

20 110257/58
BG/MMP-52003-Y
15. 10. 2020

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Емперин 8 mg таблетки
Емперин 16 mg таблетки
Emperin 8 mg tablets
Emperin 16 mg tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 8 mg бетахистинов дихидрохлорид (*betahistine dihydrochloride*)
Всяка таблетка съдържа 16 mg бетахистинов дихидрохлорид (*betahistine dihydrochloride*)

Помощни вещества с известно действие

<Емперин 8 mg таблетки>: Всяка таблетка съдържа 70 mg лактоза монохидрат.
<Емперин 16 mg таблетки>: Всяка таблетка съдържа 140 mg лактоза монохидрат.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка.

<Емперин 8 mg таблетки>: Бяла или почти бяла, кръгла таблетка, маркирана с надпис „В8” от едната страна.

<Емперин 16 mg таблетки>: Бяла или почти бяла, кръгла таблетка, маркирана с надпис „В16” от едната страна и с делителна черта от другата страна.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Бетахистин е показан за лечение на Мениеров синдром, симптомите на който могат да включат световъртеж (с гадене/повръщане), шум в ушите и загуба на слух.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни

<Емперин 8 mg таблетки>: Препоръчителните дози обикновено са в рамките на 24 - 48 mg дневно, приложени като отделни дози.
8-16 mg (1 – 2 таблетки) три пъти дневно.

<Емперин 16 mg таблетки>:



Препоръчителните дози обикновено са в рамките на 24 - 48 mg дневно, приложени като отделни дози.

8-16 mg ($\frac{1}{2}$ – 1 таблетка) три пъти дневно.

Дозата трябва да бъде коригирана в зависимост от индивидуалните нужди на пациента, според индивидуалния отговор. Понякога подобрене може да се забележи едва след две седмици на лечение. Най-добри резултати понякога се получават след няколко месеца. Своевременното лечение предотвратява прогресирането на заболяването и/или загубата на слуха в по-късните фази на болестта.

Специални популации

Педиатрична популация

Бетахистин не се препоръчва за употреба при деца под 18 години поради липса на достатъчно данни за безопасността и ефективността.

Старческа възраст

Въпреки че има ограничени данни от клинични проучвания в тази пациентска група, постмаркетинговият опит показва, че не се изисква адаптиране на дозата в старческа възраст.

Бъбречно увреждане

Не са провеждани специални клинични проучвания в тази група, но въз основа на постмаркетингов опит не е необходимо адаптиране на дозата.

Чернодробно увреждане

Не са провеждани специални клинични проучвания в тази група, но въз основа на постмаркетингов опит не е необходимо адаптиране на дозата.

Начин на приложение

За перорално приложение.

Таблетките трябва да се приемат по време на хранене.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.

Бетахистин е противопоказан при пациенти с феохромоцитом. Тъй като бетахистин е синтетичен аналог на хистамин, той може да предизвика освобождаване на катехоламини от тумора, водещо до тежка хипертония.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Препоръчва се повишено внимание при лечение на пациенти с пептична язва или анамнеза за пептично разязвяване, поради редките случаи на поява на диспепсия при пациенти, приемащи бетахистин.

Необходимо е повишено внимание при пациенти с бронхиална астма.

Препоръчва се повишено внимание при предписване на бетахистин на пациенти с уртикария, обриви или алергичен ринит, поради възможността от влошаване на тези симптоми.



Препоръчва се повишено внимание при пациенти с тежка хипотония.

Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, тотална лактазна недостатъчност или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не са провеждани *in vivo* проучвания за лекарствени взаимодействия. Като се имат предвид данните от *in vitro*, не се очаква *in vivo* инхибиране на цитохром Р 450 ензимите.

In vitro данните показват инхибиране на метаболизма на бетахистин от лекарства, които потискат моноаминооксидазата (MAO), включително подтип MAO-B (напр. селегилин). Препоръчва се повишено внимание при едновременно използване на бетахистин и MAO-инхибитори (включително селективни MAO-B инхибитори).

Тъй като бетахистин е аналог на хистамин, взаимодействие на бетахистин с антихистамини теоретично може да повлияе ефективността на едно от тези лекарства.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Няма достатъчно данни за употребата на бетахистин при бременни жени. Проучванията при животни не показват преки или косвени вредни ефекти по отношение на репродуктивната токсичност при клинично значима терапевтична експозиция. Като предпазна мярка е за предпочитане да се избягва употребата на бетахистин по време на бременност.

Кърмене

Не е известно дали бетахистин се отделя в майчиното мляко. Бетахистин се екскретира в млякото на плъхове. Ефектите, наблюдавани след раждането в проучвания при животни, са ограничени до много високи дози. Значението на това лекарство за майката трябва да се съпостави с ползите от кърменето и потенциалните рискове за детето.

Фертилитет

Проучвания при животни не показват ефекти върху фертилитета при плъхове.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Бетахистин е показан за лечение на Мениеров синдром, симптомите на който могат да включат световъртеж, шум в ушите и загуба на слух. Този синдром и неговите симптоми могат да се отразят негативно върху способността за шофиране и работа с машини. По време на клиничните изпитвания, специално предназначени да проучат способността за шофиране и работа с машини, бетахистин няма или има незначителен ефект.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

При плацебо-контролирани клинични изпитвания при пациенти, лекувани с бетахистин са наблюдавани следните нежелани събития с посочените по-долу честоти [много чести ($\geq 1/10$); чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечести ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редки ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1000$); много редки ($< 1/10\,000$)]; с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).



Нарушения на нервната система

Чести: главоболие

Стомашно-чревни нарушения

Чести: гадене и диспепсия

В допълнение към тези събития, докладвани по време на клинични изпитвания, следните нежелани реакции са съобщавани спонтанно по време на употреба след пускането на пазара и в научната литература. От наличните данни не може да бъде направена оценка на честотата и поради това е класифицирана като “неизвестна честота”.

Нарушения на имунната система

С неизвестна честота: Реакции на свръхчувствителност, напр. анафилаксия

Стомашно-чревни нарушения

С неизвестна честота: Леки стомашни оплаквания (напр. повръщане, стомашно-чревна болка, напрежение и подуване в корема). Обикновено това може да се избегне като дозата се приеме по време на хранене или дозата бъде понижена.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

С неизвестна честота: Кожни и подкожни реакции на свръхчувствителност, по-специално ангионевротичен оток, уртикария, обрив и пруритус.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез национална система за съобщаване в Изпълнителна агенция по лекарствата ул. „Дамян Груев” № 8, 1303 София, Тел.: +35 928903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

Докладвани са няколко случая на предозиране. Някои пациенти проявяват леки до умерени симптоми при дози над 640 mg (напр. гадене, сънливост, коремна болка). По сериозни усложнения (напр. конвулсии, белодробни или сърдечни усложнения) са наблюдавани в случаи на преднамерено предозиране на бетакхистин, особено в комбинация с други предозирани лекарства. Лечението при предозиране трябва да обхваща стандартните поддържащи мерки.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Препарати за лечение на вертиго, АТС код: N07C A01

Механизъм на действие

Механизмът на действие на бетакхистин дихидрохлорид е само частично известен. Съществуват няколко хипотези, които са подкрепени от проучвания при животни и данни при хора:

- Бетакхистин засяга хистаминергичната система:

Бетакхистин действа като частичен хистамин H₁-рецепторен агонист и като хистамин H₃-рецепторен антагонист в невроналните тъкани и има незначителна H₂-рецепторна активност.



Бетахистин повишава преобразуването и освобождаването на хистамин чрез блокиране на пресинаптичните H₃-рецептори и индуциране на H₃-рецепторна обратна регулация.

- Бетахистин може да повиши кръвния ток към кохлеарната област, както и към целия мозък:

Фармакологични тестове при животни са показали, че кръвната циркулация във васкуларните стрии на вътрешното ухо се подобрява, може би в смисъл на релаксация на прекапилярните сфинктери на микроциркулацията на вътрешното ухо. Бетахистин повишава церебралния кръвен ток при хора.

- Бетахистин подпомага вестибуларната компенсация:

Бетахистин увеличава вестибуларното възстановяване след унилатерална невректомия при животни чрез подобряване и подпомагане на централната вестибуларна компенсация; този ефект, характеризиращ се с повишена регулация на преработването и отделянето на хистамина се медира през H₃ рецепторен антагонизъм. При хора, лекувани с бетахистин, времето за възстановяване след вестибуларна невректомия е съкратено.

- Бетахистин променя невроналния сигнал във вестибуларните ядра:

Известно е, че бетахистин има дозозависим потискащ ефект върху образуването на израстъците на невроните в латералното и медиалното вестибуларни ядра.

Фармакодинамичните свойства, както е показано при животни, може да допринесат за терапевтичната полза на бетахистин във вестибуларната система.

Клинична ефикасност и безопасност

Ефикасността на бетахистин е демонстрирана в проучвания при пациенти с вестибуларен световъртеж и с болест на Мениер с подобрение на тежестта на заболяването и намаляване на честотата на вертигинозните кризи.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

След перорален прием бетахистин дихидрохлорид се резорбира лесно и почти напълно от всички части на стомашно-чревния тракт. След резорбцията на активното вещество бързо и почти изцяло се метаболизира до 2-РАА (2-пиридилотетна киселина). Плазмените нива на бетахистин са много ниски. Следователно фармакокинетичните анализи се базират на измервания на 2-РАА в плазмата и урината. В условия на хранене Стах е по-ниско в сравнение с условията на гладно. Въпреки това, тоталната резорбция на бетахистин е подобна при двете състояния, показвайки, че приемът на храна само забавя резорбцията на бетахистин.

Разпределение

Процентът на бетахистин, който е свързан с плазмени протеини, е под 5%.

Биотрансформация

След резорбция, бетахистин бързо и почти напълно се метаболизира до 2-РАА (която няма фармакологична активност).

След перорален прием на бетахистин плазмените (и уринните) концентрации на 2-РАА достигат своя пик 1 час след приема и намаляват с полуживот от около 3,5 часа.

Елиминиране



2-РАА се екскретира бързо през урината. При доза в рамките на 8 mg до 48 mg около 85% от постъпилото вещество се изолира в урината. Екскрецията на непроменен бетахистин с урината и изпражненията е несъществено.

Линейност

Степента на елиминиране остава постоянна за целия обхват на перорални дозировки от 8 до 48 mg, което показва, че фармакокинетиката на бетахистин е линейна и се предполага, че участващият метаболитен път не е наситен.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Хронична токсичност

Наблюдавани са нежелани реакции от страна на нервната система при кучета и павиани след интравенозни дози около и над 120 mg/kg.

Изпитванията за хронична токсичност при перорален прием в продължение на 18 месеца при плъхове в дози от 500 mg/kg, и 6 месеца при кучета в доза от 25 mg/kg показва, че бетахистин се понася добре без дефинитивна токсичност.

Мутагенен и карциногенен потенциал

Бетахистин няма мутагенен потенциал.

В 18-месечно проучване за хронична токсичност при плъхове, бетахистин в дози до 500 mg/kg не дава никакви доказателства за канцерогенен потенциал.

Репродуктивна токсичност

В проучванията за репродуктивна токсичност ефекти са наблюдавани само при експозиции, считани за значително надвишаващи максималната експозиция при хора, което има малко значение за клиничната употреба.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Повидон К90
Микрокристална целулоза
Лактоза монохидрат
Силициев диоксид, колоиден безводен
Кросповидон
Стеаринова киселина.

6.2 Несъвместимости

Не е приложимо.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25 °C в оригиналната опаковка, за да се предпази от влага.



6.5 Вид и съдържание на опаковката

Блистери от PVC/PVDC/Al.

<Емперин 8 mg таблетки>: Предлага се в опаковки от 30, 50, 100 и 120 таблетки.

<Емперин 16 mg таблетки>: Предлага се в опаковки от 20, 30, 42, 50, 60, 84 и 100 таблетки.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания за изхвърляне.

Неизползваният лекарствен продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Egis Pharmaceuticals PLC
1106 Budapest, Keresztúri út 30-38
Унгария

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Емперин 8 mg таблетки: Рег. №: 20110257
Емперин 16 mg таблетки: Рег. №: 20110258

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 18.04.2011
Дата на последно подновяване: 09.01.2014

Дата на първо разрешаване: 18.04.2011
Дата на последно подновяване: 09.01.2014

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Септември, 2019г.

