

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ВЕСТИНОРМ

Торговое название препарата: Вестинорм

Действующее вещество (МНН): бетагистин

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

1 таблетка содержит:

активное 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.

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: N07CA01.

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 H_1 -рецепторов, а также антагонистическую активность в отношении H_3 -рецепторов гистамина в нервной ткани и имеет незначительную активность в отношении H_2 -рецепторов гистамина. Бетагистин увеличивает обмен и высвобождение гистамина путем блокировки пресинаптических H_3 -рецепторов и индукции процесса снижения количества соответствующих H_3 -рецепторов.

Бетагистин может увеличивать 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 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 H_3 -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 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 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.

Способ применения и дозы

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

Таблетки по 16 мг	Таблетки по 24 мг
½–1 таблетка	1 таблетка
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.

Дети.

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

Побочные действия

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.

Противопоказания

Гиперчувствительность к любому из компонентов препарата.

Феохромоцитома.

Лекарственные взаимодействия

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 косвенного 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.

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.

Форма выпуска

По 10 таблеток в блистере.

Таблетки по 16 мг и 24 мг. По 3 или 6 блистеров в пачке.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

ПАО «Фармак». Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 63

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

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

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан

Представительство ПАО "Фармак" в Узбекистане.

100000, г. Ташкент, ул. А. Кодырий, 39.

Тел./факс: 235-77-13, 235-67-05