

Relax[®]

Buspirona

COMPOSICION

Cada comprimido contiene:

Buspirona clorhidrato 5 mg y 10 mg, respectivamente

Excipientes, c.s.

PROPIEDADES

Es un nuevo ansiolítico que ha demostrado tener actividad psicotrópica ansioselectiva. En contraste con las benzodiacepinas, barbitúricos, fenotiazinas, u otros fármacos sedantes a ansiolíticos, alivia la ansiedad sin efectos relajantes musculares o compromiso de la agilidad mental; carece de acción hipnótica y antiépiléptica; asimismo, afecta pobremente a la actividad psicomotora y presenta un débil efecto sedante.

Parece que la mayor parte del efecto ansiolítico es debido a los mecanismos serotoninérgicos. No produce dependencia o abuso y no se ha reportado síndrome de abstinencia por la supresión del medicamento, por lo tanto, no es droga controlada.

En experimentos clínicos controlados no se presentó diferencia significativa en la incidencia de la sedación (somnia y/o fatiga), ni deterioro funcional (deterioro de la habilidad para conducir vehículos automotores) entre los pacientes que lo recibieron y los que recibieron placebo. En cambio, tanto el diazepam como el clorazepam y lorazepam, presentaron deterioro funcional considerable.

Tiene una alta afinidad por los receptores para serotonina, especialmente los 5-HT_{1A}, y una moderada afinidad por los receptores cerebrales D₂ para la dopamina. No posee afinidad por los receptores de las benzodiacepinas.

FARMACOCINETICA

En el hombre, se absorbe rápidamente en el tubo digestivo, y sufre un intenso metabolismo de primer grado. Alcanza niveles pico en el plasma entre los 60 y 90 minutos a partir de su ingestión. Estudios de dosis múltiples de hasta 28 días indican que las concentraciones de plasmas estables se logran en 2 días y que la concentración de plasma es proporcional a la dosis. Una vez alcanzada la estabilidad, la concentración de plasma no se altera de manera notoria por administración crónica.

En el hombre, aproximadamente el 95% de la sustancia está ligada al plasma proteico, sin embargo, otras drogas estrechamente conectadas a las proteínas plasmáticas (fenitoína, propranolol y warfarina) no son desplazadas por esta sustancia de estas proteínas in vitro. En concentraciones clínicas pertinentes, no desplaza a ninguno de estos agentes, sin embargo, sí desplaza a la digoxina de las proteínas plasmáticas. Es metabolizada fundamentalmente por oxidación, produciendo varios derivados hidroxilados y un metabolito farmacológicamente activo, 1-pirimidinilpiperazina (1-PP).

En modelos animales predecibles de potencial ansiolítico, 1-PP tiene alrededor de 25% o menos de su actividad. Luego de una dosis única, entre el 29 y 63% de la dosis es excretada en la orina dentro de las 24 horas siguientes, en forma de metabolitos y entre un 28-38% de la dosis por excreción fecal. Su eliminación reduce en pacientes con insuficiencia hepática así como en pacientes con insuficiencia renal. No se hallaron diferencias significativas en su farmacocinética en función de la edad y/o sexo y los descubrimientos clínicos no sugieren que un grupo, basado en la edad o sexo, fuese extraordinariamente riesgoso.

TOXICOLOGIA

Los estudios tanto preclínicos como clínicos realizados para evaluarlo han demostrado que éste fármaco tiene un amplio margen de seguridad, ya que la dosis letal media es por lo menos 100 veces superior a la dosis terapéutica.

INFORMACION CLINICA

INDICACIONES

Está indicado para el tratamiento a corto plazo de desórdenes ansiolíticos y el rápido alivio de los síntomas de ansiedad con o sin depresión pertinentes, en los estados de ansiedad generalizada como temblor, intranquilidad, nerviosismo, sudor, latidos violentos, manos húmedas, parestesias, ansiedad, preocupación, temor, hiperatención resultante de abstracción, dificultad de concentración, insomnio, irritabilidad, impaciencia.

Realiza su efecto ansiolítico disminuyendo la actividad de sistemas serotoninérgicos, permitiendo la actividad dopaminérgica y noradrenérgica.

CONTRAINDICACIONES

Está contraindicado en pacientes hipersensibles al mismo. Lesiones severas de hígado y riñones, problemas de glaucoma agudo de ángulo reducido o miastenia gravis.

EFFECTOS INDESEABLES

Generalmente es bien tolerado, pero podrían presentarse síntomas al inicio del tratamiento que generalmente desaparecen en el curso del mismo, con o sin reducciones en la dosificación. Estos incluyen: vértigo, aturdimiento, cefalea, náusea, debilidad, nerviosismo o excitación. Otros síntomas como: Dolor torácico, confusión o depresión mental, taquicardia, adormecimiento, hormigueo, debilidad en las manos o pies, dolor de garganta o fiebre, requieren la suspensión del tratamiento.

No ha demostrado tener capacidad de abuso o recreativa y no existen evidencias de que provoque tolerancia o dependencia física o psicológica.

Los signos de sobredosis pueden ser vértigo severo, somnolencia marcada, trastornos digestivos incluidos náuseas o vómitos severos y pupilas inusualmente pequeñas.

No se ha informado que la supresión abrupta del tratamiento cause síndrome de abstinencia o ansiedad de rebote, pero pueden presentarse síntomas como fatiga, insomnio, náuseas y cefalea.

PRECAUCIONES

No debe administrarse concomitantemente con inhibidores de la monoaminoxidasa (MAO).

En pacientes en tratamiento con digoxina, puede producir desplazamiento de la unión proteica.

Adminístrese con precaución en pacientes que reciben otras drogas psicotrópicas y que requieren ánimo vigilante.

No se han evaluado los efectos en pacientes con historia de desórdenes convulsivos.

Interferencias con la función cognitiva y motora: Los estudios indican que es menos sedante que otros ansiolíticos y que no produce disfunción considerable. Sin embargo, sus efectos sobre el SNC no son predecibles en todos los pacientes. Por consiguiente estos deberán ser advertidos sobre los riesgos de conducir automóvil u operar maquinaria compleja hasta cuando haya certeza de que el tratamiento no los afecta adversamente.

A pesar de que estudios formales de la interacción concomitante con alcohol indican que este no disminuye la disfunción producida por el alcohol en el desempeño mental y motor, es prudente evitar el uso concomitante de ellos.

Se deben observar las precauciones usuales en el tratamiento de pacientes con falla en la función renal y hepática (se metaboliza en el hígado y se elimina por la vía renal).

Aunque el riesgo de alteraciones extrapiramidales es mínimo, debe considerarse tal posibilidad en pacientes parkinsonianos tratados con dosis elevadas.

Debido a la ausencia de tolerancia cruzada entre esta sustancia, benzodiacepinas y otros fármacos hipnóticos y/o sedantes de uso clínico común, esta droga no es eficaz en el tratamiento de los síntomas de abstinencia observados comúnmente tras la interrupción del tratamiento con estos fármacos, sobre todo cuando éstos se administran en forma crónica. Antes de comenzar el tratamiento se recomienda a proceder a una interrupción gradual de la administración de los fármacos citados.

COMPRIMIDOS

ANSIOLITICO NO BENZODIACEPINICO

USO EN EMBARAZO, LACTANCIA Y EN GERIATRIA

En estudios teratogénicos con animales no se observaron efectos nocivos sobre la fertilidad o daño fetal. Sin embargo, en humanos no han sido evaluados estos efectos, por lo que su uso durante el embarazo puede ser iniciado o continuado únicamente si en la opinión del médico encargado, los beneficios pesan más que el riesgo potencial.

Se desconocen sus efectos en relación con el parto. No se observaron efectos adversos en los estudios de reproducción realizados en ratas.

En madres lactantes se desconoce su grado de excreción o sus metabolitos en la leche humana. Por consiguiente, deberá ser administrado en mujeres lactantes solamente luego de que el médico encargado haya determinado que los beneficios para la madre pesan más que el riesgo para el bebé lactante.

No ha sido evaluado sistemáticamente en pacientes ancianos. Sin embargo, no se han identificado efectos secundarios distintos de los habituales relacionados con la edad.

INTERACCIONES

Su administración conjunta con diazepam puede conducir a la aparición de dolores de cabeza, vértigo, náuseas y/o calambres musculares.

Puede aumentar los niveles plasmáticos del haloperidol. El uso concomitante con inhibidores de la monoaminoxidasa (MAO) presenta riesgo de episodios aislados de hipertensión.

SOBREDOSIS

En personas saludables la máxima dosis terapéutica tolerada es de 375 mg/día. A medida que se alcanzan esas dosis, también se observaron los siguientes síntomas: Náuseas, vómitos, vahídos, somnolencia, miosis y molestias gástricas. No se han reportado muertes en seres humanos con sobredosis deliberadas o accidentales. Los estudios toxicológicos mostraron una dosis letal media en animales, de 500 a 1000 veces superior a la dosis diaria en humanos.

Para el tratamiento de sobredosis se recomienda el empleo de un tratamiento sintomático y de sostén, junto con lavado gástrico inmediato. Deberá monitorearse la respiración, el pulso y la presión sanguínea, como en todos los casos de intoxicación medicamentosos. No se conoce antídoto específico, ni tampoco se ha determinado la utilidad de la diálisis.

ADVERTENCIAS

No se recomienda su administración a pacientes que estén tomando inhibidores de la monoaminoxidasa (MAO), ya que existe el riesgo de hipertensión.

No se han evaluado sus efectos en pacientes con historia de desórdenes convulsivos. Carece de propiedades anticonvulsivas en animales, por consiguiente, no se recomienda para pacientes con ataques de epilepsia.

Debido a que no se ha establecido actividad antiséptica, no debe utilizarse en lugar de tratamientos antisépticos apropiados.

USO Y DOSIS

La dosis inicial recomendable es de 15 mg al día (un comprimido de 5 mg 3 veces al día). Para lograr una respuesta terapéutica óptima, la dosis puede incrementarse 5 mg al día, cada 3-8 días, en los pacientes que lo requieran. La dosis máxima diaria no debe exceder de 60 mg al día. En la mayoría de los pacientes la respuesta óptima se obtiene con una dosis promedio diaria de 20 a 30 mg dividida en 2 ó 3 tomas al día (2 a 3 comprimidos de 10 mg 2 ó 3 veces al día), apreciándose su efecto ansiolítico máximo entre la segunda y la cuarta semana del tratamiento. Debe administrarse después de los alimentos. Para lograr su mayor beneficio terapéutico, se recomienda que el tratamiento sea prescrito por lo menos durante 3 ó 4 semanas. En caso de que el médico decida utilizarlo por períodos de tiempo largos, deberá periódicamente reevaluar la utilidad del medicamento en pacientes individuales.

VIA DE ADMINISTRACION

Oral.

Antes de consumir este o cualquier otro medicamento, debe siempre consultar a su médico.

En caso de un marcado efecto secundario, sea este por sobredosis o reacción particular, acuda inmediatamente a su médico.

INFORMACION FARMACEUTICA

DURACION DE ESTABILIDAD

Verificar fecha de vencimiento señalada en el envase.

PRECAUCIONES ESPECIALES PARA SU CONSERVACION

Conservar a una temperatura menor o igual a los 30°C.

PRESENTACION

Caja conteniendo 3 tirillas de 10 comprimidos.

NOTA IMPORTANTE

Este producto se encuentra envasado y protegido en una adecuada y rigurosa laminación, especialmente diseñada para evitar su exposición con la luz y humedad, descartando además que por descuidos involuntarios los niños puedan acceder al mismo.

NUMEROS DE REGISTRO SANITARIO

Comprimidos de 5 mg: 2010-0275

Comprimidos de 10 mg: 95-0090

Registro Industrial No. 14109

Venta bajo prescripción médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Fabricado por Ethical Pharmaceutical, S.R.L.

de República Dominicana.

Doc. No.: YDP184

Rev.: I

Aprob. por: Gte. Desarrollo de Productos / Gte. Mercadeo

Ethical

P100081