

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Zenostig; 16 mg, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY SUBSTANCJI CZYNNEJ

Jedna tabletki zawiera 16 mg dichlorowodorku betahistyny (*Betahistini dihydrochloridum*).

1 tabletki zawiera 70 mg laktozy jednowodnej.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki.

Białe lub prawie białe, okrągłe tabletki. Po jednej stronie wytłoczony napis B16, z drugiej strony rowek dzielący.

Tabletkę można dzielić na dwie równe części.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Betahistyna jest wskazana w leczeniu choroby Ménière'a charakteryzującej się następującymi objawami: zawroty głowy, szumy uszne, utrata słuchu i nudności.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Dorośli (w tym osoby w podeszłym wieku):

Początkowo doustnie 8 – 16 mg trzy razy na dobę podczas posiłków.

Dawka podtrzymująca zazwyczaj wynosi 24 – 48 mg na dobę. Dawkę można dostosować do indywidualnych potrzeb pacjenta. Czasami poprawę można zaobserwować dopiero po kilku tygodniach leczenia.

Dzieci i młodzież:

Nie zaleca się stosowania betahistyny w postaci tabletek u dzieci i młodzieży poniżej 18 lat z powodu braku danych dotyczących bezpieczeństwa i skuteczności.

4.3. Przeciwwskazania

Betahistyna jest przeciwwskazana u pacjentów z guzem chromochłonnym nadnerczy. Ponieważ betahistyna jest syntetycznym analogiem histaminy, może indukować uwalnianie amin katecholowych z guza, powodując ciężkie nadciśnienie tętnicze.

Preparat jest przeciwwskazany również w przypadku nadwrażliwości na substancję czynną lub którąkolwiek substancję pomocniczą.

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy zachować ostrożność podczas leczenia pacjentów z czynną lub przebytą chorobą wrzodową, ze względu na występowanie sporadycznie dyspepsji podczas leczenia betahistyną.

Należy zachować ostrożność u pacjentów z astmą oskrzelową.

Należy zachować ostrożność w przepisywaniu betahistyny pacjentom z pokrzywką, wysypkami lub alergicznym nieżytem nosa ze względu na możliwość zaostrzenia tych objawów.

Należy zachować ostrożność u pacjentów z ciężkim niedociśnieniem tętniczym.

Pacjenci z rzadką dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy typu „Lapp” lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy nie powinni stosować tego leku.

4.5. Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Nie ma udowodnionych przypadków niebezpiecznych interakcji.

Istnieją doniesienia dotyczące interakcji z etanolem i preparatem zawierającym pirymetaminę i dapson, a także nasilania działania betahistyny przez salbutamol.

Betahistyna jest analogiem histaminy, zatem teoretycznie możliwe są jej interakcje z lekami przeciwhistaminowymi, ale dotychczas nie było takich doniesień.

4.6. Ciąża i laktacja

Badania na zwierzętach dotyczące wpływu leku na ciążę, rozwoju zarodka/płodu, przebiegu porodu i rozwoju po urodzeniu są nie wystarczające (patrz punkt 5.3. „Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie”). Potencjalne ryzyko dla człowieka nie jest znane.

Nie zaleca się stosowania preparatu Zenostig u kobiet w ciąży.

Betahistyna przenika do mleka w stężeniu podobnym do występującego w osoczu krwi. Działanie toksyczne betahistyny w takim stężeniu u noworodków nie jest znane. Należy unikać stosowania betahistyny u pacjentek karmiących piersią (patrz punkt 5.3.)

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Rzadko zgłaszano występowanie senności związanej ze stosowaniem betahistyny. Pacjenci, u których wystąpią te objawy powinni być poinformowani o konieczności unikania czynności wymagających koncentracji, takich jak prowadzenie pojazdów mechanicznych lub obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu.

4.8. Działania niepożądane

Zaburzenia układu immunologicznego:

bardzo rzadko (<1/10 000): wysypki skórne i świąd.

Zaburzenia układu nerwowego:

nieznana częstość występowania: bóle głowy i sporadycznie senność.

Zaburzenia żołądka i jelit:

rzadko (>1/10 000 do <1/1 000): zaburzenia żołądkowo-jelitowe, nudności i dyspepsja.

4.9. Przedawkowanie

Objawy przedawkowania betahistyny to: nudności, wymioty, dyspepsja, ataksja i drgawki (w przypadku dużych dawek). Nie ma swoistej odtrutki dla betahistyny. Zaleca się płukanie żołądka i leczenie objawowe.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: preparaty stosowane w zawrotach głowy, kod ATC: N07C A01.

Aktywność agonistyczną betahistyny w stosunku do receptora histaminowego H₁ wykazano u człowieka przez znoszenie wywołanego przez nią rozszerzenia obwodowych naczyń krwionośnych przez antagonistę histaminy – difenhydraminę. Betahistyna ma minimalny wpływ na wydzielanie kwasu żołądkowego (reakcja z udziałem receptora histaminowego H₂).

Mechanizm działania betahistyny w chorobie Ménière'a nie jest wyjaśniony. Skuteczność betahistyny w leczeniu zawrotów głowy może być wynikiem jej zdolności do modyfikacji krążenia w uchu wewnętrznym lub bezpośredniego wpływu na neurony jądra przedsionkowego.

Pojedyncze dawki doustne betahistyny do 32 mg u osób zdrowych powodują maksymalne hamowanie indukowanego oczopląsu przedsionkowego w ciągu 3 – 4 godz. po podaniu, a większe dawki skuteczniej skracają czas trwania oczopląsu.

Betahistyna zwiększa u człowieka przepuszczalność nabłonka płucnego. Wykazano to działanie poprzez skrócenie czasu klirensu znacznika radioaktywnego z płuc do krwi. Temu działaniu przeciwdziała wcześniejsze podanie doustne terfenadyny, która jest znaną substancją blokującą receptor H₁.

O ile histamina na serce działa inotropowo dodatnio, o tyle betahistyna nie zwiększa pojemności minutowej serca, a jej działanie rozszerzające naczynia krwionośne może u niektórych pacjentów nieznacznie obniżyć ciśnienie krwi.

U człowieka betahistyna ma słabe działanie na gruczoły wydzielania zewnętrznego.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Betahistyna po podaniu doustnym wchłania się całkowicie, a maksymalne stężenie w osoczu betahistyna znakowana ^{14}C osiąga po około 1 godz. po podaniu doustnym na czczo.

Eliminacja betahistyny odbywa się przede wszystkim przez metabolizm, a metabolity są następnie wydalone głównie przez nerki. 85 – 90% radioaktywności podanej dawki 8 mg pojawia się w moczu przez ponad 56 godz. z maksymalną szybkością wydalania 2 godz. po podaniu leku. Po podaniu doustnym betahistyny jej stężenie w osoczu krwi jest bardzo małe. Dlatego ocena farmakokinetyki betahistyny opiera się na danych dotyczących stężenia jedyne go metabolitu – kwasu 2-pirydylooctowego – w osoczu krwi.

Nie ma dowodów na metabolizm pozawątrobowy. Uważa się, że wydalanie z żółcią nie odgrywa istotnej roli w eliminacji leku lub któregośkolwiek z jego metabolitów. Lek nie wiąże się lub wiąże się w niewielkim stopniu z ludzkimi białkami osocza, chociaż betahistyna jest metabolizowana w wątrobie. Około 80 – 90% podanej dawki jest wydalana z moczem.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Sześciomiesięczne badania toksyczności po podaniu wielokrotnym u psów oraz 18-miesięczne badania u szczurów albinosów nie wykazały klinicznie istotnych działań szkodliwych w dawkach 2,5 – 120 mg/kg. Betahistyna nie wykazuje działania mutagennego i nie ma dowodów na jej działanie rakotwórcze u szczurów. Badania wykonane na ciężarnych samicach królików nie wykazały działania teratogenne go.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Wykaz substancji pomocniczych

Powidon K90
Celuloza mikrokrystaliczna
Laktoza jednowodna
Krzemionka koloidalna bezwodna
Krospowidon (typ A)
Kwas stearynowy

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3. Okres ważności

3 lata

6.4. Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25° C w oryginalnym opakowaniu.

6.5. Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry PVC/PVDC/Al w tekturowym pudełku.

Opakowania zawierają 20, 30, 42, 50, 60, 84 lub 100 tabletek.

Nie wszystkie rodzaje opakowań mogą znajdować się w obrocie.

6.6. Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

OZONE Laboratories BV
2 Martinus Nijhofflaan
2624 ES Delft, Holandia

8. NUMER(-Y) POZWOLENIA(Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO