

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

BACLOFEN – POLPHARMA 10 mg
BACLOFEN – POLPHARMA 25 mg
tablety

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna 10 mg tableta obsahuje 10 mg baklofénu (baclofenum).
Jedna 25 mg tableta obsahuje 25 mg baklofénu (baclofenum).

Pomocná látka so známym účinkom: laktóza.

Jedna 10 mg tableta obsahuje 60 mg monohydrátu laktózy.

Jedna 25 mg tableta obsahuje 50 mg monohydrátu laktózy.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

tableta

BACLOFEN – POLPHARMA 10 mg: malé vypuklé biele tablety s priečnou deliacou ryhou.
BACLOFEN – POLPHARMA 25 mg: malé vypuklé biele tablety.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Baklofén sa indikuje na liečbu spastických svalových stavov, ktoré vychádzajú z ochorení, ako je: skleróza multiplex, iné poškodenia miechy, napr. tumory miechy, syringomyelia, choroby motorických neurónov, myelitis transversa, traumatické poranenia miechy.

Baklofén sa tiež indikuje dospelým a deťom na liečbu spastických svalových stavov vyplývajúcich napr. z mozgovocievnej príhody, mozgovej obrny, meningitídy, traumatického poranenia hlavy.

Pri začatí liečby baklofénom je potrebná selekcia pacientov; je pravdepodobné, že najväčší prínos bude u pacientov, u ktorých kľčovitosť predstavuje handicap pre aktivity a/alebo fyzioterapiu. Liečba sa nemá začať, pokiaľ sa spastický stav nestabilizuje.

Pediatrická populácia

BACLOFEN-POLPHARMA je indikovaný pacientom vo veku 0 až < 18 rokov na symptomatickú liečbu kľčovitosti mozgového pôvodu, zvlášť v dôsledku detskej mozgovej obrny, ako aj následkom mozgovocievnych príhod alebo v prípade neoplastického, alebo degeneratívneho ochorenia mozgu. BACLOFEN-POLPHARMA je tiež indikovaný na symptomatickú liečbu svalových spazmov vyskytujúcich sa pri infekčných ochoreniach miechy, pri degeneratívnych, traumatických, neoplastických ochoreniach miechy alebo ochoreniach neznámeho pôvodu, ako sú skleróza multiplex, spastická spinálna paralýza, amyotrofická laterálna skleróza, syringomyelia, myelitis transversa, traumatická paraplegia alebo paraparéza a kompresia miechy.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Pred začiatkom liečby baklofénom je vhodné realisticky posúdiť celkovú mieru klinického zlepšenia, ktoré môže pacient dosiahnuť.

Odporúča sa podať najnižšiu dávku kompatibilnú s optimálnou odpoveďou na liečbu. Dĺžka liečby závisí od pacientovho klinického stavu.

Pokým pacient nie je stabilizovaný, potrebné je starostlivé titrovanie dávky (zvlášť u starších pacientov). Ak sa začne s príliš vysokou dávkou alebo ak je zvyšovanie dávky veľmi rýchle, môžu sa objaviť nežiaduce účinky. Platí to zvlášť u pacientov liečených ambulantne na minimalizáciu svalovej únavy v nepostihnutých končatinách alebo ak je spasticita potrebná ako podpora.

Ak sa dosiahne maximálna odporúčaná dávka a terapeutický účinok sa nedostaví do 6 týždňov, potrebné je zvážiť ďalšie pokračovanie liečby baklofénom.

Dávkovanie

Dospelí

Liečba začína dávkou 15 mg denne, najlepšie podaná v niekoľkých dávkach. Následne sa postupne zvyšuje, ale úprava dávky závisí od individuálnych potrieb pacienta.

Počas prvých troch dní – 5 mg (polovica 10 mg tablety) trikrát denne,

počas nasledujúcich troch dní – jedna 10 mg tableta trikrát denne,

počas ďalšieho obdobia troch dní – 15 mg (jeden a pol 10 mg tablety) trikrát denne,

počas ďalšieho obdobia troch dní – 20 mg (dve 10 mg tablety) trikrát denne.

Uspokojivá kontrola symptómov sa obvykle dosiahne pri dávkach do 60 mg denne, ale starostlivá úprava dávky je často potrebná na dosiahnutie individuálnej odpovede pacienta. Dávka sa má zvyšovať pomaly, podľa potreby, ale maximálna dávka viac ako 100 mg sa neodporúča, pokiaľ pacient nie je hospitalizovaný a pod stálym lekárskeym dohľadom. Malé časté dávky môžu byť účinnejšie v niektorých prípadoch ako vyššie dávky podávané s väčším odstupom. U niektorých pacientov má baklofén prínos len pri podávaní na noc proti bolestivým kŕčom flexorů. Podobne, jednorazová dávka podaná približne 1 hodinou pred špecifickými činnosťami ako je umývanie, obliekanie, holenie, fyzioterapia, často zlepšuje motilitu.

Starší pacienti

Starší pacienti môžu byť viac citliví na vedľajšie účinky, zvlášť v prvých štádiách liečby baklofénom. Na začiatku liečby sa preto používajú nízke dávky a dávka sa postupne titruje podľa odpovedi, pod starostlivým dohľadom. Nedokázalo sa, že ich výsledné priemerné maximálne dávky sú odlišné v porovnaní s mladšími pacientmi.

Pediatrická populácia (0 až < 18 rokov)

Liečba obvykle začína veľmi nízkou dávkou (zodpovedajúcej približne 0,3 mg/kg/deň), v 2-4 oddelených dávkach, najlepšie v 4 dávkach. Dávkovanie možno opatrne zvyšovať v 1 týždňových intervaloch, pokiaľ sa nedosiahne uspokojivá individuálna odpoveď u dieťaťa. Obvyklá denná dávka pri udržiavacej terapii sa pohybuje v intervale 0,75 až 2 mg/kg telesnej hmotnosti u detí do 8 rokov. Celková denná dávka u detí do 8 rokov nesmie prekročiť 40 mg/deň. U detí nad 8 rokov sa môže podávať maximálna denná dávka 60 mg/deň.

BACLOFEN-POLPHARMA tablety nie sú vhodné pre deti s telesnou hmotnosťou nižšou ako 33 kg.

Pacienti s porušenou funkciou obličiek

U pacientov s porušenou funkciou obličiek alebo u chronicky dialyzovaných pacientov sa odporúča znížiť dávku baklofenu na približne 5 mg denne.

Baklofén sa pri konečnom štádiu renálneho zlyhania má podávať pacientom len v prípade, že prínos prevažuje možné riziko. Títo pacienti musia byť starostlivo monitorovaní na včasnú diagnózu skorých príznakov a/alebo symptómov toxicity (napr. ospalosť, letargia) (pozri časť 4.4).

Pacienti so spastickými stavmi mozgového pôvodu

U týchto pacientov sa nežiaduce účinky vyskytujú častejšie. Preto sa odporúča veľmi opatrné dávkovanie, prispôbené pacientom, a pod starostlivým dohľadom.

Spôsob podávania

Liek sa má podávať s jedlom.

4.3 Kontraindikácie

- Precitlivenosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.
- Peptická ulcerácia.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Psychické poruchy a poruchy nervového systému

Počas liečby BACLOFENOM – POLPHARMA sa môže zhoršiť porfýria, alkoholizmus uvedený v anamnéze, hypertenzia, psychotické poruchy, schizofrénia, depresívna alebo manická porucha, stavy zmätenosti alebo Parkinsonova choroba. Pacientov, ktorí majú tieto ochorenia je preto potrebné liečiť s opatrnosťou a pod prísny lekársky dohľadom.

U pacientov liečených baklofénom boli hlásené prípady samovraždy a udalostí súvisiacich so samovraždou. Vo väčšine prípadov mali pacienti ďalšie rizikové faktory súvisiace so zvýšeným rizikom samovraždy vrátane nadmerného požívania alkoholu, depresie a/alebo pokusov o samovraždu v minulosti. Liečba má v prípade pacientov s ďalšími rizikovými faktormi pre samovraždu prebiehať pod prísny dohľadom lekára. Pacientov (a opatrovateľov pacientov) je potrebné upozorniť, že je nevyhnutné sledovanie ich stavu z hľadiska klinického zhoršenia, samovražedného správania alebo myšlienok alebo nezvyčajných zmien v správaní, a v prípade výskytu týchto príznakov je potrebné ihneď vyhľadať lekársku pomoc.

V súvislosti s užívaním baklofenu boli hlásené prípady nesprávneho použitia, zneužitia a závislosti. U pacientov so zneužívaním návykových látok v anamnéze je potrebná opatrnosť a pacienti majú byť sledovaní z hľadiska príznakov nesprávneho použitia, zneužitia alebo závislosti od baklofenu, napríklad zvyšovanie dávky, dožadovanie sa lieku a vznik tolerance.

Encefalopatia

U pacientov užívajúcich baklofén v terapeutických dávkach boli hlásené prípady encefalopatie, ktoré boli po prerušení liečby reverzibilné. Medzi príznaky patrili ospalosť, znížená úroveň vedomia, zmätenosť, myoklonus a kóma.

Ak sa pozorujú známky encefalopatie, baklofén sa má vysadiť.

Epilepsia

Baklofén môže tiež zhoršovať epileptické prejavy, ale možno ich udržiavať vhodným dohľadom a adekvátnou antikonvulzívnou terapiou.

Baklofén sa musí s opatrnosťou podávať pacientom s cerebrovaskulárnymi príhodami, alebo pacientom s respiračnou, alebo hepatálnou poruchou.

Renálna porucha

Baklofén sa musí používať s opatrnosťou u pacientov s renálnou poruchou a u pacientov s terminálnym štádiom renálneho zlyhania (CKD stage, GRF < 15 ml/min) sa má podávať len v prípade, že očakávaný prínos prevyší potenciálne riziko (pozri časť 4.2 Dávkovanie a spôsob podávania). U pacientov s poruchou funkcie obličiek užívajúcich perorálny baklofén v dávkach vyšších ako 5 mg denne a v dávkach 5 mg denne u pacientov s chronickým zlyháváním obličiek v konečnom štádiu liečených chronickou hemodialýzou sa pozorovali neurologické prejavy a príznaky predávkovania vrátane klinických prejavov toxickéj encefalopatie (napr. zmätenosť, dezorientácia, somnolencia a znížená úroveň vedomia). Pacientov s poruchou funkcie obličiek treba starostlivo sledovať s cieľom rýchlo diagnostikovať skoré symptómy toxicity (pozri časť 4.9 Predávkovanie).

Mimoriadna pozornosť je potrebná, keď sa baklofén kombinuje s liekmi, ktoré môžu výrazne ovplyvniť renálnu funkciu. Treba starostlivo sledovať renálnu funkciu a denná dávka baklofenu sa musí upraviť tak, aby nedošlo k toxicite baklofénom.

Okrem prerušenia liečby, neplánovanú dialýzu možno zvážiť ako alternatívnu liečbu u pacientov so závažnou toxicitou baklofénom. Hemodialýza efektívne odstraňuje baklofén z tela, zmiernuje klinické príznaky predávkovania a skracuje čas potrebný na zotavenie pacienta.

Poruchy močenia

Počas liečby baklofénom sa neurogénne poruchy postihujúce vyprázdňovanie močového mechúra môžu zlepšiť. U pacientov s existujúcou hypertóniou sfinkteru sa môže objaviť akútna retencia moču; liek sa musí podávať v týchto prípadoch opatrne.

Laboratórne testy

V zriedkavých prípadoch sa zaznamenalo zvýšenie AST, alkalickej fosfatázy a hladín glukózy v sére. U pacientov s pečeňovými poruchami alebo pacientov s diabetom mellitus treba robiť vhodné laboratórne testy, aby sa zabezpečilo, že liek nevyvolá žiadne zmeny ich prebiehajúceho ochorenia.

Náhle vysadenie

Liečba sa má vždy (ak sa nevyskytnú závažné nežiaduce účinky) vysadiť postupne znížením dávkovania v priebehu obdobia trvajúceho asi 1 – 2 týždne. Pri náhlom vysadení baklofenu, najmä po dlhodobej liečbe, boli hlásené stavy úzkosti a zmätenosti, halucinácie, psychotické, manické alebo paranoidné stavy, konvulzie (status epilepticus), dyskinéza, tachykardia, hypertermia, rabdomyolýza a dočasné zhoršenie spasticity ako tzv. „rebound fenomén.“

Po intrauterinnej expozícii baklofénom sa u novorodencov zaznamenali kŕče (pozri časť 4.6).

Liečba sa má vždy (pokým sa nevyskytnú závažné nežiaduce účinky) ukončovať postupne, znížením dávky počas 1-2 týždňov.

Existujú veľmi obmedzené údaje o používaní baklofenu u detí do 1 roka. Použitie u tejto vekovej skupiny je možné len na základe individuálneho posúdenia lekárom, ak prínos liečby prevažuje nad možným rizikom.

BACLOFEN-POLPHARMA tablety obsahujú laktózu.

Pacienti so zriedkavými dedičnými problémami galaktózovej intolerancie, celkovým deficitom laktázy alebo glukózo-galaktózovou malabsorpciou nesmú užívať tento liek.

4.5 Liekové a iné interakcie

- Ak je baklofén podávaný súčasne s inými liekmi pôsobiacimi na CNS, so syntetickými opiátmi alebo s alkoholom, zvyšuje ich sedatívny účinok.
- Baklofén môže potencovať hyperkinetické symptómy u pacientov užívajúcich soli lítia.
- Je tiež zvýšené riziko respiračnej depresie. Starostlivé monitorovanie respiračných a kardiovaskulárnych funkcií je potrebné zvlášť u pacientov so srdcovo-pľúcnym ochorením a slabosťou dýchacích svalov
- Počas súbežnej liečby s tricyklickými antidepresívami sa môže potencovať účinok baklofenu, čo môže viesť k výraznému zníženiu svalového tonusu.
- Keďže pri súbežnom užívaní baklofenu a antihypertenzívnych liekov je pravdepodobný pokles krvného tlaku, potrebné je upraviť podľa potreby dávkovanie antihypertenzív. Hypotenzia sa zaznamenala u jedného pacienta, ktorí dostával morfin a intratekálne baklofén.
- Lieky, ktoré môžu spôsobiť renálnu insuficienciu (napr. ibuprofén), môžu spomaliť vylučovanie baklofenu, čo môže viesť k toxickým účinkom.
- Mentálna konfúzia, halucinácie, nauzea a agitácia sa môžu vyskytnúť u pacientov s Parkinsonovou chorobou liečených levodopou s karbidopou, ktorým bol súčasne podávaný baklofén.

- Baklofén predlžuje analgéziu indukovanú fentanylom.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

V gravidite, zvlášť počas prvých 3 mesiacov, sa baklofén môže podať len vtedy, ak je to životne nevyhnutné. Prínos liečby pre matku treba starostlivo zvážiť oproti možným rizikám pre dieťa.

Baklofén prechádza placentárnou bariérou.

Jeden prípad suspektnéj reakcie z vysadenia lieku (generalizované konvulzie) sa zaznamenal u týždeň starého dieťaťa, keď matka užívala perorálne baklofén v dávke 80 mg denne počas gravidity.

Konvulzie, ktoré boli refraktérne na štandardnú antikonvulzívnu liečbu, vymizli do 30 minút po podaní baklofénu dieťaťu.

Dojčenie

Baklofén prechádza do ľudského mlieka, ale v množstvách takých nízkych, že nemožno očakávať nežiaduce účinky na dojča.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Baklofén môže byť spájaný so závratmi, sedáciou, somnolenciou a vizuálnymi poruchami (pozri časť 4.8), ktoré môžu porušiť pacientovu reakciu. Pacientov, ktorí majú takéto nežiaduce účinky, treba poučiť, aby nevedli vozilo alebo neobsluhovali stroje.

4.8 Nežiaduce účinky

Nežiaduce účinky sa vyskytujú prevažne na začiatku liečby (napr. sedácia, somnolencia a nauzea), ak sa dávku zvyšuje príliš rýchlo, ak sa podávajú vysoké dávky alebo u starších pacientov. Často sú prechodné a môžu byť zmiernené alebo eliminované znížením dávky; zriedkavo bývajú závažné a vyžadujú prerušenie liečby.

Ak nauzea pretrváva aj po znížení dávky, odporúča sa, aby sa baklofén užíval s jedlom alebo mliekom.

U pacientov s psychickými poruchami alebo cerebrovaskulárnymi poruchami (napr. mŕtvica), ako aj u starších pacientov nežiaduce reakcie môžu mať závažnejšiu formu.

Môže sa vyskytnúť zníženie prahu záchvatov a kŕčov, zvlášť u epileptických pacientov.

Nežiaduce účinky sú zaradené podľa frekvencie, najčastejší je prvý, s použitím nasledovnej konvencie: veľmi časté ($\geq 1/10$); časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$); menej časté ($\geq 1/1\,000$ až $< 1/100$); zriedkavé ($\geq 1/10\,000$ až $< 1/1\,000$); veľmi zriedkavé ($< 1/10\,000$), vrátane ojedinelých prípadov.

Poruchy nervového systému

Veľmi časté: sedácia, somnolencia

Časté: útlm dýchania, vertigo, únava, vyčerpanie, stavy zmätenosti, závraty, bolesť hlavy, insomnia, euforická nálada, depresia, svalová únava, ataxia, tremor, halucinácie, nočná mora, myalgia, nystagmus, sucho v ústach.

Zriedkavé: parestézia, dyzartria, dysgeuzia

Veľmi zriedkavé: hypotermia

Neznáme: syndróm spánkového apnoe*, encefalopatia

* Pri podávaní baklofénu vo vysokých dávkach (≥ 100 mg) sa u pacientov závislých od alkoholu pozorovali prípady centrálného syndrómu spánkového apnoe.

Poruchy oka

Časté: poruchy akomodácie, vizuálne poruchy

Poruchy srdca a srdcovej činnosti

Časté: znížený srdcový výdaj

Poruchy ciev

Časté: hypotenzia

Poruchy gastrointestinálneho traktu

Veľmi časté: nauzea
Časté: zažívacie problémy, grganie, vracanie, zápcha, hnačka
Zriedkavé: abdominálna bolesť

Poruchy pečene a žlčových ciest

Zriedkavé: abnormálna funkcia pečene

Poruchy kože a podkožného tkaniva

Časté: hyperhidróza, vyrážka
Neznáme: urtikária

Poruchy obličiek a močových ciest

Časté: polyúria, enuréza, dysúria
Zriedkavé: retencia moču

Poruchy reprodukčného systému a prsníkov

Zriedkavé: erektilná dysfunkcia

U niektorých pacientov sa objavili spasticita ako paradoxná reakcia na liečbu. Nežiaduci stupeň svalovej hypotónie – spôsobujúci problémy pacientom pri chôdzi alebo starostlivosti o seba – sa môže objaviť a môže sa obvykle zmierniť po opakovanej úprave dávkovania (napr. znížením dávok podávaných počas dňa a možným zvýšením večernej dávky).

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na

Štátny ústav pre kontrolu liečiv

Sekcia klinického skúšania liekov a farmakovigilancie

Kvetná ul. 11

SK-825 08 Bratislava 26

Tel: + 421 2 507 01 206

e-mail: neziaduce.ucinky@sukl.sk

Tlačivo na hlásenie nežiaduceho účinku je na webovej stránke www.sukl.sk v časti Bezpečnosť liekov/Hlásenie o nežiaducich účinkoch

Formulár na elektronické podávanie hlásení: <https://portal.sukl.sk/eskadra/>

4.9 Predávkovanie

Symptómy

Výrazné sú znaky centrálného nervového útľmu alebo encefalopatie: ospalosť, porucha vedomia, útľm dýchania, kóma a tinitus.

Môžu sa tiež vyskytnúť: zmätenosť, halucinácie, agitácia, konvulzie, abnormálne výsledky elektroencefalogramu (vzorec potlačenia výkyvov (*burst suppression pattern*, *BSP*) a trifázické vlny, generalizované spomalenie na EEG), porucha akomodácie, narušený pupilárny reflex; generalizovaná svalová hypotónia, myoklónia, hyporeflexia alebo areflexia; periférna vazodilatácia, hypotenzia alebo hypertenzia, bradykardia alebo tachykardia, či srdcová arytmia; hypotermia; nevoľnosť, vracanie, hnačka, hypersekrécia slín; zvýšená hladina pečenejých enzýmov, spánkové apnoe, rabdomyolýza. U pacientov s renálnou poruchou sa môžu objaviť príznaky predávkovania aj po nízkej perorálnej dávke baklofenu (pozri časti 4.2 a 4.4).

Zhoršenie stavu sa môže objaviť, ak sa rôzne látky alebo lieky ovplyvňujúce centrálny nervový systém (napr. alkohol, diazepam, tricyklické antidepresíva) užívajú v rovnaký čas.

Liečba

Nie je známe žiadne špecifické antidotum.

Podporné opatrenia a symptomatickú liečbu treba začať pri komplikáciách ako sú hypotenzia, hypertenzia, kŕče, respiračný alebo kardiovaskulárny útlm.

Po požití potenciálne toxického množstva treba zvážiť podanie aktívneho uhlia. V krátkom čase po požití možno zvážiť podanie aktívneho uhlia u dospelých, ktorí požili viac ako 100 mg baklofenu počas 1 hodiny a u detí, ktoré požili viac ako 5 mg/kg baklofenu počas 1 hodiny.

Dekontaminácia žalúdka (napr. výplach žalúdka) možno zvážiť v individuálnych prípadoch, zvlášť v krátkom čase (60 minút) po požití potenciálne život ohrozujúcej dávky. Komatóznych alebo konvulzívnych pacientov treba intubovať pred začiatkom dekontaminácie žalúdka.

Keďže liek sa vylučuje prevažne obličkami, potrebné je podať dostatočné množstvo tekutín, najlepšie spolu s diuretikami. Hemodialýza (niekedy nevynútená) môže byť užitočná pri ťažkej otrave spojennej s renálnym zlyhaním (pozri časť 4.4). V prípade kŕčov treba opatrne podať intravenózne diazepam.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Myorelaxanciá. Centrálne pôsobiace myorelaxanciá.
ATC kód: M03BX01

Baklofén je protispazmové liečivo pôsobiace na úrovni miechy. Derivát kyseliny gama-aminomaslovej (GABA), baklofén, chemicky nesúvisí s inými antispazmatickými liekmi.

Baklofén znižuje monosynaptickú a polysynaptickú transmisiu reflexov, prevažne stimuláciou GABA_B-receptorov, a táto stimulácia zase inhibuje uvoľnenie dráždivých aminokyselín glutamátu a aspartátu. Neuromuskulárna blokáda nie je ovplyvnená baklofénom.

Hlavný prínos baklofenu vychádza z jeho schopnosti znižovať bolestivý spazmus flexorů a spontánneho klonusu, čím sa uľahčuje mobilita pacienta, zvyšuje sa jeho samostatnosť a napomáha pri rehabilitácii.

Baklofén tiež vykazuje antinociceptívny účinok. K celkovej výhode prispieva aj fakt, že dochádza k zlepšeniu stavu a menšej sedácii, ako pri iných centrálne pôsobiacich liečivách.

Baklofén stimuluje sekréciu žalúdočnej kyseliny.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia

Baklofén sa rýchlo a úplne absorbuje z gastrointestinálneho traktu. Nezaznamenal sa významný rozdiel medzi liekovou formou vo forme tekutiny a tabliet s ohľadom na t_{max} , C_{max} a biodostupnosť. Po perorálnom podaní jednorazových dávok (10-30 mg) sa maximálne plazmatické koncentrácie dosahujú v priebehu 0,5 až 1,5 hodiny a plochy pod krivkou koncentrácie sú proporcionálne k dávke.

Distribúcia

Distribučný objem baklofenu je 0,7 l/kg a na proteíny sa viaže približne 30 %. Koncentrácia liečiva v mozgovomiešnom moku je približne 8,5krát vyššia ako v plazme.

Biotransformácia

Baklofén sa metabolizuje len v malej miere. Deamináciou vzniká hlavný metabolit, β -(p-chlorofenyl)-4-hydroxymaslová kyselina, ktorá je farmakologicky inaktívna.

Eliminácia

Plazmatický polčas eliminácie baklofenu je v priemere 3 až 4 hodiny. Miera väzby na sérové proteíny je približne 30 %.

Baklofén sa eliminuje vo veľkej miere v nezmenenej forme. Do 72 hodín sa približne 75 % dávky vylúči obličkami a približne 5 % z tohto množstva vo forme metabolitov.

Starší pacienti

Farmakokinetika baklofenu u starších pacientov je veľmi podobná ako u mladších subjektov. Maximálna plazmatické koncentrácie baklofenu i starších pacientov sú mierne nižšie a objavujú sa neskôr ako u zdravých mladých dobrovoľníkov, ale hodnoty AUC boli podobné u oboch skupín.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Baklofen zvyšuje výskyt pupočníkovej prietrže (brušná hernia) u plodov potkanov, ktorým sa podávali približne 13krát vyššie dávky (mg/kg) ako sú maximálne odporúčané dávky u ľudí. Nepozorovalo sa to u myši alebo králikov.

Zrejme od dávky závislý zvýšený výskyt ovariálnych cýst a menej významný nárast zväčšených a/alebo hemoragických nadobličiek sa pozoroval u samičiek potkanov liečených počas 2 rokov. Klinický význam týchto zistení nie je známy.

Podľa doteraz získaných experimentálnych údajov sa predpokladá, že baklofen nemá karcinogénne ani mutagénne vlastnosti.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

monohydrát laktózy
zemiakový škrob
želatína
mastenec
stearát horečnatý
etylcelulóza

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

3 roky

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajú sa na suchom mieste pri teplote do 25 °C, chránia sa pred svetlom.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Tablety sú balené v polyetylénových fľaškách s ochranným krúžkom. Vonkajší obal - papierová škatuľka, písomná informácia pre používateľa.
Veľkosť balenia: 50 tabliet

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu

Všetok nepoužitý liek alebo obsah vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

Pharmaceutical Works POLPHARMA S.A.

ul. Pelplińska 19
83-200 Starogard Gdański, Poľsko

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLA

BACLOFEN – POLPHARMA 10 mg: 63/0102/81-C/S

BACLOFEN – POLPHARMA 25 mg: 63/0562/12-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE /PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 30. december 1981

Dátum posledného predĺženia registrácie: 15. august 2007

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

05/2025