

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Баклофен, 10 мг, таблетки.

Баклофен, 25 мг, таблетки.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: баклофен.

Баклофен, 10 мг, таблетки.

Каждая таблетка содержит: 10 мг баклофена.

Баклофен, 25 мг, таблетки.

Каждая таблетка содержит: 25 мг баклофена.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Баклофен, 10 мг, таблетки.

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые. Таблетки 10 мг имеют делительную риску.

Таблетку можно разделить на равные дозы.

Баклофен, 25 мг, таблетки.

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Баклофен показан к применению у взрослых и детей старше 3-х лет.

Повышение мышечного тонуса при рассеянном склерозе, заболеваниях спинного мозга (опухоли, сирингомиелия, болезни двигательных мотонейронов, травмы, миелит), цереброваскулярных заболеваниях, церебральном параличе, менингите, черепно-мозговой травме.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Начальная доза препарата Баклофен у взрослых составляет 5 мг (1/2 таблетки по 10 мг) 3 раза в сутки, с последующим увеличением дозы каждые 3 дня на 5 мг до наступления терапевтического эффекта (обычно 30-75 мг в день).

Максимальная суточная доза составляет 100 мг.

Окончательная доза устанавливается таким образом, чтобы снижение мышечного тонуса не приводило к чрезмерной миастении и не ухудшало двигательные функции.

При повышенной чувствительности начальная суточная доза составляет 5-10 мг, с последующим более медленным увеличением.

У больных, требующих приема высоких доз баклофена (от 75 мг до 100 мг в день), следует применять препарат в таблетках по 25 мг.

После достижения максимальной рекомендуемой дозы, если терапевтический эффект не проявляется в течение 6-8 недель, принимается решение о продолжении лечения.

Удовлетворительный контроль симптомов обычно достигается при приеме доз до 60 мг в день, но часто необходима коррекция дозировки в соответствии с потребностями каждого отдельного пациента. Кроме того, некоторым пациентам рекомендуется применять баклофен только ночью, чтобы устранить болезненный мышечный спазм. Аналогичным образом, однократная доза, примененная примерно за 1 час до выполнения определенных действий, таких как умывание, одевание, бритье, физиотерапия, часто улучшает подвижность.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

У пациентов старше 65 лет дозу препарата следует увеличивать с осторожностью, в связи с повышением риска возникновения нежелательных реакций. Поэтому в начале лечения следует применять небольшие дозы, постепенно титруя дозу в зависимости от реакции, под тщательным наблюдением.

Пациенты с нарушением функции почек

При хронической почечной недостаточности и при проведении гемодиализа суточная доза 5 мг (1/2 таблетки по 10 мг).

Баклофен следует назначать пациентам с терминальной стадией почечной недостаточности только в том случае, когда ожидаемая польза для пациента превышает риски применения препарата, за этими пациентами следует тщательно наблюдать для быстрой диагностики ранних признаков и/или симптомов токсичности (например, сонливость, летаргии) (см. разделы 4.4 и 4.9).

Дети

Лечение обычно начинают с очень низкой дозы (соответствующей приблизительно 0,3 мг/кг в день), разделенной на 2-4 приема, предпочтительно на 4 приема. Дозу следует осторожно повышать с интервалом примерно в 1 неделю. Суточная доза для поддерживающей терапии колеблется от 0,75 до 2 мг/кг масс тела.

Максимальная суточная доза не должна превышать 40 мг/сут у детей в возрасте до 8 лет. Детям старше 8 лет может быть назначена максимальная суточная доза до 60 мг/сут. Таблетки баклофена не предназначены для применения у детей с массой тела менее 33 кг.

Способ применения

Внутрь.

Препарат принимают во время еды.

После достижения максимальной дозировки, если в течение 6-8 недель не наблюдается клинического улучшения, необходимо решить вопрос о необходимости дальнейшего применения баклофена.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к баклофену или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.
- Эпилепсия.
- Судороги (в т.ч. в анамнезе).
- Психозы.
- Болезнь Паркинсона.
- Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки.
- Дефицит лактазы.
- Непереносимость лактозы.
- Глюкозо-галактозная мальабсорбция.
- Беременность и период лактации.
- Детский возраст до 3 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- Цереброваскулярная недостаточность.
- Атеросклероз сосудов головного мозга.
- Хроническая почечная недостаточность.
- Пожилой возраст.
- Детский возраст до 12 лет.

Особые указания

Нежелательные реакции часто имеют транзиторный характер, их следует отличать от симптомов заболевания, по поводу которого проводится лечение: при сопутствующей эпилепсии лечение проводят без отмены противосудорожных средств.

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. 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. 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, 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.

Психические расстройства и расстройства нервной системы

Пациентам с психическими расстройствами, шизофренией, депрессией или манией, спутанностью сознания или болезнью Паркинсона следует проводить лечение с осторожностью и под тщательным наблюдением, поскольку вышеуказанные состояния могут ухудшиться под влиянием баклофена. Сообщалось о случаях самоубийства и связанных с ним событий у пациентов, принимавших баклофен. Следует внимательно следить во время терапии баклофеном за пациентами с дополнительными факторами риска, связанными с повышенным риском суицида, включая злоупотребление алкоголем, депрессию и/или предыдущие попытки суицида в анамнезе. Пациенты (и лица, осуществляющие уход за пациентами) должны быть предупреждены о возникновении клинического ухудшения, суицидального поведения, суицидальных мыслей или необычных изменений в поведении и необходимости немедленно обратиться к врачу в случае возникновения этих симптомов. Сообщалось о случаях неправильного применения, злоупотребления и возникновения зависимости от баклофена. У пациентов, злоупотребляющих психоактивными веществами, следует проявлять осторожность и следует следить за появлением симптомов злоупотребления или зависимости от баклофена, например, увеличение дозировки, изменение поведения, связанное с поиском наркотиков, развитие толерантности к препарату.

Эпилепсия

Больные эпилепсией требуют дополнительного наблюдения, поскольку у данных пациентов возможно снижение судорожного порога. Иногда возникали приступы при отмене баклофена или при передозировке. Баклофен следует применять с осторожностью у пациентов с язвенной болезнью желудка или язвой желудка в анамнезе, а также у пациентов с цереброваскулярными заболеваниями или нарушением функции легких или печени.

Нарушение функции почек

Помимо прекращения лечения, гемодиализ можно рассматривать как альтернативный вариант лечения у пациентов с признаками тяжелой токсичности баклофена. Гемодиализ эффективно выводит баклофен из организма, облегчает клинические симптомы передозировки и сокращает сроки выздоровления у таких пациентов. Расстройства мочевыводящих путей, нейрогенные расстройства, влияющие на опорожнение мочевого пузыря, могут улучшиться при терапии баклофеном. Напротив, острая задержка мочи может возникнуть у пациентов с гипертонусом сфинктера в анамнезе. Поэтому баклофен в таких случаях следует применять с осторожностью.

Результаты лабораторных исследований

Поскольку в редких случаях сообщалось о повышении уровня аспартатаминотрансферазы, щелочной фосфатазы в крови и уровня глюкозы в крови, при лечении баклофеном у пациентов с заболеваниями печени или сахарным диабетом следует регулярно проводить соответствующие лабораторные исследования для мониторинга данных показателей.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Усиливает действие препаратов, угнетающих центральную нервную систему, гипотензивных и противоподрагических лекарственных средств, этанола.

Трициклические антидепрессанты усиливают снижение мышечного тонуса; леводопа, карбидопа в сочетании с леводопой повышают риск развития галлюцинаций, спутанности сознания, возбуждения.

Препараты, подавляющие центральную нервную систему

Усиление седативного эффекта возможно, если баклофен принимать в сочетании с другими препаратами, вызывающими угнетение центральной нервной системы, включая другие миорелаксанты (такие как тизанидин), синтетические наркотики или алкоголь (см. также раздел 4.7). Существует также повышенный риск угнетения дыхания. Кроме того, сообщалось о гипотонии при одновременном применении морфина и интратекально баклофена. Важно тщательно контролировать функции дыхания и сердечно-сосудистой системы, особенно при наличии сердечно-легочных заболеваний и слабости дыхательных мышц.

Антидепрессанты

Трициклические антидепрессанты могут усиливать эффект баклофена; это приводит к выраженной мышечной гипотонии.

Литий

Одновременное применение баклофена для перорального применения и лития приводило к ухудшению гиперкинетических расстройств (при их наличии). Поэтому следует соблюдать осторожность при одновременном применении баклофена с литием.

Гипотензивные препараты

Возможно снижение артериального давления при сочетании баклофена с антигипертензивной терапией, может потребоваться корректировка дозы гипотензивного препарата.

Ингибитор леводопы/дофа-декарбоксилазы (карбидопа)

У пациентов с болезнью Паркинсона, получавших комбинацию леводопы, сообщалось о спутанности сознания, галлюцинациях, головной боли, тошноте и возбуждении. Поэтому следует соблюдать осторожность при одновременном применении баклофена и леводопы/карбидопы.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Адекватных и хорошо контролируемых исследований безопасности применения баклофена при беременности не проводилось.

Применение препарата во время беременности возможно только строго по назначению врача, в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает возможный риск для ребенка и должно проводиться под строгим медицинским контролем. Баклофен проникает через плацентарный барьер. Во время беременности, особенно в первые 3 месяца, баклофен следует применять только в том случае, если его применение является жизненно необходимым. Сообщалось о реакциях отмены препарата, включая послеродовые судороги у новорожденных, после внутриутробного воздействия перорального баклофена.

Лактация

Имеются сведения о проникновении баклофена в грудное молоко.

Применение препарата в период грудного вскармливания возможно только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для ребенка.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Баклофен оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. Были зарегистрированы такие нежелательные реакции, как головокружение, седативный эффект, сонливость и нарушение зрения (см. раздел 4.8). Пациенты, у которых возникают подобные нежелательные реакции, не должны управлять транспортными средствами или работать с механизмами.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Для оценки частоты возникновения нежелательных явлений использованы следующие критерии (согласно классификации Всемирной организации здравоохранения):

очень часто ($\geq 1/10$);

часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$);

нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$);

редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$);

очень редко ($< 1/10000$);

частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны нервной системы:

очень часто – сонливость, седативный эффект;

часто – головокружение, слабость, усталость, спутанность сознания, нарушение походки, бессонница, эйфория, депрессия, астения, атаксия, тремор, галлюцинации, ночные кошмары, нистагм, сухость во рту;

редко – парестезии, дизартрия; частота неизвестна – синдром апноэ во время сна*.

Нарушения со стороны органа зрения:

часто – парез аккомодации, зрительные нарушения.

Нарушения со стороны сердца:

часто – снижение сердечного выброса.

Нарушения со стороны сосудов:

часто – артериальная гипотензия; частота неизвестна – брадикардия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

часто – угнетение дыхания.

Желудочно-кишечные нарушения:

очень часто – тошнота;

часто – рвота, запор, диарея, диспепсические явления;

редко – абдоминальные боли, дисгевзия, нарушение функции печени.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

часто – гипергидроз, сыпь;

частота неизвестна – крапивница.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани:

часто – миалгия.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

часто – полиурия, энурез, дизурия;

редко – задержка мочи.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

редко – эректильная дисфункция.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

очень редко – гипотермия;

частота неизвестна – синдром отмены (см. раздел 4.4.).

Лабораторные и инструментальные данные:

частота неизвестна – повышение концентрации глюкозы.

Примечание. * – случаи центрального синдрома апноэ во время сна наблюдались при использовании баклофена в высоких дозах (≥ 100 мг) у пациентов с алкогольной зависимостью.

Описание отдельных нежелательных реакций

В единичных случаях наблюдалось повышение спастичности, что расценивалось как парадоксальная реакция на препарат.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза-риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств-членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация.

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения.

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1.

Телефон: +7 800 550 99 03.

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Сонливость, потеря сознания, кома, угнетение дыхания; спутанность сознания, галлюцинации, тревожное возбуждение (ажитация), судороги, отклонения на электрокардиограмме (феномен «вспышка-подавление» и трехфазные волны), нарушения аккомодации, нарушение зрачкового рефлекса; генерализованная мышечная гипотония,

миоклония, гипорефлексия или арефлексия; судороги, расширение периферических сосудов, гипотония или гипертензия, брадикардия или тахикардия, либо аритмия сердца; гипотермия; тошнота, рвота, диарея, гиперсекреция слюны; повышение уровня печеночных ферментов, значений СГОТ (АСТ) и щелочной фосфатазы (ЩФ), рабдомиолиз.

Лечение

Показаны поддерживающие меры и симптоматическое лечение. Следует рассмотреть возможность применения активированного угля после проглатывания потенциально токсичного количества, особенно если проглатывание произошло недавно. Промывание желудка эффективно в отдельных случаях, особенно вскоре (60 минут) после приема потенциально опасной для жизни дозы. Пациентов в коме и пациентов с судорогами следует интубировать перед промыванием желудка. Поскольку препарат выводится преимущественно почками, требуется назначать большое количество жидкости, по возможности, вместе с диуретиком. Гемодиализ может рассматриваться в случае тяжелой интоксикации, связанной с почечной недостаточностью (см. раздел 4.4.). При наличии судорог необходимо в/в применение диазепама с соблюдением необходимых мер предосторожности. При угнетении дыхания – искусственная вентиляция легких.

Специфического антидота не существует.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: миорелаксанты; миорелаксанты центрального действия; другие миорелаксанты центрального действия.

Код АТХ: M03BX01

Фармакодинамические эффекты

Миорелаксант центрального действия, производное гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК_B-стимулятор). Снижая возбудимость концевых отделов афферентных чувствительных волокон и подавляя промежуточные нейроны, угнетает моно- и полисинаптическую передачу нервных импульсов; уменьшает предварительное напряжение мышечных веретен. Не оказывает действия на нервно-мышечную передачу. При неврологических заболеваниях, сопровождающихся спастичностью скелетных мышц, ослабляет болезненные спазмы и клонические судороги; увеличивает объем движения в суставах, облегчает проведение пассивной и активной кинезотерапии (физические упражнения, массаж, мануальная терапия).

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Абсорбция высокая. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 2–3 часа после приема препарата.

Баклофен быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. При пероральном применении максимальная концентрация в плазме регистрируется через 0,5–1,5 часа, соответственно. Объем распределения баклофена составляет 0,7 л/кг, а процент связывания с белками плазмы составляет примерно 30 %. Уровень баклофена в спинномозговой жидкости примерно в 8,5 раз ниже, чем в плазме. Период полувыведения баклофена из плазмы составляет 3–4 часа. Баклофен выводится в основном в неизменном виде. В течение 72 часов примерно 75 % введенной дозы выводится через почки, из них

только 5 % – в виде метаболитов. Остальная часть введенной дозы выводится с калом, при этом 5 % также в виде метаболитов. Основным метаболитом является β -(п-хлорфенил)- γ -гидроксимасляная кислота, фармакологически неактивная.

Лица пожилого возраста

Фармакокинетика баклофена у пациентов пожилого возраста практически такая же, как у пациентов более молодого возраста. После однократного перорального приема у пожилых пациентов выведение баклофена происходит медленнее, но системное воздействие баклофена такое же, как и у молодых людей. Экстраполяция этих результатов при лечении несколькими дозами предполагает отсутствие существенных фармакокинетических различий между пациентами моложе 65 лет и пожилыми пациентами.

Дети

Сообщалось, что после перорального приема таблеток баклофена в дозе 2,5 мг у детей (от 2 до 12 лет) $C_{\max}$ составляла $62,8 \pm 28,7$ нг/мл, а $T_{\max}$ – в диапазоне 0,95–2 ч. Средний плазменный клиренс (Cl) – 315,9 мл/ч/кг. Сообщалось, что объем распределения (V_d) составил 2,58 л/кг, а период полувыведения ($T_{1/2}$) составил 5,10 ч.

Печеночная недостаточность

Фармакокинетические данные у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют.

Однако, поскольку печень не играет основной роли в распределении баклофена, маловероятно, что фармакокинетика баклофена будет изменяться до клинически значимого уровня у пациентов со сниженной функцией печени.

Почечная недостаточность

Контролируемых клинических фармакокинетических исследований у пациентов с нарушением функции почек после применения баклофена не проводились. Элиминация баклофена с мочой практически не изменяется. Редкие данные о концентрации в плазме пациенток женского пола, находящихся на постоянном гемодиализе или с наличием компенсированной почечной недостаточности, указывают на значительное снижение клиренса и увеличение периода полувыведения баклофена у этих пациентов. У пациентов с почечной недостаточностью следует рассмотреть возможность корректировки дозы баклофена в зависимости от его системной концентрации, а немедленный гемодиализ является эффективным способом остановить чрезмерное попадание баклофена в системный кровоток.

Распределение

Связь с белками плазмы крови – 30 %. Проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком.

Биотрансформация

Метаболизируется в печени.

Элиминация

Выводится почками (преимущественно в неизменном виде).

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат.

Крахмал картофельный.

Желатин.

Тальк.

Магния стеарат.

Этилцеллюлоза.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

Таблетки, 10 мг и 25 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2, 3, 4, 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона. Пачки помещают в групповую упаковку.

100, 200, 300, 400, 600, 800 контурных ячейковых упаковок с равным количеством инструкций по медицинскому применению помещают в коробку картонную (для стационаров).

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация.

Акционерное общество «Усолье-Сибирский химико-фармацевтический завод» (АО «Усолье-Сибирский химфармзавод»).

665452, Иркутская обл., г.о. город Усолье-Сибирское, тер. Промышленный массив, ул. Индустриальная, зд. 62.

Тел.: +7 (395) 435-89-08.

Электронная почта: usolpharm@usolpharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация.

Акционерное общество «Усолье-Сибирский химико-фармацевтический завод» (АО «Усолье-Сибирский химфармзавод»).

665452, Иркутская обл., г.о. город Усолье-Сибирское, тер. Промышленный массив, ул. Индустриальная, зд. 62.

Тел.: +7 (395) 435-89-08.

Электронная почта: usolpharm@usolpharm.ru

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Баклофен доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) (https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC).