

ZĀĻU APRAKSTS

1. ZĀĻU NOSAUKUMS

BACLOSAL 10 mg tabletes

BACLOSAL 25 mg tabletes

2. KVALITATĪVAIS UN KVANTITATĪVAIS SASTĀVS

Katra 10 mg tablete satur 10 mg baklofēna (*Baclofenum*)

Katra 25 mg tablete satur 25 mg baklofēna (*Baclofenum*)

Palīgviela ar zināmu iedarbību: laktozes monohidrāts.

Katra 10 mg tablete satur 60 mg laktozes monohidrāta.

Katra 25 mg tablete satur 50 mg laktozes monohidrāta.

Pilnu palīgvielu sarakstu skatīt 6.1. apakšpunktā.

3. ZĀĻU FORMA

Tabletes.

Baclosal 10 mg tabletes un Baclosal 25 mg tabletes ir baltas, apaļas un abpusēji izliektas. Baclosal 10 mg tabletēm ir dalījuma līnija.

Tableti var sadalīt vienādās devās.

4. KLĪNISKĀ INFORMĀCIJA

4.1. Terapeitiskās indikācijas

Smagi, hroniski spastiski stāvokļi, ko izraisījušas dažādas patoloģijas, piemēram, izkaisītā skleroze vai traumatisks daļējs muguras smadzeņu bojājums.

Pediātriskā populācija

Baclosal indicēts 0–18 gadus veciem pacientiem simptomātiskai cerebrālas izcelsmes, īpaši bērnu cerebrālās triekas izraisītas spasticitātes ārstēšanai, kā arī pēc cerebrovaskulāriem traucējumiem vai galvas smadzeņu jaunveidojumu un deģeneratīvu slimību gadījumā.

Baclosal indicēts arī simptomātiskai ārstēšanai, lai atvieglotu muskuļu spazmas, ko izraisa infekciozas, deģeneratīvas, traumatiskas, ar jaunveidojumiem saistītas vai nezināmas etioloģijas muguras smadzeņu slimības, piemēram, multiplā skleroze, spastiska spināla paralīze, amiotropā laterālā skleroze, siringomielija, transverss mielīts, traumatiska paraplēģija vai paraparēze un muguras smadzeņu saspiedums.

4.2. Devas un lietošanas veids

Lai noteiktu minimālo efektīvo devu, kas neizraisa nevēlamas blakusparādības, deva jāizvēlas individuāli. Ieteicama šāda terapijas shēma:

Pieaugušie

Pirmo trīs dienu laikā – 5 mg (puse no 10 mg tabletes) trīs reizes dienā;
turpmāko trīs dienu laikā – viena 10 mg tablete trīs reizes dienā;
turpmāko trīs dienu laikā – 15 mg (1½ 10 mg tablete) trīs reizes dienā;
turpmāko trīs dienu laikā – 20 mg (divas 10 mg tabletes) trīs reizes dienā.

Lietošana pēc šādas shēmas nodrošina labu zāļu panesamību.

Vairumam pacientu terapeitiskos efektus novēro pēc 30 līdz 75 mg lielām dienas devām.

Ja nepieciešams, ievērojot īpašu piesardzību, devu var pakāpeniski palielināt.

Pacienti, kam nepieciešamas lielākas zāļu devas (75 – 100 mg dienā), var lietot 25 mg tabletes.

Zāļu dienas deva nedrīkst pārsniegt 100 mg.

Terapijas ilgums ir atkarīgs no pacienta klīniskā stāvokļa.

Baklofēna terapiju nedrīkst pārtraukt pēkšņi, jo var rasties halucinācijas un paasināties spastiskie stāvokļi.

Gados vecāki pacienti

Gados vecākiem pacientiem zāļu deva jāpalielina īpaši piesardzīgi, jo pastāv lielāks nevēlamo blakusparādību risks.

Pediātriskā populācija (0–18 gadus veci pacienti)

Ārstēšana parasti jāsāk ar ļoti mazām dienas devām (aptuveni 0,3 mg/kg), zāles lietojot divās līdz četrās dalītās devās (vislabāk četrās dalītās devās). Šī deva aptuveni ik pēc nedēļas piesardzīgi jāpalielina, līdz tā kļūst atbilstoša bērna individuālajām vajadzībām. Parastā balstterapijas dienas deva ir 0,75–2 mg/kg ķermeņa masas. Bērniem līdz astoņu gadu vecumam kopējā dienas deva nedrīkst būt lielāka par 40 mg. Bērniem pēc astoņu gadu vecuma maksimālā dienas deva ir 60 mg.

Baclosal tabletes nav piemērotas bērniem ar ķermeņa masu līdz 33 kg.

Pacienti ar nieru darbības traucējumiem:

Šiem, kā arī pacientiem ar dialīzi ieteicamās zāļu devas jāsamazina līdz 5 mg dienā.

Zāles jālieto ēšanas laikā.

4.3. Kontrindikācijas

- Paaugstināta jutība pret baklofēnu vai jebkuru no 6.1. apakšpunktā uzskaitītajām palīgvielām.
- Peptiskas čūlas.

4.4. Īpaši brīdinājumi un piesardzība lietošanā

Baclosal terapijas laikā var paasināties porfīrija, anamnēzē esošs alkoholisms, hipertensija, psihotiskie traucējumi, šizofrēnija, depresīvie vai maniakālie traucējumi, apjukuma stāvokļi vai Parkinsona slimība. Tāpēc pacientiem, kuriem ir kāds no šiem stāvokļiem, ārstēšana ir jāveic piesardzīgi un jānodrošina stingra uzraudzība.

Ziņots par pašnāvībām un ar pašnāvību saistītiem notikumiem pacientiem, kas ārstēti ar baklofēnu. Vairumā gadījumu pacientiem bija papildu riska faktori, kas saistīti ar paaugstinātu pašnāvības risku, tostarp alkohola

lietošanas problēmas, depresija un/vai pašnāvības mēģinājumi anamnēzē. Pacienti ar pašnāvības papildu riska faktoriem, terapijas laikā rūpīgi jāuzrauga. Pacienti (un pacientu aprūpētāji) ir jāinformē par to, ka ir jāvēro, vai pacientam nerodas klīniskā stāvokļa pasliktināšanās, pašnāvnieciska uzvedība vai domas, vai neparastas izmaiņas uzvedībā, un nekavējoties jāvēršas pēc medicīniskas palīdzības, ja ir šādi simptomi.

Ir ziņots par neatbilstošas lietošanas, ļaunprātīgas lietošanas un atkarības gadījumiem, lietojot baklofēnu. Jāievēro piesardzība attiecībā uz pacientiem, kuriem anamnēzē ir bijusi ļaunprātīga vielu lietošana, un jāvēro, vai pacientiem nerodas baklofēna neatbilstošas lietošanas, ļaunprātīgas lietošanas vai atkarības simptomi, piemēram, devas palielināšana, uzvedība, kas liecina par tieksmi pēc zālēm, tolerances veidošanās.

Terapija vienmēr (ja vien nerodas nopietnas nevēlamas blakusparādības) ir jāpārtrauc pakāpeniski, sekmīgi samazinot devu aptuveni 1 – 2 nedēļu laikā. Pēc pēkšņas Baclosal lietošanas pārtraukšanas, it īpaši pēc zāļu ilgstošas lietošanas, ir ziņots par nemieru un apjukumu, delīriju, halucinācijām, psihotiskiem traucējumiem, māniju vai paranoju, krampjiem (epileptisks stāvoklis), diskinēziju, tahikardiju, hipertermiju, rbdomiolīzi un īslaicīgu spasticitātes saasināšanos kā atsietena efektu.

Baklofēns ar piesardzību jālieto pacientiem ar nieru darbības traucējumiem, un pacientiem ar nieru slimību gala stadijā to drīkst lietot tikai tad, ja paredzamais ieguvums pārsniedz iespējamo risku (skatīt 4.2. apakšpunktu). Pārdozēšanas neiroloģiskās pazīmes un simptomi, iekļaujot toksiskas encefalopātijas klīniskās izpausmes (piemēram, apjukums, dezorientācija, miegainība un samazināta apziņa), ir novēroti pacientiem ar nieru darbības traucējumiem, kas iekšīgi lieto baklofēna devu virs 5 mg dienā, un devās 5 mg dienā pacientiem ar nieru mazspēju terminālā stadijā, kurus ilgstoši ārstē ar hemodialīzi. Pacienti ar nieru darbības traucējumiem ir rūpīgi jāuzrauga, lai laikus noteiktu toksicitātes agrīnos simptomus (skatīt 4.9. apakšpunktu).

Īpaša piesardzība jāievēro, ja baklofēnu vienlaikus lieto ar citām zālēm, kas var ievērojami ietekmēt nieru darbību. Nieru darbība ir rūpīgi jāuzrauga, un baklofēna dienas deva ir atbilstoši jāpielāgo, lai novērstu baklofēna toksicitāti.

Īpaša piesardzība jāievēro gadījumos, kad ar baklofēnu ārstē gados vecākus pacientus (palielināts nevēlamo blakusparādību attīstības risks).

Epilepsijas slimniekiem, kuriem nepieciešama vienlaicīga terapija ar baklofēnu, ir jānodrošina rūpīga klīniska un EEG kontrole, jo ir novērota pretkrampju terapijas efektivitātes mazināšanās un EEG izmaiņas.

Piesardzība jāievēro, ārstējot ar baklofēnu pacientus, kuriem vertikāla ķermeņa stāvokļa saglabāšana un līdzsvars vai kustību apjoma palielināšana ir atkarīga no paaugstināta muskuļu tonusa.

Īpaši piesardzīgi baklofēns jālieto pacientiem, kas saņem zāles pret hipertensiju (ir iespējama mijiedarbība).

Zāles jālieto piesardzīgi pacientiem ar smadzeņu insultu un, ja anamnēzē ir peptiska čūla, elpošanas traucējumi vai aknu darbības traucējumi.

Zāles jālieto piesardzīgi pacientiem ar paaugstinātu urīnpūšļa sfinktera tonusu (iespējama urīna aizture).

Dažiem pacientiem, kuri ir ārstēti ar baklofēnu, ir novērota paaugstināta ASAT, sārmainās fosfatāzes vai glikozes koncentrācija serumā. Ieteicams veikt laboratoriskus izmeklējumus, it īpaši pacientiem ar aknu darbības traucējumiem un cukura diabētu.

Klīniskie dati par baklofēna lietošanu bērniem līdz viena gada vecumam ir ļoti ierobežoti. Šajā pacientu populācijā zāles lietojamas pēc ārsta lēmuma, kad individuāli izvērtēts pacienta ieguvums un risks.

Tabletes satur laktozi. Šīs zāles nevajadzētu lietot pacientiem ar retu iedzimtu galaktozes nepanesību, ar pilnīgu laktāzes deficītu vai glikozes-galaktozes malabsorbciju.

4.5. Mijiedarbība ar citām zālēm un citi mijiedarbības veidi

- Lietojot baklofēnu kopā ar citām zālēm, kas ietekmē CNS (tostarp prettrauksmes un miega līdzekļiem) vai alkoholu, pastiprinās to sedatīvā iedarbība.
- Pacientiem, kas saņem litija sāļus, baklofēns var pastiprināt hiperkinēzijas simptomus.
- Tricikliskie antidepresanti var pastiprināt baklofēna iedarbību, kā rezultātā nozīmīgi samazinās muskuļu tonuss.
- Baklofēns var pastiprināt antihipertensīvo zāļu (tostarp AKE inhibitoru un diurētisko līdzekļu) iedarbību; šādos gadījumos var būt nepieciešama devas korekcija.
- Zāles, kuras spēj izraisīt nieru mazspēju (piemēram, ibuprofēns), var aizkavēt baklofēna ekskrēciju, izraisot toksisku iedarbību.
- Pacientiem ar Parkinsona slimību, kurus ārstē ar levodopu un karbidopu, vienlaicīgas baklofēna lietošanas laikā var rasties apjukums, halucinācijas un uzbudinājums.
- Baklofēns paildzina fentanila inducēto pretsāpju ietekmi.

4.6. Fertilitāte, grūtniecība un barošana ar krūti

Grūtniecība

C kategorija.

Pētījumos ar žurkām, lietojot baklofēna devu, kas bija apmēram 13 reizes lielāka par cilvēkam ieteikto maksimālo devu, augļiem biežāk attīstījās nabas trūce.

Pelēm un trušiem netika novērotas teratogēniskas izmaiņas, bet lietojot pelēm un trušiem baklofēna dienas devas, kas 17 – 34 reizes pārsniedza cilvēkam paredzētās devas, tika novērota augļa masas samazināšanās un skeleta pārkaulošanās traucējumi.

Citos pētījumos ar žurku mātītēm, kas baklofēnu saņēma divus gadus, tika novērotas no devas atkarīgas olnīcu izmaiņas.

Baklofēns šķērso placentāro barjeru.

Nav veikti kontrolēti pētījumi par zāļu lietošanu grūtniecēm.

Grūtniecības laikā baklofēnu drīkst lietot tikai tad, ja ārsts uzskata, ka terapijas sniegtais guvums mātei atsver iespējamo bojājuma risku auglim.

Barošana ar krūti

Baklofēns izdalās ar mātes pienu.

Zāļu lietošanas laikā nav ieteicams barot bērnu ar krūti.

4.7. Ietekme uz spēju vadīt transportlīdzekļus un apkalpot mehānismus

Baklofēns var izraisīt sedāciju un traucēt koncentrēšanās spēju.

Tādējādi pacienti, kas ārstēti ar šīm zālēm, nedrīkst vadīt transportlīdzekļus, apkalpot kustīgus mehānismus vai veikt citas potenciāli bīstamas darbības.

4.8. Nevēlamās blakusparādības

Nevēlamās blakusparādības visbiežāk rodas, strauji palielinot zāļu devu vai lietojot lielas baklofēna devas, kā arī gados vecākiem pacientiem.

Vairumā gadījumu parādības ir pārejošas un izzūd pēc devas mazināšanas. Smagu nevēlamu blakusparādību gadījumā terapija ir jāpārtrauc.

Pēc baklofēna lietošanas ir novērotas šādas nevēlamās blakusparādības:

Nervu sistēmas traucējumi

10–63 % miegainība

5–15 % vertigo

4–12 % slikta dūša

1–11 % apjukums

4–8 % galvassāpes

2–7 % bezmiegs

2–4 % nespēks un vājuma sajūta

Reti: eiforija, uzbudinājums, depresija, halucinācijas, parestēzijas, muskuļu sāpes un vājums, ataksija, sausums mutē, spēku izsīkums, trīce, astēnija, elpošanas vai sirds – asinsvadu darbības nomākums, orientācijas traucējumi, viegls reibonis, vemšanas reflekss, vemšana, akomodācijas traucējumi, nistagms, murgi; iespējams krampju sliekšņa pazeminājums un krampji, it īpaši epilepsijas slimniekiem.

Nav zināmi: miega apnojas sindroms*

Sirds funkcijas un asinsvadu sistēmas traucējumi

0–9 % hipotensija

Reti: elpas trūkums, sirdsklauves, sāpes krūšu kurvī un ģībonis.

Kuņģa-zarnu trakta traucējumi

2–6 % aizcietējums

Reti: anoreksija, garšas sajūtas traucējumi, sāpes vēderā, caureja, pozitīvs rezultāts izkārnījumu analīzei uz slēptām asinīm.

Uroģenitālā sistēma

2–6 % neatliekama urinēšanas vajadzība

Reti: patvaļīga urinēšana, urīna aizture, anūrija, impotence, ejakulācijas traucējumi, nakts enurēze un hematūrija.

Citas: redzes traucējumi, garšas sajūtas traucējumi, izsitumi, nieze, potīšu tūska, pastiprināta svīšana, ķermeņa masas pieaugums, deguna aizlikuma sajūta, izmainīta cukura koncentrācija asinīs, aknu funkcionālo testu rezultātu izmaiņas. Dažiem pacientiem ir novērots spastisko stāvokļu paasinājums (paradoksāla reakcija uz zālēm).

*Centrālās miega apnojas sindroma gadījumi ir novēroti pacientiem, kuri ir atkarīgi no alkohola un kuri lietojuši baklofēna lielu devu (≥ 100 mg).

Ziņošana par iespējamām nevēlamām blakusparādībām

Ir svarīgi ziņot par iespējamām nevēlamām blakusparādībām pēc zāļu reģistrācijas. Tādējādi zāļu ieguvuma/riska attiecība tiek nepārtraukti uzraudzīta. Veselības aprūpes speciālisti tiek lūgti ziņot par jebkādam iespējamām nevēlamām blakusparādībām Zāļu valsts aģentūrai, Jersikas ielā 15, Rīgā, LV 1003. Tīmekļa vietne: www.zva.gov.lv

4.9. Pārdozēšana

Pēc zāļu pārdozēšanas var attīstīties šādas nevēlamas CNS blakusparādības: miegainība, samaņas zudums, koma un elpošanas apstāšanās.

Var arī rasties šādas nevēlamās blakusparādības: apjukums, halucinācijas, uzbudinājums, krampji, normai neatbilstoša elektroencefalogramma (uzliesmojuma-nomākuma pazīme un trīsfāzu līknes), akomodācijas traucējumi, zīlīšu refleksa traucējumi; ģeneralizēta muskuļu hipotonija, mioklonija, hiporefleksija vai arefleksija; perifērā vazodilatācija, hipotensija vai hipertensija, bradikardija vai tahikardija, sirds aritmija; hipotermija; slikta dūša, vemšana, caureja, siekalu hipersekrecija; palielināts aknu enzīmu līmenis, AsAT un SF vērtības, rabdomiolīze, troksnis ausīs.

Pārdozēšanas terapija

Specifisks baklofēna antidots nav pieejams.

Pēc iespējas ātrāk jāizraisa vemšana vai jāskalo kuņģis un jālieto aktivētā ogle.

Pacienti, kas atrodas komā, pirms kuņģa skalošanas ir jāintubē.

Ja nepieciešams, jādod caureju izraisoši sāļi.

Pacientiem ar elpošanas apstāšanos jāveic makslīgā elpināšana un jāordinē asinsriti uzturoša terapija.

Atbilstoši dažu autoru darbiem, mazāk smagu intoksikāciju gadījumos nevēlamās blakusparādības centrālajā nervu sistēmā, piemēram, miegainību un elpošanas nomākumu, mazina intravenozi ievadīts fizostigmīns (1 – 2 mg deva, ko ievada 5 līdz 10 minūšu laikā). Ja pēc pirmās devas nav uzlabošanās, pēc 30 līdz 60 minūtēm var ievadīt vēl vienu fizostigmīna devu.

Lai palielinātu baklofēna izvadī ar urīnu, jāievada arī šķidrums un diurētiskie līdzekļi. Krampju gadījumā var intravenozi piesardzīgi ievadīt diazepamu.

5. FARMAKOLOĢISKĀS ĪPAŠĪBAS

5.1. Farmakodinamiskās īpašības

Farmakoterapeitiskā grupa: citi centrālas darbības miorelaksanti, ATĶ kods: M03B X01

Baklofēns samazina pārlieku skeleta muskuļu tonusu, ko izraisījuši muguras smadzeņu bojājumi. Zāles vienlaicīgi (un vienādā apjomā) vājina ādas refleksus un samazina muskuļu tonusu, bet tikai nedaudz samazina cīpslu refleksu amplitūdu.

Iespējams, ka šis darbības mehānisms ietver ascendējošo nervu hiperpolarizāciju un monosimpātisko un polisimpātisko refleksu inhibīciju muguras smadzeņu līmenī.

Pētījumos ar dzīvniekiem baklofēns paātrināja dopamīna metabolismu, bet cilvēkam zāles neradīja 5-hidroksiindola acetāta vai dopamīna metabolītu koncentrācijas pārmaiņas muguras smadzeņu šķidrumā.

Tā kā lielas baklofēna devas var izraisīt CNS darbības nomākumu, tiek uzskatīts, ka zāles var ietekmēt arī virs muguras smadzenēm atrodošos centrus.

5.2. Farmakokinētiskās īpašības

Uzsūkšanās

No kuņģa – zarnu traktā baklofēns absorbējas ātri un gandrīz pilnīgi.

Pēc lielāku zāļu devu ieņemšanas absorbcija samazinās.

Terapeitiskā koncentrācija (atbilstoši literatūras datiem) ir 80 – 395 ng/ml.

Pētījumos ar dzīvniekiem tika pierādīts, ka baklofēns izplatās daudzos audos, bet tikai neliels vielas daudzums šķērso hematoencefālisko barjeru.

Pacientiem, kuri lieto baklofēnu, maksimālā koncentrācija C_{max} (500 – 600 ng/ml) tiek sasniegta 2 – 3 stundu laikā pēc lietošanas, un koncentrācija virs 200 ng/ml saglabājas 8 stundas.

Izkliede

Baklofēns šķērso placentāro barjeru.

Neliels zāļu daudzums izdalās mātes pienā.

Aptuveni 30 % baklofēna saistās ar seruma olbaltumiem.

Biotransformācija

Aptuveni 15 % lietotās zāļu devas dezaminēšanās ceļā metabolizējas aknās.

Eliminācija

Eliminācijas pusperiods ir 2,5–4 stundas.

Ar urīnu izdalās 70 – 80 % baklofēna neizmainītā veidā vai metabolītu veidā. Atlikušais vielas daudzums izdalās ar izkārnījumiem.

72 stundu laikā pēc perorālas lietošanas zāles ir gandrīz pilnīgi izdalījušās.

5.3. Preklīniskie dati par drošumu

a) Akūtā toksicitāte

Perorālu devu akūtās toksicitātes pētījumi tika veikti ar peļu un žurku mātītēm. Baklofēns izraisīja miorelaksāciju un pārtrauca spēju reaģēt uz ārējiem kairinājumiem. 2 līdz 3 stundas pēc zāļu lietošanas dzīvniekiem iestājās nāve. Perorālas baklofēna LD50 žurku un peļu mātītēm ir attiecīgi 251 un 130 mg/kg.

b) Subakūtā toksicitāte

Sešas nedēļas ilgi perorāli lietotas 12,5 mg/kg un 25,1 mg/kg lielas baklofēna devas žurkām kavēja ķermeņa masas pieaugumu un izraisīja iekšējo orgānu (aknu un nieru) masas mazināšanos.

Histopatoloģiskos izmeklējumos žurkām netika konstatētas patoloģiskas izmaiņas aknās, sirdī, nierēs vai plaušās.

Perorālas 6,5 mg/kg un 13 mg/kg lielas baklofēna devas pelēm mazināja motorisko koordināciju.

6. FARMACEITISKĀ INFORMĀCIJA

6.1. Palīgvielu saraksts

Laktozes monohidrāts

Kartupeļu ciete

Želatīns

Talks

Magnija stearāts

Etilceluloze

6.2. Nesaderība

Nav piemērojama.

6.3. Uzglabāšanas laiks

3 gadi.

6.4. Īpaši uzglabāšanas nosacījumi

Uzglabāt temperatūrā līdz 25 °C.

Uzglabāt ārējā iepakojumā, lai sargātu no gaismas un mitruma.

6.5. Iepakojuma veids un saturs

Baclofen 10 mg un 25 mg tabletes ir iepakotas augsta blīvuma polietilēna flakonos ar aizsarggredzenu pa 50 tabletēm vienā flakonā.

Ārējais iepakojums ir kartona kārba ar ofseta apdruku, kurā ir viens flakons kopā ar lietošanas instrukciju.

6.6. Īpaši norādījumi atkritumu likvidēšanai un citi norādījumi par rīkošanos

Nav piemērojami.

7. REĢISTRĀCIJAS APLIECĪBAS ĪPAŠNIEKS

Zakłady Farmaceutyczne POLPHARMA S.A.
ul. Pelplińska 19, 83-200 Starogard Gdański, Polija

8. REĢISTRĀCIJAS APLIECĪBAS NUMURS(-I)

Baclofen 10 mg: 98-0240
Baclofen 25 mg: 98-0108

9. REĢISTRĀCIJAS /PĀRREĢISTRĀCIJAS DATUMS

Reģistrācijas datums: 22.04.1998
Pēdējās pārreģistrācijas datums: 15.02.2008

10. TEKSTA PĀRSKATĪŠANAS DATUMS

10/2021