Спитомин



Код АТХ:

- N05BE01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Буспирон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с гравировкой "E151" на одной стороне и с риской - на другой; без запаха или со слабым характерным запахом.

	1 таб.
буспирона гидрохлорид	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 55.7 мг, целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с гравировкой "E152" на одной стороне и с риской - на другой; без запаха или со слабым характерным запахом.

	1 таб.
буспирона гидрохлорид	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 111.4 мг, целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анксиолитический препарат (транквилизатор) небензодиазепинового ряда, оказывает также антидепрессивное действие. В отличие от классических анксиолитиков, не обладает противоэпилептическим, седативным, снотворным и миорелаксирующим эффектами.

Механизм действия связан с влиянием буспирона на серотонинергическую и допаминергическую системы. Селективно блокирует пресинаптические допаминовые рецепторы и повышает скорость возбуждения дофаминовых нейронов среднего мозга. Кроме того, буспирон является селективным частичным агонистом 5-HT_{1A}-серотониновых рецепторов. Буспирон не оказывает существенного эффекта на бензодиазепиновые рецепторы и не влияет на связывание GABA, не обладает отрицательным влиянием на психомоторные функции, не вызывает толерантности, лекарственной зависимости и синдрома "отмены". Не потенцирует действие алкоголя. По анксиолитической активности буспирон примерно равен бензодиазепинам.

Терапевтический эффект развивается постепенно и отмечается через 7-14 дней от начала лечения, максимальный эффект регистрируется через 4 нед.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь буспирон быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ. Буспирон подвергается интенсивному метаболизму при "первом прохождении" через печень. Поэтому неизмененное вещество обнаруживается в системном кровотоке в небольшой концентрации, которая имеет значительные индивидуальные различия. Биодоступность составляет 4%. C_{max} в плазме крови достигается через 60-90 мин после приема препарата. У здоровых добровольцев буспирон имел линейную (пропорциональную дозе) фармакокинетику после приема 10-40 мг. Аналогичные фармакокинетические параметры обнаружены у пациентов пожилого возраста. После однократного приема внутрь препарата в дозе 20 мг его концентрация в плазме крови составляла от 1 до 6 нг/мл.

Одновременный прием пищи замедляет всасывание буспирона, но благодаря снижению досистемного клиренса (эффект "первого прохождения") при этом значительно повышается биодоступность буспирона. После приема с пищей значение AUC буспирона повышается на 84%, а его C_{max} повышается на 16%.

Распределение

Связывание буспирона с белками плазмы крови составляет примерно 95% (86% с альбумином плазмы, остальная часть - с кислым α_1-гликопротеином).

C_{ss} в плазме крови может быть достигнута примерно через 2 дня после начала регулярного приема. Кажущийся V_d составляет 5.3 л/кг.

Буспирон выделяется с грудным молоком. Данные о проникновении препарата через плацентарный барьер отсутствуют.

Метаболизм

Буспирон подвергается окислительному метаболизму в основном с участием изоферментов CYP3A4. Образуются различные гидроксилированные метаболиты. Основной метаболит (5-OH-буспирон) не активен. Деалкилированный метаболит (1-(2-пиримидинил)-пиперазин, 1-PP) активен. Его анксиолитическая активность в 4-5 раз ниже, чем у исходного вещества, но его уровень в плазме крови выше и $T_{1/2}$ приблизительно в 2 раза продолжительнее, чем у буспирона.

Выведение

После однократного введения ^{14}C-меченого буспирона 29-63% радиоактивности выделяется с мочой в течение 24 ч, в основном в форме метаболитов. Примерно 18-38 % введенной дозы выводится с калом. После однократного приема в дозе 10-40 мг $T_{1/2}$ исходного вещества составляет примерно 2-3 ч, а $T_{1/2}$ активного метаболита равен 4.8 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При нарушении функции печени возможны повышение концентрации буспирона в плазме и значения AUC, а также удлинение $T_{1/2}$. В связи с выделением неизмененного вещества в желчь, возможен второй пик концентрации буспирона в плазме крови. Пациентам с циррозом печени следует назначать препарат в более низких дозах или в тех же дозах с удлиненными интервалами.

При почечной недостаточности клиренс буспирона может снижаться на 50%. При почечной недостаточности буспирон следует назначать с осторожностью и в сниженных дозах.

Фармакокинетика буспирона у пациентов пожилого возраста не изменена.

Показания к применению:

— генерализованное тревожное расстройство (ГТР);

— паническое расстройство;

— синдром вегетативной дисфункции;

— алкогольный абстинентный синдром (в качестве вспомогательной терапии);

— вспомогательная терапия депрессивных расстройств (препарат не назначается для монотерапии депрессии).

Относится к болезням:

- Абстинентный синдром
- Депрессивное расстройство
- Депрессия
- Паническое расстройство
- Тревожное расстройство

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— почечная недостаточность тяжелой степени (СКФ < 10 мл/мин);

— тяжелая печеночная недостаточность (протромбиновое время > более 18 сек);

— глаукома;

— миастения;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (безопасность и эффективность буспирона для этой возрастной группы не доказаны);

— одновременное применение ингибиторов МАО или 14-дневный период после отмены необратимого ингибитора МАО или 1 день после отмены обратимого ингибитора МАО;

— период лактации (грудного вскармливания);

— беременность или подозрение на беременность.

С осторожностью: цирроз печени, почечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Препарат следует принимать всегда в одно и то же время дня, до или после еды, чтобы избежать значительных колебаний концентрации активного вещества в плазме крови на протяжении суток.

Препарат нельзя принимать эпизодически для лечения тревоги, поскольку терапевтический эффект препарата Спитомин развивается только после многократного приема и проявляется не ранее чем через 7-14 дней лечения.

Дозу следует подбирать индивидуально.

Рекомендуемая доза - 15 мг, ее можно повышать по 5 мг/сут каждые 2-3 дня. Суточную дозу следует разделить на 2-3 приема. Обычная суточная доза составляет 20-30 мг. Максимальная разовая доза составляет 30 мг. Максимальная суточная доза - 60 мг.

У **пациентов пожилого возраста** коррекция дозы не требует, т.к. фармакокинетика буспирона не зависит от возраста.

При **нарушении функции почек** препарат следует применять с осторожностью и в сниженных дозах.

При **нарушении функции печени** препарат следует применять с осторожностью и в сниженных дозах, с этой целью

уменьшают разовые дозы или увеличивают интервал между приемами.

Побочное действие:

Буспирон обычно хорошо переносится. Побочные эффекты, если они наблюдаются, обычно возникают в начале курса лечения и затем исчезают, несмотря на продолжение приема препарата. В некоторых случаях необходимо снижение дозы.

Определение частоты побочных эффектов: часто (1/100), нечасто (от 1/100 до 1/1000), редко (< 1/1000). Во многих случаях при отсутствии препарата сравнения связь нежелательных эффектов с приемом препарата не могла быть доказана.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - боль в груди; нечасто - обморок, артериальная гипотензия, артериальная гипертензия; редко - нарушения мозгового кровообращения, декомпенсация сердечной недостаточности, инфаркт миокарда, миокардиопатия, брадикардия.

Со стороны нервной системы: часто - головокружение, головная боль, повышенная нервная возбудимость, нарушения сна; нечасто - дисфорические реакции, деперсонализация, дисфория, повышенная чувствительность к шуму, эйфория, гиперкинезы, страх, апатия, галлюцинации, спутанность сознания, удлинение времени реакции, суицидальные мысли, эпилептические припадки, парестезии, нарушение координации движений, тремор; редко - клаустрофобия, непереносимость холода, ступор, заикание, экстрапирамидные расстройства, психотические расстройства.

Со стороны органов чувств: часто - шум в ушах; нечасто - нечеткость зрения, зуд в глазах, покраснение глаз, конъюнктивит, нарушение вкусовых и обонятельных ощущений; редко - нарушения внутреннего уха, боль в глазах, фотофобия, повышение внутриглазного давления.

Со стороны дыхательной системы: часто - ларингит, отек слизистой носа; нечасто - гипервентиляция, нехватка воздуха, ощущение тяжести в груди; редко - носовое кровотечение.

Со стороны эндокринной системы: редко - галактorея, поражение щитовидной железы.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - тошнота, метеоризм, анорексия, повышение аппетита, слюнотечение, кишечное кровотечение; редко - диарея, жжение в языке.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - дизурия (в т.ч. учащенное мочеиспускание, задержка мочеиспускания); редко - ночное недержание мочи.

Со стороны половой системы: нечасто - нарушения менструального цикла, снижение полового влечения; редко - аменорея, воспаление тазовых органов, задержка эякуляции, импотенция.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - мышечные спазмы, ригидность мышц, артралгия; редко - мышечная слабость, боль в мышцах и костях.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - отек, зуд, приливы, выпадение волос, сухость кожи, отек лица, ранимость кожи, сыпь.

Изменения лабораторных показателей: нечасто - повышение активности АЛТ и АСТ в сыворотке; редко - эозинофилия, лейкопения, тромбоцитопения.

Прочие: увеличение массы тела, лихорадка, снижение массы тела; редко - злоупотребление алкоголем, потеря голоса, шум в ушах, икота.

Передозировка:

Симптомы: желудочно-кишечные нарушения, тошнота, рвота, головокружение и сонливость (также при тяжелых формах), угнетение сознания различной степени тяжести.

Лечение: промывание желудка и симптоматическая терапия. Специфический антидот не известен, диализ неэффективен. Имеющийся к настоящему времени опыт свидетельствует о том, что даже крайне высокие дозы (однократный прием внутрь 375 мг) не обязательно вызывает тяжелые симптомы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Ввиду отсутствия надлежащим образом контролируемых данных клинических исследований, применение буспирона при беременности возможно только в том случае, когда ожидаемая польза терапии для матери оправдывает возможный риск для плода.

Женщинам детородного возраста во время курса лечения буспироном следует применять адекватные методы контрацепции, поскольку безопасность буспирона при беременности не доказана.

Буспирон выделяется с грудным молоком. Данных клинических исследований применения буспирона в период грудного вскармливания недостаточно, поэтому не следует назначать препарат кормящим матерям.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Учитывая фармакокинетические свойства препарата (низкая биодоступность, интенсивный метаболизм в печени, высокое связывание с белками), имеется высокая вероятность взаимодействия буспирона с лекарственными средствами при одновременном применении. Однако поскольку буспирон имеет значительную терапевтическую широту, фармакокинетические взаимодействия не приводят к клинически существенным фармакодинамическим изменениям.

Ингибиторы МАО: описано повышение АД и возникновение гипертонических кризов после одновременного введения буспирона и препаратов, действующих на МАО (моклобемид, селегилин); в связи с этим буспирон нельзя сочетать с ингибиторами МАО. После отмены необратимого ингибитора МАО (например, селегилина) до начала введения препарата Спитомин (и наоборот) должно пройти не менее 14 недель. Аналогичным образом, должно пройти не менее 14 дней после отмены препарата Спитомин до начала введения моклобемида (обратимый ингибитор МАО). Однако Спитомин можно принимать через 1 день после отмены моклобемида.

Ингибиторы и индукторы CYP3A4: исследования in vitro показали, что буспирон в основном метаболизируется изоферментами CYP3A4. Одновременное введение буспирона и ингибиторов CYP3A4 (эритромицина, итраконазола, нефазодона, дилтиазема, верапамила и грейпфрутового сока) может привести к лекарственному взаимодействию, а при введении сильного ингибитора также повысить концентрацию буспирона в плазме крови; поэтому необходимо снижение дозы буспирона (например, до 2.5 мг 2 раза/сут). Сильные индукторы CYP3A4 (например, рифампицин) могут значительно уменьшить концентрацию буспирона в плазме крови и ослабить его фармакодинамические эффекты.

Препараты с высокой степенью связывания с белками: поскольку буспирон в высокой степени связывается с белками плазмы (95%), постоянно существует вероятность взаимодействия с другими активными веществами, характеризующимися высоким связыванием с белками плазмы. Исследования in vitro показали, что буспирон не способен вытеснять из мест связывания с белками препараты, характеризующиеся сильным связыванием (варфарин, фенитоин, пропранолол), но может замещать препараты с низким связыванием, например, дигоксин.

При совместном применении *циметидина* и буспирона C_{max} буспирона возрастает на 40%, а его AUC не изменяется. Совместное введение этих препаратов требует тщательного медицинского наблюдения.

При совместном применении *диазепама* и буспирона концентрация нордиазепама несколько повышается, и могут возникать побочные эффекты: системное головокружение, головная боль, тошнота.

Вещества, угнетающие ЦНС, и алкоголь: при совместном применении буспирона с триазоламом или флуразепамом не увеличивается длительность или силу эффекта этих бензодиазепинов. После однократной дозы 20 мг буспирона его эффекты на ЦНС не усиливаются. Опыт совместного применения буспирона и других анксиолитиков или других средств, действующих на ЦНС (например, нейролептиков и антидепрессантов), недостаточен. Поэтому в таких случаях необходимо тщательное медицинское наблюдение.

Другие лекарственные средства: из-за недостаточности соответствующих клинических данных совместное применение буспирона с антигипертензивными препаратами, сердечными гликозидами, пероральными контрацептивами и гипогликемическими средствами возможно лишь в условиях тщательного медицинского наблюдения.

Особые указания и меры предосторожности:

Буспирон подвергается интенсивному метаболизму в печени. При однократном приеме в дозе 30 мг у пациентов с циррозом печени повышается концентрация буспирона в плазме крови и увеличивается AUC с удлинением $T_{1/2}$ препарата. В связи с выделением неизмененного вещества в желчь, возможен второй пик концентрации буспирона в плазме крови. Препарат противопоказан больным с тяжелой печеночной недостаточностью. Пациентам с циррозом печени следует назначать препарат в более низких дозах или в тех же дозах с удлиненными интервалами.

При почечной недостаточности средней или тяжелой степени клиренс буспирона может снижаться на 50%. Препарат противопоказан пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени при СКФ менее 10 мл/мин. При легкой (СКФ более 30 мл/мин) и умеренной (СКФ 10-30 мл/мин) почечной недостаточности буспирон давать можно, однако при этом следует соблюдать осторожность и препарат в уменьшенных дозах.

У пациентов пожилого возраста коррекция дозы не требуется, однако препарат следует применять с осторожностью, например, в связи с возможным снижением функции почек и/или печени и повышенной вероятности возникновения побочных эффектов. Данным пациентам препарат следует назначать в минимальных эффективных дозах, а в случае

повышения дозы следует устанавливать тщательное наблюдение за пациентом.

С особой осторожностью следует применять препарат у пациентов с закрытоугольной глаукомой и миастенией.

Пациентам следует рекомендовать не употреблять в пищу грейпфруты и не пить грейпфрутовый сок в значительных количествах, т.к. эти продукты могут повысить концентрацию буспирона в плазме крови и привести к увеличению частоты или тяжести побочных эффектов.

Перевод пациентов с бензодиазепинов на буспирон: буспирон не может устранить симптомы отмены бензодиазепинов. Если пациента переводят на буспирон после длительной бензодиазепиновой терапии, буспирон следует давать только после завершения периода постепенного снижения дозы бензодиазепинов.

Буспирон не вызывает пристрастия к препарату, однако его введение пациентам с установленной или подозреваемой предрасположенностью к лекарственной зависимости требует тщательного медицинского контроля.

Поскольку анксиолитический эффект проявляется после 7-14 дней приема препарата, а полный терапевтический эффект развивается примерно за 4 недели, пациенты с сильной тревогой нуждаются в тщательном медицинском наблюдении в начальном периоде терапии.

На протяжении всего курса лечения буспироном пациентам следует избегать употребления алкоголя.

В случае непереносимости лактозы при составлении диеты следует учитывать содержание лактозы в таблетках (55.7 мг в таблетках по 5 мг и 111.4 мг в таблетках по 10 мг).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Результаты клинических исследований показали, что монотерапия буспироном не влияет на показатели психомоторной деятельности пациентов. Несмотря на это, в начале курса лечения возможны преходящие нежелательные эффекты, в связи с чем пациентов следует предупреждать о том, что вождение транспортных средств и управление механизмами возможно только при полной уверенности пациента в своих психомоторных функциях. Способность пациента управлять транспортными средствами и механизмами следует определять индивидуально в зависимости от реакции пациента на лечение и применения сопутствующей терапии.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: почечная недостаточность тяжелой степени (СКФ < 10 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказание: тяжелая печеночная недостаточность (протромбиновое время > более 18 сек).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Spitomin