

#ficha técnica

Insumo Farmacologicamente Ativo (IFA)

Buspirona



Elaborado por
Maria Eduarda
Carvalho Amaral

Revisado por
Prof^a Jaise Silva
Ferreira

Indicações

Tratamento de distúrbios de ansiedade, como o transtorno de ansiedade generalizada e no alívio em curto prazo dos sintomas de ansiedade, acompanhados ou não de depressão.

Farmacocinética

É rapidamente absorvida via oral, atingindo níveis sanguíneos máximos em 60-90 minutos após a ingestão. Nas doses de 10, 20 e 4 mg, os picos médios de concentração plasmática são, respectivamente 0,9 ng/mL, 1,7 ng/ml e 3,2ng/ml.

Estudos de dose múltipla de até 28 dias, indicaram que as concentrações plasmáticas de equilíbrio (steady-state) são atingidas dentro do período de dois dias e são proporcionais à dose. Quando o equilíbrio é alcançado, a concentração plasmática de bupirona não é marcadamente alterada pela administração crônica.

A atividade ansiolítica não é alterada pela ingestão de alimentos, muito embora estes causem diminuição na sua velocidade de absorção. Em seres humanos, cerca de 95% da bupirona se liga às proteínas plasmáticas e o tempo de meia-vida varia de 2 ± 1 a 11 ± 3 horas. Em estudos, após uma única dose de bupirona, 29 a 63% da

dose foi excretada na urina, num período de 24 horas, principalmente na forma de metabólitos; e a excreção fecal foi de 18 a 38% da dose.

Modo de usar

A dosagem inicial recomendada é de 15mg diários (5mg três vezes ao dia, de preferência nos intervalos das refeições).

Deve ser administrado no mesmo horário todos os dias, com ou sem alimentos.

A ingestão junto com alimentos pode aumentar a biodisponibilidade do fármaco.

Para atingir resposta ótima terapêutica, a cada dois ou três dias a dosagem poderá ser aumentada em 5 mg por dia, se necessário. A dosagem máxima diária não deve exceder 60 mg. Uma resposta ótima terapêutica é obtida para a maioria dos pacientes, incluindo idosos, com pequenos aumentos na dose até uma dosagem diária de 20 a 30 mg divididas em duas ou três tomadas.

Mecanismo de ação

O mecanismo de ação difere dos benzodiazepínicos. Em seres humanos, entretanto, os detalhes sobre o seu mecanismo de ação an-

ficha técnica

Buspirona

siolítica ainda não foram totalmente elucidados. Por meio de estudos em animais, sabe-se que a buspirona interage com os sistemas da serotonina, norepinefrina, acetilcolina e dopamina do cérebro.

O medicamento intensifica a atividade das vias noradrenérgicas e dopaminérgicas específicas e reduz a atividade da serotonina e da acetilcolina. Administrada cronicamente em ratos, a buspirona não alterou a dinâmica da ligação do receptor de dopamina; entretanto, o grau de ligação à serotonina tipo 2 e aos sítios beta-adrenérgicos é diminuído.

Estudos pré-clínicos in vitro demonstraram que a buspirona tem alta afinidade pelos receptores de serotonina (5 HT1A). A buspirona não parece interagir diretamente com os receptores benzodiazepínicos nem com o ácido gama-aminobutírico (GABA) in vitro, quando testada em modelos pré-clínicos. Estudos sugerem que a buspirona pode ter efeitos indiretos sobre os outros sistemas de receptores de neurotransmissão, incluindo os receptores benzodiazepínicos, GABA e de dopamina. Com relação à dopamina, a buspirona parece atuar como um antagonista pré-sináptico da dopamina.

ficha técnica
Buspirona

Reações adversas

- Tontura
- Cefaleia
- Sonolência
- Insônia
- Depressão
- Desordens do sono
- Fadiga
- Dor abdominal
- Diarreia
- Boca seca
- Náusea
- Taquicardia

Interações medicamentosas

- Inibidores da monoamina oxidase (IMAO)
- Inibidores seletivos de recaptação de serotonina (ISRS)
- Haloperidol
- Trazodona
- Nordiazepam
- Interação potencial com fármacos que inibem o citocromo P450 3A4 (CYP3A4)
- Nefazodona
- Eritromicina

ficha técnica
Buspirona

- Itraconazol
- Diltiazem
- Verapamil
- Rifampicina
- Outros inibidores e indutores do CYP3 A4

Contraindicações

- Menores de 18 anos de idade
- Pacientes com epilepsia
- Pacientes com intoxicação aguda por álcool, hipnóticos, analgésicos ou drogas antipsicóticas
- Pacientes com insuficiência renal e hepática graves
- Pacientes com história de crises convulsivas.

Dados sobre intoxicação

A dose terapêutica máxima tolerada em indivíduos normais e sadios é de 375mg/d. Quando os níveis máximos foram ingeridos, os sintomas mais comumente observados foram: náusea, vômito, tontura, sonolência, miose e distúrbios gástricos.

Medidas gerais sintomáticas e de suporte deverão ser utilizadas junto à imediata lavagem gástrica. A respiração, o pulso e a pressão sanguínea deverão ser monitorados em todos os

casos de superdosagem de medicamentos.

Não se conhece nenhum antídoto específico. A bupirona não é removida por hemodiálise; o metabólito 1-pp é parcialmente removido por hemodiálise

Formas de apresentação comercial

Comprimidos com 5mg de cloridrato de bupirona. Embalagens com 8, 20 ou 60 comprimidos.

Comprimidos com 10mg de cloridrato de bupirona. Embalagens com 20 ou 60 comprimidos.

Nome comercial

Ansitec®

Referências

Ansitec®. [Bula]. São Paulo: Libbs Farmacêutica Ltda. Disponível em: <https://consultas.anvisa.gov.br/#/bulario/q/?nomeProduto=ANSITEC>.

Acesso em: 05 out. 2023.