

SAMANTEKT Á EIGINLEIKUM LYFS

1. HEITI LYFS

Baklofen Viatris 10 og 25 mg töflur.

2. INNIHALDSLÝSING

Hver tafla inniheldur baklofen 10 mg eða 25 mg.

Hjálparefni með þekkta verkun

Hver 10 mg tafla inniheldur 40 mg laktósaeinhýdrat.

Hver 25 mg tafla inniheldur 60 mg laktósaeinhýdrat.

Hver 10 mg tafla inniheldur 0,2 míkróg natriúmsterkjuglýkólat.

Hver 25 mg tafla inniheldur 0,2 míkróg natriúmsterkjuglýkólat.

Sjá lista yfir öll hjálparefni í kafla 6.1.

3. LYFJAFORM

Tafla.

Útlitslýsing á lyfjaforminu:

10 mg: Hvít kringlótt tafla 7 mm í þvermál, deilistrik á annarri hliðinni ásamt BN/10 og G á hinni hliðinni.

Töflunni má skipta í tvo jafna skammta.

25 mg: Hvít kringlótt tafla 8 mm í þvermál, deilistrik á annarri hliðinni ásamt BN/25 og G á hinni hliðinni.

Töflunni má skipta í tvo jafna skammta.

4. KLÍNÍSKAR UPPLÝSINGAR

4.1 Ábendingar

Fullorðnir

Til meðferðar við einkennum langvarandi síspennu (spasticity) af völdum kvilla í miðtaugakerfinu.

Börn (yngri en 18 ára)

Baklofen Viatris er ætlað sjúklingum á aldrinum 0 til 18 ára til meðferðar við einkennum heilatengdrar síspennu, einkum vegna frumberskuheilalömunar (infantile cerebral palsy) sem og eftir áverka á heilaaðum, æxli í heila eða vegna heilahrönnunarsjúkdóms. Baklofen Viatris er einnig ætlað til meðferðar við einkennum vöðvakrampa sem koma fram vegna kvilla í mænu í kjölfar sýkingar. Eða vegna hrönnunar, áverka, æxla eða af óþekktum orsökum, svo sem MS-sjúkdóms, mænulömunar sem fylgir síspenna, hreyfitaugahrönnunar (amyotrophic lateral sclerosis), holmænu (syringomyelia), þvermænubólgu (transverse myelitis), þverlömunar af völdum áverka (traumatic paraplegia) eða máttminnkunar í báðum fótleggjum (paraparesis) og þrýstings á mænu.

4.2 Skammtar og lyfjagjöf

Skammtar

Til að forðast verulegt máttleysi og hættu á falli á að gæta varúðar við notkun Baklofen Viatris ef síspenna er nauðsynleg til að halda líkamanum í uppréttri stöðu og halda jafnvægi eða ef síspenna

nýtist til að viðhalda starfsemi. Mikilvægt getur verið að viðhalda tiltekinni vöðvaspennu og þola einstaka vöðvakippi til að styðja við blóðrásarstarfsemi.

Fullorðnir

5 mg 3 sinnum á dag, auka á skammta varlega um 5 mg 3 sinnum á dag þriðja hvern dag þar til viðhaldsskammti sem er 30-80 mg á dag er náð.

Gæta skal varúðar við gjöf dagskammta yfir 100-120 mg og fylgjast með sjúklingnum á sjúkrahúsi.

Aldraðir sjúklingar (≥ 65 ára)

Þar sem aukaverkanir hafa meiri tilhneigingu til að koma fram hjá öldruðum sjúklingum þarf að gæta varúðar við skömmtun. Jafnframt þarf að hafa nákvæmt eftirlit með sjúklingnum.

Börn (yngri en 18 ára)

Venjulega skal hefja meðferð með mjög litlum skammti (samsvarar u.þ.b. 0,3 mg/kg á sólarhring), skipt í 2-4 skammta (helst skipt í 4 skammta). Skammta skal auka með varúð á u.þ.b. 1 viku fresti, þar til þeir fullnægja einstaklingsbundnum þörfum barnsins. Venjulegur sólarhringsskammtur fyrir viðhaldsmeðferð er á bilinu 0,75 til 2 mg/kg líkamsþyngdar. Heildarsólarhringsskammtur má ekki vera stærri en 40 mg/sólarhring hjá börnum yngri en 8 ára. Hjá börnum eldri en 8 ára má hámarkssólarhringsskammtur vera 60 mg/sólarhring.

Baklofen Viatris töflur eru ekki ætlaðar börnum sem eru léttari en 33 kg.

Mjög takmörkuð klínísk gögn liggja fyrir um notkun baklofens handa börnum yngri en 1 árs (sjá kafla 4.4).

Skert nýrnastarfsemi

Gæta skal varúðar við gjöf baklofens hjá sjúklingum með skerta nýrnastarfsemi og nota minni skammta. Plasmabéttni baklofens er hækkuð hjá sjúklingum í langvinnri blóðskilun ef notaðir eru skammtar sem ráðlagðir eru handa sjúklingum með eðlilega nýrnastarfsemi og skal því nota sérstaklega lítinn skammt af Baklofen Viatris, þ.e. um það bil 5 mg/dag.

Ekki á að gefa sjúklingum með nýrnabilun á lokastigi Baklofen Viatris nema væntanlegur ávinningur vegi þyngra en hugsanleg áhætta. Fylgjast á vandlega með þeim sjúklingum fyrst eftir að þeir fá lyfið til að unnt sé að greina snemmkomin teikn og/eða einkenni eitúráhrifa (t.d. svefnhöfgi og svefndrunga) (sjá kafla 4.4 og 4.9).

Skert lifrastarfsemi

Ekki hafa verið gerðar rannsóknir á meðferð með baklofeni hjá sjúklingum með skerta lifrastarfsemi. Lifur skiptir ekki miklu máli fyrir umbrot baklofens eftir inntöku lyfsins (sjá kafla 5.2). Baklofen getur hækkað gildi lifrarensíma. Gæta skal varúðar við ávísun Baklofen Viatris handa sjúklingum með skerta lifrastarfsemi (sjá kafla 4.4).

Ef meðferð er hætt á alltaf að gera það með því að minnka skammta smám saman á u.þ.b. 1-2 vikum, nema í neyðartilvikum sem tengjast ofskömmtun eða ef alvarlegar aukaverkanir hafa komið fram (sjá kafla 4.4)

Lyfjagjöf

Taka á Baklofen Viatris inn með mat og lítils háttar vökva.

4.3 Frábendingar

Ekki má nota Baklofen Viatris hjá sjúklingum með ofnæmi fyrir virka efninu eða einhverju hjálparefnanna sem talin eru upp í kafla 6.1.

4.4 Sérstök varnaðarorð og varúðarreglur við notkun

Geðræn vandamál og taugakerfi

Gæta skal varúðar hjá sjúklingum með síspennu sem rekja má til heila, geðrofsraskanir, geðklofa, í þunglyndis- eða oflætisástandi, með ringlun eða Parkinsonsjúkdóm. Fylgjast þarf nákvæmlega með þessum sjúklingum þar sem ofangreindar raskanir geta versnað.

Tilkynnt hefur verið um sjálfsvíg og sjálfsvígstengd atvik hjá sjúklingum sem meðhöndlaðir eru með baklofeni. Í flestum tilfellum höfðu sjúklingarnir aðra viðbótaráætluþætti tengda aukinni hættu á sjálfsvíg, þar með talið áfengissýki, þunglyndi og/eða fyrri tilfelli sjálfsvígstilrauna. Auk lyfjameðferðar skal hafa náði eftirlit með sjúklingum með viðbótaráætluþætti sem tengjast sjálfsvíg. Sjúklingum (og umönnunaraðilum sjúklinga) skal gert ljóst að eftirlit sé nauðsynlegt til að fylgjast með hvort versnun verði á klínísku ástandi, sjálfsvígshegðun eða -hugsunum og hvort óvenjulegar breytingar verði á hegðun og að leita læknaaðstoðar strax ef þessi einkenni koma fram.

Tilkynnt hefur verið um ofnotkun, misnotkun og lyfjaávana við notkun baklofens. Gæta skal varúðar hjá sjúklingum sem hafa sögu um misnotkun efna og fylgjast skal með einkennum um ofnotkun, misnotkun og lyfjaávana við notkun baklofens, t.d. stigvaxandi skammtastærð, ef leitast er við að fá önnur lyf, þróun lyfjapöls.

Flogaveiki

Gæta skal sérstakrar varúðar hjá sjúklingum með flogaveiki þar sem krampaþröskuldur getur lækkað og stundum hefur verið greint frá kasti í tengslum við að meðferð með Baklofen Viatrix hefur verið hætt eða ofskömmtum. Halda skal áfram nægilegri krampastillandi meðferð og hafa skal nákvæmt eftirlit með sjúklingnum með tilliti til krampa, þar sem krampaþröskuldur getur lækkað.

Heilakvilli

Greint hefur verið frá heilakvilla hjá sjúklingum sem fá baklofen í ráðlögðum skömmtum, sem gengur til baka þegar meðferð er hætt. Einkennin eru m.a. svefnþrungi, skert meðvitund, rugl, vöðvakykkjakrampi og dá.

Ef teikn um heilakvilla kemur fram skal hætta notkun baklofens

Annað

Sjúklingar sem þjást af taugrænni truflun sem hefur áhrif á þvagblöðrulosun geta sýnt bata við meðferð með Baklofen Viatrix.

Gæta skal varúðar við notkun Baklofen Viatrix hjá sjúklingum með:

- sögu um magasár.
- sjúkdóm í heilæðum.
- skerta öndunarstarfsemi.
- skerta lifrar- eða nýrnastarfsemi.
- of mikla vöðvaspennu í hringvöðva þar sem bráð þvagteppa getur komið fram.

Gæta skal varúðar í skömmtum handa öldruðum og sjúklingum með heilatengda síspennu, þar sem líklegra er að aukaverkanir komi fram hjá þeim sjúklingahópum (sjá kafla 4.2).

Skert nýrnastarfsemi

Nota skal baklofen með varúð hjá sjúklingum með skerta nýrnastarfssemi og einungis má nota baklofen handa sjúklingum með nýrnabilun á lokastigi ef væntanlegur ávinningur vegur þyngra en möguleg hættu (sjá kafla 4.2). Hjá sjúklingum með skerta nýrnastarfsemi sem tóku inn baklofen í skammtastærðum yfir 5 mg á dag hefur orðið vart við teikn og einkenni ofskömmtum, þar með talin klínísk einkenni heilakvilla vegna eituráhrifa (t.d. rugl, vistarfirring, svefnhöfgi og minnkuð meðvitund) og í 5 mg skömmtum á dag hjá sjúklingum með nýrnabilun á lokastigi sem eru í langvarandi blóðskilun. Hafa skal náði eftirlit með þessum sjúklingum til að hægt sé að greina snemma einkenni eitrunar.

Gæta skal sérstakrar varúðar þegar baklofen er notað samhliða lyfjum sem geta haft veruleg áhrif á nýrnastarfsemi. Fylgjast á vandlega með nýrnastarfsemi og aðlaga dagskammta af baklofen samkvæmt henni, til að forðast eituráhrif af baklofeni.

Auk þess að hætta meðferð má íhuga blóðskilun sem meðferðarúrræði handa sjúklingum með alvarleg eituráhrif af baklofeni. Blóðskilun fjarlægir baklofen skilvirkt úr líkamanum, mildar klínísk einkenni ofskömmtunar og styttr tímenn þar til sjúklingnum fer að batna.

Hækkuð gildi aspartat amínótransferasa og alkalískos fosfatasa í sermi og glúkósa í blóði hafa í mjög sjaldgæfum tilvikum komið fram. Því þarf reglulega að gera viðeigandi mælingar á rannsóknastofu hjá sjúklingum með lifrarsjúkdóm eða sykursýki, til þess að tryggja að ekki komi fram breytingar á þessum sjúkdómum af völdum lyfja.

Börn

Mjög takmarkaðar klínískar upplýsingar liggja fyrir um notkun Baklofen Viatrix hjá börnum yngri en 1 árs. Notkun hjá þessum sjúklingahópi skal grundvallast á mati lækinsins á ávinningi og áhættu, í hverju tilviki fyrir sig.

Líkamsstaða og jafnvægi

Gæta skal varúðar við notkun Baklofen Viatrix þegar sísþenna er nauðsynleg til þess halda uppréttri líkamsstöðu eða jafnvægi við hreyfingu (sjá kafla 4.2).

Meðferð hætt skyndilega

Ávallt skal hætta meðferðinni smám saman (nema ef alvarlegar aukaverkanir koma fram) með því að minnka skammta smám saman á u.þ.b. 1-2 vikum. Eftir að meðferð með baklofen hefur verið hætt skyndilega, einkum eftir langtímameðferð, hefur verið greint frá kvíða og ringlun, óráði, ofskynjunum, geðrofssjúkdómi, oflæti eða ofsóknarkennd, krömpum (síflög), ranghreyfingum, hraðslætti, ofhita (hyperthermia), rákvöðvalýsu og tímabundinni versun sísþennu (rebound phenomenon).

Tilkynnt hefur verið um fráhrarfseinkenni hjá nýbura eftir að móðirin hafði tekið inn baklofen á meðgöngu. Í varúðarskyni má íhuga að gefa nýburum baklofen í minnkandi skömmtum, til að koma í veg fyrir fráhrarfseinkenni. Áhrif þess eru þó ekki staðfest (sjá kafla 4.6 „Frjósemi, meðganga og brjóstagjöf“).

Lyfið inniheldur laktósa og natríum

Laktósi: Sjúklingar með arfgengt galaktósaóþol, algjöran laktasaskort eða glúkósa-galaktósa vanfrásog, skulu ekki nota lyfið.

Natríum: Lyfið inniheldur minna en 1 mmól (23 mg) af natríum í hverri töflu, þ.e.a.s. er sem næst natríumlaust.

4.5 Milliverkanir við önnur lyf og aðrar milliverkanir

Samhliða notkun eftirfarandi annarra lyfja kallar á varúðarráðstafanir og aðlögun skammta.

Levódópa/dópadekarboxýlasa (DDC)-hemill (karbidópa)

Greint hefur verið frá rugli, ofskynjunum, höfuðverk, ógleði og æsingi hjá sjúklingum með parkinsonsjúkdóm í samhliða meðferð með Baklofen Viatrix og levódópa (einu sér eða ásamt DDC-hemli, karbidópa). Einnig hefur verið tilkynnt um versnun einkenna parkinsonsjúkdóms. Gæta skal varúðar við samhliða meðferð með baklofeni og levódópa/karbidópa.

Lyf sem hafa bælandi áhrif á miðtaugakerfið

Aukin slæving getur komið fram ef baklofen er notað samtímis öðrum lyfjum sem hafa bælandi áhrif á miðtaugakerfið, þ.m.t. öðrum vöðvaslakandi lyfjum (svo sem tízaníðni), tilbúnum ópíötum eða áfengi (sjá kafla 4.7). Hætta á öndunarerfiðleikum er einnig aukin. Einnig hefur verið tilkynnt um lágbrýsting við samhliða notkun morfíns og baklofens sem gefið er í mænugöng. Mikilvægt er að fylgjast með starfsemi öndunarfæra og hjarta- og æðakerfis hjá sjúklingum með hjarta- og lungnakvilla og máttleysi í öndunarvöðvum.

Þríhringlaga þunglyndislyf

Þríhringlaga þunglyndislyf geta aukið verkun baklofens og orsakað áberandi minnkun í vöðvaspennu.

Lítíum

Samhliða notkun baklofens til inntöku og lítíums olli versnun ofhreyfieinkenna. Því skal gæta varúðar þegar baklofen er notað samhliða lítíum.

Blóðþrýstingslækkandi lyf

Þar sem samtímis meðferð með baklofeni og blóðþrýstingslækkandi lyfjum er líkleg til að valda aukinni blóðþrýstingslækkun, er nauðsynlegt að aðlaga skammtinn af blóðþrýstingslækkandi lyfjunum í samræmi við lækkunina.

Lyf sem draga úr nýrnastarfsemi

Lyf sem geta breytt nýrnastarfsemi verulega geta minnkað útskilnað baklofens, sem leiðir til eituráhrifa (sjá kafla 4.4 og kafla 4.9).

4.6 Frjósemi, meðganga og brjóstagjöf

Frjósemi

Engin gögn liggja fyrir um áhrif baklofens á frjósemi hjá mönnum. Baklofen til inntöku hafði engar aukaverkanir á frjósemi hjá körlum eða konum í skömmtum sem voru minni en þeir sem ollu eituráhrifum á móður hjá rottum.

Meðganga

Baklofen fer yfir fylgju og má því aðeins nota á meðgöngu þegar væntanlegur heildarávinningur vegur þyngra en hugsanleg áhætta fyrir fóstrið.

Ekki liggja fyrir fullnægjandi samanburðarrannsóknir hjá þunguðum konum sem benda til vanskapandi áhrifa á fóstur. Hugsanleg áhætta hjá mönnum er ekki þekkt.

Tilkynnt hefur verið um fráhrarfseinkenni hjá nýbura eftir að móðirin hafði tekið inn baklofen á meðgöngu.

Brjóstagjöf

Baklofen skilst út í brjóstamjólk en ekki er búist að barnið verði fyrir áhrifum við brjóstagjöf þegar notaðir eru ráðlagðir skammtar.

4.7 Áhrif á hæfni til aksturs og notkunar véla

Baklofen Viatrix getur vegna aukaverkana eins og sundl, slævandi áhrifa, svefnhöfga og sjóntruflana haft veruleg áhrif á hæfni til aksturs og notkunar véla (sjá kafla 4.8).

4.8 Aukaverkanir

Aukaverkanir koma aðallega fram í upphafi meðferðar (t.d. slævandi áhrif og svefnhöfgi), ef skammtur er aukinn of geyst eða stórir skammtar eru notaðir. Aukaverkanirnar eru oft skammvinnar og minnka eða hverfa alveg þegar skammtar eru minnkaðir. Aukaverkanirnar eru mjög sjaldan það alvarlegar að nauðsynlegt þygi að hætta meðferð. Hjá sjúklingum með sögu um geðræna sjúkdóma eða sjúkdóma í heilaæðum (t.d. heilablóðfall) og hjá öldruðum sjúklingum geta aukaverkanir verið alvarlegri. Hjá sumum sjúklingum hefur aukinn stífleiki í vöðvum komið fram sem svörun við lyfjagjöfni.

Aukaverkanir (tafla 1) eru flokkaðar eftir MedDRA líffæraflokkum. Aukaverkunum er raðað eftir tíðni, samkvæmt eftirfarandi flokkun, þær algengustu fyrst: mjög algengar ($\geq 1/10$); algengar ($\geq 1/100$ til $< 1/10$), sjaldgæfar ($\geq 1/1.000$ til $< 1/100$), mjög sjaldgæfar ($\geq 1/10.000$ til $< 1/1.000$); koma örsjaldan fyrir ($< 1/10.000$), tíðni ekki þekkt (ekki hægt að áætla tíðni út frá fyrirliggjandi gögnum). Innan hvers tíðniflokks eru alvarlegustu aukaverkanirnar taldar upp fyrst.

Tafla 1 Aukaverkanir

Geðræn vandamál Algengar	Ringlun/vistarfiring, ofskynjanir, þunglyndi, svefntruflanir þ.m.t. svefnleysi, sæluvíma, martraðir.
Taugakerfi Mjög algengar Algengar Mjög sjaldgæfar Tíðni ekki þekkt	Slævandi áhrif, svefnhöfgi/syfja. Sundl, hreyfiglöp, skjálfti, höfuðverkur, sljóleiki, þrekleysi. Krampi ¹ , lækkaður krampaþröskuldur, náladofi, talerfiðleikar. Versnun einkenna parkinsonsjúkdóms, kæfisvefnshéilkenni (sleep apnoea syndrome) ² , heilakvilli.
Augu Algengar	Sjónskerðing, truflanir á sjónstillingu (þokusýn, rangeygð, ljósopsþrenging), augntin.
Eyru og vöndarhús Mjög sjaldgæfar	Eyrnasuð.
Hjarta Algengar Mjög sjaldgæfar Tíðni ekki þekkt	Minnkað mínúturúmmál. Hjartsláttarónot, brjóstverkur, yfirlið. Hægsláttur
Æðar Algengar	Lágþrýstingur.
Öndunarfæri, brjósthol og miðmæti Algengar	Öndunarbæling.
Meltingarfæri Mjög algengar Algengar Mjög sjaldgæfar	Ógleði. Meltingarkvillar, hægðatregða, niðurgangur, uppköst, munnþurrkur, truflað bragðskyn. Kviðverkir.
Lifur og gall Mjög sjaldgæfar	Áhrif á lifrarstarfsemi.
Húð og undirhúð Algengar Sjaldgæfar Tíðni ekki þekkt	Útbrot, ofsvitnun. Kláði. Ofsakláði.

Stoðkerfi og stoðvefur Algengar	Máttleysi í vöðvum, vöðvaverkir.
Mjög sjaldgæfar	Stífleiki í vöðvum.
Mjög sjaldgæfar – Koma örsjaldan fyrir	Trufluð vöðvaspenna.
Nýru og þvagfæri Algengar	Tíð þvaglát, ósjálfráð þvaglát, þvaglátstregða.
Mjög sjaldgæfar	Þvagteppa.
Æxlunarfæri og brjóst Sjaldgæfar	Ristruflanir (getuleysi, sáðlátsvandamál).
Almennar aukaverkanir og aukaverkanir á íkomustað Algengar	Preyta.
Sjaldgæfar	Þyngdaraukning, bjúgur á ökklum eða útlimum.
Koma örsjaldan fyrir	Lækkun líkamshita.
Tíðni ekki þekkt	Fráhvarfsheilkenni ³
Rannsóknaniðurstöður Tíðni ekki þekkt	Hækkaður blóðsykur.

¹ Krampar koma einkum fram hjá flogaveikum.

² Kæfisvefn af miðlægum toga (central sleep apnoea syndrome) hefur komið fram við notkun baklofens í stórum skömmtum (≥ 100 mg) hjá áfengissjúklingum.

³ Tilkynt hefur verið um fráhvarfseinkenni eftir útsetningu fyrir baklofeni, sem tekið var inn, í móðurkviði.

Tilkynning aukaverkana sem grunur er um að tengist lyfinu

Eftir að lyf hefur fengið markaðsleyfi er mikilvægt að tilkynna aukaverkanir sem grunur er um að tengist því. Þannig er hægt að fylgjast stöðugt með sambandinu milli ávinnings og áhættu af notkun lyfsins. Heilbrigðisstarfsmenn eru hvattir til að tilkynna allar aukaverkanir sem grunur er um að tengist lyfinu til Lyfjastofnunar, www.lyfjastofnun.is.

4.9 Ofskömmun

Eiturverkanir

Fullorðnir

100-200 mg: miðlungi alvarleg eitrun.

240-450 mg: alvarleg eitrun.

0,5 g og 1,5 g: mjög alvarleg eitrun.

1 g hefur valdið meðvitundarleysi.

1,25 g - 2 g hafa valdið dauðsföllum.

Aldraðir

100 mg: miðlungi alvarleg eitrun.

Börn

120 mg hjá 2 ára: alvarleg eitrun.

75 mg hjá 10 ára: miðlungi alvarleg eitrun.

Einkenni

Einkenni: Áberandi einkenni eru merki um miðtaugakerfisbælingu eða heilakvilla svo sem svefndrungi, skert meðvitund, öndunarbæling og eyrnasuð.

Einnig geta komið fram: rugl, ofskynjanir, æsingur, krampar, óeðlilegt heilarafrit („burst suppression“ mynstur og þrífasa bylgjur), dreifð hægbylgjuvirkni á heilarafriti, truflanir á sjónstillingu, skert ljósopsviðbragð, almennur vöðvaslappleiki, vöðvakippir, vanviðbrögð eða viðbragðaleysi, krampar; útæðavíkkun, lágþrýstingur eða háþrýstingur, hægsláttur eðahraðtaktur eða hjartsláttaróregla, lágur líkamshiti, ógleði, uppköst, niðurgangur, aukin munnvatnsmyndun, hækkuð gildi lifrarensíma, öndunarstöðvun í svefni, rákvöðvalýsa.

Einkenni ofskömmtnar geta orðið alvarlegri, ef fleiri efni eða lyf sem verka á miðtaugakerfið hafa verið tekin inn samhliða, t.d. áfengi, díazepam og þríhringlaga þunglyndislyf.

Meðferð

Ekkert sértækt mótefni er til.

Einkennabundin meðferð við fylgikvillum eins og lágþrýstingi, háþrýstingi, krömpum, meltingartruflunum og bælingu á öndunar- eða hjartastarfsemi.

Eftir inntöku skammts sem hugsanlega veldur eiturveknum skal íhuga meðferð með lyfjakolum þegar stutt er liðið frá inntöku. Á fyrsta tímabilinu (60 mín.) eftir inntöku skammts sem hugsanlega er lífshættulegur skal íhuga magatæming (t.d. magaskolon) í hverju tilviki fyrir sig. Sjúklinga í dái eða með krampa skal barkaþræða áður en magatæming er hafin.

Þar sem lyfið skilst aðallega út um nýru skal gefa ríkulegt magn vökva, ásamt þvagræsilyfi ef hægt er. Beita má blóðskilun þegar um alvarlega eitrun er að ræða (sjá kafla 4.4).

5. LYFJAFRÆÐILEGAR UPPLÝSINGAR

5.1 Lyfhrif

Flokkun eftir verkun: Önnur vöðvaslakandi lyf, sem hafa miðlæg áhrif, ATC flokkur: M 03 B X 01.

Baklofen er krampastillandi lyf sem hefur bælandi verkun á einmóta (monosynaptic) og fjölmóta (polysynaptic) viðbrögð í mænu með því að örva GABA_B-viðtaka. Þessi örvun hindrar losun glutamats og aspartats.

Lyfhrif

Lyfhrif baklofens eru minnkun spennu og færri síspennutilvik í vöðvum vegna viðbragða. Baklofen hefur ekki áhrif á flutning taugaboða til vöðva. Baklofen örvar seytingu magasýru.

5.2 Lyfjahvörf

Frásog

Baklofen frásogast hratt og að fullu úr meltingarvegi. 0,5-1,5 klst. eftir inntöku næst 180 ng/ml hámarksþéttni í plasma eftir 10 mg skammt, 340 ng/ml eftir 20 mg skammt og 650 nanógrömm/ml eftir 30 mg skammt. AUC er í réttu hlutfalli við skammtastærð.

Dreifing

Dreifingarrúmmálið er 0,7 l/kg. Próteinbinding er um það bil 30% og er stöðug á þéttibilinu frá 10 nanógrömm/ml til 300 míkrogrömm/ml. Þéttni í heila- og mænuvökva er um 8,5 sinnum minni en í plasma.

Umbrot

Helsta umbrotsefnið er lyfjafræðilega óvirk β-(p-klórófenýl)-4-hýdroxybútansýra, en baklofen er ekki umbrotið nema að litlu leyti.

Brotthvarf

Helmingunartíminn er 3-4 klst. og lyfið útskilst að mestu á óbreyttu formi. Eftir 72 klst. hefur um 75% af skammtinum verið skilið út um nýrun, þar af um 5% sem umbrotsefni. Brotthvarf þess sem eftir er af skammtinum verður með hægðum.

Sérstakir sjúklingahópar

Aldraðir (≥ 65 ára)

Lyfjahlvörf baklofens hjá öldruðum sjúklingum eru nánast eins og hjá sjúklingum sem eru yngri en 65 ára. Eftir inntöku staks skammts er brotthvarf hægara hjá öldruðum sjúklingum en altæk útsetning er samsvarandi, samanborið við fullorðna sem eru yngri en 65 ára. Yfirfærsla þessara niðurstaðna á meðferð með endurteknum skömmtum bendir ekki til verulegs munar á lyfjahlvörfum milli sjúklinga sem eru yngri en 65 ára og aldara sjúklinga.

Börn

Eftir að börnum (á aldrinum 2 til 12 ára) voru gefnar 2,5 mg baklofen töflur til inntöku mældist C_{max} $62,8 \pm 28,7$ nanógrömm/ml og t_{max} 0,95-2 klst. Meðalplasmaúthreinsun (Cl) var 315,9 ml/klst/kg; dreifingarrúmmál (Vd) 2,58 l/kg og helmingunartími ($t_{1/2}$) 5,10 klst.

Skert lifrarstarfsemi

Engar upplýsingar liggja fyrir um lyfjahlvörf eftir gjöf baklofens hjá sjúklingum með skerta lifrarstarfsemi. Þar sem lifrin gegnir ekki mikilvægu hlutverki í umbroti baklofens er ólíklegt að klínískt mikilvæg breyting verði á lyfjahlvörfum hjá sjúklingum með skerta lifrarstarfsemi.

Skert nýrnastarfsemi

Engar klínískar samanburðarannsóknir eru fyrirliggjandi á lyfjahlvörfum eftir gjöf baklofens hjá sjúklingum með skerta nýrnastarfsemi. Baklofen útskilst aðallega óbreytt í þvagi. Takmarkaðar upplýsingar um plasmaþéttni, sem safnað var hjá konum í langvarandi blóðskilunarmeðferð eða með tempraða (compensated) nýrnabilun, benda til verulega minnkaðrar úthreinsunar og lengri helmingunartíma baklofens hjá þessum sjúklingum. Íhuga skal að breyta baklofenskömmtum með tilliti til altækrar þéttni hjá sjúklingum með skerta nýrnastarfsemi. Tafarlaus blóðskilunarmeðferð er árangursrík aðferð til að hreinsa umframmagn baklofens úr blóðrás.

5.3 Forklínískar upplýsingar

Eiturverkun á æxlun

Hjá rottum hafði inntaka baklofens, í minni skömmtum en þeim sem höfðu eituráhrif á mæður, engar aukaverkanir á frjósemi eða þroska eftir got. Baklofen hafði ekki vanskapandi áhrif hjá músum, rottum eða kanínum í skömmtum sem voru að minnsta kosti 0,34-faldur hámarksskammtur til inntöku, í mg/m², hjá fullorðnum. Komið hefur í ljós að baklofen sem gefið er til inntöku hækkar tíðni kviðveggsgalla (magálshauls) hjá rottufóstrum, þegar það er gefið í u.þ.b. 1,35-földum hámarksskammti til inntöku, í mg/m², hjá fullorðnum. Þessi afbrigðileiki sást ekki hjá músum eða kanínum. Komið hefur í ljós að baklofen gefið til inntöku olli seinkun á fósturvexti (beingervingu) í skömmtum sem einnig ollu eiturverkun á mæður hjá rottum og kanínum.

Stökkbreytandi og krabbameinsvaldandi áhrif

Baklofen sýndi ekki stökkbreytandi áhrif eða eituráhrif á erfðaeftni í prófum í bakteríum, spendýrafrumum, gerfrumum eða í kínerskum hömstrum. Þetta bendir til þess að ósennilegt sé að baklofen hafi stökkbreytandi áhrif. Baklofen hafði ekki krabbameinsvaldandi áhrif í rannsókn á rottum sem stóð í 2 ár. Hjá kvenrottum sem var gefið baklofen í tvö ár virtist verða skammtaháð aukning á tíðni blaðra í eggjastokkum og stækkun og/eða blæðingu í nýrnahettum við hámarksskammta (50 til 100 mg/kg).

6. LYFJAGERÐARFRÆÐILEGAR UPPLÝSINGAR

6.1 Hjálparefni

Örkristallaður sellulósi
Laktósaeynhýdrat
Vatnsfrítt kalsíumhýdrógenfosfat
Vatnsfrí kísilkvoða
Magnesíumsterat
Natríumsterkjuglýkólat.

6.2 Ósamrýmanleiki

Á ekki við.

6.3 Geymsluþol

3 ár.

6.4 Sérstakar varúðarreglur við geymslu

Geymið við lægri hita en 30°C.

6.5 Gerð íláts og innihald

10 mg

Grænar PVC/PVdC álþynnur með 50 töflum.
Hvít HDPE-glas með 50, 100, 200 eða 250 töflum.

25 mg

Grænar PVC/PVdC álþynnur með 50 töflum.
Hvít HDPE-glas með loki úr pólýprópýleni, með 50 töflum.

Ekki er víst að allar pakkningastærðir séu markaðssettar.

6.6 Leiðbeiningar um förgun og aðra meðhöndlun

Engin sérstök fyrirmæli.
Farga skal öllum lyfjaleifum og/eða úrgangi í samræmi við gildandi reglur.

7. MARKAÐSLEYFISHAFI

Viartis Limited
Damastown Industrial Park
Mulhuddart
Dublin 15
Dublin
Írland

8. MARKAÐSLEYFISNÚMER

10 mg: 870161 (IS)
25 mg: 870162 (IS)

**9. DAGSETNING FYRSTU ÚTGÁFU MARKAÐSLEYFIS/ENDURNÝJUNAR
MARKAÐSLEYFIS**

Dagsetning fyrstu útgáfu markaðsleyfis: 1. janúar 1990.
Dagsetning endurnýjunar markaðsleyfis: 1. júlí 2011.

10. DAGSETNING ENDURSKOÐUNAR TEXTANS

14. október 2024.