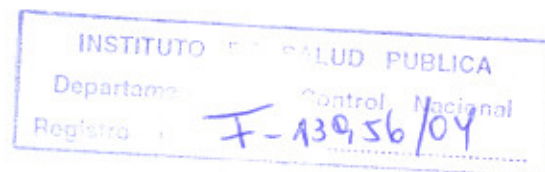


FOLLETO DE INFORMACION MEDICA

Pitil MR

Baclofeno 10 mg

Comprimidos



29 JUN 2004

COMPOSICIÓN

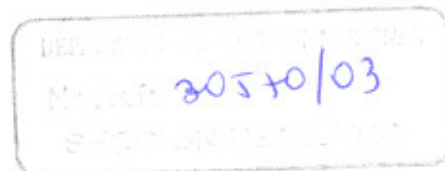
Cada comprimido contiene:

Baclofeno 10 mg

Excipientes: polividona, celulosa microcristalina pH 101, crospovidona, dióxido de silicio coloidal, estearato de magnesio, almidón de maíz.

PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Relajante muscular, antiespástico.



PROPIEDADES FARMACODINAMICAS

Pitil MR es un antiespástico sumamente eficaz con un punto de ataque medular. El Baclofeno amortigua la conducción monosináptica y polisináptica de los reflejos en la medula espinal estimulando a los receptores del GABA_B que inhibe a su vez la liberación de los aminoácidos excitatorios glutamato y aspartato.

La transmisión neuromuscular no resulta afectada por el baclofeno. El baclofeno ejerce un efecto antinociceptivo. En las afecciones neurológicas que se acompañan de espasmos en la musculatura estriada, la acción del **Pitil MR** se traduce clínicamente por un influjo favorable sobre las contracciones musculares reflejas y un alivio marcado de los espasmos dolorosos, los automatismos y el clonus. **Pitil MR** favorece la movilidad del paciente, ayudándole a valerse mejor por sí solo (inclusive cateterización) y facilita además la fisioterapia. También se ha observado la prevención y curación de úlceras por decúbito, la mejoría del sueño, gracias a la eliminación de espasmos musculares dolorosos, y de las funciones vesical y esfinteriana, como efectos indirectos del tratamiento con **Pitil MR**, lo cual proporciona una mayor calidad de vida a los pacientes.

El Baclofeno estimula la secreción de ácido gástrico.

PROPIEDADES FARMACOCINETICAS

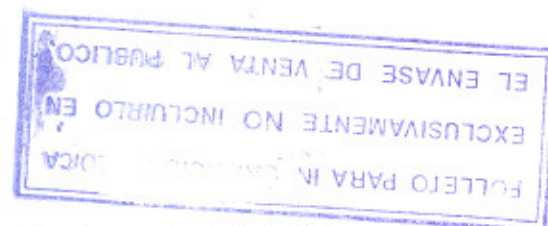
Absorción

El Baclofeno se absorbe rápida y completamente en el tracto gastrointestinal.

Después de administrar dosis orales simples de 10, 20 y 30 mg de Baclofeno se han medido concentraciones plasmáticas máximas medias de 180, 340 y 650 ng/ml respectivamente al cabo de media hora a hora y media. Las correspondientes áreas bajo la curva de la concentración sérica (ABC) son proporcionales al volumen de la dosis.

Distribución

El volumen de distribución del baclofeno es de 0,7 l/kg y la tasa de incorporación a proteínas es del 30% aproximadamente. La sustancia activa alcanza en el líquido cefalorraquídeo concentraciones aproximadamente 8,5 veces más bajas que en el



Biotransformación

El baclofeno sólo se metaboliza en escasa medida. La desaminación da origen al principal metabolito, el ácido β -(p-clorofenil)-4-hidroxibutírico que es farmacológicamente inactivo

Eliminación/excreción

La vida media de eliminación plasmática del Baclofeno es de tres a cuatro horas en promedio. El Baclofeno se excreta mayormente en forma inalterada. En el plazo de 72 horas se excreta alrededor del 75% de la dosis a través de los riñones, estando constituido el 5 % aproximadamente por metabolitos. El resto de la dosis, inclusive un 5 % en forma de metabolitos se excreta con las heces.

Características en los pacientes

La farmacocinética del Baclofeno en los pacientes de edad es virtualmente igual que en los sujetos jóvenes.

INDICACIONES TERAPEUTICAS

Espasticidad de la musculatura estriada en la esclerosis múltiple. Estados espásticos en las mielopatías (de etiología infecciosa, degenerativa, traumática, neoplásica).

POSOLOGÍA Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN

El tratamiento se iniciará siempre con dosis bajas de **Pitil MR** que se incrementarán gradualmente. La dosis diaria óptima se adaptará individualmente a las necesidades del paciente, de tal modo que se aminoren el clonus, los espasmos de flexores y extensores y la espasticidad, pero evitando en lo posible los efectos secundarios.

Para evitar una debilidad excesiva y las caídas, **Pitil MR** se empleará con precaución cuando la espasticidad sea necesaria para mantener la postura erguida y el equilibrio en la locomoción o cuando la espasticidad se utilice para mantener la función. Puede ser importante mantener cierto grado de tonicidad muscular y permitir que se produzcan espasmos ocasionales para contribuir a apoyar la función circulatoria.

Pitil MR se ingerirá durante las comidas con un poco de líquido. La dosis diaria se fraccionará preferentemente en 3 tomas para los adultos y en 4 para los niños.

Adultos

El tratamiento debería iniciarse por regla general con una dosis de 5 mg tres veces diarias, aumentándose luego con cautela cada tres días en 5 mg tres veces diarias hasta llegar a la dosis cotidiana necesaria. En ciertos pacientes que reaccionan sensiblemente a los medicamentos, puede ser aconsejable empezar con una dosificación diaria baja (5 mg o 10 mg) y elevarla más gradualmente. La posología óptima suele oscilar entre 30 mg y 80 mg al día. Pueden administrarse a pacientes hospitalizados cuidadosamente controlados dosis diarias de 100-120 mg.

Niños

La seguridad y eficacia no han sido establecidas en niños menores de 12 años.

El tratamiento deberá iniciarse normalmente con una dosis muy baja, p.ej. 0,3 mg/kg al día en dosis fraccionadas. La posología se aumentará precavidamente a intervalos de alrededor de 1-2 semanas, hasta que sea suficiente para las necesidades individuales del niño. Las dosis diarias usuales para la terapéutica de mantenimiento oscilan entre 0,75 y 2 mg/kg de peso corporal. Sin embargo, a niños de más de 10

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.

años de edad, se les puede administrar una dosis máxima diaria de 2,5 mg/kg de peso.

Si no se aprecia mejoría tras 6 a 8 semanas de haberse alcanzado la posología máxima, se decidirá si se debe continuar administrando **Pitil MR**.

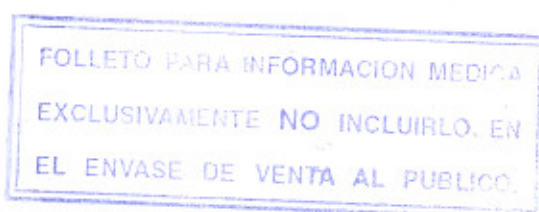
En los sujetos con *menoscabo de la función* renal el baclofeno se administrará con precaución y a dosis más bajas. En los pacientes sometidos a hemodiálisis crónica, están elevadas las concentraciones plasmáticas de baclofeno. por lo que deberá elegirse una dosificación particularmente baja de **Pitil MR**, es decir, unos 5 mg diarios.

Comoquiera que entre los *pacientes ancianos* hay que contar con efectos indeseados más frecuentes, se recomienda una dosificación extremadamente cautelosa y someterlos a una vigilancia apropiada.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad conocida al Baclofeno.

EFFECTOS ADVERSOS



Los efectos adversos se manifiestan principalmente al instituirse el tratamiento, si se incrementa la dosis con demasiada rapidez o si se emplean dosis altas. Suelen ser de naturaleza pasajera y pueden reducirse o suprimirse disminuyendo la posología. Rara vez son tan intensos que hagan necesario retirar la medicación. Es posible que los efectos secundarios sean más graves en los sujetos con antecedentes de enfermedad mental o afecciones cerebrovasculares (p.ej. ataque apopléjico) y en los ancianos.

Sistema nervioso central

Frecuente: particularmente al comienzo de la medicación: sedación diurna, somnolencia. **Ocasionales:** depresión respiratoria, aturdimiento, lasitud, agotamiento, confusión mental, vértigo, cefalea, insomnio, euforia, depresión, debilidad muscular, ataxia, temblor, alucinaciones, pesadillas, mialgia, nistagmo, sequedad de boca.

Raros: parestesias, disartria.

Es posible que descienda el umbral de las convulsiones y se produzcan accesos convulsivos, sobre todo en los epilépticos.

Organos sensoriales

Ocasionales: trastornos de la acomodación, alteraciones visuales.

Raros: disgeusia.

Tracto gastrointestinal

Frecuente: náusea; **Ocasionales:** trastornos gastrointestinales leves, náuseas, vómitos, estreñimiento, diarrea; **Raros:** dolor abdominal.

Sistema cardiovascular

Ocasionales: hipotensión, funciones cardiovasculares disminuidas.

Sistema urogenital

Ocasionales: micción frecuente, enuresis, disuria. **Raros:** retención de orina, impotencia.

Hígado:

Raro: trastorno de la función hepática.

Piel:

Ocasionales: hiperhidrosis, exantema.

Ciertos pacientes han mostrado un incremento de la espasticidad como reacción paradójica a la medicación. Se sabe que muchos de los efectos secundarios comunicados ocurren en asociación con la enfermedad subyacente que se está tratando.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES ESPECIALES DE EMPLEO

Los pacientes que sufran trastornos psicóticos, esquizofrenia, trastornos depresivos o maniacos, estados de confusión o enfermedad de Parkinson deberán ser tratados precavidamente con **Pitil MR** y mantenidos bajo estrecha vigilancia, ya que pueden producirse exacerbaciones de estos estados.

Habrà que prestar particular atención a los pacientes que se sabe padecen epilepsia, ya que puede darse un descenso del umbral para las convulsiones y se han comunicado crisis convulsivas ocasionales relacionadas con la interrupción del **Pitil MR** o con una sobredosificación del mismo. Se mantendrá una terapéutica anticonvulsiva adecuada y se vigilará cuidadosamente al enfermo.

Pitil MR se empleará con precaución en los sujetos con úlcera péptica o antecedentes de la misma, así como en los que sufran afecciones cerebrovasculares o respiratorias, así como insuficiencia hepática o renal.

Bajo el tratamiento con **Pitil MR** pueden mejorar los trastornos neurógenos que afectan al vaciado de la vejiga. En pacientes con hipertonia del esfínter preexistente puede producirse una retención aguda de orina; el preparado se empleará con cuidado en tales casos.

Puesto que se han registrado en raras ocasiones valores aumentados de SGOT, fosfatasa alcalina y niveles de glucosa en el suero, se efectuarán periódicamente los análisis de laboratorio pertinentes en los enfermos con afecciones hepáticas o diabetes mellitus, a fin de asegurarse de que no se trata de alteraciones de las enfermedades de base inducidas por el medicamento.

Interrupción súbita

Se han comunicado ansiedad y estados de confusión, alucinaciones, estados psicóticos, maniacos o paranoides, convulsiones (estado epiléptico), discinesia, taquicardia, hipertermia y, como fenómeno de rebote, empeoramiento temporal de la espasticidad tras la suspensión abrupta del **Pitil MR**, especialmente después de una medicación prolongada. Por esta razón, la terapéutica deberá retirarse gradualmente, reduciendo la dosificación de modo progresivo (durante un periodo aproximado de 1-2 semanas), excepto cuando se producen emergencias por sobredosis o ha habido efectos secundarios graves.

Embarazo y lactancia

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.

El Baclofeno administrado por vía oral ha demostrado aumentar la incidencia de onfalocela (hernia umbilical) en fetos de ratas que recibieron aproximadamente 13 veces la dosis oral máxima (en base a mg/kg) recomendada para el empleo en seres humanos. Esta anomalía no se apreció en ratones o conejos.

No existen estudios adecuados y bien controlados con mujeres embarazadas. Baclofeno cruza la barrera placentaria y no debería emplearse durante el embarazo, a no ser que el beneficio potencial compense el posible riesgo para el feto.

En las madres que toman **Pitil MR** a dosis terapéuticas, la sustancia activa pasa a la leche materna, pero en cantidades tan pequeñas que no cabe esperar efectos indeseados en el lactante.

Efectos sobre la capacidad para conducir vehículos y utilizar maquinaria

La capacidad de reacción del paciente puede resultar menoscabada por la sedación y la pérdida de vigilia causadas por **Pitil MR**, por lo que se impone cautela al conducir vehículos o manejar maquinaria.

INTERACCION CON OTROS MEDICAMENTOS Y OTRAS FORMAS DE INTERACCION

Cuando **Pitil MR** se toma simultáneamente con otros fármacos que actúan sobre el SNC, con opiáceos sintéticos o con alcohol, puede darse un mayor grado de sedación (ver también bajo ("Efectos sobre la capacidad para conducir vehículos y utilizar maquinaria"). También está aumentado el riesgo de depresión respiratoria.

Es esencial un control cuidadoso de las funciones respiratoria y cardiovascular, especialmente en pacientes con afección cardiopulmonar y debilidad del músculo respiratorio.

Durante el tratamiento simultáneo con antidepresivos tricíclicos, el efecto de **Pitil MR** puede verse potenciado, derivándose una pronunciada hipotonía muscular.

Puesto que es probable que la medicación simultánea con **Pitil MR** y antihipertensivos intensifique el descenso tensional, la dosificación de los antihipertensivos se ajustará de modo conveniente.

Se ha comunicado hipotensión en un paciente que recibía morfina y baclofeno intratecal.

Se ha comunicado la aparición de confusión mental, alucinaciones, cefaleas, náuseas y agitación en pacientes afectados de la enfermedad de Parkinson que recibían tratamiento con **Pitil MR** y levodopa.

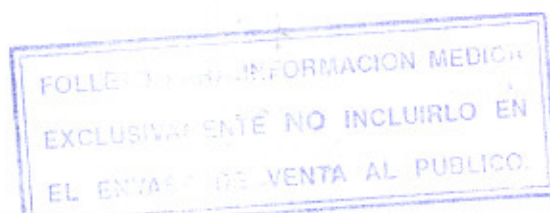
SOBREDOSIFICACION

Signos y síntomas:

Predominan los signos de depresión del sistema nervioso central: somnolencia, menoscabo de la conciencia, coma, depresión respiratoria.

También pueden manifestarse: confusión, alucinaciones, agitación, convulsiones, trastornos de la acomodación, ausencia de reflejo pupilar, hipotonía muscular generalizada, núoclonía, hiporreflexia o arreflexia, vasodilatación periférica, hipotensión, bradicardia, hipotermia, náusea, vómito, diarrea, hipersalivación, enzimas hepáticas aumentadas.

Puede producirse un empeoramiento del síndrome de sobredosis si se han tomado simultáneamente varias sustancias que actúan sobre el sistema nervioso central (p.ej. alcohol, Diazepam, antidepresivos tricíclicos).



Tratamiento

No se conoce un antídoto específico .

Eliminación del fármaco del tracto gastrointestinal (inducción del vómito, lavado gástrico; los pacientes comatosos deberían ser intubados antes del lavado gástrico), administración de carbón activado; si se juzgan apropiados, laxantes salinos; en presencia de depresión respiratoria se aplicará la respiración artificial y se reforzarán las funciones cardiovasculares. Dado que el fármaco se elimina principalmente a través de los riñones, se darán grandes cantidades de líquidos, acaso junto con un diurético. La diálisis puede ser útil en caso de intoxicación aguda asociada con insuficiencia renal. En caso de convulsiones el Diazepam se administrará con cautela por vía i.v..

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.