




СПІТОМІН®

життя без тривоги

буспірон

 Зменшення
симптомів тривоги

 Додаткова
антидепресивна дія

 Відсутність
залежності¹



¹Інструкція з медичного застосування.

Показання. Симптоматичне лікування тривожних станів з домінуючими симптомами: тривожність, внутрішній неспокій, стан напруження. **Фармакотерапевтична група.** Ансіолітики. **Фармакологічні властивості.** Механізм ансіолітичного ефекту буспірону відрізняється від механізму дії бензодіазепінів. Встановлено наявність у буспірону властивостей типових для ансіолітиків та антидепресантів. На відміну від бензодіазепінів, буспірон не викликає толерантності або залежності, а після завершення курсу лікування не розвиваються симптоми відміни. **Спосіб застосування та дози.** Дози ви-

значає лікар індивідуально для кожного пацієнта залежно від стану захворювання. На початку терапії призначати по 5 мг буспірону гідрохлориду 2–3 рази на добу. Для досягнення максимального терапевтичного ефекту добову дозу слід поступово підвищувати до 20–30 мг буспірону, розподілених на кілька окремих доз. Максимальна одноразова доза не повинна перевищувати 30 мг. Максимальна добова доза не повинна перевищувати 60 мг. Транквілізатори не можна застосовувати без контролю протягом тривалого часу. Якщо необхідне тривале застосування препарату (до 6 місяців), слід проводити ретельний медичний моніторинг. **Протипоказання.** Тяжкі захворювання печінки, тяжка

ниркова недостатність, епілесія, підвищена чутливість до буспірону або до інших компонентів препарату. **Побічні реакції.** Запаморочення, безсоння, головний біль, підвищена втомлюваність. Відпускається за рецептом лікаря. **Р.П.** № UA/5603/01/01, № UA/5603/01/02.

Виробник: ЗАТ Фармацевтичний завод ЕГІС, Угорщина.

Для отримання більш детальної інформації, будь ласка, ознайомтесь з інструкцією з медичного застосування препарату. Інформація для професійної діяльності лікарів та фармацевтів, а також для розповсюдження на конференціях, семінарах, симпозиумах з медичної практики.

Контакти представника виробника в Україні:

04119, Київ, вул. Дегтярівська, 27-Т. Тел.: +38 (044) 496 05 39, факс: +38 (044) 496 05 38



K. Garg, H. Tyagi, Велика Британія

Буспірон у нейропсихіатрії: огляд літератури

Вступ

- Буспірон є новим анксиолітичним препаратом із додатковим слабким антидепресивним і антипсихотичним ефектами (на українському фармацевтичному ринку представлений препаратом Спітомін® компанії «Egis»). Наразі це єдиний представник класу серотонінергічних анксиолітиків – азапіронів.
- Уперше буспірон був розроблений групою дослідників на чолі з Mead Johnson [1] у 1986 році як потенційний антипсихотичний засіб. Згодом було встановлено, що препарат зменшує агресію і не впливає на психотичні симптоми [2].
- Схвалений у 1986 році Управлінням з контролю за якістю продуктів харчування та лікарських засобів США (FDA) для застосування при генералізованому тривожному розладі.
- Відтоді буспірон застосовували переважно як анксиолітичний засіб, утім, останнім часом спектр показань до його призначення розширився, завдяки здебільшого його хорошему профілю безпеки та переносимості, а також нещодавно виявленим нейробиологічним ефектам [1, 3].
- Опубліковані дані щодо можливості ширшого використання буспірону залишаються поодинокими, а клінічні випробування часто є незначними та варіюють за якістю.
- Цей огляд надає клінічно орієнтовані та засновані на доказах підсумки застосування буспірону в нейропсихіатричних установах, вивчення фармакологічних властивостей, а також потенціалу його використання в нейрореабілітаційних установах як основного засобу лікування тривоги і потенційного препарату другої лінії для лікування хронічних нервово-психічних розладів.

Матеріали та методи

- Пошук літератури здійснювали в електронних бібліотеках MEDLINE та PubMed, опублікованих до квітня 2021 року. Як ключові слова використовували «буспірон» і «нейрореабілітація», «буспірон» і «травма головного мозку», «буспірон» і «інсульт», «буспірон» і «травма спинного мозку». Рецензувалися лише англійські тексти.

Фармакологічні властивості

- Буспірон – частковий агоніст постсинаптичних рецепторів серотоніну-1A (5HT_{1A}) в центральній нервовій системі та повний агоніст пресинаптичних рецепторів 5-HT_{1A} ядра шва, до яких він має високу спорідненість. Це спричиняє інгібування нейронів 5-HT і синтез 5-HT у цій ділянці [2].
- Також показано, що буспірон має слабку спорідненість з рецепторами 5HT₂, тому припускають, що підвищена серотонінергічна активність у мигдалині та провідних шляхах, залучених у формування відчуття страху і тривоги, зумовлює розвиток анксиолітичної дії [3].
- Додатково препарат чинить антагоністичну дію на пресинаптичні дофамінові рецептори D₂, D₃, D₄ і виявляє частковий агонізм до α₁-адренорецепторів [1].
- Максимальна рекомендована FDA доза буспірону становить 60 мг/день, але можна використовувати вищі дози за умови їх хорошої переносимості. Передозування буспіроном не спричиняє розвитку серйозних ускладнень, тому вважається безпечним [4].

Використання в психіатрії

- За результатами численних досліджень підтверджено, що ефективність буспірону в лікуванні генералізованого тривожного розладу наближається до ефективності бензодіазепінів. Препарат називають анксиоселективним у зв'язку з відсутністю седативної, психомоторних порушень, а також потенціалу розвитку звикання [5].
- Вплив буспірону на депресію не залежить від його протитривожної дії, що свідчить про доцільність призначення в пацієнтів зі змішаним профілем тривоги та депресії [2, 3].
- Дослідження STAR*D продемонструвало можливість використання буспірону як допоміжного засобу при стійкій депресії [6].
- Існує недостатньо доказів щодо ефективності буспірону за інших психічних розладів.

Література

Дискінезії

- Прийом високих доз буспірону, які використовували для лікування пізньої дискінезії, не призводили до погіршення проявів психозу [7].
- Буспірон запропоновано використовувати як потенційний терапевтичний варіант лікування індукованої леводопой дискінезії у разі хвороби Паркінсона [2]. Дослідження «гострого виклику» виявило покращення дискінезії на 20% протягом 3 днів [8].
- Переважно серотонінергічна іннервація мозочка викликала зацікавленість щодо застосування буспірону як потенційного засобу лікування спинно-мозочкових атакцій [2]. Дослідження показали хороший вплив буспірону на легку та помірну атаксію [9, 10].

Інсульт

- Тривога та депресія є поширеними наслідками інсульту, симптоми яких відчувають ≈20% пацієнтів [11].
- Дослідники виявили, що комбінована терапія циталопрамом і буспіроном була кращою, ніж монотерапія циталопрамом у лікуванні постінсультної депресії [12].
- У плацебо-контрольованому дослідженні за участю 72 пацієнтів після перенесеного інсульту буспірон був визнаний ефективним у лікуванні тривоги та депресії, а також покращив прогноз у хворих з інсультом [13].

Поведінка та пізнання

- Органічні нервово-психічні захворювання, в т. ч. черепно-мозкова травма і деменція, можуть також супроводжуватися симптомами збудження та агресії.
- Буспірон може бути кращим препаратом порівняно з іншими у зв'язку з відсутністю взаємодії з іншими препаратами, легкістю моніторингу лікування, відсутністю симптомів відміни, мінімальним впливом на когнітивні функції та седативний ефект [2].
- Доведено, що буспірон позитивно впливає на агресію. Відкриті випробування на людях показали переваги в боротьбі з агресією, пов'язаною з деменцією [14] та когнітивними порушеннями [15].
- Результати рандомізованого подвійного сліпого дослідження, проведеного в будинках для літніх, продемонстрували, що буспірон є зіставним із галоперидолом у зниженні агресії, забезпечує краще пригнічення тривоги та має сприятливий профіль переносимості [16].
- Деякі дані свідчать про те, що буспірон у поєднанні з мелатоніном має потенціал для лікування великого депресивного розладу, стимулює нейрогенез і покращує когнітивні результати [17].

Висновки

- Буспірон має унікальні властивості серед доступних на сьогодні психотропних фармакологічних препаратів, а також низку потенційних терапевтичних застосувань, що охоплюють широкий спектр неврологічних, психіатричних і поведінкових порушень, характеризується сприятливим профілем безпеки.
- Завдяки впливу на моторну функцію буспірон відкриває перспективні можливості його використання для послаблення дискінезії при хворобі Паркінсона й атаксії.
- Буспірон можна вважати обґрунтованим варіантом контролю дратівливості, збудження та агресії.
- Потенційний синергізм буспірону в поєднанні з мелатоніном, що сприяє нейрогенезу, підвищенню ефективності лікування депресії, когнітивних порушень, відкриває цікаві перспективи для подальших досліджень.
- Можна стверджувати, що сьогодні буспірон недостатньо використовується в нейрореабілітаційних установах.
- Для підтвердження нещодавно виявлених позитивних ефектів буспірону у визначених клінічних ситуаціях необхідні подальші детальніші контрольовані дослідження.

1. Howland RH. Buspirone: Back to the Future. J Psychosoc Nurs Ment Health Serv. 2015 Nov; 53(11): 21-4. doi: 10.3928/02795695-20151022-01. PMID: 26555760. 2. Loane C, Politis M. Buspirone: what is it all about? Brain Res. 2012 Jun 21; 1461: 111-8. doi: 10.1016/j.brainres.2012.04.032. Epub 2012 Apr 24. PMID: 22608068. 3. Wilson T.K., Tripp J. Buspirone. 2021 Aug 12. In: StatPearls [Internet]. Treasure Island (FL): StatPearls Publishing; 2021 Jan. PMID: 30285572. 4. Fulton, Bret, and Rex N. Brogden. 1997. Buspirone. CNS Drugs 7(1): 68-88. 5. Taylor D.P. Buspirone, a new approach to the treatment of anxiety. FASEB J. 1988 Jun; 2(9): 2445-52. doi: 10.1096/fasebj.2.9.2856252. PMID: 2856252. 6. Trivedi M.H., Fava M., Wisniewski S.R., Thase M.E., Quitkin F., Warden D., Ritz L., Nierenberg A.A., Lebowitz B.D., Biggs M.M., Luther J.F., Shores-Wilson K., Rush A.J., STAR*D Study Team. Medication augmentation after the failure of SSRIs for depression. N Engl J Med. 2006 Mar 23; 354(12): 1243-52. doi: 10.1056/NEJMoa052964. PMID: 16554526. 7. Moss L.E., Neppe V.M., Drevets W.C. Buspirone in the treatment of tardive dyskinesia. J Clin Psychopharmacol. 1995 Jun; 15(3): 204-9. PMID: 8102622. 8. Kleedorfer B., Lees A.J., Stern G.M. Buspirone in the treatment of levodopa induced dyskinesias. J Neurol Neurosurg Psychiatry. 1991 Apr; 54(4): 376-7. doi: 10.1136/jnnp.54.4.376-a. PMID: 2056334. PMID: PM C488507. 9. Lou J.S., Goldfarb L., McShane L., Gatey P., Hallett M. Use of buspirone for treatment of cerebellar ataxia. An open-label study. Arch Neurol. 1995 Oct; 52(10): 982-8. doi: 10.1001/archneur.1995.00540340074015. PMID: 7575226. 10. Trouillas P., Xie J., Adeleine P., Michel D., Vighetto A., Homorat J., Dumas R., Nighoghossian N., Laurent B. Buspirone, a 5-hydroxytryptamine 1A agonist, is active in cerebellar ataxia. Results of a double-blind placebo study in patients with cerebellar cortical atrophy. Arch Neurol. 1997 Jun; 54(6): 749-52. doi: 10.1001/archneur.1997.00550180059013. PMID: 9193210. 11. Campbell Burton C.A., Murray J., Holmes J., Astin F., Greenwood D., Knapp P. Frequency of anxiety after stroke: a systematic review and meta-analysis of observational studies. Int J Stroke. 2013 Oct; 8(7): 545-59. doi: 10.1111/j.1747-4949.2012.00906.x. Epub 2012 Sep 27. PMID: 23013268. 12. Sun Q.X., Zeng D.Z. & Wang B.H. (2007). Efficacy and Safety of Citalopram Combined with Buspirone in Treatment of Patients with Post-stroke Depression. Chinese Journal of Rehabilitation, 02. 13. Zhang Y.X., Zhang H.L. & Wang H. (2005). Effects of buspirone hydrochloride on post-stroke affective disorder and neural function. Chin J Clin Rehabil. 9. 8-9. 14. Herrmann N., Eryavec G. Buspirone in the Management of Agitation and Aggression Associated With Dementia. Am J Geriatr Psychiatry. 1993 Summer; 1(3): 249-253. doi: 10.1097/00019442-199300130-00010. Epub 2013 Jan 28. PMID: 28530926. 15. Ratey J., Sovner R., Parks A. & Rogentine K. (1991). Buspirone treatment of aggression and anxiety in mentally retarded patients: a multiple-baseline, placebo lead-in study. The Journal of clinical psychiatry. 16. Cantillon M., Brunswick R., Molina D., Bahro M. Buspirone vs. Haloperidol: A Double-Blind Trial for Agitation in a Nursing Home Population With Alzheimer's Disease. Am J Geriatr Psychiatry. 1996 Summer; 4(3): 263-267. doi: 10.1097/00019442-199622450-00011. Epub 2012 Aug 14. PMID: 28531086. 17. Fava M., Targum S.D., Nierenberg A.A., Bleicher L.S., Carter T.A., Wedel P.C., Hen R., Gage F.H., Barlow C. An exploratory study of combination buspirone and melatonin SR in major depressive disorder (MDD): a possible role for neurogenesis in drug discovery. J Psychiatr.