



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

BUSPIRONA

2. VIA DE ADMINISTRACION

ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Ansiolíticos. Derivados de azaspirodecanodiona.
Código ATC: N05BE01.

3.1. Farmacodinamia

Buspirona es un agente ansiolítico no relacionado con las benzodiazepinas. No exhibe actividad anticonvulsivante ni miorrelajante; no afecta de manera importante la función psicomotora y su efecto sedante es de escasa magnitud. Su mecanismo de acción es desconocido, pero parece involucrar diversos sistemas de neurotransmisores centrales que incluyen al serotoninérgico, dopaminérgico, colinérgico y noradrenérgico (alfa-adrenérgico).

No muestra una afinidad apreciable por los receptores de benzodiazepina, ni afecta la unión del ácido gamma-aminobutírico (GABA) a sus sitios de acción.

3.2. Farmacocinética

Absorción

Tras su administración por vía oral buspirona se absorbe rápido y casi completamente en el tracto gastrointestinal. Sin embargo, debido a un intenso metabolismo hepático de primer paso, sólo un 1% de la dosis alcanza la circulación sistémica como buspirona intacta. Los alimentos incrementan su biodisponibilidad.

El uso continuo genera un efecto terapéutico inicial apreciable a las 2 semanas que se hace máximo a las 3 - 4 semanas y, en algunos casos, a las 4 - 6 semanas.

Distribución

Se distribuye ampliamente en el organismo (Vd: 5.3 l/kg) y se une a proteínas plasmáticas en un 86 - 95%. En animales de experimentación (ratas) difunde a la leche materna, pero se desconoce si ocurre lo mismo en humanos. Tampoco se sabe si atraviesa la placenta.

Biotransformación

Se distribuye ampliamente en el organismo (Vd: 5.3 l/kg) y se une a proteínas plasmáticas en un 86 - 95%. En animales de experimentación (ratas) difunde a la leche materna, pero se desconoce si ocurre lo mismo en humanos. Tampoco se sabe si atraviesa la placenta.

Eliminación

Su vida media de eliminación es de 2 - 4 horas.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

3.3. Información preclínica sobre seguridad

Los estudios a largo plazo en animales para evaluar el potencial carcinogénico de buspirona mostraron resultados negativos, al igual que las pruebas de mutagenicidad realizadas. En los ensayos de reproducción no hubo evidencias de teratogenicidad o fetotoxicidad, ni alteraciones de la fertilidad.

4. INDICACIONES

Tratamiento de ansiedad.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos

Dosis inicial: 5 mg cada 8 o 12 horas al día. La dosis puede incrementarse según necesidad en 5 mg diarios cada dos o tres días, hasta alcanzar la respuesta deseada, sin exceder los 60 mg/día. La dosis óptima, por lo general, se ubica entre 20 y 30 mg/día divididas en 2 o 3 tomas.

5.2. Dosis máxima

60 mg/día. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

No se han descrito pautas especiales de dosificación para estos pacientes. En presencia de insuficiencia severa el uso está contraindicado.

Insuficiencia hepática

No se han descrito pautas especiales de dosificación para estos pacientes. En presencia de insuficiencia severa el uso está contraindicado.

Edad avanzada (≥ 65 años)

No se han descrito pautas especiales de dosificación para estos pacientes.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Administra por vía oral con agua, con o sin las comidas, y preferiblemente a las mismas horas del día durante todo el tratamiento.

La opción de acompañar o no la administración del producto con la ingesta de alimentos deben ser constante y aplicar por igual a todas las dosis a objeto de evitar fluctuaciones en la biodisponibilidad.

Los pacientes deben ser informados al respecto.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos de la sangre y del sistema linfático

Raras: Eosinofilia, leucopenia, trombocitopenia.

Trastornos del sistema inmunológico

Raras: Reacciones de hipersensibilidad, angioedema.

Trastornos endocrinos

Raras: Trastornos tiroideos.

Trastornos del metabolismo y de la nutrición

Raras: Anorexia, incremento del apetito, variaciones (aumento o pérdida) de peso.

Trastornos psiquiátricos

Muy frecuentes: Depresión, confusión, trastornos del sueño, déficit de atención, somnolencia.

Frecuentes: Nerviosismo, insomnio, excitación.

Raras: Ideación suicida.

Muy raras: Labilidad emocional, ira/hostilidad, trastornos psicóticos, alucinaciones, despersonalización, amnesia, inquietud.

Trastornos del sistema nervioso

Muy frecuentes: Mareo, cefalea.

Frecuentes: Parestesia, aturdimiento.

Raras: Intolerancia al frío, alteración del sentido del olfato.

Muy raras: Síndrome serotoninérgico, disquinesia, distonía, dificultad para hablar, ataxia, acatisia, síndrome parkinsoniano, síndrome de piernas inquietas, rigidez de la rueda dentada, convulsiones.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Trastornos oculares

Frecuentes: Visión borrosa.

Raras: Conjuntivitis, dolor ocular.

Muy raras: Visión de túnel.

Trastornos del oído y del laberinto

Frecuentes: Tinnitus.

Raras: Hiperacusia.

Trastornos cardiacos

Frecuentes: Dolor de pecho, taquicardia.

Raras: Bradicardia, infarto de miocardio, cardiomiopatía, insuficiencia cardíaca.

Trastornos vasculares

Raras: Hipotensión, hipertensión, accidente cerebrovascular.

Muy raras: Síncope.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Frecuentes: Congestión nasal, dolor faringolaríngeo.

Raras: Hiperventilación, epistaxis, dolor de garganta.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Náuseas, vómitos, dolor abdominal, boca seca, diarrea, constipación.

Raras: Salivación.

Trastornos hepatobiliares

Raras: Aumento de enzimas hepáticas.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Frecuentes: Sudoración, erupción.

Raras: Equimosis, urticaria, acné, caída del cabello, sequedad de la piel.

Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo

Frecuentes: Temblor, mialgia.

Raras: Espasmos musculares, calambres, artralgia, debilidad.

Trastornos renales y urinarios

Raras: Aumento en la frecuencia urinaria, amenorrea, disuria, nocturia.

Muy raras: Retención urinaria.

Trastornos del aparato reproductor y de la mama

Raras: Trastornos menstruales, disfunción eréctil.

Muy raras: Galactorrea.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Frecuentes: Fatiga,

Raras: Fiebre, hipo, abuso de alcohol.

"Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita a los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel", a través de la página web: http://inhrr.gob.ve/?page_id=4493".

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Los inhibidores potentes de la isoenzima CYP3A4 (como itraconazol, eritromicina, ritonavir, diltiazem, verapamilo, fluvoxamina, nefazodone y el jugo de toronja, entre otros) pueden disminuir el metabolismo hepático de buspirona y con ello aumentar sus concentraciones plasmáticas y el riesgo de reacciones adversas. Por el contrario, inductores de dicha enzima (como rifampicina, dexametasona, fenobarbital, fenitoína y carbamazepina, entre otros) podrían reducir los niveles séricos de buspirona y comprometer su eficacia terapéutica.

El uso combinado de buspirona y medicamentos que producen depresión del sistema nervioso central (como: analgésicos opiáceos, hipnóticos/sedantes, antihistamínicos, antipsicóticos y benzodiazepinas, entre otros) puede resultar en un efecto depresor aditivo.

La coadministración de buspirona y medicamentos con actividad inhibidora de la enzima monoaminoxidasa (como: tranilcipromina, isocarboxazida, moclobemida, procarbazona, selegilina y linezolid, entre otros) puede dar lugar a incrementos importantes de presión arterial, incluyendo la posibilidad de crisis hipertensiva. La interacción puede ocurrir incluso si se administra la buspirona dentro de los 14 días siguientes a la finalización de la terapia con el inhibidor de monoaminoxidasa.

Con el uso simultáneo de buspirona y haloperidol se ha registrado aumento de las concentraciones séricas del haloperidol.

Se ha descrito que la combinación de buspirona y trazodona puede provocar en algunos pacientes elevación de la enzima alanina aminotransferasa (ALT) hepática.

En pacientes que reciben buspirona y warfarina se ha reportado prolongación del tiempo de protrombina.

El uso concomitante de buspirona y cimetidina puede causar un aumento discreto de las concentraciones plasmáticas de buspirona.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

Buspirona puede provocar resultados falsos positivos en las determinaciones urinarias de metanefrina/catecolamina para el diagnóstico de feocromocitoma.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Dado que se ha demostrado que buspirona interactúa con receptores centrales de dopamina y que en algunos pacientes se han observado manifestaciones que sugieren un efecto dopaminérgico, se debe considerar dicha posibilidad durante el tratamiento y, así mismo, prestar atención a la ocurrencia de reacciones neurológicas como: distonía, acatisia, temblor, pseudo-parkinsonismo y disquinesia tardía.

Buspirona no exhibe tolerancia cruzada con benzodiazepinas u otros depresores del sistema nervioso central, por lo cual no previene la aparición del síndrome de abstinencia que, por lo general, ocurre tras la suspensión de un tratamiento prolongado con esos fármacos. Por ello, en pacientes que son transferidos de una terapia con dichos medicamentos a buspirona, se recomienda el retiro lento y gradual de los mismos.

Aunque se ha evidenciado que buspirona no potencia ni empeora el deterioro mental, cognitivo y psicomotor ocasionado por el alcohol, se recomienda evitar el consumo de bebidas alcohólicas durante el tratamiento.

Usar con precaución en pacientes con insuficiencia hepática y/o renal leve a moderada. En presencia de disfunción severa el uso está contraindicado.

La eficacia y seguridad de buspirona en menores de 18 años no ha sido establecida.

8.2. Embarazo

Aunque no se ha evidenciado teratogenicidad ni fetotoxicidad en los ensayos experimentales con buspirona, no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que, a criterio médico, el balance beneficio/riesgo sea favorable.

8.3. Lactancia

Dado que no se conoce si buspirona se distribuye en la leche materna, ni se dispone de información sobre la seguridad de su administración durante la lactancia, se debe evitar su empleo en ese período.

En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

8.4. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

En algunos pacientes buspirona puede causar mareo, somnolencia, confusión, visión borrosa y déficit de atención, lo cual podría comprometer la capacidad y/o habilidad para conducir vehículos u operar maquinarias.

Los pacientes deben ser informados al respecto al objeto de que eviten dichas actividades hasta asegurarse que el medicamento no los afecta de esa manera.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.
Insuficiencia hepática y/o renal severa.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La información disponible relativa a sobredosis de buspirona es escasa. Estudios en voluntarios sanos con dosis diarias de hasta 375 mg reportan como reacciones adversas: náuseas, vómitos, mareo, somnolencia, miosis y malestar gástrico. Otras fuentes han referido bradicardia e hipotensión, más la posibilidad de síntomas extrapiramidales y convulsión.

10.2. Tratamiento

En casos de ingestión reciente (menos de 60 minutos) de una dosis masiva, aplicar medidas orientadas a prevenir la absorción gastrointestinal del fármaco (emesis o lavado gástrico, según la condición del paciente, más carbón activado), seguido por tratamiento sintomático y de soporte. La diálisis resulta inefectiva para remover el fármaco absorbido debido a su elevada unión a proteínas plasmáticas (>90%).

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

VIA DE ADMINISTRACION: Oral.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia, a menos que el médico lo indique.

En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

Procure tomar este medicamento siempre acompañado con comidas o siempre alejado de éstas (1 hora antes o 2 horas después) y evite en lo posible combinar dichas formas de administración.

No suspenda el medicamento sin la indicación de su médico tratante.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Este producto puede causar somnolencia. Durante su administración evítese actividades que impliquen coordinación y estado de alerta mental.

Con el uso de este producto no ingiera bebidas alcohólicas.

El uso por tiempo prolongado puede causar dependencia.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

PRECAUCIONES:

En conductores de vehículos y operadores de maquinarias.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA Y RECIPE ARCHIVADO

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Abril de 2023



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

