

ИНСТРУКЦИЯ ПО ПРИМЕНЕНИЮ

Баклосан
Baclosan

Торговое наименование

Баклосан

Международное непатентованное название

Баклофен (*Baclofen*)

Лекарственная форма

Таблетки

СОСТАВ

1 таблетка содержит:

активное вещество: баклофен 10 мг или 25 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, картофельный крахмал, желатин, тальк, магния стеарат, этилцеллюлоза.

Описание

Баклосан 10 мг: таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с разделяющей риской. Таблетки можно делить пополам.

Баклосан 25 мг: таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

Миорелаксанты центрального действия.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Баклофен уменьшает повышенный мышечный тонус, обусловленный повреждением спинного мозга. Препарат одновременно и в равной степени угнетает кожные рефлексы и тонус мышц, при этом только в малой степени снижает амплитуду сухожильных рефлексов.

Механизм этого действия состоит, по всей видимости, в гиперполяризации восходящих нервов и торможении как моно-, так и полисинаптических рефлексов на уровне спинного мозга.

В экспериментах на животных баклофен ускорял метаболизм допамина, однако у людей, под влиянием препарата, концентрация ацетата 5-гидроксииндола или метаболитов допамина в спинномозговой жидкости не изменялась.

Так как баклофен, применяемый в высоких дозах, может вызывать угнетение функций ЦНС, то существует вероятность действия препарата на центры, находящиеся выше спинного мозга.

Баклофен также уменьшает болевую чувствительность. Улучшение таким образом общего самочувствия пациента и успокоение является менее затруднительным, чем при применении лекарственных средств, оказывающих влияние на ЦНС.

Баклофен стимулирует секрецию желудочного сока.

Фармакокинетика

Всасывание

Баклофен быстро и почти полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта.

Степень всасывания уменьшается при назначении высших доз.

Терапевтическая концентрация составляет 80-395 нг/мл.

В экспериментах на животных выявлено, что баклофен распределяется во многих тканях, но только небольшая его часть проникает через гематоэнцефалический барьер. У пациентов максимальная концентрация C_{max} (500-600 нг/мл) достигается через 2-3 часа после приема, а концентрация свыше 200 нг/мл сохраняется на протяжении 8 часов.

Распределение

Баклофен проникает через плацентарный барьер.

Минимальное количество препарата выделяется с грудным молоком.

Объем распределения баклофена составляет 0,7 л/кг, а связывается с белками плазмы приблизительно на 30%. В спинномозговой жидкости концентрация действующего вещества в 8,5 раза меньше, чем в сыворотке.

Биотрансформация

Примерно 15% принятой дозы подвергается биотрансформации в печени за счет дезаминирования.

Выведение

Период полувыведения составляет от 2,5 до 4 часов.

Баклофен выводится с мочой, в 70-80% в неизменном виде или в форме метаболитов.

Остальная часть выводится с калом.

При применении внутрь баклофен выводится почти полностью в течение 72 часов.

Пациенты пожилого возраста

Фармакокинетика у пациентов пожилого возраста практически такая же, как и у взрослых. Максимальная концентрация баклофена в плазме незначительно ниже, чем у здоровых, молодых лиц, но показатель AUC является подобным в обеих группах пациентов.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Спастические состояния при:

- рассеянном склерозе;
- других повреждениях спинного мозга (например: опухоли спинного мозга, сирингомиелия, болезнь двигательного нейрона, поперечный миелит, травмы спинного мозга);
- мозговых инсультах;
- церебральном параличе;
- воспалении оболочек спинного и головного мозга;
- травмах головы.

Дети и подростки в возрасте до 18 лет

Баклофен применяют у детей и подростков в возрасте до 18 лет в симптоматическом лечении спастических состояний церебрального генеза, а именно, возникших в результате детского церебрального паралича, а также церебральных сосудистых инцидентов вследствие новообразований или заболеваний головного мозга дегенеративного генеза.

Баклофен также показан при симптоматическом лечении мышечной спастичности, возникшей в результате инфекции и заболеваний спинного мозга, дегенеративных изменений, травм, новообразований и поражения неизвестного происхождения, такого как рассеянный склероз, амиотрофический боковой склероз, сирингомиелия, поперечный миелит, травматическое поражение или нижний парапарез или компрессия спинного мозга.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Врач устанавливает дозу индивидуально с целью определения наименьшей эффективной дозы, не вызывающей побочных эффектов.

Препарат следует принимать во время еды.

До начала лечения следует оценить, в какой степени наступит улучшение общего состояния пациента после применения баклофена. Следует с осторожностью увеличивать дозу препарата (особенно у лиц старше 65 лет) до нормализации общего состояния пациента. Если будет применена слишком высокая начальная доза или повышение дозы наступит быстро, то могут проявиться побочные эффекты. Это особенно важно в случае ходящих пациентов с целью уменьшения ослабления мышц в здоровых конечностях или когда необходимо достичь снижения мышечного напряжения.

Если применяются максимальные рекомендуемые дозы, а в течение 6 недель лечения терапевтический эффект не будет достигнут, врач должен решить вопрос о продолжении лечения баклофеном.

Рекомендуется следующая схема дозирования:

Взрослые

Лечение начинают с суточной дозы – 15 мг разделенных на несколько равных приемов.

- В первые 3 дня по 5 мг (½ таблетки 10 мг) 3 раза в сутки,
- в течение следующих 3 дней по 10 мг (1 таблетка 10 мг) 3 раза в сутки,
- в последующие 3 дня по 15 мг (1½ таблетки 10 мг) 3 раза в сутки,
- в течение следующих 3 дней по 20 мг (2 таблетки 10 мг) 3 раза в сутки.

У большинства пациентов терапевтический эффект наступает при дозе 30 мг до 75 мг в сутки.

Вышеуказанный режим применения обеспечивает хорошую переносимость препарата.

При необходимости дозу можно с осторожностью увеличивать.

У пациентов, у которых необходимо применять большие дозы препарата (75 мг до 100 мг в сутки) можно применять баклофен в форме таблеток по 25 мг.

Не следует превышать дозу более 100 мг в сутки.

Продолжительность лечения зависит от клинического состояния пациента.

Не следует внезапно прекращать лечение баклофеном из-за опасности появления галлюцинаций и обострения спастических состояний.

Пациенты пожилого возраста

У пожилых пациентов дозу препарата следует увеличивать с особой осторожностью в связи с повышенным риском возникновения побочных эффектов.

Дети и подростки в возрасте до 18 лет

Лечение следует начать с очень низкой дозы (что соответствует дозе в пересчете приблизительно 0,3 мг/кг массы тела), разделенных на 2-4 приема (лучше всего на 4 равные приема).

Дозу следует увеличивать с осторожностью, с интервалом одной недели, до достижения оптимального терапевтического эффекта у ребенка.

Обычно применяемая суточная доза поддерживающей терапии составляет от 0,75 до 2 мг/кг массы тела.

Максимальная суточная доза не должна превышать 40 мг у детей младше 8 лет. Для детей старше 8 лет максимальная суточная доза составляет 60 мг.

Баклофен в виде таблеток не следует назначать детям с массой тела менее 33 кг.

Пациенты с нарушением функции почек

У этих пациентов, а также у диализируемых пациентов рекомендуемые дозы следует уменьшить до 5 мг в сутки.

У пациентов в терминальной стадии почечной недостаточности баклофен может быть применен, когда потенциальная польза превышает риск. У таких пациентов следует проводить мониторинг симптомов раннего отравления (например, сонливость, кома).

Пациенты со спастическими состояниями церебрального происхождения

Побочные действия чаще всего наблюдаются в данной группе пациентов. Следует соответственно установить режим дозирования для этих пациентов, они должны находиться под тщательным врачебным наблюдением.

Пропуск приема дозы препарата Баклосан

В случае пропуска приема дозы препарата, следует принять ее как можно быстрее. Если уже наступило время приема следующей дозы препарата, не следует принимать пропущенную дозу. Не следует принимать двойную дозу с целью восполнения пропущенной дозы.

Прекращение приема препарата Баклосан

Не следует внезапно прерывать лечение или самому изменять дозировку препарата без консультации у врача.

Дозу препарата Баклосан следует уменьшать постепенно, в течение 1-2 недель.

Внезапная отмена препарата Баклосан связана с риском появления нежелательных эффектов, таких как: судороги, беспокойство, страх, галлюцинации, нарушения настроения и психическое расстройство, повышенный мышечный тонус, лабильность настроения.

В случае каких-либо сомнений, связанных с применением этого препарата, необходимо обратиться к врачу.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Повышенная чувствительность к баклофену или к какому-либо вспомогательному веществу лекарственного препарата.

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Психические расстройства и нарушения со стороны нервной системы

Порфирия, алкоголизм в анамнезе гипертензия, психотические расстройства, шизофренические депрессивные или маниакальные расстройства, спутанные состояния или болезнь Паркинсона могут обостриться при лечении препаратом Баклосан. Следовательно, применять препарат у пациентов, страдающих этими заболеваниями, следует с осторожностью, при этом необходимо внимательно наблюдать за их состоянием.

Имеются сообщения о случаях развития суицидальных и суицид-ассоциированных состояний у пациентов, получающих терапию баклофеном. В большинстве случаев у пациентов имелись дополнительные факторы повышенного риска самоубийства, включая злоупотребление алкоголем, депрессию и/или предыдущие попытки самоубийства в анамнезе. Медикаментозная терапия должна сопровождаться тщательным наблюдением пациентов с дополнительными факторами риска суицида. Пациенты (и лица, осуществляющие уход за пациентами) должны быть предупреждены о необходимости выявлять возможное клиническое ухудшение, суицидальное поведение и мысли, необычные изменения поведения и немедленно обращаться за медицинской помощью при наличии подобных симптомов.

Сообщалось о случаях злоупотребления (преднамеренного или непреднамеренного) и зависимости от баклофена. Следует проявлять осторожность при лечении пациентов со злоупотреблением психоактивными веществами в анамнезе, кроме того такие пациенты должны находиться под наблюдением для выявления симптомов злоупотребления (преднамеренного или непреднамеренного) и зависимости от баклофена, таких как увеличение дозы, образ жизни, связанный с зависимостью от психоактивных веществ, развитие толерантности.

Энцефалопатия

Сообщалось о случаях энцефалопатии у пациентов, получавших баклофен в терапевтических дозах, которые были обратимы после прекращения лечения. Симптомы включали сонливость, снижение уровня сознания, спутанность сознания, миоклонус и кому.

При появлении признаков энцефалопатии прием баклофена следует прекратить.

Эпилепсия

Пациенты с эпилепсией, которым необходима одновременная терапия баклофеном, требуют постоянного клинического наблюдения и выполнения ЭЭГ, поскольку отмечено уменьшение эффективности применяемых противосудорожных препаратов и изменения в картине ЭЭГ.

Прочие

Следует проявлять осторожность при применении баклофена у пациентов, у которых поддержание вертикального положения тела и равновесия или увеличение амплитуды движений зависит от выраженного мышечного напряжения.

Препарат Баклосан необходимо назначать с особой осторожностью у пациентов, применяющих антигипертензивные препараты (возможно возникновение взаимодействий).

Препарат следует с осторожностью применять у пациентов с инсультом, нарушениями дыхательной системы, нарушениями функции печени.

Нарушения дыхательной системы

У пациентов, применяющих баклофен повышается риск развития дыхательной депрессии. Следует проводить тщательный мониторинг сердечной деятельности и дыхательной системы, особенно у пациентов с сопутствующими заболеваниями кровеносной и дыхательной системы и со слабостью дыхательной мускулатуры.

Нарушения со стороны почек

Баклофен следует использовать с осторожностью у пациентов с почечной недостаточностью, а применение препарата у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности возможно только, если предполагаемая польза превосходит потенциальный риск (смотри раздел «Способ применения и дозы»). Симптомы Неврологические признаки и симптомы передозировки, включая клинические проявления токсической энцефалопатии (например, спутанность сознания, дезориентация, сонливость и сниженный уровень сознания), наблюдались у пациентов с почечной недостаточностью, получавших пероральные дозы баклофена более 5 мг в сутки. Пациенты с нарушенной функцией почек должны находиться под тщательным наблюдением для быстрого диагностирования ранних симптомов токсичности. Особая осторожность необходима при использовании баклофена в комбинации с лекарственными препаратами или медицинскими продуктами, которые могут значимо влиять на функцию почек. Следует тщательно контролировать функцию почек, и суточную дозу баклофена необходимо корректировать соответствующим образом для предотвращения токсичности препарата.

Нарушения со стороны мочевыводящих путей

Следует проявлять осторожность у пациентов с повышенным тонусом сфинктера мочевого пузыря (возможна задержка мочеиспускания). Улучшение состояния после применения баклофена наблюдается у пациентов с нейрогенным нарушением опорожнения мочевого пузыря.

Лабораторные исследования

У некоторых пациентов в ходе лечения баклофеном, наблюдалось повышение активности аспаратаминотрансферазы, щелочной фосфатазы и увеличение уровня глюкозы в сыворотке. Рекомендуется проводить лабораторные исследования, особенно у пациентов с нарушением функции печени и больных сахарным диабетом.

Внезапная отмена

Препарат следует всегда (за исключением случаев, когда возникают серьезные нежелательные эффекты) отменять постепенно, последовательно снижая дозу в течение примерно 1-2 недель. При быстрой отмене препарата Баклосан, особенно после длительного применения, сообщалось о таких проявлениях синдрома отмены, как тревожное состояние и спутанность сознания, бред, галлюцинации, психотическое расстройство, маниакальное состояние или паранойя, судороги (эпилептический статус), дискинезия, тахикардия, гипертермия, рабдомиолиз и временное усиление спастичности.

Пациенты старше 65 лет

Следует соблюдать особую осторожность при лечении пациентов пожилого возраста (повышение риска возникновения побочных эффектов).

Применение у детей в возрасте до 1 года

Имеются ограниченные клинические данные, касающиеся применения баклофена у детей в возрасте до 1 года.

Применение баклофена в данной возрастной группе должно основываться на индивидуальной оценке соотношения пользы и риска терапии.

Отмечено появление судорог у новорожденных после внутриматочной экспозиции баклофена.

Вспомогательные вещества

Препарат Баклосан содержит лактозы моногидрат. В связи с этим он не должен применяться у пациентов с редкой наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы (типа Лаппа) или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы.

Применение во время беременности и в период кормления грудью

Отсутствуют контролируемые исследования с применением препарата Баклосан у беременных женщин. Баклофен проникает через плацентарный барьер.

Препарат Баклосан может быть применен во время беременности (особенно в первом триместре беременности) только в том случае, если по мнению врача польза для матери превышает возможный риск повреждения плода.

Отмечен один случай синдрома отмены (судороги) у семидневного новорожденного, мать которого принимала баклофен в дозе 80 мг в сутки в период беременности. Судороги, которые пробовали лечить стандартными противосудорожными препаратами, исчезли спустя 30 минут после введения баклофена.

Баклофен, принимаемый в терапевтических дозах, выделяется с грудным молоком, но в так малых количествах, что не ожидается появления нежелательных действий у новорожденного.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и обслуживать механизмы

Баклофен может оказывать успокаивающее действие и снижать концентрацию внимания.

Пациенты в период лечения препаратом Баклосан не должны управлять транспортными средствами и обслуживать механизмы, а также заниматься другой опасной деятельностью.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

Одновременное применение баклофена с другими препаратами, действующими на ЦНС, синтетическими опиатами или с алкоголем, усиливает их седативное действие.

Баклофен может усиливать гиперкинезию у пациентов, принимающих одновременно соли лития.

Трициклические антидепрессанты могут потенцировать действие баклофена и значительно снизить мышечный тонус.

Баклофен потенцирует действие антигипертензивных средств (может быть необходима коррекция дозирования).

Лекарственные препараты, влияющие на функцию почек (например, ибупрофен), замедляют выведение баклофена, что является причиной возникновения симптомов отравления.

У пациентов с болезнью Паркинсона, принимающих препараты с леводопой и карбидопой, в случае сочетанного применения с баклофеном, возможно возникновение состояния спутанности сознания, галлюцинаций и психического возбуждения.

Баклофен продлевает анальгезию, вызванную фентанилом.

ПОБОЧНЫЕ ДЕЙСТВИЯ

Как каждый лекарственный препарат, Баклосан может оказывать побочные действия, хотя не у каждого они возникнут.

Нежелательные эффекты чаще всего наблюдаются в начале лечения (например, успокоение, сонливость и тошнота), во время быстрого повышения дозы или применения высоких доз баклофена, а также у пациентов пожилого возраста. В основном, они имеют преходящий характер и исчезают после снижения дозы. В случае тяжелых побочных действий возникает необходимость отмены препарата. Если тошнота удерживается после уменьшения дозы, рекомендуется применять баклофен с пищей или запивать молоком.

У пациентов с психическим заболеванием в анамнезе или цереброваскулярными заболеваниями (например, инсульт), а также у пациентов пожилого возраста нежелательные эффекты могут протекать с более серьезными последствиями.

У некоторых пациентов наблюдалось повышение спастичности (парадоксальная реакция на действие препарата).

Нежелательная степень мышечного напряжения, создающая для пациентов трудности при ходьбе или при самостоятельном передвижении, которая может наступить, обычно проходит после корректировки дозирования (например, путем уменьшения доз, применяемых в течение дня, но увеличения дозы вечернего приема).

При применении баклофена наблюдались следующие нежелательные эффекты, которые сгруппированы по частоте проявления: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); редко ($\geq 1/10\ 000$, но $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10\ 000$); частота неизвестна (на основании доступных данных частота не может быть определена).

Нарушения со стороны психики

Очень часто: спутанность сознания

Часто: бессонница, дезориентация, эйфория, возбуждение, депрессия, галлюцинации, кошмарные сновидения, снижение судорожной готовности и увеличение числа судорожных приступов, особенно у пациентов с эпилепсией

Нарушения со стороны нервной системы

Очень часто: сонливость, успокоение

Часто: дыхательная депрессия, чувство пустоты в голове, усталость, головная боль, атаксия

Редко: парестезии, нарушение речи, расстройство вкуса

Частота неизвестна: затруднение дыхания во время сна (синдром апноэ во время сна), энцефалопатия

Нарушения со стороны органа зрения

Часто: нарушение зрения, расстройство аккомодации, нистагм

Нарушения со стороны сердца

Редко: снижение минутного объема сердца, чувство удушья, учащенное сердцебиение, боль в грудной клетке

Нарушения со стороны сосудов

Часто: снижение кровяного давления

Редко: обморок, отеки стоп

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Очень часто: тошнота

Часто: сухость во рту, расстройство вкуса, отвращение к пище, рвотные позывы, рвота, запор, диарея

Редко: боли в животе

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Редко: нарушения функции печени

Нарушения со стороны кожи и подкожной ткани

Часто: сыпь, повышенное потоотделение

Частота неизвестна: зуд, крапивница

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

Часто: мышечная слабость, мышечное дрожание, боль в мышцах

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Часто: полиурия, непроизвольное мочеиспускание, болезненное мочеиспускание

Редко: задержка мочеиспускания, ночной энурез, гематурия

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы

Редко: нарушение эякуляции, нарушение эрекции, импотенция

Нарушения со стороны эндокринной системы

Частота неизвестна: увеличение массы тела

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко: угнетение дыхания

Частота неизвестна: чувство заложенности в носу

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Часто: слабость, ощущение усталости, истощение

Очень редко: гипотермия

Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований

Частота неизвестна: положительный результат анализа на скрытую кровь в кале

В случае усиления какой-либо из нежелательных реакций или появления каких-либо нежелательных явлений, не описанных в этой инструкции, следует сообщить о них врачу или фармацевту.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

В случае передозировки препаратом следует немедленно обратиться к врачу или в ближайшее приемное отделение больницы.

Характерными признаками передозировки являются угнетение центральной нервной системы или энцефалопатия: сонливость, снижение уровня сознания, угнетение дыхания, кома и шум в ушах. Также возможны: спутанность сознания, галлюцинации, возбуждение, судороги, аномалии электроэнцефалограммы (подавление всплесков и трехфазных волн, общее замедление ЭЭГ), нарушение аккомодации, нарушение зрачкового рефлекса; общая мышечная гипотония, миоклония, гипорефлексия или арефлексия; судороги; расширение периферических сосудов, гипотензия или гипертензия, брадикардия или тахикардия, или сердечная аритмия; гипотермия; тошнота, рвота, диарея, гиперсекреция слюны; повышение активности печеночных ферментов, апноэ во сне, рабдомиолиз.

ФОРМА ВЫПУСКА И УПАКОВКА

По 50 таблеток полиэтиленовую банку, с полиэтиленовой крышкой с контролем первого вскрытия. Банку вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить в оригинальной упаковке для защиты от влаги и света, при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

Срок годности 3 года.

Не применять препарат после истечения срока годности.

Срок годности обозначает последний день указанного месяца.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Группа фармацевтического продукта I, отпускается по рецепту формы №2.

ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ И ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

Фармацевтический завод «ПОЛЬФАРМА» АО

ул. Пельплиньска 19, 83-200 Старогард Гданьски, Польша