, могут обеспечить положительный терапевтический эффект препарата в вестибулярной системе. Эффективность бетагистина была показана во время исследований у пациентов с вестибулярным головокружением и болезнью Меньера, что было продемонстрировано путем уменьшения тяжести и частоты приступов головокружения.

Фармакокинетика.

Всасывание.

При пероральном введении бетагистин быстро и практически полностью всасывается во всех отделах желудочно-кишечного тракта. 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 и моче.

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

Распределение.

Процент бетагистина, что связывается с белками плазмы крови, составляет менее 5 %.

Биотрансформация.

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

После приема бетагистина внутрь 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 дозе 8-48 мг около 85 % начальной дозы обнаруживается в моче. Выведение бетагистина почками или с калом незначительно.

Линейность.

Скорость восстановления остается постоянной при пероральном приеме 8-48 мг препарата, указывая на линейность фармакокинетики бетагистина, и дает возможность предположить, что задействован метаболический путь является ненасыщаемым.

Показания к применению

Болезнь и синдром Меньера, характеризующиеся тремя основными симптомами:

- головокружением, что иногда сопровождается тошнотой и рвотой;
- снижением слуха (тугоухостью);
- шумом в ушах.

Симптоматическое лечение вестибулярного головокружения различного происхождения.

Противопоказания

Гиперчувствительность к любому из компонентов препарата.

Феохромоцитома.

Способ применения и дозы

Суточная доза для взрослых составляет 24-48 мг, равномерно распределенная для приема в течение суток.

<i>Таблетки по 8 мг</i>	<i>Таблетки по 16 мг</i>	<i>Таблетки по 24 мг</i>
1–2 таблетки	½–1 таблетка	1 таблетка
3 раза в сутки	3 раза в сутки	2 раза в сутки

Дозу следует подбирать индивидуально, в зависимости от эффекта. Уменьшение симптомов иногда наблюдается только после 2-3 недель лечения. Лучшие результаты иногда достигаются при приеме препарата в течение нескольких месяцев. Существуют данные о том, что назначение лечения в начале заболевания предотвращает его прогрессирование и/или потерю слуха на поздних стадиях.

Пациенты пожилого возраста

Хотя на данное время данные клинических исследований в этой группе пациентов ограничены, широкий опыт применения препарата в пострегистрационный период предполагает, что коррекция дозы для этой категории пациентов не требуется.

Почечная недостаточность

В этой группе пациентов специальные клинические испытания не проводили, но в соответствии с опытом пострегистрационного применения коррекция дозы не требуется.

Печеночная недостаточность

В этой группе пациентов специальные клинические испытания не проводили, но в соответствии с опытом послерегистрационного применения коррекция дозы не требуется.

Побочные реакции

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота и диспепсия, жалобы на незначительные расстройства желудка (рвота, гастроинтестинальная боль, вздутие живота и метеоризм). Эти побочные эффекты обычно исчезают при приеме препарата с пищей или после уменьшения дозы.

Со стороны нервной системы: головная боль.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, например анафилаксия.

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Исследования *in vivo*, направленные на изучение взаимодействия с другими лекарственными средствами, не проводили. Учитывая данные исследований *in vitro* не ожидается подавление активности ферментов цитохрома P450 *in vivo*.

Данные, полученные в условиях *in vitro*, свидетельствуют об угнетении метаболизма бетагистина препаратами, которые ингибируют активность моноаминоксидазы (МАО), в том числе подтипа В МАО (например селегилином). 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 теоретически может повлиять на эффективность одного из этих препаратов.

Особые указания

Во время лечения препаратом необходимо тщательно контролировать состояние пациентов с бронхиальной астмой и/или язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе.

Рекомендуется с осторожностью применять для лечения пациентов с язвенной болезнью (в т.ч. в анамнезе), поскольку периодически возникают случаи диспепсии у пациентов, принимающих бетагистин.

Следует с осторожностью назначать бетагистин пациентам с имеющейся крапивницей, сыпью или аллергическим ринитом, поскольку возможно нарастание этих симптомов.

Следует с осторожностью назначать препарат пациентам с тяжелой гипотензией.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность. Нет достаточных данных относительно применения бетагистина беременным женщинам.

Результаты исследований на животных недостаточны для оценки прямого или непрямого влияния на течение беременности, развитие эмбриона/плода, роды и постнатальное развитие. Потенциальный риск для человека неизвестен. Бетагистин не следует применять в период беременности, за исключением случаев неопровержимой необходимости.

Период кормления грудью. Неизвестно, проникает ли бетагистин в грудное молоко человека. Исследования на животных по проникновению бетагистина в молоко не проводились. Бетагистин не следует применять в период кормления грудью.

Дети.

В связи с недостаточностью данных по безопасности и эффективности применения препарата Вестинорм, его не рекомендуется назначать детям (до 18 лет).

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

Головокружение, снижение слуха, шум в ушах связанные с синдромом Меньера могут негативно влиять на способность управлять автотранспортом или работать с другими механизмами. Бетагистин по данным клинических исследований, не оказывает значительного влияния или эффектов, которые потенциально влияют на способность управлять автомобилем или работать с другими механизмами.

Передозировка

Известно несколько случаев передозировки препарата. У некоторых пациентов наблюдались легкие и средней степени тяжести симптомы при приеме в дозе до 640 мг (тошнота, сонливость, боль в животе). Другими симптомами передозировки были рвота, диспепсия, атаксия и судороги. Серьезные осложнения (судороги, осложнения со стороны сердца и легких) наблюдались при намеренном приеме повышенных доз бетагистина,

особенно с одновременной передозировкой другими лекарственными средствами.

Лечение: промывание желудка и симптоматическая терапия рекомендованы в течение одного часа после приема препарата.

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. По 3 блистера в пачке.

Условия отпуска

По рецепту.

Производитель.

ПАО «Фармак».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 74.