

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

BUSPİR 5 mg tablet

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Her bir tablet;

Etkin madde:

Buspiron HCl 5 mg

Yardımcı maddeler:

Laktoz 55.7 mg

Sodyum nişasta glikolat 8.0 mg

Yardımcı maddeler için 6.1'e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Tablet

Beyaz renkli, düz bombeli yuvarlak tablet

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1 Terapötik endikasyonlar

BUSPİR, genelize anksiyetenin semptomatik tedavisinde kullanılır.

4.2 Pozoloji ve uygulama şekli

Pozoloji/uygulama sıklığı ve süresi:

Tedaviye günde 2-3 defa 5 mg buspiron verilerek başlanır. Optimum doz günde 15-30 mg (bölünmüş dozlar halinde) arasında değişir. Maksimum günlük doz 45 mg'ı geçmemelidir. Renal veya hepatik bozuklukda doz azaltılmalıdır.

Uygulama şekli:

BUSPİR tablet oral uygulama içindir.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Böbrek/Karaciğer yetmezliği:

Renal veya hepatik bozuklukda doz azaltılmalıdır.

Pediyatrik popülasyon: 18 yaşından küçüklerde kullanılmamalıdır.

Geriatrik popülasyon: Yetişkinlerdeki gibidir

4.3 Kontrendikasyonlar

Karaciğer ve böbrek fonksiyon bozuklukları (kreatinin klirensinin 20 ml/dk veya altında olması veya plazma kreatinin düzeyinin 200 µmol/l'ün üzerinde olması), durgunluk halleri,

buspiron veya içindeki komponentlere aşırı duyarlılığı olan kişilerde, akut dar açılı glokom, miyastenia gravis, epilepsi ve hamilelikte kullanılmamalıdır.

4.4 Özel kullanım uyarıları ve önlemleri

Günlük yaşamın streslerine bağlı anksiyete ve gerilim herhangi bir anksiyolitik kullanımı gerektirmez.

Bugüne kadar buspironun kullanımı ile ilgili deneyim sınırlı olduğundan ve uzun süreli kullanımının güvenlik ve etkinliği, yüksek doz toksisitesi, çocuk ve yaşlılarda kullanımı ile ilgili literatür mevcut olmadığından, maddenin kullanımına yön verebilecek bilgiler kesinlik kazanana kadar yan etkiler bölümünde belirtilen hususlar dikkatle göz önünde bulundurulmalıdır.

Hastanın izlenmesi: Plazma düzeylerinin tayin edilmesine gerek yoktur. Buspiron doğrusal olmayan farmakokinetik özellikler göstermektedir. Dozajın artırılması, plazma konsantrasyonunu, verilen dozla orantısız bir biçimde arttırabilmektedir. Bu nedenle dozajın 2 veya 3 günde bir 5 mg' dan fazla olmayacak biçimde arttırılması gerekmektedir. Hasta yan etkiler (örn: sedasyon, disfori, baş dönmesi, gastrointestinal şikayetler v.b) açısından dikkatle izlenmelidir.

MAO inhibitörleri ile birlikte kullanımı hipertansif reaksiyonlara neden olabileceğinden birlikte kullanımları önerilmez.

Buspiron diğer anksiyolitiklere kıyasla düşük oranda sedasyona yol açar.

Buspiron ile benzodiazepinler ve sedatif/hipnotik ilaçlar arasında çapraz tolerans olmadığından, Buspiron bu ilaçların aniden kesilmesi ile ortaya çıkabilecek kesilme reaksiyonlarını önlemez. Bu nedenle bu tür ilaçlar aniden kesilmemeli, doz giderek azaltılarak tedaviye son verilmeli, bunu takiben buspirona başlanmalıdır.

Buspiron karaciğerde metabolize edilip, böbreklerden atıldığından, ağır böbrek ve karaciğer bozukluklarında kullanılması tavsiye edilmez.

BUSPİR laktoz içermektedir. Nadir kalıtsal galaktoz intoleransı, Lapp laktaz yetmezliği ya da glikoz-galaktoz malabsorpsiyon problemi olan hastaların bu ilacı kullanmamaları gerekir.

BUSPİR her dozunda 1 mmol (23 mg)'dan daha az sodyum ihtiva eder; Dozu nedeniyle bir uyarı gerekmemektedir.

Alkol kullanımından kaçınılmalıdır.

4.5 Diğer tıbbi ürünler ile etkileşimler ve diğer etkileşim şekilleri

Kan basıncında artma görülebileceğinden MAO inhibitörleriyle (fenelzin ve tranilsipramin) birlikte kullanılmamalıdır.

İn vitro çalışmalar buspironun varfarin, fenitoin veya propranololün plazma proteinlerindeki yerlerini değiştirmediğini göstermiştir.

Amitriptilin ile etkileşim görülmemiştir. Diazepamın metabolitlerinde hafif yükselme gözlenmiştir. Buspiron sitokrom CYP3A4 enzim sistemi ile (in vitro) metabolize olur. Bu izoenzim ile inhibe olan eritromisin, itakonazol, nefazodon, greyfurt suyu, diltiazem ve verapamil ile buspiron arasında da etkileşim gözlenmiştir. Bu tip potent CYP3A4 inhibitör ilaçlarla kullanıldığında buspiron dozu düşürülmelidir. CYP3A4 indükleyicisi olan rifampisin ile birlikte kullanıldığında buspironun plazma konsantrasyonları ve farmakodinamik etkilerinde azalma görülmüştür.

Baklofen, lofeksidin, nabilon, antihistaminikler, sedatif etkiyi artırabilir. Trazodon ile beraber kullanıldığında SGPT’de artma gözlenmiştir. Haloperidol ile birlikte kullanıldığında serum haloperidol konsantrasyonlarında artış olmaktadır. Buspiron, digoksin gibi kan proteinlerine zayıf olarak bağlanan ilaçların yerlerine bağlanarak onları serbest hale geçirebilir. Her ne kadar alkol ile etkileştiğini gösterir herhangi bir bulgu mevcut değilse de, bir arada kullanmaktan kaçınılmalıdır. Yüksek dozlarda plazma prolaktin düzeylerini arttırdığından teşhis amacıyla yapılacak testlerde bu durum göz önüne alınmalıdır. Serotonejerik ilaçlarla kombinasyonunda dikkatli olunmalıdır: (MAOI’ler, L-triptofan, triptanlar, tramadol, linezolid, SSRI’ler, lityum ve St. John’s Wort (sarı kantaron). SSRI’larla tedavide serotonin sendromundan kuşku kullanıldığında buspiron derhal kesilmeli ve destekleyici semptomatik tedaviye başlanmalıdır.

4.6 Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik kategorisi: B

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar/Doğum Kontrolü (Kontrasepsiyon)

Buspiron hidroklorür için gebeliklerde maruz kalmaya ilişkin veri mevcut değildir. Hayvanlar üzerinde yapılan çalışmalar, gebelik / embriyonal / fetal gelişim / doğum ya da doğum sonrası gelişim ile ilgili olarak doğrudan ya da dolaylı zararlı etkiler olduğunu göstermemektedir. (Bkz. Kısım 5.3) Gebe kadınlara verilirken dikkatli olunmalıdır.

Gebelik dönemi:

Hamile kadınlarda yapılmış yeterli ve kontrollü çalışmalar mevcut olmadığından doktor tarafından zorunlu görülmedikçe gebelikte (özellikle ilk trimesterde) kullanımından kaçınılmalıdır.

Laktasyon dönemi:

Anne sütüne ne ölçüde geçtiği bilinmemektedir. Ancak sıçanlarda buspironun ve metabolitinin süte geçtiği görülmüştür. Bu nedenle emzirenlerde bu özelliği göz önünde bulundurulmalıdır. Zorunlu görülmedikçe emzirme döneminde verilmemelidir.

Üreme yeteneği/Fertilite

Yapılan hayvan çalışmalarında üreme yeteneği üzerine herhangi bir etkisi görülmemiştir.

4.7 Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

Erken dönemde geçici advers etkiler görülebileceğinden hasta ilacın advers etkilerinden etkilenmediği döneme kadar dikkat gerektiren araç ve makine kullanımından kaçınılmalıdır.

4.8 İstenmeyen etkiler

Buspiron genellikle iyi tolere edilir. Yan etkiler çoğunlukla tedavinin başlangıcında görülür ve devamlı kullanım ve/veya dozun düşürülmesi ile yan etkiler azaltılabilir.

Buspiron tedavisinde plaseboya kıyasla en sık rastlanılan yan etkiler:

Santral Sinir Sistemi: Sersemlik, baş dönmesi, EPS, serotonin sendromu, baş ağrısı, heyecan, sinirlilik, hafiflik hissi.

Dermatolojik: Döküntü.

Gastrointestinal Sistem: Diyare, mide bulantısı.

Nöromüsküler Sistem: Kaslarda zayıflık, uyuşma, koordinasyon eksikliği.

Özel Duyular: Bulanık görme.

Bunun yanında taşikardi, palpitasyon, göğüs ağrısı, rahavet hissi, konfüzyon, nöbet, ağız kuruluğu, yorgunluk ve terleme nadir olarak bildirilen yan etkilerdir.

Kulak çınlaması, nazal konjesyon, boğaz ağrısı görülme sıklığı bilinmeyen yan etkilerdir.

Şüpheli advers reaksiyonların raporlanması:

Ruhsatlandırma sonrası şüpheli ilaç advers reaksiyonlarının raporlanması büyük önem taşımaktadır. Raporlama yapılması, ilacın yarar/risk dengesinin sürekli olarak izlenmesine olanak sağlar. Sağlık mesleği mensuplarının herhangi bir şüpheli advers reaksiyonu Türkiye Farmakovijilans Merkezi (TÜFAM)'ne bildirmeleri gerekmektedir. (www.titck.gov.tr; e-posta: tufam@titck.gov.tr ; tel: 0 800 314 00 08; faks: 0 312 218 35 99)

4.9 Doz aşımı ve tedavisi

Özellikler:

Belirtileri mide bulantısı, kusma, baş ağrısı, baş dönmesi, uyuşukluk, kulak çınlaması ve huzursuzluk. Hafif bradikardi ve hipotansiyon bildirilmiştir. Ekstrapiramidal belirtiler, terapötik dozlarda kullanımdan sonra bildirilmiştir. Nadiren konvülsiyonlar oluşabilir.

Yönetimi:

Tedavi semptomatik ve destekleyici olmalıdır. Gastrik dekontaminasyonun faydaları belirsizdir. Hasta 5 mg/kg'dan daha fazla buspirona maruz kalmış, üzerinden maksimum 1 saat zaman geçmiş hastada uykulu hal mevcut değil ise aktif kömür ile tedavi düşünülebilir.

5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER

5.1 Farmakodinamik özellikler

Farmakoterapötik grup: Anksiyolitikler

ATC kodu: N05BE01

Buspiron bir azaspirodekandion türevidir. Buspironun etki mekanizması tam açıklık kazanmamakla birlikte, benzodiazepinlerden tamamen değişik etki mekanizmasına ve kimyasal yapıya sahip bir anksiyolitiklerdir. Buspiron, 5-HT_{1A} reseptörlerinin parsiyel agonistidir ve anksiyolitik etkisinin bu şekilde oluştuğu düşünülmektedir. Buspironun benzodiazepin reseptörlerine afinitesi olmadığı ve GABA bağlanmasını etkilemediği gösterilmiştir. Benzodiazepinlerin antikonvülsif, sedasyon ve kas gevşetici etkilerine sahip değildir. Buspiron, serotonin ve asetilkolin aktivitesini düşürdüğü halde spesifik noradrenerjik ve dopaminerjik yolların aktivitesini artırır. Apomorfine oluşturulan stereotipiye bloke eder. Yüksek dozlarda prolaktin seviyesini artırır da, terapötik dozlarda bu etkiden yoksundur.

5.2 Farmakokinetik özellikler

Emilim:

Oral dozlardan sonra hızla absorbe olur ancak büyük ölçüde ilk geçiş metabolizmasına uğrar.

Dağılım:

Doruk plazma seviyelerine ilaç alındıktan 60-90 dakika sonra ulaşılır. Plazma konsantrasyonları dozla doğrusal ilişkilidir. Çoklu dozları takiben 2 gün içinde kararlı durum plazma konsantrasyonlarına ulaşılır. Buspiron proteinlere % 95 oranında bağlanır.

Biyotransformasyon:

Buspiron karaciğerde CYP3A4 enzimi ile metabolize olur. Metabolitleri 5-hidroksi buspiron ve 1-primidinil piperazindir. Sonuncu madde aktif metabolit olup ana bileşiğin aktivitesinin % 1-20'sine sahiptir. Ortalama plazma yarı ömrü 2-11 saat arasında değişmektedir.

Atılım:

% 0.1'i idrarla değişmeden atılır. Absorbe olan miktarın % 60-67'si idrarla kalanı feçes yoluyla atılır.

5.3 Klinik öncesi güvenlik verileri

Sıçan ve farelerde yapılan üreme çalışmalarında, buspironun insanlar için önerilen maksimum dozdan 30 kat daha yüksek dozda verilmesi ile fetüste herhangi bir hasara neden olmadığı ve fertilite bozukluğuna yol açmadığı görülmüştür.

Sıçanlarda yapılan 24 ay süreli bir çalışmada insanlar için önerilen maksimum dozdan 133 kat daha yüksek oranda veya farelerde 18 ay süreli bir çalışmada insanlar için önerilen maksimum dozdan 167 kez daha yüksek miktarda buspiron verilmesi ile karsinogenetik potansiyel ile ilgili bir bulguya rastlanmamıştır.

Yapılan çalışmalarda buspironun mutajen olmadığı görülmüştür.

6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

6.1 Yardımcı maddelerin listesi

Laktoz

Sodyum nişasta glikolat

Mikrokristal selüloz

Kolloidal silikon dioksit

Magnezyum stearat

6.2 Geçimsizlikler

Bilinen herhangi bir geçimsizliği bulunmamaktadır.

6.3 Raf ömrü

24 ay

6.4 Saklamaya yönelik özel tedbirler

30°C'nin altındaki oda sıcaklığında, nemsiz bir yerde ve ışıktan korunarak saklanmalıdır.

6.5 Ambalajın niteliği ve içeriği

25 ve 50 tablet içeren PVC/Al blister ve karton kutu ambalaj

6.6 Beşeri tıbbi üründen arta kalan maddelerin imhası ve diğer özel önlemler

Kullanılmamış olan ürünler ya da atık materyaller “Tıbbi Atıkların Kontrolü Yönetmeliği” ve “Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmelik”lerine uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

Adı : SANOVEL İLAÇ SAN. VE TİC. A.Ş.

Adresi: 34460 İstinye-İstanbul

Tel : (212) 362 18 00

Faks : (212) 362 17 38

8. RUHSAT NUMARASI

153/59

9. İLK RUHSAT TARİHİ/RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi: 09.10.1990

Ruhsat yenileme tarihi:

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ