



1. NAZWA WŁASNA PRODUKTU LECZNICZEGO

Baclofen Polpharma 10 mg tabletki
Baclofen Polpharma 25 mg tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 tabletkę zawiera 10 mg lub 25 mg baklofenu (*Baclofenum*).
Substancja pomocnicza: laktoza, odpowiednio 60 mg lub 50 mg.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki.

Baclofen Polpharma 10 mg: białe, okrągłe, obustronnie wypukłe tabletki z kreską dzielącą.
Tabletki można podzielić na połowy.

Baclofen Polpharma 25 mg: tabletki białe, okrągłe, obustronnie wypukłe.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Stany spastyczne występujące w przebiegu:

- stwardnienia rozsianego;
- innych uszkodzeń rdzenia kręgowego (np. guzy rdzenia kręgowego, jamistość rdzenia, choroby neuronów ruchowych, poprzeczne zapalenie rdzenia kręgowego, urazy rdzenia kręgowego);
- udarów naczyniowych mózgu;
- porażenia mózgowego;
- zapalenia opon mózgowo – rdzeniowych;
- urazów głowy.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkę należy ustalać indywidualnie, aby określić najmniejszą skuteczną dawkę nie wywołującą objawów niepożądanych.

Lek należy przyjmować w czasie posiłków.

Zaleca się następujący schemat dawkowania:

Dorośli

Przez pierwsze 3 dni 5 mg (pół tabletki 10 mg) 3 razy na dobę,
przez następne 3 dni 1 tabletkę 10 mg 3 razy na dobę,
przez kolejne 3 dni 1½ tabletki 10 mg 3 razy na dobę,
przez kolejne 3 dni 2 tabletki 10 mg 3 razy na dobę.

U większości pacjentów skuteczne działanie występuje po dawce 30 mg do 75 mg na dobę.
Taki sposób dawkowania zapewni dobrą tolerancję leku.

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15

W razie potrzeby dawkę można bardzo ostrożnie zwiększać.

U pacjentów wymagających większych dawek (75 mg do 100 mg na dobę), można stosować baklofen w postaci tabletek 25 mg.

Nie należy stosować dawki większej niż 100 mg na dobę.

Czas leczenia zależy od stanu klinicznego pacjenta.

Nie należy nagle przerywać leczenia baklofenem z uwagi na możliwość wystąpienia omamów i zaostrzenia stanów spastycznych.

Pacjenci w podeszłym wieku

U pacjentów w podeszłym wieku dawkę leku należy zwiększać ze szczególną ostrożnością, z uwagi na większe ryzyko wystąpienia działań niepożądanych.

Dzieci

Zwykle stosuje się 0,75 do 2 mg/kg masy ciała.

Zaleca się następujące dawkowanie:

u dzieci w wieku	od 12 miesięcy do 2 lat:	10 do 20 mg na dobę;
	od 2 do 6 lat:	20 do 30 mg na dobę;
	od 6 do 10 lat:	30 do 60 mg na dobę.

U dzieci powyżej 10 lat maksymalna dawka dobową wynosi 2,5 mg/kg mc.

Leczenie rozpoczyna się od dawki 5 mg podawanej 2 razy na dobę.

W razie potrzeby dawkę można ostrożnie zwiększać co 3 dni, aż do uzyskania odpowiedniej skuteczności.

Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek

U tych pacjentów, a także u pacjentów poddawanych dializie, zalecane dawki leku należy zmniejszyć do 5 mg na dobę.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na baklofen lub którąkolwiek substancję pomocniczą produktu.

Choroba wrzodowa żołądka i dwunastnicy.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Podczas leczenia baklofenem zaostrzeniu ulegają zespoły psychiatryczne, schizofrenia, stany drgawkowe i stany splątania. U pacjentów w takich stanach lek należy stosować ostrożnie, a pacjent powinien pozostać pod ścisłą obserwacją lekarza.

Po nagłym odstawieniu mogą wystąpić stany lękowe, stany splątania, omamy, stany psychiatryczne, maniakalne, paranoidalne i drgawkowe, oraz mogą się nasilić stany spastyczne, dlatego dawkę leku należy zmniejszać stopniowo w czasie 1-2 tygodni.

Baklofen wydalany jest z moczem, głównie w postaci niezmienionej, dlatego należy go stosować ostrożnie u pacjentów z zaburzeniami czynności nerek. U tych pacjentów dawkę należy odpowiednio zmniejszyć.

Należy zachować szczególną ostrożność podczas leczenia pacjentów w podeszłym wieku (zwiększone ryzyko wystąpienia objawów niepożądanych).

Pacjenci z padaczką wymagający równoczesnego leczenia baklofenem powinni pozostawać pod stałą kontrolą kliniczną i EEG, ponieważ obserwowano zmniejszenie skuteczności leków przeciwdrgawkowych i zmiany w zapisie EEG.

Należy zachować ostrożność podczas leczenia baklofenem pacjentów, u których utrzymanie pionowej pozycji ciała i równowagi lub zwiększenie zakresu ruchów uzależnione jest od wzmożonego napięcia mięśni.

Baclofen Polpharma należy stosować ze szczególną ostrożnością u pacjentów leczonych lekami obniżającymi ciśnienie krwi (możliwość wystąpienia interakcji).

Lek należy stosować ostrożnie u pacjentów z udarem mózgowym, zaburzeniami układu oddechowego, zaburzeniami czynności wątroby.

Lek należy stosować ostrożnie u pacjentów ze zwiększonym napięciem zwieracza pęcherza moczowego (może wystąpić zatrzymanie moczu).

U niektórych pacjentów leczonych baklofenem obserwowano zwiększenie aktywności AspAT, fosfatazy alkalicznej i zwiększenie stężenia glukozy w surowicy. Wskazane jest wykonanie badań laboratoryjnych, szczególnie u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby i z cukrzycą.

Produkt leczniczy zawiera laktozę, dlatego nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy (typu Lappa) lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Baklofen stosowany równocześnie z innymi lekami działającymi na ośrodkowy układ nerwowy lub z alkoholem, nasila ich działanie uspokajające.

Baklofen może nasilić nadczynność ruchową u pacjentów stosujących równocześnie sole litu.

Trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne mogą nasilać działanie baklofenu i zmniejszyć w znacznym stopniu napięcie mięśniowe.

Baklofen nasila działanie leków obniżających ciśnienie krwi (może powodować konieczność zmiany dawkowania).

Leki, które mogą spowodować niewydolność nerek (np. ibuprofen), opóźniają wydalanie baklofenu, co jest przyczyną wystąpienia działań toksycznych.

W przypadku równoczesnego zastosowania baklofenu u pacjentów z chorobą Parkinsona leczonych preparatami lewodopy z karbidopą, mogą wystąpić stany splątania, omamy i pobudzenie.

Baklofen przedłuża analgezję wywołaną przez fentanyl.

4.6 Ciąża lub laktacja

W badaniach na szczurach, którym podawano baklofen w dawce około 13-krotnie większej niż zalecana maksymalna dawka dla ludzi, częściej występowała przepuklina pępkowa u płodów.

Nie obserwowano działania teratogennego u myszy i królików, ale opisano zmniejszenie masy płodu i zaburzenia kostnienia szkieletu płodów myszy, które otrzymywały baklofen w dawkach dobowych 17- lub 34-krotnie większych od dawek stosowanych u ludzi.

W innych badaniach przeprowadzonych u samic szczurów, które otrzymywały baklofen przez 2 lata, obserwowano zależne od dawki zmiany w obrębie jajników.

Baklofen przenika przez łożysko.

Brak kontrolowanych badań z zastosowaniem leku u kobiet w ciąży.

Produkt Baclofen Polpharma może być stosowany w czasie ciąży tylko wtedy, jeśli, zdaniem lekarza, korzyści wynikające z leczenia matki przewyższają ewentualne ryzyko dla płodu.

Baklofen przenika do mleka kobiecego.

Nie zaleca się karmienia piersią w czasie przyjmowania leku.

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Baklofen może działać uspokajająco i osłabiać koncentrację.

Pacjenci w trakcie leczenia nie powinni prowadzić pojazdów mechanicznych ani obsługiwać maszyn w ruchu, a także wykonywać innych niebezpiecznych czynności.

4.8. Działania niepożądane

Działania niepożądane występują najczęściej podczas szybkiego zwiększania dawki lub zastosowania dużych dawek baklofenu, a także u pacjentów w podeszłym wieku.

Są one najczęściej przemijające i ustępują po zmniejszeniu dawki. Ciężkie objawy niepożądane powodują konieczność odstawienia leku.

Po baklofenie obserwowano następujące objawy niepożądane:

(częstość występowania określono jako: bardzo często ($\geq 1/10$); często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często ($\geq 1/1000$ do $< 1/100$); rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1000$); bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$); częstość nieznana - nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Często: osłabienie, zmęczenie, wyczerpanie, hipotermia

Zaburzenia układu nerwowego

Bardzo często: senność, uspokojenie

Często: depresja oddechowa, uczucie pustki w głowie, bóle głowy, zawroty głowy, ataksja

Rzadko: parestezje, upośledzenie mowy

Zaburzenia psychiczne

Bardzo często: splątanie

Często: bezsenność, dezorientacja

Rzadko: euforia, pobudzenie, depresja, omamy, koszmary nocne, obniżenie progu drgawkowego i zwiększenie liczby napadów drgawkowych, szczególnie u pacjentów z padaczką

Zaburzenia żołądka i jelit

Bardzo często: nudności

Często: suchość w ustach, zaburzenia smaku, jadłowstręt, odruchy wymiotne, wymioty, zaparcia, biegunka

Rzadko: bóle brzucha

Częstość nieznana: dodatni wynik badania na krew utajoną w kale

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Rzadko: zaburzenia czynności wątroby

Zaburzenia serca

Rzadko: zmniejszenie pojemności minutowej serca, uczucie duszności, kołatanie serca, bóle w klatce piersiowej

Zaburzenia naczyniowe

Często: obniżenie ciśnienia krwi

Rzadko: omdlenia, obrzęk kostek

Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej

Często: osłabienie siły mięśniowej, bóle mięśni, drżenie

Zaburzenia oka

Często: zaburzenia widzenia, zaburzenia akomodacji, oczopląs

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Często: wysypka, nadmierna potliwość
Częstość nieznaną: świąd

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Często: wielomocz, mimowolne oddawanie moczu, bolesne oddawanie moczu
Rzadko: zatrzymanie moczu, moczenie nocne, krwiomocz

Zaburzenia układu rozrodczego i piersi

Rzadko: zaburzenia wytrysku, impotencja

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Częstość nieznaną: zwiększenie masy ciała

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Rzadko: zahamowanie oddechu

Częstość nieznaną: uczucie zatkania nosa.

U niektórych pacjentów obserwowano nasilenie stanów spastycznych (paradoksalna reakcja na lek).

4.9 Przedawkowanie

Po przedawkowaniu występują następujące objawy niepożądane ze strony ośrodkowego układu nerwowego: senność, utrata świadomości, śpiączka, zahamowanie oddechu.

Mogą też wystąpić inne objawy jak: stany splątania, omamy, pobudzenie, zaburzenia akomodacji, brak odruchu źrenic, hipotonia mięśni, drgawki kloniczne, zahamowanie lub brak odruchów, drgawki, rozszerzenie naczyń obwodowych, niedociśnienie, bradykardia, obniżenie temperatury ciała, nudności, wymioty, biegunka, nadmierne wydzielanie śliny, zwiększenie aktywności LDH, AspAT i AP.

Leczenie przedawkowania:

Brak swoistej odtrutki.

Należy jak najszybciej sprowokować wymioty lub wykonać płukanie żołądka oraz podać węgiel aktywowany.

Pacjenci w stanie śpiączki przed płukaniem żołądka powinni być intubowani.

Jeśli konieczne, należy podać sole przeczyszczające.

U pacjentów z zatrzymaniem oddechu należy zastosować sztuczne oddychanie a także leczenie podtrzymujące krążenie.

Według niektórych danych z piśmiennictwa, fizostygmina podana dożylnie w lżejszych zatruciach (1-2 mg podane w czasie 5-10 minut) likwiduje działania niepożądane ze strony ośrodkowego układu nerwowego, szczególnie senność i zahamowanie oddechu. W razie braku poprawy po pierwszej dawce, kolejną dawkę fizostygminy można podać po 30-60 minutach.

Należy również podawać płyny jednocześnie z lekami moczopędnymi, aby zwiększyć wydalanie baklofenu z moczem.

Jeśli występują drgawki, można bardzo ostrożnie zastosować dożylnie diazepam.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki zwiotczające mięśnie działające ośrodkowo

Kod ATC: M03BX01

Baklofen zmniejsza nadmierne napięcie mięśni szkieletowych spowodowane uszkodzeniem rdzenia kręgowego. Równocześnie i w równym stopniu hamuje odruchy skórne i napięcie mięśni, ale tylko w niewielkim stopniu obniża amplitudę odruchów ścięgniastych.

Mechanizm tego działania polega prawdopodobnie na hiperpolaryzacji wstępujących nerwów i hamowaniu odruchów zarówno mono- jak i polisynaptycznych na poziomie rdzenia kręgowego.

W badaniach na zwierzętach baklofen przyspieszał metabolizm dopaminy, ale u ludzi stężenie octanu 5-hydroksyindolu lub metabolitów dopaminy w płynie mózgowo - rdzeniowym nie zmieniało się pod wpływem leku.

Ponieważ baklofen stosowany w dużych dawkach może powodować zahamowanie czynności ośrodkowego układu nerwowego, sugeruje się, że lek może również działać na ośrodki leżące powyżej rdzenia kręgowego.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Baklofen wchłania się szybko i prawie całkowicie z przewodu pokarmowego.

Stopień wchłaniania zmniejsza się po zastosowaniu większych dawek.

Stężenie terapeutyczne wynosi 80 - 395 ng/ml.

W badaniach na zwierzętach wykazano, że baklofen rozmieszcza się w wielu tkankach; tylko niewielka ilość przenika barierę krew - mózg.

U pacjentów stężenie maksymalne C_{max} (500-600 ng/ml) osiągane jest po 2-3 godz. od chwili zastosowania, a stężenie powyżej 200 ng/ml utrzymuje się przez 8 godz.

Dystrybucja

Baklofen przenika przez barierę łożyskową.

Minimalna ilość przenika do mleka kobiecego.

Okolo 30% baklofenu wiąże się z białkami surowicy krwi.

Metabolizm

Okolo 15% przyjętej dawki ulega przemianie w wątrobie, w przebiegu dezaminacji.

Eliminacja

Okres półtrwania wynosi od 2,5 do 4 godzin.

Baklofen wydalany jest z moczem w 70-80%, w postaci niezmienionej lub metabolitów. Reszta wydalana jest z kałem.

Po doustnym zastosowaniu lek jest prawie całkowicie wydalany w ciągu 72 godz.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Toksyczność ostra

Badanie toksyczności ostrej (doustnej) przeprowadzono na myszach i szczurach (samice). Baklofen powodował zwióczenie mięśni i zanik reaktywności na bodźce zewnętrzne. Śmierć zwierząt następowała w ciągu 2 do 3 godzin po podaniu. LD_{50} dla samic szczurów po podaniu doustnym wynosiła 251 mg/kg mc., dla samic myszy 130 mg/kg mc.

Toksyczność podostna

Baklofen podawany szczurom *per os* w dawkach 12,5 mg/kg mc. i 25,1 mg/kg mc. w ciągu 6 tygodni hamował przyrost masy ciała oraz powodował spadek masy narządów wewnętrznych (wątroby i nerek).

W badaniach histopatologicznych nie stwierdzono zmian patomorfologicznych w wątrobie, sercu, nerkach i płucach.

Baklofen podawany myszom *per os* w dawkach 6,5 mg/kg mc. i 13 mg/kg mc. zmniejszał koordynację ruchową.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Laktoza

Skrobia ziemniaczana

Żelatyna

Talk
Magnezu stearynian
Etyloceluloza

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 25°C.
Przechowywać w oryginalnym opakowaniu w celu ochrony przed światłem i wilgocią.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Pojemnik polipropylenowy w tekturowym pudełku.
50 tabletek (1 pojemnik 50 szt.)

6.6 Instrukcja dotycząca przygotowania produktu leczniczego do stosowania i usuwania jego pozostałości

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Zakłady Farmaceutyczne POLPHARMA SA
ul. Pełplińska 19, 83-200 Starogard Gdański

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

10 mg: Pozwolenie nr R/0337
25 mg: Pozwolenie nr R/0338

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

12.04.1977 r./28.08.1990 r./09.03.1999 r./29.04.2004 r./29.04.2005 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15
2008-04-03