



BETAISTINA DICLORIDRATO

Vertigem e zumbido



Betaistina é um medicamento análogo histamínico que age promovendo a melhora do fluxo sanguíneo no seu ouvido interno. Isso resulta na diminuição do acúmulo da pressão. Betaistina melhora os sintomas de vertigem (acompanhada de náuseas e vômitos) e zumbido no ouvido.

A melhora, algumas vezes, só pode ser observada após algumas semanas de tratamento. Os melhores resultados são obtidos às vezes depois de alguns meses e existem evidências que o tratamento desde o início da doença previne a sua progressão e/ou a perda de audição em fases avançadas da doença.

MECANISMO DE AÇÃO

Betaistina apresenta uma ação agonista parcial sobre os receptores histamínicos H1 e antagonista sobre os receptores H3 em tecido neuronal, e tem atividade negligenciável sobre os receptores H2. A betaistina aumenta o "turnover" e liberação de histamina através do bloqueio de receptores pré-sinápticos H3 e indução da regulação do receptor H3.

Betaistina também apresenta um efeito inibitório dose-dependente na geração do pico neural nos núcleos vestibulares lateral e médio. As propriedades farmacodinâmicas demonstradas em animais podem contribuir com o benefício terapêutico da betaistina no sistema vestibular.

Nome IUPAC

N-methyl-2-(pyridin-2-yl)ethanamine

Fórmula Molecular

C₈H₁₂N₂·2 HCl

Classe terapêutica

Fraco agonista dos receptores H1

Sinônimos

Labirin® Betina®

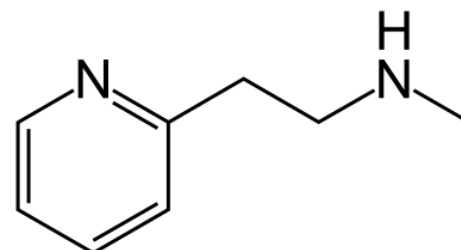
Dose usual

8 mg ou 16mg três vezes ao dia, de preferência durante as refeições. Ou 24 mg duas vezes ao dia.
Dose máxima de 48 mg/dia.

Indicações do produto

- Tratamento sintomático da vertigem interativa com ou sem sinais cocleares.
- Vertigens devidas a distúrbios circulatórios do ouvido interno;
- Zumbidos no ouvido e vertigens do tipo Síndrome de Menière;
- Diminuir a frequência e a severidade dos ataques de vertigem.

Fórmula estrutural



Resultados de Eficácia

Em um estudo duplo-cego, controlado com placebo, no modelo “crossover”, foi conduzido em 18 clínicas de otorrinolaringologia com 82 pacientes que apresentavam vertigem de várias origens. No primeiro período de tratamento, os pacientes receberam betaistina (48 mg/dia) ou placebo por cinco semanas. No segundo período de tratamento, houve inversão da medicação que cada grupo receberia nas cinco semanas seguintes. Durante o primeiro período de tratamento, o grupo que recebeu betaistina demonstrou uma melhora estatisticamente significativa na frequência das crises quando comparada com o grupo placebo. Quando os pacientes deste grupo inverteram a medicação com o grupo placebo, houve um pequeno aumento na frequência de crises. Entretanto, quando os pacientes que começaram no grupo placebo e passaram a receber betaistina, uma melhora ainda melhor ocorreu. Betaistina apresentou resultados significativamente melhores que o placebo na redução da severidade das crises.

Avaliação de eficácia do uso de betaistina na Doença de Ménière

Em estudo multicêntrico, controlado com placebo, 144 pacientes recrutados em 11 centros e que apresentavam vertigem recorrente decorrente de Doença de Ménière ou vertigem paroxística posicional, receberam 16 mg de dicloridrato de betaistina, 3 vezes ao dia ou placebo por 3 meses. O número mensal de crises de vertigem em pacientes com Doença de Ménière foi significativamente reduzido pela betaistina (de 6,70 crises para 2,06 crises depois de 3 meses), quando comparado com o placebo desde o primeiro mês e durante o estudo ($p < 0,05$). As escalas de autopreenchimento para mensuração da intensidade das crises, duração e sintomas associados à vertigem (tinnitus, plenitude aural, náusea, vômito) mostraram uma melhora significativamente maior no grupo tratado com dicloridrato de betaistina, quando comparado ao grupo tratado com placebo ($p < 0,001$ – $p < 0,02$).² Não foram observados efeitos adversos após administração por três meses de doses orais de até e acima de 250 mg/kg de dicloridrato de betaistina em cachorros e ratos, respectivamente. Efeitos colaterais sobre Sistema Nervoso foram verificados em cachorros e babuínos após administração intravenosa de doses de e acima de 120 mg/kg.

PROPRIEDADES FARMACOCINÉTICAS

Absorção

Oralmente administrado betaistina é prontamente e quase completamente absorvido por todas as partes do trato gastrointestinal. Após absorção, a betaistina é rapidamente e quase totalmente metabolizada em ácido 2-piridilacético (2-PAA). Os níveis plasmáticos de betaistina são muito baixos. Todas as análises farmacocinéticas são, portanto, baseadas em medidas de 2-PAA no plasma e urina. A concentração máxima (C_{max}) de betaistina após a ingestão de alimentos é menor do que a observada quando em jejum. Entretanto, a absorção total de betaistina é semelhante nas duas condições, indicando que a ingestão de alimentos somente retarda sua absorção.

Distribuição

A porcentagem da betaistina que é ligada à proteína plasmática sanguínea é menor que 5%.

Biotransformação

Depois de absorvida, a betaistina é rapidamente e quase totalmente metabolizada em 2-PAA (que não apresenta atividade farmacológica). Depois da administração oral de betaistina a concentração plasmática máxima (e urinária) de 2-PAA é observada após uma hora da administração e declina com meia vida de eliminação de aproximadamente 3,5 horas.

Excreção

2-PAA é rapidamente eliminado na urina. A dose de betaistina varia de 8 mg a 48 mg e cerca de 85% da dose original é encontrada na urina. A excreção renal ou fecal de betaistina é mínima.

REAÇÕES ADVERSAS

A boa tolerância permite o uso prolongado de betaistina. Entretanto, foram reportadas reações adversas, sendo as mais frequentes epigastralgia, exacerbação das úlceras pépticas, náusea, e vômito. Raramente, podem ocorrer ainda diarreia, cefaleia e sonolência.

SUGESTÃO EXCIPIENTES

Lactose, amido, polivinilpirrolidona K30, fosfato tricálcico, dióxido de silício coloidal, estearato de magnésio, croscarmelose sódica.

CONTRAINDICAÇÃO

Não é recomendado o uso de betaistina durante a gestação e a lactação e para pacientes com úlcera gastrointestinal ativa e feocromocitoma.

Em pacientes asmáticos a administração exige um acompanhamento cuidadoso devido ao risco de ocorrer broncoconstrição.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Há interação com a atropina não sendo recomendado o uso simultâneo destas drogas. E também pode ocorrer interação medicamentosa aditiva entre a histamina e a betaistina.




REFERÊNCIAS

Fabricante, 2017

AFANASYEVA, S. A.; GORBACHEVA, F. E.; NATYAZHKINA, G. M. Isolated vertigo: pathogenesis and efficacy of betahistine (Betaserc). *Journal of Neurology*, v. 4. p. 12-16, 2003.
GATER, P. R.; WEBBER, S. C.; GUI, C. P. H.; JORDAN, C. C.; HAYES, M.A.; ASHFORD, J. J.; FOREMAN, J. C. Some studies of the action of betahistine at H1 and H2 receptors for histamine. *Inflammation Research*, v. 18, n. 3-4, p. 342-350, 1986. OOSTERVELD, W.J.; BLIJLEVEN, W.; VAN ELFEREN, L.W.M. Betahistine versus placebo in paroxysmal vertigo; a double-blind trial. *J Drug Ther Res.*, 14, p. 122-126, 1989. 2. MIRA, E.; GUIDETTI, G.; GHILARDI, P.L.; FATTORI, B.; MALANNINO, N.; MAIOLINO, L.; MORA, R.; OTTOBONI, S.; PAGNINI, P.; LEPRINI, M.; PALLESTRINI, E.; PASSALI, D.; NUTI, D.; RUSSOLO, M.; TIRELLI, G.; SIMONCELLI, C.; BRIZI, S.; VICINI, C.; FRASCONI, P. Betahistine dihydrochloride in the treatment of peripheral vestibular vertigo. *Eur Arch Otorhinolaryngol*, 260(2), p. 73-77, 2003.

Alcântara - Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130
Centro / Zé Garoto - Rua Coronel Serrado, 1630, lojas 102/103. Telefone (21) 2605-1349

 vendas@farmacam.com.br

 whatsapp (21) 98493-7033

 Facebook.com.br/farmacam

 Instagram.com.br/farmacam