

MẪU TỜ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG VIÊN NÉN BACLOFEN 10

Rx Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

BACLOFEN 10

Đề xa tầm tay trẻ em

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC

Mỗi viên nén chứa:

Thành phần hoạt chất:

Baclofen 10 mg

Thành phần tá dược: Tinh bột lúa mì, Đường trắng, Povidon K90, Natri starch glycolat, Colloidal silica khan, Talc, Magnesi stearat

DẠNG BẢO CHẾ

Dạng bào chế: viên nén

Mô tả dạng bào chế: Viên nén hình tròn, hai mặt trơn, màu trắng đến trắng ngà.

CHỈ ĐỊNH

- Baclofen được chỉ định để làm giảm sự co cứng cơ chủ động do các rối loạn như đa xơ cứng, các tổn thương cột sống khác, ví dụ như các khối u ở tủy sống, bệnh rối loạn tủy sống, bệnh tể bào thần kinh vận động, viêm tủy ngang, chấn thương một phần tủy sống.
- Baclofen cũng được chỉ định ở người lớn và trẻ em để làm giảm sự co cứng cơ chủ động phát sinh do tai biến mạch máu não, bại não, viêm màng não, chấn thương đầu.

Lựa chọn bệnh nhân là bước quan trọng khi bắt đầu điều trị với baclofen. Thuốc có khả năng mang lại lợi ích cao nhất ở những bệnh nhân bị co cứng gây cản trở cho các hoạt động của cơ thể và/hoặc khi tiến hành vật lý trị liệu. Không nên bắt đầu điều trị cho đến khi tình trạng co cứng đã ổn định.

Trẻ em

Baclofen được chỉ định ở những bệnh nhân từ 0 đến dưới 18 tuổi trong điều trị triệu chứng co cứng có nguồn gốc từ não, đặc biệt là do bại não ở trẻ sơ sinh, cũng như sau các tai biến mạch máu não hoặc do khối u hoặc mắc bệnh thoái hóa não.

Baclofen cũng được chỉ định để điều trị triệu chứng co cứng cơ xảy ra trong các bệnh về tủy sống do nhiễm trùng, thoái hóa, chấn thương, khối u hoặc không rõ nguồn gốc như bệnh đa xơ cứng, liệt cột sống co cứng, xơ cứng teo cơ một bên, bệnh rối loạn tủy sống, viêm tủy ngang, chấn thương liệt chi dưới hoặc liệt nhẹ hai chi dưới, và chèn ép tủy sống.

CÁCH DÙNG – LIỀU DÙNG

Liều dùng

Nên dùng liều thấp nhất tương thích với đáp ứng tối ưu được khuyến cáo.

Trước khi bắt đầu điều trị bằng baclofen, cần thận trọng đánh giá mức độ cải thiện lâm sàng mà bệnh nhân có thể đạt được. Việc cần thận trọng điều chỉnh liều là cần thiết (đặc biệt ở người cao tuổi) cho đến khi bệnh nhân ổn định. Nếu bắt đầu với liều quá cao hoặc nếu tăng liều quá nhanh, tác dụng phụ có thể xảy ra. Điều này đặc biệt quan trọng nếu bệnh nhân cần đi lại để giảm tình trạng yếu cơ ở các chi không bị ảnh hưởng hoặc những vùng bị co cứng cần phải hỗ trợ.

Khi dùng đến liều tối đa, nếu hiệu quả điều trị trong 6 tuần không rõ ràng thì phải cân nhắc có nên tiếp tục dùng baclofen không.

Khi ngừng điều trị phải luôn giảm liều từ từ trong thời gian 1 đến 2 tuần, ngoại trừ trường hợp cấp cứu quá liều hoặc khi xảy ra các tác dụng phụ nghiêm trọng.

Người lớn

Bắt đầu điều trị với liều 15 mg mỗi ngày, tốt nhất chia thành nhiều lần. Chế độ tăng liều từ từ sau đây được đề xuất nhưng có thể cần điều chỉnh cho phù hợp với từng bệnh nhân.

5 mg x 3 lần/ngày, dùng trong 3 ngày.

10 mg x 3 lần/ngày, dùng trong 3 ngày.

15 mg x 3 lần/ngày, dùng trong 3 ngày.

20 mg x 3 lần/ngày, dùng trong 3 ngày.

Liều kiểm soát tốt các triệu chứng thường lên đến 60 mg mỗi ngày, nhưng cần điều chỉnh liều thận trọng để đáp ứng nhu cầu của từng bệnh nhân.

Có thể tăng liều từ từ khi cần thiết với liều tối đa hàng ngày không quá 100 mg trừ khi bệnh nhân nằm viện dưới sự giám sát y tế cẩn thận.

Chế độ liều nhỏ thường xuyên có thể có lợi hơn trong một số trường hợp so với dùng liều cao cách quãng. Ngoài ra, một số bệnh nhân có thể đáp ứng tốt khi dùng một liều baclofen vào ban đêm để chống lại cơn đau cơ cứng gập. Tương tự, nên dùng thuốc khoảng một giờ trước khi thực hiện các hoạt động như tắm, cạo râu, mặc quần áo và tập vật lý trị liệu để cải thiện khả năng vận động.

Các đối tượng đặc biệt:

Người cao tuổi (≥ 65 tuổi)

Bệnh nhân cao tuổi có thể dễ bị tác dụng phụ hơn, đặc biệt trong giai đoạn đầu sử dụng baclofen. Nên sử dụng liều thấp khi bắt đầu điều trị, điều chỉnh liều từ từ theo đáp ứng của bệnh nhân dưới sự giám sát cẩn thận. Chưa có bằng chứng cho thấy liều tối đa trung bình khác với bệnh nhân trẻ tuổi.

Trẻ em (từ 0 đến < 18 tuổi)

Thường bắt đầu điều trị với liều rất thấp (tương ứng với khoảng 0,3 mg/kg mỗi ngày), chia thành 2 – 4 lần, tốt nhất là chia thành 4 lần.

Thận trọng khi tăng liều, trong khoảng 1 tuần, cho đến khi đáp ứng nhu cầu của từng bệnh nhân. Liều hàng ngày thông thường duy trì trong khoảng 0,75 đến 2 mg/kg trọng lượng cơ thể. Tổng liều hàng ngày không được vượt quá mức tối đa là 40 mg/ngày ở trẻ dưới 8 tuổi. Ở trẻ em trên 8 tuổi, có thể dùng liều tối đa hàng ngày là 60 mg/ngày.

Thuốc này không phù hợp để dùng cho trẻ em có cân nặng dưới 33 kg.

Bệnh nhân suy thận

Ở những bệnh nhân bị suy giảm chức năng thận hoặc bệnh nhân phải chạy thận nhân tạo mãn tính, nên sử dụng liều baclofen đặc biệt thấp, khoảng 5 mg mỗi ngày.

Chỉ nên dùng baclofen cho bệnh nhân suy thận giai đoạn cuối khi lợi ích dự kiến lớn hơn nhiều so với nguy cơ tiềm ẩn. Những bệnh nhân này cần được theo dõi chặt chẽ để chẩn đoán kịp thời các dấu hiệu sớm và/hoặc các triệu chứng nhiễm độc (ví dụ như buồn ngủ, mệt mỏi).

Bệnh nhân suy gan

Chưa có nghiên cứu ở những bệnh nhân suy gan được điều trị bằng baclofen. Gan không đóng vai trò quan trọng trong quá trình chuyển hóa baclofen. Tuy nhiên, baclofen có khả năng làm tăng men gan. Nên thận trọng khi kê đơn baclofen ở bệnh nhân suy gan.

Bệnh nhân có tình trạng co cứng có nguồn gốc từ não

Tác dụng không mong muốn thường xảy ra ở những bệnh nhân này. Do đó, nên áp dụng chế độ liều thận trọng và theo dõi bệnh nhân thích hợp.

* Với các liều 5 mg, 15 mg nên dùng dạng bào chế phù hợp chứa baclofen 5 mg, 15 mg.

Cách dùng

Baclofen được dùng theo đường uống. Nên dùng baclofen trong bữa ăn với một ít nước.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Quá mẫn cảm với baclofen hoặc với bất kỳ thành phần nào của thuốc. Loét dạ dày.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Rối loạn tâm thần và hệ thần kinh

Rối loạn tâm thần (nặng), tâm thần phân liệt, rối loạn trầm cảm hoặc hưng cảm, các trạng thái lẫn hoặc bệnh Parkinson có thể nặng hơn khi điều trị bằng baclofen. Do đó, bệnh nhân mắc các tình trạng này nên được điều trị thận trọng và theo dõi chặt chẽ.

Các sự việc về tự sát hoặc liên quan đến tự sát đã được báo cáo ở những bệnh nhân được điều trị bằng baclofen. Trong hầu hết các trường hợp, bệnh nhân có thêm các yếu tố nguy cơ liên quan đến tăng khả năng tự tử bao gồm sử dụng rượu, trầm cảm và/hoặc đã từng cố

tự tử. Cần giám sát chặt chẽ những bệnh nhân có các nguy cơ tự tử kết hợp điều trị bằng thuốc. Bệnh nhân (và người chăm sóc bệnh nhân) cần được cảnh báo về sự cần thiết phải theo dõi đối với tình trạng lâm sàng chuyển biến xấu, hành vi hoặc suy nghĩ tự tử hoặc những thay đổi bất thường trong hành vi và thảo luận với bác sĩ ngay lập tức nếu những triệu chứng đó xuất hiện.

Các trường hợp lạm dụng và phụ thuộc thuốc đã được báo cáo với baclofen. Cần sử dụng thuốc thận trọng đối với bệnh nhân có tiền sử lạm dụng thuốc và cần theo dõi các triệu chứng của việc lạm dụng hoặc phụ thuộc baclofen như tăng liều, hành vi tìm kiếm thuốc và dùng nạp thuốc.

Động kinh

Baclofen có thể làm nặng thêm các biểu hiện động kinh nhưng có thể được sử dụng với sự giám sát thích hợp và duy trì đầy đủ các liệu pháp điều trị chống co giật.

Những trường hợp khác

Baclofen nên được sử dụng hết sức cẩn thận ở những bệnh nhân đang được điều trị tăng huyết áp.

Nên thận trọng khi sử dụng baclofen ở những bệnh nhân bị tai biến mạch máu não, suy hô hấp hoặc suy gan.

Do các tác dụng không mong muốn có nhiều khả năng xảy ra, nên áp dụng chế độ liều thận trọng ở người cao tuổi và bệnh nhân bị co cứng có nguồn gốc ở não.

Suy thận

Baclofen nên được sử dụng thận trọng đối với các bệnh nhân suy thận và chỉ nên dùng cho bệnh nhân suy thận giai đoạn cuối khi lợi ích dự kiến lớn hơn nhiều so với nguy cơ tiềm ẩn. Các dấu hiệu và triệu chứng thần kinh bao gồm các biểu hiện lâm sàng của bệnh não nhiễm độc (ví dụ lú lẫn, mất phương hướng, buồn ngủ và giảm nhận thức) quan sát được ở những bệnh nhân suy thận dùng baclofen với liều hơn 5 mg mỗi ngày. Bệnh nhân suy giảm chức năng thận cần được theo dõi chặt chẽ để chẩn đoán kịp thời các triệu chứng nhiễm độc sớm.

Cần thận trọng khi kết hợp baclofen với thuốc hoặc các sản phẩm y khoa có thể ảnh hưởng đáng kể đến chức năng thận. Nên theo dõi chặt chẽ chức năng thận và điều chỉnh liều hàng ngày phù hợp để ngăn ngừa độc tính của baclofen.

Các trường hợp ngộ độc baclofen đã được báo cáo ở bệnh nhân suy thận cấp.

Bên cạnh việc ngưng điều trị, thẩm phân máu có thể coi là phương pháp điều trị thay thế ở những bệnh nhân nhiễm độc baclofen nặng. Thẩm phân máu có tác động loại bỏ baclofen khỏi cơ thể, làm giảm các triệu chứng lâm sàng khi quá liều và rút ngắn thời gian phục hồi ở những bệnh nhân này.

Rối loạn tiết niệu

Khi điều trị bằng baclofen, các rối loạn thần kinh ảnh hưởng đến việc làm rỗng bàng quang có thể được cải thiện. Ở những bệnh nhân bị tăng trương lực cơ vòng trước đó, có thể xảy ra tình trạng bí tiểu cấp tính; nên dùng thuốc thận trọng ở những bệnh nhân này.

Các xét nghiệm

Nồng độ aspartat aminotransferase, phosphatase kiềm và glucose trong huyết thanh tăng cao đã được báo cáo hiếm gặp. Các xét nghiệm thích hợp nên được thực hiện ở những bệnh nhân có bệnh gan hoặc đái tháo đường để đảm bảo thuốc không gây ra thay đổi ở những bệnh nhân này.

Ngưng thuốc đột ngột

Ngưng điều trị bằng cách giảm liều từ từ trong thời gian khoảng 1 – 2 tuần (trừ khi xảy ra tác dụng phụ nghiêm trọng). Lo âu, lú lẫn, mê sảng, ảo giác, rối loạn tâm thần, hưng cảm hoặc hoang tưởng, co giật (trạng thái động kinh), rối loạn vận động, nhịp tim nhanh, tăng thân nhiệt, tiêu cơ vân và tình trạng co cứng nặng thêm tạm thời đã được báo cáo khi ngừng baclofen đột ngột, đặc biệt là sau khi dùng thuốc trong thời gian dài.

Co giật sau sinh ở trẻ sơ sinh đã được báo cáo sau khi tiếp xúc trong tử cung với baclofen đường uống.

Trẻ em

Dữ liệu lâm sàng rất hạn chế về việc sử dụng baclofen ở trẻ em dưới một tuổi. Sử dụng ở nhóm bệnh nhân này nên dựa trên sự cân nhắc về lợi ích và nguy cơ khi điều trị.

Tư thế và thăng bằng

Baclofen nên được sử dụng thận trọng khi sự co cứng là cần thiết để duy trì tư thế đứng và cân bằng khi vận động.

Lưu ý: Trong thuốc có chứa các tá dược:

Tinh bột lúa mì: Tinh bột lúa mì có trong thuốc chỉ chứa hàm lượng gluten rất thấp, có thể “xem như không chứa gluten” và ít có khả năng có hại nếu bệnh nhân có bệnh Celiac. Một viên nén bao phim không chứa nhiều hơn 167 µg gluten. Nếu bị dị ứng với lúa mì (tránh nhầm với bệnh Celiac), bệnh nhân không nên dùng thuốc này.

Đường trắng: Bệnh nhân bị rối loạn di truyền hiếm gặp như không dung nạp fructose, kém hấp thu glucose-galactose hoặc thiếu hụt enzym sucrase-isomaltase không nên dùng thuốc này. Mỗi viên nén chứa 62 mg sucrose, cần cân nhắc đối với bệnh nhân bị đái tháo đường.

SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ

Thời kỳ mang thai:

Khi mang thai, đặc biệt là trong 3 tháng đầu, chỉ nên sử dụng baclofen khi thực sự cần thiết. Lợi ích của việc điều trị cho người mẹ phải được cân nhắc cẩn thận trước những rủi ro có thể xảy ra với con. Baclofen qua được hàng rào nhau thai.

Các phản ứng phụ ở thai nhi/ trẻ sơ sinh:

Co giật sau sinh ở trẻ sơ sinh đã được báo cáo sau khi tiếp xúc trong tử cung với baclofen đường uống.

Thời kỳ cho con bú:

Ở những người mẹ dùng baclofen với liều điều trị, hoạt chất này sẽ đi vào sữa mẹ, nhưng với lượng nhỏ đến mức không có tác dụng không mong muốn đối với trẻ sơ sinh.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE, VẬN HÀNH MÁY MÓC

Baclofen có thể liên quan đến các tác dụng phụ như chóng mặt, an thần, buồn ngủ và suy giảm thị lực, có thể làm giảm phản ứng của bệnh nhân. Khuyến cáo bệnh nhân khi gặp phải những phản ứng bất lợi này nên tránh lái xe hoặc vận hành máy móc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG KỶ CỦA THUỐC

Levodopa/ chất ức chế dopa decarboxylase (Carbidopa)

Ở những bệnh nhân mắc bệnh Parkinson được điều trị đồng thời bằng baclofen và levodopa (riêng lẻ hoặc kết hợp với thuốc ức chế dopa decarboxylase, carbidopa), đã có báo cáo về rối loạn tâm thần, ảo giác, buồn nôn và kích động. Các triệu chứng của bệnh Parkinson tiến triển nặng hơn cũng đã được báo cáo. Do đó, cần thận trọng khi dùng đồng thời baclofen và levodopa/carbidopa.

Thuốc ức chế hệ thần kinh trung ương (CNS)

Tác dụng an thần có thể tăng khi dùng baclofen đồng thời với các thuốc khác gây ức chế thần kinh trung ương bao gồm các thuốc giãn cơ khác (như tizanidin), thuốc giảm đau tổng hợp hoặc với rượu.

Nguy cơ suy hô hấp cũng tăng lên. Ngoài ra, hạ huyết áp đã được báo cáo khi sử dụng đồng thời morphin và baclofen tiêm màng não tủy. Cần theo dõi cẩn thận các chức năng hô hấp và tim mạch, đặc biệt ở những bệnh nhân mắc bệnh tim phổi và yếu cơ hô hấp.

Thuốc chống trầm cảm

Khi điều trị đồng thời với thuốc chống trầm cảm ba vòng, có thể làm tăng tác dụng của baclofen, dẫn đến giảm trương lực cơ rõ rệt.

Lithi

Sử dụng đồng thời baclofen và lithi đường uống dẫn đến làm nặng hơn các triệu chứng tăng vận động. Vì vậy, cần thận trọng khi sử dụng baclofen đồng thời với lithi.

Thuốc điều trị tăng huyết áp

Dùng đồng thời baclofen và thuốc điều trị tăng huyết áp có khả năng làm giảm huyết áp quá mức, nên điều chỉnh liều thuốc điều trị tăng huyết áp.

Tác nhân làm giảm chức năng thận

Thuốc hoặc các sản phẩm y khoa tác động đáng kể đến chức năng thận có thể làm giảm thải trừ baclofen dẫn đến tác dụng gây độc.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC

Tác dụng không mong muốn xảy ra chủ yếu khi bắt đầu điều trị (ví dụ: an thần, buồn ngủ và buồn nôn), hoặc khi tăng liều quá nhanh, hay khi sử dụng liều cao hoặc ở bệnh nhân cao tuổi. Các tác dụng không mong muốn thường thoáng qua và có thể giảm hoặc biến mất khi giảm liều; hiếm khi nghiêm trọng bắt buộc phải ngưng thuốc.

Nếu buồn nôn kéo dài sau khi giảm liều, khuyến cáo nên uống baclofen chung với thức ăn hoặc sữa.

Ở những bệnh nhân có tiền sử bệnh tâm thần hoặc tai biến mạch máu não (ví dụ đột quỵ) cũng như ở bệnh nhân cao tuổi, các tác dụng không mong muốn có thể nghiêm trọng hơn.

Hạ thấp ngưỡng co giật và co giật có thể xảy ra, đặc biệt ở những bệnh nhân động kinh.

Ở một số bệnh nhân có sự tăng co cứng như một phản ứng nghịch lý với thuốc.

Mức độ giảm trương lực cơ không mong muốn khiến bệnh nhân khó đi lại hoặc khó tự chống đỡ hơn có thể xảy ra và thường có thể thuyên giảm bằng cách điều chỉnh liều (ví dụ giảm liều dùng trong ngày và có thể tăng liều buổi tối).

Các tác dụng không mong muốn được phân theo tần suất có quy ước như sau: *rất thường gặp* ($\geq 1/10$), *thường gặp* ($\geq 1/100$ đến $< 1/10$), *ít gặp* ($\geq 1/1.000$ đến $< 1/100$), *hiếm gặp* ($\geq 1/10.000$ đến $< 1/1.000$), *rất hiếm gặp* ($< 1/10.000$), *chưa rõ tần suất* (không thể ước tính từ dữ liệu có sẵn).

Rối loạn hệ thần kinh

Rất thường gặp: an thần, buồn ngủ

Thường gặp: suy hô hấp, lảo, chóng mặt, ảo giác, trầm cảm, mệt mỏi, mất ngủ, tâm trạng hưng phấn, yếu cơ, thất điều, run, ác mộng, đau cơ, đau đầu, giật nhãn cầu, khô miệng.

Hiếm gặp: dị cảm, loạn vận ngôn, loạn vị giác.

Chưa rõ tần suất: hội chứng ngưng thở khi ngủ (Các trường hợp hội chứng ngưng thở khi ngủ đã được quan sát với baclofen liều cao (≥ 100 mg) ở những bệnh nhân nghiện rượu)

Rối loạn thị giác

Thường gặp: rối loạn điều tiết, suy giảm thị lực.

Rối loạn tim

Thường gặp: giảm cung lượng tim

Chưa rõ tần suất: nhịp tim chậm

Rối loạn mạch máu

Thường gặp: hạ huyết áp

Rối loạn hệ tiêu hóa

Rất thường gặp: buồn nôn

Thường gặp: rối loạn tiêu hóa, táo bón, tiêu chảy, nôn khan, nôn

Hiếm gặp: đau bụng

Rối loạn gan mật

Hiếm gặp: chức năng gan bất thường

Rối loạn da và mô dưới da

Thường gặp: phát ban, tăng tiết mồ hôi

Chưa rõ tần suất: mày đay

Rối loạn thận và hệ tiết niệu

Thường gặp: tiểu rắt, khó tiểu, đái dầm

Hiếm gặp: bí tiểu

Rối loạn hệ sinh sản và tuyến vú

Hiếm gặp: rối loạn cương dương

Rối loạn toàn thân và tại nơi dùng thuốc

Rất hiếm gặp: Hạ thân nhiệt

Chưa rõ tần suất: hội chứng cai thuốc bao gồm co giật sau sinh ở trẻ sơ sinh đã được báo cáo sau khi tiếp xúc trong tử cung với baclofen

Xét nghiệm

Chưa rõ tần suất: tăng glucose huyết

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những phản ứng có hại gặp phải khi sử dụng thuốc

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Triệu chứng

Triệu chứng nổi bật là dấu hiệu ức chế thần kinh trung ương: buồn ngủ, suy giảm ý thức, hôn mê, suy hô hấp.

Cũng có khả năng xảy ra: bị lảo, ảo giác, kích động, co giật, điện não đồ bất thường (dạng bùng nổ - ức chế và sóng 3 chiều), rối loạn điều tiết, giảm phản xạ đồng tử, giảm trương lực cơ toàn thân, giật rung cơ, giảm hoặc mất phản xạ, giãn mạch ngoại vi, hạ huyết áp hoặc tăng huyết áp, nhịp tim chậm, nhịp tim nhanh hoặc rối loạn nhịp tim, hạ thân nhiệt, buồn nôn, nôn, tiêu chảy, tăng tiết nước bọt, tăng men gan và tiêu cơ vân. Bệnh nhân suy thận có thể tiến triển các dấu hiệu quá liều ngay cả khi dùng baclofen liều thấp.

Tình trạng trở nên xấu hơn nếu sử dụng đồng thời các chất hoặc các thuốc tác động lên hệ thần kinh trung ương (ví dụ: rượu, diazepam, thuốc chống trầm cảm ba vòng).

Xử trí

Chưa có thuốc giải độc đặc hiệu.

Các biện pháp hỗ trợ và điều trị triệu chứng nên được chỉ định khi có biến chứng như hạ huyết áp, tăng huyết áp, co giật, rối loạn tiêu hóa và suy hô hấp hoặc suy tim mạch.

Vì thuốc được bài tiết chủ yếu qua thận, nên có thể uống nhiều nước, kết hợp với thuốc lợi tiểu. Thận phân máu có thể mang đến lợi ích trong trường hợp ngộ độc nặng liên quan đến suy thận.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: Thuốc giãn cơ và chống co cứng tác dụng lên cột sống

Mã ATC: M03B X01

Baclofen là một thuốc chống co cứng tác dụng lên cột sống. Là một dẫn xuất của acid gamma-aminobutyric (GABA), baclofen không liên quan về mặt hóa học với các chất chống co cứng khác.

Baclofen làm giảm dẫn truyền phản xạ đơn sinap và đa sinap, có thể bằng cách kích thích các thụ thể GABA_B, sự kích thích này lần lượt ức chế giải phóng các acid amin có tính kích thích như glutamat và aspartat. Dẫn truyền thần kinh cơ không bị ảnh hưởng bởi baclofen.

Những lợi ích chính của baclofen bắt nguồn từ khả năng giảm cơn đau do co cơ gấp và rung giật tự phát, do đó tăng khả năng di chuyển của bệnh nhân, tăng tính chủ động và khả năng phục hồi cho bệnh nhân.

Baclofen cũng có tác dụng kháng thụ thể cảm giác đau. Thường cải thiện tốt hơn và ít tác dụng an thần hơn các thuốc tác dụng trên thần kinh trung ương.

Baclofen kích thích tiết acid dạ dày.

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Baclofen được hấp thu nhanh và hoàn toàn qua đường tiêu hóa. Sau khi uống một liều (10 – 30 mg) nồng độ đỉnh trong huyết tương đạt được sau 0,5 đến 1,5 giờ và diện tích dưới đường cong trong huyết tương tỷ lệ thuận với liều.

Phân bố

Thể tích phân bố của baclofen là 0,7 L/kg. Tỷ lệ liên kết với protein xấp xỉ 30% và không đổi trong khoảng nồng độ từ 10 ng/ml đến 300 µg/ml. Nồng độ hoạt chất trong dịch não tủy thấp hơn khoảng 8,5 lần so với trong huyết tương.

Chuyển hóa

Baclofen được chuyển hóa với tỉ lệ nhỏ. Khử amin để tạo ra chất chuyển hóa chính, acid β-(p-chlorophenyl)-4-hydroxybutyric, là chất không còn hoạt tính dược lý.

Thải trừ

Thời gian bán thải trong huyết tương của baclofen trung bình từ 3 đến 4 giờ.

Baclofen được thải chủ yếu ở dạng không biến đổi. Trong vòng 72 giờ, khoảng 75% liều được đào thải qua thận với khoảng 5% đã bị chuyển hóa.

Các đối tượng đặc biệt:

Người cao tuổi (từ 65 tuổi trở lên)

Dược động học của baclofen ở bệnh nhân cao tuổi gần như giống ở bệnh nhân dưới 65 tuổi. Sau một liều uống duy nhất, bệnh nhân cao tuổi có thể thải trừ chậm hơn nhưng tiếp xúc toàn thân tương tự so với

người lớn dưới 65 tuổi. Ngoài suy những kết quả này để điều trị đa liều cho thấy không có sự khác biệt đáng kể về được động học giữa bệnh nhân dưới 65 tuổi và bệnh nhân cao tuổi.

Trẻ em

Sau khi trẻ em (từ 2 đến 12 tuổi) uống 2,5 mg baclofen, C_{max} là $62,8 \pm 28,7$ ng/ml và T_{max} nằm trong khoảng 0,95 – 2h đã được báo cáo. Độ thanh thải trung bình trong huyết tương (Cl) là 315,9 ml/giờ/kg; thể tích phân bố (Vd) là 2,58 L/kg; và thời gian bán thải ($T_{1/2}$) 5,1 giờ đã được báo cáo.

Suy gan

Chưa có dữ liệu được động học ở bệnh nhân suy gan sau khi dùng baclofen. Tuy nhiên, do gan không đóng vai trò quan trọng trong việc thải trừ baclofen, nên không chắc rằng được động học của baclofen sẽ thay đổi ở mức có ý nghĩa lâm sàng ở bệnh nhân suy gan.

Suy thận

Chưa có nghiên cứu lâm sàng về được động học ở những bệnh nhân suy thận sau khi dùng baclofen. Baclofen thải trừ chủ yếu dưới dạng không đổi trong nước tiểu. Một số dữ liệu nồng độ huyết tương được thu thập ở bệnh nhân nữ được thẩm phân máu mãn tính hoặc suy thận còn bù cho thấy độ thanh thải giảm và thời gian bán thải tăng đáng kể ở những bệnh nhân này. Điều chỉnh liều baclofen dựa vào nồng độ

toàn thân nên được xem xét ở bệnh nhân suy thận, và thẩm phân máu là biện pháp hiệu quả để đảo ngược lượng baclofen tích lũy trong hệ tuần hoàn toàn thân.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI:

Hộp 3 vỉ x 10 viên nén

Hộp 10 vỉ x 10 viên nén

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN, HẠN DÙNG, TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG

Điều kiện bảo quản: Để nơi khô mát, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.

Hạn dùng: 24 tháng kể từ ngày sản xuất.

Tiêu chuẩn chất lượng: Tiêu chuẩn cơ sở

TÊN, ĐỊA CHỈ CỦA CƠ SỞ SẢN XUẤT THUỐC:



CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM 3/2
601 Cách Mạng Tháng Tám, P.15, Q.10, Tp.HCM

Sản xuất tại nhà máy số 930 C2, Đường C, KCN Cát Lái, Cụm II,
P. Thạnh Mỹ Lợi, Quận 2, Tp.Hồ Chí Minh.
ĐT: 39700025 - 37422612. Fax: 39700182
Email: duocpham32@ft-pharma.com
Website: www.ft-pharma.com

Ngày 27 tháng 03 năm 2024

Phó Giám đốc nhà máy



ĐS. PHẠM THỊ KIM YÊN

