




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, епілепсія, 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



Буспірон: лікування тривоги, аугментація лікування депресії та інші поля для застосування

Буспірон, який було розроблено в 1986 р., дотепер не втратив прихильності лікарів (Shmuts et al., 2020; Howland, 2015). З моменту схвалення Управлінням з контролю за якістю продуктів харчування та лікарських засобів США (FDA) для застосування при генералізованому тривожному розладі (1986) буспірон застосовували переважно як анксиолітичний засіб, утім, спектр показань до його призначення може розширитися завдяки нещодавно виявленим нейробіологічним ефектам, а також хорошему профілю безпеки і переносимості (Howland, 2015; Wilson et al., 2021).

Механізм дії буспірону

Буспірон є частковим агоністом постсинаптичних рецепторів серотоніну 1A (5-HT_{1A}) та повним агоністом пресинаптичних рецепторів 5-HT_{1A} ядра шва, до яких має високу спорідненість (рис.). Вважається, що провідним механізмом анксиолітичної дії цього препарату є модуляція серотонінергічної активності в амігдалі та провідних шляхах, залучених до формування відчуття страху, а також тривоги (Wilson et al., 2021).

Оскільки буспірон поповнює виснажені запаси серотоніну в організмі та/або посилює його синтез, діючи на рецептори 5-HT_{1A}, застосування цього препарату зменшує вираженість симптомів депресії (Shmuts R. et al., 2020).

Крім серотонінергічного впливу, молекула буспірону є центральним антагоністом дофаміну для пресинаптичних рецепторів D2, D3, D4 (Howland, 2015). Оскільки механізм дії буспірону не передбачає зв'язування з рецепторами γ-аміномасляної кислоти або впливу на опосередковані цієї кислотою процеси, цей анксиолітик не чинить седативного впливу (Quock, 2024).

Буспірон має унікальні властивості серед доступних на сьогодні психотропних фармакологічних препаратів, а також характеризується низкою потенційних терапевтичних застосувань, що охоплюють широкий спектр неврологічних, психіатричних і поведінкових порушень (Garg, Tyagi, 2023). Перевагами буспірону є відсутність взаємодії з іншими препаратами, легкість моніторингу лікування, відсутність синдрому відміни та седативного ефекту (Loane, Politis, 2012).

Безпека застосування

Буспірону притаманний сприятливий профіль побічних ефектів; найчастіше з останніх зустрічаються запаморочення і нудота. Важливо, що буспірон не чинить седативної дії. Буспірон також є потенційно безпечним для вагітних. За класифікацією FDA, буспірон належить до категорії B. Це означає, що дослідження на тваринах засвідчили відсутність негативних явищ під час вагітності.

Завдяки своєму центральному D2-антагонізму буспірон не лише має низький потенціал (<1%) виникнення екстрапірамідних симптомів, а й здатен сприяти регресії таких симптомів, спричинених галоперидолом (Shmuts et al., 2020).

Застосування буспірону за різних патологічних станів Тривожні розлади

Тривожні розлади – найпоширеніший психіатричний діагноз, який нерідко є найскладнішим для лікування (NAMI, 2017). Як засоби першої лінії для лікування гострої та хронічної тривоги нерідко призначаються бензодіазепіни, однак ця група засобів має вагомий недолік – спричиняє фізичну залежність й абстинентний синдром, тому доцільно обирати інші (безпечніші) анксиолітики, наприклад буспірон (Shmuts et al., 2020). Ефективність буспірону в лікуванні генералізованого тривожного розладу наближається до такої бензодіазепінів, але, на відміну від останніх, буспірон є анксиоселективним через відсутність седативної, психомоторних порушень, а також потенціалу розвитку звикання (Taylor, 1988).

Буспірон ефективний у лікуванні тривоги різного генезу, зокрема постінсультного її різновиду. Тривога та депресія – поширені наслідки інсульту, які спостерігаються в ≈20% пацієнтів

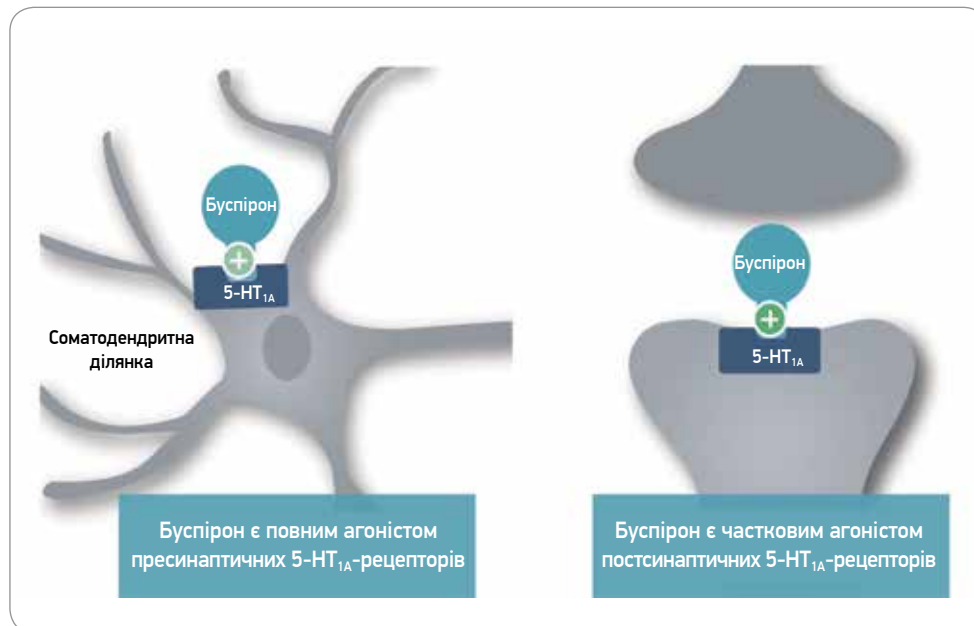


Рис. Вплив буспірону на пре- та постсинаптичні рецептори (Guzman, 2014)

(Burton et al., 2013). Буспірон є ефективнішим за плацебо в лікуванні постінсультної тривоги (Burton et al., 2011), а комбінація циталопраму та буспірону чинить потужнішу анксиолітичну дію в таких пацієнтів, ніж монотерапія циталопрамом (Sun et al., 2007).

Депресія

Буспірон також використовується при лікуванні резистентної депресії або депресії з неповною відповіддю на антидепресивну терапію в ролі допоміжного засобу на додачу до селективних інгібіторів зворотного захоплення серотоніну (СИЗЗС). Додавання буспірону до стартової схеми лікування забезпечує суттєву редукцію симптомів депресії та/або тривоги в пацієнтів, які отримують СИЗЗС, але не можуть досягти позитивної динаміки за допомогою монотерапії цими засобами (Appelberg et al., 2001; APA, 2019). Вплив буспірону на депресію не залежить від його протитривожної дії, що свідчить про доцільність призначення цього препарату пацієнтам зі змішаним профілем тривоги та депресії (Wilson et al., 2021; Loane, Politis, 2012). Дослідження STAR*D підтвердило ефективність буспірону як допоміжного засобу за стійкої депресії (Trivedi et al., 2006).

Слід зауважити, що в разі застосування в поєднанні із СИЗЗС буспірон компенсує деякі несприятливі ефекти цих засобів, зокрема сексуальну дисфункцію. Зменшення цього побічного ефекту відбувається вже протягом першого тижня лікування (Landén et al., 1999). Це поліпшення було помітнішим у жінок, ніж у чоловіків, хоча сексуальна дисфункція в жінок зазвичай гірше підлягає корекції (Hensley et al., 2002). У практичних рекомендаціях Американської психіатричної асоціації (APA) з лікування великих депресивних розладів буспірон визнано корисною стратегією лікування еректильної та оргазмічної дисфункції, зумовлених застосуванням СИЗЗС (APA, 2019).

Деякі дані свідчать про те, що буспірон у поєднанні з мелатоніном має потенціал для лікування великого депресивного розладу, стимулює нейрогенез і покращує когнітивні здатності пацієнтів (Fava et al., 2012).

Психіатричні захворювання

У подвійному сліпому плацебо-контрольованому дослідженні за участю пацієнтів із шизофренією на тлі додавання буспірону

до атипичних антипсихотичних препаратів спостерігалось достовірне покращення когнітивних функцій за результатами тесту на підставлення цифрових символів, який застосовується для оцінки уваги та швидкісної моторики. Значущий ефект у групі буспірону (порівняно з групою плацебо) спостерігалось вже через 3 місяці лікування (Sumiyoshi et al., 2007).

Буспірон з успіхом застосовується в лікуванні пацієнтів, які зловживають алкоголем. Так, у зазначених осіб призначення цього препарату протягом 12 тижнів сприяє зниженню тривоги, збільшенню часу до рецидиву зловживання та зменшенню кількості днів, у які пацієнт живив алкоголь (Kranzler et al., 1994).

Органічні нервово-психічні захворювання, в т. ч. черепно-мозкова травма та деменція, можуть супроводжуватися симптомами збудження й агресії. Доведено, що буспірон знижує рівень агресії, пов'язаної з деменцією та когнітивними порушеннями (Herrmann, Eryavac, 1993; Ratey et al., 1991). Результати рандомізованого подвійного сліпого дослідження продемонстрували, що ефективність буспірону в зниженні агресії є зіставною з показниками галоперидолу, але забезпечує краще пригнічення тривоги. Крім того, буспірону притаманний сприятливіший профіль переносимості (Cantillon et al., 1996).

Неврологічні хвороби

Буспірон запропоновано використовувати як можливий варіант лікування індукованої леводопою дискінезії при хворобі Паркінсона (Loane, Politis, 2012). Так, застосування буспірону протягом усього лише 3 днів зменшувало дискінезію на 20% (Kleedorfer et al., 1991). Сприятливий вплив буспірону на прояви хвороби Паркінсона забезпечується нейропротекторними ефектами блокади дофамінових рецепторів класу D3. За блокування цих рецепторів буспірон захищає нейрони від дофамінергічної дегенерації та зменшує вираженість нейропалення. Експериментальні дані свідчать, що буспірон не лише зменшує експресію прозональних факторів, а й підвищує експресію протекторних нейропептидів і нейротрофічних факторів (Broome, Castorina, 2022).

S. Maresh і співавт. (2020) продемонстрували, що буспірон здатен запобігати розвитку синдрому обструктивного апное сну в пацієнтів з ушкодженням спинного мозку. Застосування

цього анксиолітика сприяло достовірному збільшенню резерву CO₂ порівняно з тразодоном і плацебо. Отже, буспірон знижував чутливість до гіпокапічного центрального апное за рахунок зменшення хемочутливості та підвищення резерву вуглекислого газу.

У пацієнтів із хворобами аутистичного спектра часто зустрічається коморбідна тривожність. Можливості лікування такого поєднання нозологій (як за інструкцією для медичного використання препаратів, так і поза нею, тобто off-label) обмежені. Клінічні дані свідчать, що із цією метою можна застосовувати буспірон (Gupta et al., 2023).

Продемонстровано, що буспірон чинить сприятливий вплив на когнітивну функцію пацієнтів із хворобою Альцгеймера (Schechter et al., 2002).

Функціональна диспепсія

Серед полів застосування буспірону є й гастроентерологія, зокрема лікування функціональної диспепсії. У дослідженні J. Task і співавт. (2012) 4-тижневий курс лікування буспіроном забезпечував достовірне покращення моторної функції шлунка та зменшення симптомів диспепсії. Інше схоже дослідження передбачало лікування буспіроном упродовж 3 місяців і також продемонструвало нормалізацію гастральної моторики та зменшення вираженості диспептичних проявів, насамперед відчуття раннього насичення (Caviglia et al., 2017). Вплив буспірону на моторику травного тракту залежить від дози: застосування >20 мг/добу сповільнює спорожнення шлунка, >30 мг/добу сприяє розслабленню дна шлунка та збільшенню його проксимального об'єму. Вагома перевага буспірону в цьому контексті – мінімум побічних ефектів (найчастіше, але в менш ніж 10% пацієнтів, спостерігалось запаморочення) (Radetic, Gabbard, 2019).

Буспірону властивий потужний стимулювальний вплив на перистальтику стравоходу та функцію нижнього стравохідного сфінктера, що дозволяє зменшувати вираженість основних симптомів гастроєзофагеальної рефлюксної хвороби – печії та регургітації (Karamanolis et al., 2016).

Оскільки функціональні захворювання травної системи нерідко сполучаються з тривожними розладами, цей фенотип пацієнтів може отримати максимальні переваги від застосування буспірону.

Висновки

Отже, буспірон – анксиолітичний препарат, який з успіхом застосовується для лікування тривожних станів різного походження, особливо неврозів, що супроводжуються відчуттям тривожності та неспокою, напруженням, дратівливістю. Крім тривоги, цей препарат застосовується в комплексному лікуванні депресії, шизофренії, хвороби Паркінсона, Альцгеймера тощо. На відміну від бензодіазепінів, буспірон не спричиняє толерантності чи залежності, а після завершення курсу лікування не зумовлює синдрому відміни. Анксиолітичний ефект препарату проявляється вже через 7-14 днів застосування, а повний терапевтичний ефект розвивається приблизно через 4 тижні лікування.

На фармацевтичному ринку України буспірон представлено препаратом Спітомін («ЕГІС», Угорщина), який випускається у формі таблеток по 5 та 10 мг діючої речовини. Показаннями для застосування Спітоміну є симптоматичне лікування тривожних станів із домінуванням таких симптомів, як тривожність, внутрішній неспокій, стан напруження, а також нетривале лікування станів, що супроводжуються тривогою. Максимальна одноразова доза Спітоміну не має перевищувати 30 мг, максимальна добова – 60 мг.

Підготувала Лариса Стрільчук