

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
Буспірон ГЕКСАЛ
(Buspiron HEXAL)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: buspiron; (8-/4-/4-/2-піримідиніл/-1-піперазинілбутил/-8-азаспіро/4,5/декан-7,9-діону гідрохлорид);

основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми, з опуклою поверхнею на одному боці таблетки, з рискою та плоскою поверхнею, скошеною до середини таблетки (до розподільчої риски) – на іншому, білого кольору; на поверхні таблетки допускається мармуровість;

склад: 1 таблетка містить буспірону гідрохлориду 5 мг або 10 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний, кальцію гідрофосфат дигідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, натрію крохмальгліколят (тип А), целюлоза мікрокристалічна, магнію стеарат.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що впливають на нервову систему. Анксиолітики. Код АТС N05B E01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Буспірон анксиолітичний лікарський засіб, усуває психічні та вегетативні симптоми страху. Механізм дії до кінця не встановлений, однак відомо, що буспірон має інший механізм дії, ніж бензодіазепіни та інші анксиолітичні засоби. Виявляє спорідненість до серотонінових рецепторів 5HT_{1A} і помірну до D₂ в головному мозку. У серії доклінічних досліджень на експериментальних моделях була встановлена наявність у буспірону властивостей, типових для анксиолітиків та антидепресантів.

Не виявляє протисудомної та міорелаксуючої дії, не спричиняє звикання. Після припинення застосування буспірон не спричиняє симптомів відміни або швидкого рецидиву симптомів тривоги.

Фармакокінетика. Після перорального застосування буспірон швидко і повністю абсорбується зі шлунково-кишкового тракту, але оскільки він піддається інтенсивному метаболізму (I фаза), то його системна доступність становить 4%.

Максимальна концентрація препарату в плазмі досягається через 60 - 80 хв. У межах рекомендованих доз для буспірону характерна лінійна фармакокінетика.

Період напіввиведення з плазми дорівнює 2 - 3 год. Понад 95% активної субстанції зв'язується з білками плазми. При безперервному прийманні фармакологічні параметри препарату не змінюються (при цьому кумуляція відсутня). Їх відхилення у здорових осіб похилого віку не були виявлені.

Основним фармакологічно активним метаболітом буспірону у тестованих видів тварин і людини є 1-2-піримідиніл -піперазин (1-PP). Після перорального застосування буспірону максимальна концентрація метаболіту препарату в плазмі досягається також через 60 - 90 хв. Проте величина цієї концентрації перевищує у 7 - 8 разів таку для буспірону.

Період напіввиведення з плазми 1-PP подовжується приблизно на 6 год порівняно з буспіроном. Після введення повторних терапевтичних доз буспірону було знайдено 13-кратне перевищення експозиції з 1-PP порівняно з батьківською сполукою.

Показання для застосування. Симптоматичне лікування тривожних станів різного походження, особливо неврози, що супроводжуються відчуттям тривоги, небезпеки, неспокою, напруженням, погіршенням сну, роздратованістю, а також соматичними порушеннями.

Спосіб застосування та дози. Режим дозування залежить від індивідуального стану здоров'я пацієнта на початковому рівні.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Пацієнтам від 18 років рекомендується такий режим дозування.

На початку терапії призначають по 5 мг буспірону гідрохлориду (що відповідає 1 таблетці Буспірону ГЕКСАЛ по 5 мг або ½ таблетки Буспірону ГЕКСАЛ по 10 мг) 3 рази на добу.

Для досягнення максимального терапевтичного ефекту добову дозу підвищують на 5 мг з інтервалом у 2 - 3 дні. Оптимальна добова доза зазвичай становить 20 – 30 мг буспірону гідрохлориду (що відповідає 4 - 6 таблеткам Буспірону ГЕКСАЛ по 5 мг або 2 - 3 таблеткам Буспірону ГЕКСАЛ по 10 мг), розподілених на декілька однократних денних доз.

Максимальна одноразова доза не повинна перевищувати 30 мг (6 таблеток Буспірону ГЕКСАЛ по 5 мг або 3 таблетки Буспірону ГЕКСАЛ по 10 мг); добова – 60 мг буспірону гідрохлориду (12 таблеток Буспірону ГЕКСАЛ по 5 мг або 6 таблеток Буспірону ГЕКСАЛ по 10 мг).

Таблетки слід приймати не розжовуючи, запиваючи невеликою кількістю рідини, після їди або незалежно від її прийому.

Тривалість лікування – не більше 4 місяців.

Побічна дія. Найчастішими проявами побічної дії препарату є сонливість, нудота, головний біль, нервозність, запаморочення і збудження (роздратування).

Крім того, в поодиноких випадках спостерігались такі побічні ефекти.

Дихальна система: надмірне тахіпное (прискорене дихання без його поглиблення).

Органи зору: помутніння зору, свербіж очей, кон'юнктивіт, відчуття тиску на очі.

Кров: еозинofilія, лейкопенія, тромбоцитопенія.

Сечостатева система: дисменорея, порушення сечовипускання, зниження або збільшення лібідю, аменорея, енурез, порушення еякуляції.

Вуха, горло, ніс: шум у вухах, фарингіт, закладеність носа, носова кровотеча.

Шкіра: екзема, набряк, кропив'янка, гіперемія, діатез з гематомою, алопеція, алергічні реакції, акне.

Серцево-судинна система: неспецифічна пекторальгія, непритомність, гіпотензія або гіпертензія, порушення мозкового кровообігу, серцева недостатність, кардіоміопатія, брадикардія.

Ендокринна система: гінекомастія, порушення функції щитовидної залози.

Печінка: збільшені значення печінкових тестів.

М'язова система: міалгія, міоспазм, артралгія, міастенія.

Нервова система: парестезія, порушення координації, тремор, тривожні сновидіння, ворожість, сплутаність свідомості, довільні рухи, зниження часу реакції, психоз, патологічно підвищене сприйняття звичайних звуків, гіперкінезія, втрата інтересу, втома, порушення асоціації, суїцидальні думки, різка зміна настрою, клаустрофобія, ступор, нечленороздільна мова, психоз.

Шлунково-кишковий тракт: метеоризм, відсутність апетиту, подразнення товстої кишки.

Протипоказання. Підвищена чутливість до буспірону або до одного з інгредієнтів; гостра застійна глаукома; зловякісна міастенія; тяжка дисфункція печінки; тяжка ниркова недостатність; епілепсія; лактація; діти і підлітки до 18 років.

Передозування.

Симптоми: нудота, блювання, запаморочення, втома, міоз (звуження зіниці) і порушення функції шлунково-кишкового тракту. Більш тяжкі ускладнення у людини не спостерігалися, навіть при введенні щоденних доз до 2 400 мг.

Лікування: симптоматичне; промивання шлунка. Як і у випадку передозування іншими лікарськими засобами, необхідно здійснювати постійне спостереження за функціями дихальної системи, пульсу й артеріального тиску. Специфічний антидот – відсутній.

Особливості застосування. Не при всіх станах тривоги потрібне лікування. Вони можуть також являти собою ускладнення соматичних або психічних захворювань, що потребують терапії основного захворювання.

Буспірон ГЕКСАЛ не призначений для лікування симптомів абстиненції, зумовлених застосуванням

бензодіазепінів; з цієї причини до початку лікування буспіроном слід поступово припинити застосування анксиолітичних лікарських засобів і лише після цього переходити до терапії препаратом Буспірон ГЕКСАЛ .

Вагітність і лактація.

Оскільки досвід застосування буспірону в період вагітності відсутній, призначати препарат в цей період можна тільки за наявності точного діагнозу та абсолютних показань для його застосування. В експерименті на тваринах тератогенна дія препарату встановлена не була. Годування груддю під час лікування слід припинити.

Вплив на керування автотранспортними засобами або іншими складними механізмами.

Буспірон може впливати на пильність і концентрацію уваги, особливо на початку лікування. Тому цей факт необхідно враховувати пацієнтам, які займаються потенційно небезпечними видами діяльності, що вимагають підвищеної уваги та швидкості психомоторних реакцій – таких як керування автомобілем або іншими складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. В експериментах, проведених на тваринах, взаємодія з алкоголем встановлена не була, проте, одночасне застосування буспірону та алкоголю повинно бути виключено.

Не слід призначати буспірон з інгібіторами MAO через підвищений ризик розвитку артеріального тиску.

Буспірон підвищує концентрацію галоперидолу в сироватці крові.

При одночасному застосуванні з тразодоном у 3 - 6 разів підвищується рівень АлАТ.

Умови та термін зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 С. Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 2 блістери (2 10) у картонній коробці.

Виробник. “Салютас Фарма ГмбХ”, підприємство компанії “Гексал АГ”, Німеччина.

Адреса. HEXAL AG, Industriestrasse 25, D-83607 Holzkirchen, Germany.