# KISA ÜRÜN BİLGİSİ

## 1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

BUSPON 5 mg kapsül

## 2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Her bir kapsül;

**Etkin madde:**

Buspiron hidroklorür 5.0 mg

**Yardımcı madde(ler):**

Laktoz monohidrat 94 mg

Tartrazin (E102)

Diğer yardımcı maddeler için, 6.1' e bakınız.

## 3. FARMASÖTİK FORM

Kapsül,

Gövde beyaz renkli opak, kapak mavi renkli opak sert jelatin kapsüller içinde (no:3) homojen görünüşlü toz.

## 4. KLİNİK ÖZELLİKLER

### 4.1 Terapötik endikasyonlar

BUSPON jeneralize 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:**

BUSPON kapsül oral uygulama içindir.

**Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:**

**Böbrek/Karaciğer yetmezliği:**

Renal veya hepatik bozuklukda doz azaltılmalıdır.

**Pediyatrik popülasyon:**

18 yaşından küçüklerde kullanılmamalıdır.

**Geriyatrik popülasyon:**
Yetişkinlerdeki gibidir.

**4.3 Kontrendikasyonlar**
Karaciğer ve böbrek fonksiyon bozuklukları (kreatinin klirensinin 20 ml/dk'nın altında 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 güvenlilik 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 arttırılması, 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.
Aşağıdaki nadir kalıtımsal hastalıkları olanlar buspiron almamalıdır:
- Galaktoz intoleransı, Lapp laktoz yetmezliği ya da glikoz - galaktoz malabsorpsiyon

Formülünde tartrazin içerdiğinden alerjik reaksiyonlara neden olabilir.
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, itrakonazol, 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 kuşkulanıldığında 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/Fertitilte**

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 kaçınmalıdır.

**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, rehavet hissi, konfüzyon, nöbet, ağız kuruluğu, yorgunluk ve terleme nadir olarak bildirilen yan etkilerdir.

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

**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 anksiyolitiktir. 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 yolakların aktivitesini arttırır. Apomorfinle oluşturulan stereotipiyi bloke eder. Yüksek dozlarda prolaktin seviyesini arttırırsa 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 güvenlilik 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 karsinojenesitik potansiyel ile ilgili bir bulguya rastlanmamıştır.

Yapılan çalışmalarda buspironun mutajen olmadığı görülmüştür.

## 6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

**6.1 Yardımcı maddelerin listesi**

Nişasta

Magnezyum stearat

Titanyum dioksit (E171)

Eritrosin (E127)

İndigotin (E132)

Jelatin

**6.2 Geçimsizlikler**

Yoktur.

**6.3 Raf ömrü**

48 Ay

**6.4 Saklamaya yönelik özel uyarılar**

25 $^{o}$C'nin altındaki oda sıcaklığında saklayınız.

**6.5 Ambalajın niteliği ve içeriği**

Bir yüzü şeffaf PVC, diğer yüzü üzeri baskılı 25 kapsüllük blisterler.

Her karton kutu 25 veya 50 kapsül içermektedir.

**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 ve Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmelik"lerine uygun olarak imha edilmelidir.

**7. RUHSAT SAHİBİ**

Deva Holding A.Ş.

Halkalı Merkez Mah. Basın Ekspres Cad.

No:1 34303 Küçükçekmece-İSTANBUL

**Tel:** 0212 692 92 92

**Faks:** 0212 697 00 24

**8. RUHSAT NUMARASI**

143/71

**9. İLK RUHSAT TARİHİ/ RUHSAT YENİLEME TARİHİ**

İlk Ruhsatlandırma Tarihi: 05.01.1988

Son Yenileme Tarihi: 10.03.2004

**10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ**