

Акувер 8 mg/ доза перорален разтвор
Acuver 8 mg/ dose oral solution

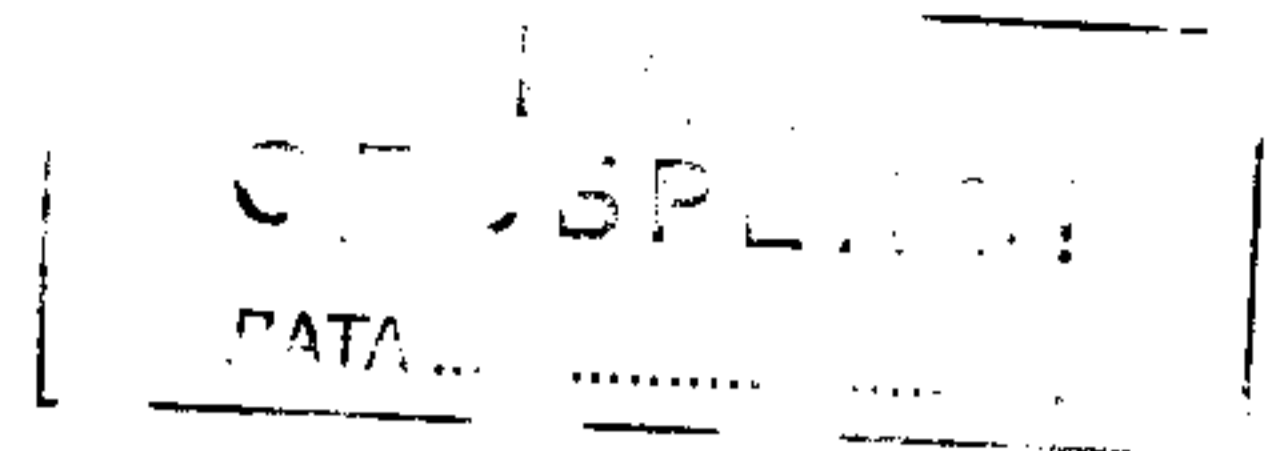
Раздел 1.3.1
КХП



Кратка характеристика на продукта

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Акувер 8 mg/ доза перорален разтвор
Acuver 8 mg / dose oral solution



2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

0,8 ml (=1 впръскване) Акувер съдържа 8 mg бетахистинов дихидрохлорид (betahistine dihydrochloride).

Помощно вещество: 50 mg/ml етанол (96 об. %)

За пълния списък на помощните вещества виж 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Перорален разтвор, бистра прозрачна течност.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

За лечение на вертиго, свързано с функционални разстройства на вестибуларния апарат в контекста на комплексния Мениеров синдром.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка при възрастни:

Стандартната доза е:

3 пъти дневно по 1 – 2 впръсквания (съответстващо на 3 пъти дневно по 8 -16 mg бетахистинов дихидрохлорид).

1 впръскване е еквивалентно на 0,8 ml разтвор.

Деца и юноши:

Акувер не се препоръчва за лечение на деца и юноши до 18-годишна възраст.

Безопасността и ефикасността в тази възрастова група не са установени в проучвания (виж 4.4 и 5.2).

Начин на приложение:

Преди първата употреба отстранете винтовата капачка и завинтете приложената мерителна помпа на бутилката.

Предписаната доза се освобождава от бутилката с помощта на мерителната помпа и се разтваря в неутрална течност (вода) (най-малко в 100 ml вода в чаша).



Акувер да се приема по време или след хранене.

Времетраене на лечението:

Времетраенето на лечението зависи от клиничната картина и протичането на заболяването. В повечето случаи е необходимо продължително лечение (няколко месеца).

4.3 Противопоказания

Акувер е противопоказан в следните случаи:

- свръхчувствителност към бетахистинов дихидрохлорид или някои от помощните вещества;
- по време на бременност и кърмене (виж 4.6);
- феохромоцитома.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки за употреба

Препоръчва се внимателна употреба при лечение на пациенти с:

- стомашна язва (включително анамнестични данни за такова разстройство) – при лекувани с бетахистинов дихидрохлорид пациенти може да настъпи диспепсия;
- бронхиална астма;
- уртикария, екзантема или алергичен ринит – тези симптоми може да се влошат;
- изразена хипотония;
- съпътстващо приложение на антихистамини (виж 4.5)

Акувер не се препоръчва за лечение на деца и юноши под 18-годишна възраст. Безопасността и ефикасността в тази група пациенти не е установена в проучвания (виж 4.4 и 5.2).

Акувер съдържа малки количества етанол (алкохол), по-малко от 100 mg една доза.

При случайно инхалиране на Акувер перорален разтвор вместо перорален прием теоретично е възможно да настъпи бронхоспазъм или понижаване на кръвното налягане.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не са провеждани изпитвания за взаимодействия, по-специално не са провеждани изпитвания за взаимодействия с лекарствени продукти, които често се употребяват успоредно с бетахистин при указаните по-горе терапевтични показания, например вазодилататори, психоактивни вещества (седативи, транквилизатори, невролептици), парасимпатиколитици или витамини.

Акувер да не се приема успоредно с антихистаминови лекарствени продукти, тъй като резултатите от експериментални проучвания при животни сочат, че тези продукти може да намалят взаимно ефикасността си.



Указание:

Ако бетахистин бъде предписан след лечение с антихистамини, трябва да се вземе предвид, че повечето антихистамини имат седативен ефект и при внезапно прекъсване на лечението е възможно да се проявят неприятни симптоми на отнемането като нарушения на съня или възбуда. Следователно, лечението с антихистамини следва да се преустанови бавно с продължаващо намаление на дозата за около 6 дни.

4.6 Бременност и кърмене

Проучванията при животни не са достатъчни по отношение на ефектите върху бременността, ембрионалното/феталното развитие, раждането и постнаталното развитие (виж 5.3). Потенциалният риск за човека не е известен.

Не са налице данни за екскрецията на бетахистин в кърмата.

Поради това Акувер е противопоказан по време на бременност и лактация (виж 4.3).

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

По време на прием на Акувер може да се проявят нежелани ефекти като сънливост. Като се има предвид, че Акувер съдържа и малки количества етанол (алкохол), употребата на Акувер може да понижи способността за реагиране и така да намали способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Честотата на нежеланите лекарствени реакции се класифицира както следва:

| |
|---|
| Много чести ($\geq 1/10$) |
| Чести ($\geq 1/100 < 1/10$) |
| Нечести ($\geq 1/1\ 000 < 1/100$) |
| Редки ($\geq 1/10\ 000 < 1/1\ 000$) |
| Много редки ($< 1/10\ 000$), неизвестни (не може да се даде оценка въз основа на наличните данни) |

Нежеланите лекарствени реакции са представени по системо-органи класове.

Нарушения на нервната система:

Редки: Сънливост, усещане за тежест в главата, главоболие.

Сърдечни нарушения:

Редки: Сърцебиене, стягане в гръдната област.

Гастроинтестинални нарушения:

Редки: Гадене, повдигане, киселини, стомашен дискомфорт и болка, газове, диария, повръщане.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан:



Много редки: Обрив, сърбеж, уртикария.

Общи нарушения:

Редки: Усещане за топлина.

В повечето случаи стомашният дискомфорт може да се избегне, като Акувер се приема по време на или след хранене или с намаление на дозата.

4.9 Предозиране

Симптоматика на предозирането:

Докладвани са много редки случаи на предозиране. В повечето от тези случаи не са настъпвали симптоми на отравяне. При малък брой пациенти след дозировка от над 200 mg е наблюдавана лека до умерено тежка симптоматика. Само един пациент е получил конвулсии след прием на 728 mg бетахистин. Във всички случаи пациентите напълно са се възстановили.

В случай на предозиране може да се очакват аналогични на хистаминовите ефекти, водещи до следните симптоми: главоболие, зачервяване на лицето, замаяност, тахикардия, хипотония, бронхоспазъм, отоци, локализирани предимно в лигавиците на горните дихателни пътища (едем на Квинке).

Няма специфичен антидот. В допълнение на общите мерки за детоксикация (стомашен лаваж, приложение на активен въглен), лечението е симптоматично.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: лекарствени продукти антивертиго, АТС код: N07 SA01.

Бетахистин представлява съединение от групата на бета-2-пиридилалкиламините.

Структурата на бетахистин е подобна на структурата на ендогенния амин хистамин.

Точният механизъм на действие на бетахистин по отношение на биохимичните му ефекти, както и рецепторната му специфичност и афинитет все още не е изяснена.

Проучвания при животни разкриват усилена циркулация в striae vascularis на вътрешното ухо, която вероятно се дължи на отпускане на прекапилярните сфинктери в микроциркулацията на вътрешното ухо.

Проведените фармакологични проучвания показват слабо изразен H_1 -агонистичен и значителен H_3 -антагонистичен ефект на бетахистина в ЦНС и автономната нервна



система. Доказано е дозозависимо инхибиращо действие на бетахистин върху активността на латералните и медиалните вестибуларни ядра. При всички случаи, релевантността на тези наблюдения по отношение лечението на Мениеровия синдром остава неясна.

5.2 Фармакокинетични свойства

Към днешна дата чист бетахистинов дихидрохлорид не може да бъде определян в човешкия организъм (под граници на определяне). Поради това плазмените концентрации и плазменният полуживот се определят с помоща на радиоактивно маркиран бетахистинов дихидрохлорид и чрез концентрациите в урината на неактивния главен метаболит 2-пиридилоцетна киселина.

Резорбция

След перорално приложение бетахистинов дихидрохлорид се резорбира бързо и напълно. Максимални концентрации на маркиран с ¹⁴C бетахистинов дихидрохлорид се достигат около 1 час след перорално приложение при доброволци на гладно. Абсолютната бионаличност на бетахистиновия дихидрохлорид не е установена.

Разпределение

Обемът на разпределение на бетахистиновия дихидрохлорид не е установен.

Свързването с плазмените протеини е под 5%.

Метаболизъм

Бетахистиновият дихидрохлорид се метаболизира бързо в черния дроб до неактивния главен метаболит 2-пиридилоцетна киселина и до деметил-бетахистин.

Елиминиране

Около 90% от приложената доза се елиминира в урината за 24 часа под формата на главния метаболит. В урината се установяват само следи от деметил бетахистинов дихидрохлорид. Елиминирането през жлъчката не е сигнификантен път на елиминиране на активното лекарствено вещество или неговите метаболити.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Хронична токсичност

Проучвания за хронична токсичност след перорален прием на бетахистинов дихидрохлорид са проведени при плъхове за период от 18 месеца и при кучета за период от 3 и 6 месеца. Резултатите показват, че дозировка от 500 mg/kg/дневно (плъхове) и 25 mg/kg/дневно (кучета) се понасят без отклонения в биохимичните и хематологични параметри. Хистологичната находка също остава непроменена. При високата доза от 300 mg/kg при кучетата е наблюдавано повръщане, загуба на тегло и преходна лека анемия. При изпитвания с бетахистин приложен на плъхове за 6 месеца се съобщава за хиперемия на далака като хистологична находка в групата, третирана с 39 mg/kg; в групите, при които е прилагана по-високата доза се наблюдава и хиперемия на бъбреците и черния дроб, отчасти съчетана с клетъчна атрофия и клетъчна



дегенерация, което може да се отдаде на голямата доза приложено вазоактивно вещество.

Мутагенен и канцерогенен потенциал

Няма данни за мутагенност и канцерогенност на бетакхистин и неговите съединения.

Репродуктивна токсичност

Изпитванията при животни са недостатъчни за оценка на репродуктивната токсичност на бетакхистина и неговите съединения. И в двете проучвани групи (10 и 100 mg/kg/дневно) ембрио-феталната загуба е по-висока в сравнение с контролната група. Същественият ефект на бетакхистина не може да бъде изключен.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Захарин натрий (Saccharin sodium)

Глицерол (Glycerol)

Етанол (Ethanol) (96 об. %)

Натриев бензоат (Sodium benzoate) (E 211)

Солна киселина (Hydrochloric acid) (3,5 % w/w) за коригиране на pH

Вода, пречистена

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

4 години.

120 ml: 2 месеца след първото отваряне.

60 ml: 1 месец след първото отваряне.

6.4 Специални предпазни мерки при съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпазва от светлина.

Да не се съхранява в хладилник или замразява.

6.5 Вид и състав на контейнера

Контейнер:

Бутилка от кехлибарено стъкло (хидролитична устойчивост, тип III) със защитена от деца капачка на винт и приложена мерителна помпа.

Размер на опаковките:

60 ml и 120 ml

Не всички размери на опаковките може да се пускат на пазара.



6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне
Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

CYATHUS Exquirere PharmaforschungsGmbH
Rudolfsplatz 2/1/8
1010 Vienna - Австрия
Tel.: 0043 (0)1 246 46 0
Fax: 0043 (0)1 246 46 666
Email: office@cyathus.eu

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

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

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

{ММ/ГГГГ}.

