

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
БАКЛОФЕН
(BACLOFEN)

Склад:

діюча речовина: баклофен;

1 таблетка містить баклофену 10 мг або 25 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний, желатин, тальк, магнію стеарат, етилцелюлоза.

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Міорелаксанти з центральним механізмом дії.

Код АТС M03B X01.

Клінічні характеристики.**Показання.**

Хронічна тяжка м'язова спастичність, яка виникає внаслідок таких розладів, як розсіяний склероз або частковий травматичний розрив спинного мозку.

Протипоказання. Підвищена чутливість до баклофену або до будь-якого компонента препарату. Пептична виразкова хвороба.

Спосіб застосування та дози.

Дозу Баклофену необхідно призначати індивідуально для визначення найнижчої ефективної дози, яка не спричинює побічних ефектів.

Препарат слід приймати з їжею.

Рекомендовані такі схеми дозування:

1 - 3-й день – 5 мг (½ таблетки по 10 мг) тричі на добу;

4 - 6-й день – 10 мг (1 таблетка) тричі на добу;

7 - 9-й день – 15 мг (1 ½ таблетки по 10 мг) тричі на добу;

10 - 12-й день – 20 мг (2 таблетки по 10 мг) тричі на добу.

У більшості пацієнтів терапевтичний ефект спостерігається після застосування добової дози 30-75 мг. За необхідності дозу можна з обережністю та поступово підвищувати.

Пацієнтам, які потребують вищих доз препарату (75-100 мг на добу), призначають таблетки по 25 мг. Добова доза препарату не повинна перевищувати 100 мг. Тривалість лікування залежить від клінічного стану пацієнта.

Лікування Баклофеном не слід припиняти раптово, оскільки можуть виникнути галюцинації та може погіршитися спастичний стан.

Пацієнти літнього віку.

Пацієнтам літнього віку дозу препарату треба підвищувати з особливою обережністю, оскільки ризик виникнення у них небажаних явищ вищий, ніж у пацієнтів молодшого віку.

Діти.

Звичайна добова доза препарату становить 0,75-2 мг/кг маси тіла.

Рекомендовані такі дози:

Діти віком від 12 місяців до 2 років: 10-20 мг на добу;

від 2 до 6 років: 20-30 мг на добу;

від 6 до 10 років: 30-60 мг на добу.

Для дітей старше 10 років максимальна добова доза становить 2,5 мг/кг маси тіла. Лікування розпочинають з дози 5 мг, яку приймають двічі на добу.

За необхідності дозу можна обережно збільшувати кожні три дні до отримання оптимального терапевтичного ефекту.

Пацієнти з порушенням функції нирок.

Для пацієнтів з порушенням функції нирок, а також для пацієнтів, які перебувають на діалізі, рекомендована доза препарату має бути знижена до 5 мг на добу.

Побічні реакції.

Найчастіше побічні ефекти виникають після раптового збільшення дози препарату, прийому високих доз або в пацієнтів літнього віку.

У багатьох випадках ці явища згодом послаблюються та минають після зниження дози. У разі серйозних небажаних явищ лікування необхідно припинити.

Під час лікування Баклофеном спостерігаються такі побічні ефекти:

Центральна нервова

система

10-63%

сонливість

5-15%

вертиго

4-12%

нудота

1-11%

сплутаність свідомості

4-8%

головний біль

2-7%

безсоння

2-4%

слабкість і втома

рідко:

ейфорія, збудливість, депресія, галюцинації, парестезія, біль і слабкість у м'язах, атаксія, сухість у ротовій порожнині, виснаження, тремор, астенія, пригнічення дихальної та серцево-судинної системи, дезорієнтація у просторі, запаморочення, блювання, порушення пристосованості, нічні жахи; ністагм, знижений поріг судом і виникнення нападу судом, особливо у хворих на епілепсію;

Серцево-судинна

система

0-9%

артеріальна гіпотензія

рідко:

диспное, прискорене серцебиття, біль у грудній клітці та знепритомніння;

Травна система

2-6%

запор

рідко:

анорексія, порушення смаку, біль у животі, діарея, позитивні результати тесту на приховану кров у фекаліях;

Сечостатева система

2-6%

часті позиви до сечовипускання

рідко:

мимовільне сечовипускання, затримка сечі, нічний енурез та гематурія, анурія, імпотенція, порушення еякуляції;

Інші

порушення зору, порушення смаку, висипання, свербіж, набряк щиколоток, надмірне потовиділення, збільшення маси тіла, відчуття закладення носа, зміни рівня цукру крові, зміни в біохімічних показниках, у деяких пацієнтів спостерігається погіршення спастичного стану (парадоксальна реакція на препарат).

Передозування.

Симптоми. Безсоння, втрата свідомості, кома, порушення дихальної функції, сплутаність свідомості, галюцинації, тривожність, порушення акомодатії, відсутність реакції зрачків, гіпотонія м'язів, клонічні судоми, гіпорексія або арефлексія, судоми, периферична вазодилатація, брадикардія, зниження температури тіла, нудота, блювання, діарея, надмірне слиновиділення, підвищення рівня

ліпопротеїдів низької щільності, альдозоредуктази та лужної фосфатази.

Лікування. Не існує специфічного антидоту баклофену.

Якомога скоріше слід викликати блювання або зробити промивання шлунка і дати активоване вугілля.

У пацієнтів, які знаходяться у комі після інтубації, слід за необхідності застосовувати сольові проносні засоби (через зонд).

Пацієнтам із зупинкою дихання слід зробити штучне дихання, а також застосувати препарати для підтримки кровообігу.

Для збільшення виведення баклофену з організму проводять форсований діурез.

При судомомах з обережністю проводять внутрішньовенне введення діазепаму.

У деяких випадках (при менш вираженій інтоксикації) застосовують фізостигмін.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Баклофен проходить крізь плацентарний бар'єр. У зв'язку з відсутністю даних щодо застосування препарату в період вагітності, в цей період Баклофен можна приймати у разі, коли очікувана користь для матері перевищує можливий ризик для плода. Баклофен виділяється в грудне молоко, тому під час прийому препарату не рекомендується годувати дітей груддю.

Діти.

Препарат застосовують для лікування дітей віком від 1 року.

Особливості застосування.

Під час лікування Баклофеном можливе загострення психотичних синдромів, шизофренії, судом та станів дезорієнтації у часі і просторі, тому пацієнти повинні перебувати під ретельним медичним наглядом.

Після раптового припинення лікування препаратом можуть розвинути стани тривожності та сплутаності свідомості, галюцинації, психоз, маніакальний синдром, параноя та конвульсії, можуть посилитися спастичні симптоми, тому дозу препарату слід зменшувати поступово протягом 1-2 тижнів.

Баклофен виводиться із сечею, переважно у незмінній формі, тому його слід з обережністю призначати хворим з порушенням ниркової функції. Таким пацієнтам дозу необхідно зменшити залежно від ступеня порушення.

Слід бути особливо обережними під час лікування Баклофеном пацієнтів літнього віку через підвищений ризик виникнення небажаних явищ.

Пацієнти, які хворіють на епілепсію та яким потрібне супутнє лікування Баклофеном, повинні знаходитися під ретельним клінічним та ЕЕГ контролем, оскільки спостерігалися випадки зниження ефективності протисудомного лікування та зміни у діаграмі ЕЕГ.

Також слід з обережністю призначати препарат пацієнтам, у яких підтримання вертикального положення тіла та рівноваги або збільшення рухового діапазону залежить від тону м'язів.

Особливо обережно слід застосовувати Баклофен пацієнтам, які отримують антигіпертензивне лікування, через можливу взаємодію лікарських засобів.

Препарат слід обережно призначати пацієнтам після інсульту, з виразкою шлунка та дванадцятипалої кишки, дихальною або печінковою недостатністю.

Препарат слід обережно призначати пацієнтам з підвищеним тонусом сфінктера сечового міхура, оскільки може виникнути затримка сечі.

У деяких пацієнтів, які приймали Баклофен, в сироватці спостерігалися підвищені рівні АЛТ, ЛФ або глюкози. Рекомендується проводити лабораторні аналізи, особливо для пацієнтів з порушенням функції печінки і хворих на цукровий діабет.

Баклофен містить лактозу, тому пацієнтам із рідкісними спадковими порушеннями у вигляді непереносимості галактози, недостатності лактози або з недостатнім всмоктуванням глюкози-галактози цей препарат приймати не можна.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Під час прийому препарату можуть спостерігатися симптоми, пов'язані із седативною дією препарату та зменшенням концентрації уваги. У цьому випадку може погіршитись здатність керувати транспортними засобами та механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Слід дотримуватись особливої обережності при одночасному застосуванні препарату Баклофен з такими лікарськими засобами:

препарати, які впливають на ЦНС: посилення седативної дії;

солі літію: можливість посилення гіперкінетичних симптомів;

трициклічні антидепресанти: можливість посилення дії баклофену, що призводить до значного зниження тону м'язів;

антигіпертензивні препарати, в тому числі інгібітори ангіотензинперетворювального ферменту, діуретиків: можливість посилення гіпотензивної дії (може виникнути потреба в регулюванні дози);

препарати, застосування яких може призвести до ниркової недостатності (наприклад, ібупрофен): уповільнення виділення баклофену може посилити токсичні ефекти;

леводопа, карбідопа: у пацієнтів з хворобою Паркінсона можливі прояви сплутаності свідомості, галюцинації і збудливість;

фентаніл: подовження знеболювальної дії фентанілу.

Фармакологічні властивості.***Фармакодинаміка.***

Баклофен – препарат, який знижує надмірний тонус скелетних м'язів, спричинений ураженнями спинного мозку. Баклофен пригнічує шкірні рефлексі і тонус м'язів, але тільки незначною мірою зменшує амплітуду сухожильного рефлексу.

Механізм дії базується ймовірно на гіперполяризації висхідних нервів і пригніченні моно- та полісинаптичних рефлексів на рівні спинного мозку.

Оскільки Баклофен, уведений у високій дозі, може спричинити пригнічення функції ЦНС, вважають, що препарат також може впливати на центри, розташовані супраспінально.

Фармакокінетика.***Всмоктування***

Баклофен швидко і практично повністю всмоктується зі шлунково-кишкового тракту.

Після введення великої дози препарату всмоктування уповільнюється.

Терапевтична концентрація становить 80-395 нг/мл. Максимальні концентрації (C_{max}) (500-600 нг/мл) досягаються через 2-3 години після перорального прийому, а концентрація в плазмі (близько 200 нг/мл) зберігається протягом 8 годин.

Розповсюдження

Баклофен розподіляється по багатьох тканинах, але лише незначна частина проходить крізь гематоенцефалічний бар'єр.

Баклофен проходить крізь плацентарний бар'єр.

Мінімальні кількості потрапляють у грудне молоко.

Баклофен зв'язується з білками сироватки приблизно на 30%.

Метаболізм

Близько 15% від прийнятої дози препарату метаболізується в печінці шляхом дезамінування.

Виведення

Період напіввиведення становить 2,5-4 години.

Баклофен на 70-80% виводиться із сечею у незмінній формі або у вигляді метаболітів, решта виділяється з фекаліями.

Після перорального застосування препарат майже повністю виводиться протягом 72 годин.

Фармацевтичні характеристики.**Основні фізико-хімічні властивості:**

таблетки 10 мг: круглі, двоопуклі, білого кольору, з рискою;

таблетки 25 мг: круглі, двоопуклі, білого кольору.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в недоступному для дітей, сухому та захищеному від світла місці при температурі нижче 25 °С.

Упаковка. По 50 таблеток у поліпропіленовому флаконі. По 1 флакону в картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Фармацевтичний Завод „Польфарма” С. А., Польща /
Pharmaceutical Works “Polpharma” S. A., Poland.

Або:

Medana Pharma S.A., Poland.

Медана Фарма Акціонерне Товариство, Польща.

Місцезнаходження.

вул. Пельплиньська, 19, 83-200 Старогард Гданьски, Польща /
19 Pelplinska Street, 83-200 Starogard Gdanski, Poland.

Або: вул. В. Локетка 10, 98-200 Серадз, Польща.

ul. Wl. Lokietka 10, 98-200 Sieradz, Poland.