

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Бетасерк® Лонг

Регистрационный номер: ЛП-006452

Торговое наименование: Бетасерк® Лонг

Международное непатентованное наименование: бетагистин

Лекарственная форма: таблетки с модифицированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой

Состав: 1 таблетка с модифицированным высвобождением, покрытая пленочной оболочкой, 48 мг, содержит:

Ядро:

Действующее вещество: бетагистина дигидрохлорид 24,00 мг

Вспомогательные вещества: коллидон SR, целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, лимонная кислота, магния стеарат, тальк.

Пленочная оболочка (первый слой пленочного покрытия):

Действующее вещество: бетагистина дигидрохлорид 24,00 мг

Вспомогательные вещества: лимонная кислота; смесь для покрытия пленочной оболочкой белого цвета [гипромеллоза, титана диоксид (E171), макрогол-6000].

Пленочная оболочка (второй слой пленочного покрытия (цветного)):

смесь для покрытия пленочной оболочкой желтого цвета [поливиниловый спирт, титана диоксид (E171), макрогол-4000, тальк, краситель железа оксид желтый (E172)].

Описание: Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые верхней пленочной оболочкой коричневатого-желтого цвета. На поперечном разрезе ядро таблетки от белого до белого с желтым оттенком цвета, первый слой пленочной оболочки белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: препарат гистамина

Код АТХ: N07CA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

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

- Влияние на гистаминергическую систему

Частичный агонист H₁-гистаминовых и антагонист H₃-гистаминовых рецепторов вестибулярных ядер ЦНС, 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.

- Подавление возбуждения 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.

Эффективность бетагистина была продемонстрирована у пациентов с вестибулярным головокружением и синдромом Меньера, что проявлялось уменьшением выраженности и частоты головокружений.

Фармакокинетика

Всасывание

При пероральном приеме бетагистин быстро и практически полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. После всасывания препарат быстро и почти полностью метаболизируется с образованием неактивного метаболита 2-пиридилуксусной кислоты.

Концентрация бетагистина в плазме крови очень низкая. Таким образом, фармакокинетические анализы основаны на измерении концентрации метаболита 2-пиридилуксусной кислоты (2-ПАА) в плазме и моче.

Для препарата Бетасерк® Лонг максимальная концентрация (C_{max}) составляет в среднем (\pm SD) 847 ± 147 нг/мл, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – $0,333-2,0$ ч (медиана 1,0 ч), время задержки T_{lag} – 0 ч. Конечный период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет $5,54 \pm 1,57$ ч, конечная константа элиминации (λ_z) – $0,134 \pm 0,036$ ч⁻¹. Общая экспозиция 2-ПАА в плазме крови составляет: $AUC_{0-inf} - 7266 \pm 1338$ ч×нг/мл (геометрическое среднее 7141 ч×нг/мл), $AUC_{0-t} - 7159 \pm 1327$ ч×нг/мл (геометрическое

среднее 7035 ч×нг/мл), AUC₀₋₂₄, что соответствует AUC_{0-τ}, – 6621±1111 ч×нг/мл (геометрическое среднее 6524 ч×нг/мл).

При однократном приеме препарата Бетасерк® Лонг C_{max} 2-РАА увеличилась в 1,2 раза по сравнению с последовательным приемом двух таблеток препарата Бетасерк® 24 мг с 12-часовым интервалом. T_{max} при приеме Бетасерк® Лонг в среднем увеличено на 0,33 ч. Период полувыведения 2-РАА при приеме Бетасерк® Лонг в среднем увеличился в 1,4 раза. Общая экспозиция при приеме 1 таблетки Бетасерк® Лонг составляет в среднем 0,91 от AUC₀₋₂₄, 0,83 от AUC_{0-t} и 0,84 от AUC_{0-inf} при приеме 2-х таблеток Бетасерк® 24 мг. При приеме однократной дозы препарата Бетасерк® Лонг достигается экспозиция 2-РАА в плазме крови, сравнимая с двукратным приемом препарата Бетасерк® 24 мг, но без значительного увеличения максимальной концентрации в плазме крови.

Прием пищи не оказывает влияния на фармакокинетику 2-РАА при приеме препарата Бетасерк® Лонг.

Распределение

Связывание бетагистина с белками плазмы крови составляет менее 5 %.

Метаболизм

После всасывания бетагистин быстро и почти полностью метаболизируется с образованием метаболита 2-РАА (который не обладает фармакологической активностью).

Выведение

2-РАА быстро выводится с мочой. При приеме препарата в дозе 48 мг около 85 % начальной дозы обнаруживается в моче. Выведение бетагистина почками или через кишечник незначительно.

Линейность

Скорость выведения остается постоянной при пероральном приеме 48 мг препарата, указывая на линейность фармакокинетики бетагистина, и позволяет предположить, что задействованный метаболический путь остается ненасыщенным.

Показания к применению

Синдром Меньера, характеризующийся следующими основными симптомами:

- головокружение (сопровождающееся тошнотой/рвотой)
- снижение слуха (тугоухость)
- шум в ушах

Симптоматическое лечение вестибулярного головокружения (вертиго).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата
- Непереносимость лактозы, дефицит лактазы и глюкозо-галактозная

мальабсорбция в связи с наличием в составе препарата лактозы

- Феохромоцитома
- Не рекомендуется для применения у детей в возрасте до 18 лет в связи с недостаточностью данных по эффективности и безопасности

С осторожностью

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

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Имеющихся данных о применении бетагистина беременными женщинами недостаточно. Исследования на животных не выявили прямой или непрямо́й репродуктивной токсичности. Бетагистин не должен использоваться во время беременности за исключением случаев абсолютной необходимости.

Период грудного вскармливания

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.

Способ применения и дозы

Внутрь. Во время еды.

Таблетку Бетасерк® Лонг нельзя делить на части, так как она покрыта пленочной оболочкой с целью постепенного высвобождения действующего вещества.

Доза Бетасерк® Лонг для взрослых составляет:

По 1 таблетке в день утром.

Пожилрой возраст

Несмотря на ограниченность данных клинических исследований, обширный пострегистрационный опыт предполагает, что коррекция дозы у этой группы пациентов не требуется.

Пациенты с почечной/ печеночной недостаточностью

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

Побочное действие

Ниже представлены нежелательные лекарственные реакции (НЛР), возникавшие при применении препарата в клинических исследованиях с указанием частоты их возникновения. НЛР сгруппированы в соответствии с классификацией органов и систем органов MedDRA.

Частота встречаемости определяется следующим образом: *очень часто* ($\geq 1/10$), *часто* ($\geq 1/100$ и $< 1/10$), *нечасто* ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$), *редко* ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$), *очень редко* ($< 1/10000$, включая отдельные случаи).

Нарушения со стороны нервной системы: часто: головная боль.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто: тошнота и диспепсия.

При приеме Бетасерк® Лонг нежелательные явления со стороны желудочно-кишечного тракта и центральной нервной системы (головная боль) развивались с меньшей частотой, что было статистически подтверждено проведением дополнительного анализа в клиническом исследовании эффективности и безопасности препарата Бетасерк® Лонг.

Кроме этих эффектов, выявленных при проведении клинических исследований, в процессе пострегистрационного применения бетагистина 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.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: умеренные расстройства, такие как рвота, желудочно-кишечные боли, вздутие живота. Эти эффекты обычно исчезают после приема препарата одновременно с пищей.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: реакции гиперчувствительности со стороны кожи и подкожной клетчатки, в особенности, ангионевротический отек, зуд и сыпь.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубятся или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не упомянутые в данной инструкции, или какой-либо побочный эффект принял серьезный характер, уведомите, пожалуйста, **Вашего лечащего врача**.

Передозировка

Информация о передозировке Бетасерк® Лонг отсутствует.

Симптомы

Известно несколько случаев передозировки бетагистином. У некоторых пациентов наблюдались легкие и умеренные симптомы (тошнота, сонливость, боль в животе) после

приема бетагистина 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.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Если в настоящее время или в недавнем прошлом Вы принимали другие лекарственные средства, в том числе без назначения врача, сообщите об этом, пожалуйста, Вашему лечащему врачу.

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 (MAO), включая MAO подтипа В (например, селегилин). Следует соблюдать осторожность при одновременном применении бетагистина и ингибиторов MAO (включая MAO-B).

Бетагистин является аналогом гистамина, взаимодействие бетагистина с блокаторами H₁-гистаминовых рецепторов теоретически может влиять на эффективность одного из этих лекарственных средств.

Особые указания

Ввиду особенностей лекарственной формы препарата Бетасерк® Лонг, таблетки с модифицированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, каркас таблетки может не растворяться в кишечнике и выводиться с калом, что не влияет на терапевтическую эффективность препарата.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Бетагистин не влияет или незначительно влияет на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами, в клинических исследованиях нежелательные реакции, которые могли бы повлиять на такую способность, не выявлены.

Форма выпуска

Таблетки с модифицированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, 48 мг. По 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки ПВХ/ПВДХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

2, 4 или 7 контурные(х) ячейковые(х) упаковки(ок) вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

АО «ВЕРОФАРМ», Россия

308013, г. Белгород, ул. Рабочая, д. 14

Владелец регистрационного удостоверения

«Э б б о т т П р о д а к т с О п е р е й ш н з Э й Д ж и»,

Ш в е й ц а р и я

Х е г е н х а й м е р м а т т в е г 127, 4123 А л ь ш в и л ь ,

Ш в е й ц а р и я .

Организация, уполномоченная владельцем регистрационного удостоверения на принятие претензий от потребителей

О О О « Э б б о т т Л э б о р а т о р и з »

125171, г. Москва, Ленинградское шоссе, д. 16А,

с т р . 1

Т е л . : +7 (495) 258-42-80

Ф а к с : +7 (495) 258-42-81

abbott-russia@abbott.com