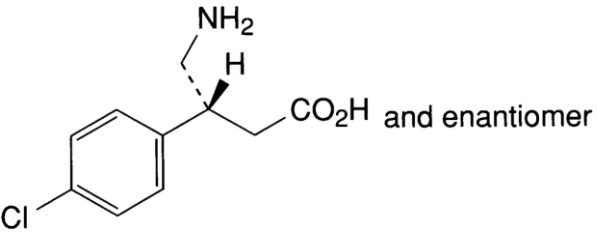


	<b>INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)</b>		<b>CODIGO: R-VE-74</b>
			<b>VERSION: 01</b>
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 1 de 6

<b>1. Denominación</b>	
Nombre:	<b>BACLOFLEX® TABLETAS</b>
Principio Activo:	BACLOFENO
Forma Farmacéutica:	TABLETA
Presentaciones:	Frascox 30tabletas

<b>2. Presentación:</b>	
Cada tableta contiene:	
Baclofeno	10 mg
Excipiente c.b.p	1 TABLETA

<b>3. Fórmulas:</b>	
Fórmula de Baclofeno	$C_{10}H_{12}ClNO_2$
Nombre Químico de Baclofeno	(3RS)-4-amino-3-(4-chlorophenyl)butanoicacid
Estructura Química	
P.M. de Baclofeno	213.7
Número CAS: Baclofeno	1134-47-0

<b>4. Aspectos Químicos:</b>	
Polvo blanco o casi blanco. Ligeramente soluble en agua y alcohol. Insoluble en éter y acetona, soluble en soluciones ácidas	

	<b>INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)</b>			<b>CODIGO: R-VE-74</b>
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 2 de 6	<b>VERSION: 01</b> Firma de aprobación: 

--

<b>5. Categoría:</b>
<p>Grupo fármaco terapéutico:Relajantes musculares. Agentes relajantes musculares de acción central. Otros agentes de acción central.</p> <p>ATC: M03BX01</p>

<b>6. Indicaciones:</b>
<p><b>Bacloflex®</b>(baclofeno) es un relajante muscular.</p> <p>Este medicamento se utiliza para aliviar espasmos y calambres musculares como consecuencia de algunas enfermedades que afectan otros trastornos del sistema nervioso, como la enfermedad de la neurona motora y meningitis o bien como consecuencia de accidentes vasculares cerebrales o daño consecutivo a traumatismos de la cabeza o la columna vertebral.</p> <p>Esto quiere decir que para las lumbalgias crónicas es un excelente escoge.</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>-Tratamiento del hipo persistente (singulto)</li> <li>-Tratamiento de la neuralgia del trigémino.</li> <li>-Tratamiento de la espasticidad en la esclerosis múltiple o en otros desórdenes de la médula espinal (isquemia espinal, tumor espinal, mielitis transversa, espondilosis cervical, parálisis cerebral o mielopatía degenerativa).</li> <li>-Crisis de Migraña.</li> </ul>

<b>7. Farmacología:</b>
<p><b>FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:</b></p> <p><b>Bacloflex®</b> contiene como sustancia activabaclofeno; el cual es un relajante muscular activo por vía oral. Se trata de un derivado del neurotransmisor inhibidor ácido Gamma-aminobutírico (<b>GABA</b>). El baclofeno es utilizado clínicamente para tratar la espasticidad y mejorar la movilidad de los pacientes con esclerosis múltiple y otras lesiones de la médula espinal, aliviando el dolor y la rigidez muscular. El baclofeno también mejora la función de la vejiga urinaria e intestino en algunos de estos pacientes.</p> <p><b>Mecanismo de acción.</b></p> <p>No se conoce con muy bien el mecanismo de acción del baclofeno, aunque se cree que el fármaco actúa a nivel de la médula espinal bloqueando las vías de transmisión aferentes polisináptica y monosinápticas. El baclofeno bloquea la transmisión de impulsos por estas vías actuando como un neurotransmisor inhibitorio por sí mismo, o también induciendo una hiperpolarización de los terminales nerviosos primarios, lo que inhibiría la liberación de</p>

	<b>INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)</b>			<b>CODIGO: R-VE-74</b>
				<b>VERSION: 01</b>
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 3 de 6	Firma de aprobación: 

neurotransmisores excitatorios como el glutamato o el aspartato. Como el baclofeno en dosis elevadas ocasiona una depresión del sistema nervioso central, se ha postulado que el fármaco también actúa a nivel supraespinal. Incluso, se ha descrito el baclofeno como un agonista **GABA** (Ácido Gammaaminobutírico), lo que reduciría la liberación de los neurotransmisores aspartato y glutamato y minimizaría la excitabilidad de las neuronas alfamotoras. En resumen, el Baclofeno es un análogo del ácido Gammaaminobutírico (**GABA**). Se utiliza para tratar la rigidez, y la tensión en los músculos (espasticidad). Este medicamento ayuda a aliviar los espasmos y calambres musculares.

#### **Farmacocinética.**

**Bacloflex®** administrado por vía oral se absorbe rápida y completamente, aunque su biodisponibilidad varía de un paciente a otro. La velocidad y extensión de la absorción son inversamente proporcionales a la dosis. Las concentraciones máximas en sangre se obtienen a las 2-3 horas. El baclofeno se distribuye ampliamente por el organismo, y sólo cruza la barrera hemato-encefálica en muy pequeña proporción. Su unión a las proteínas del plasma es pequeña. El fármaco es metabolizado en un 15% por el hígado. El resto es eliminado sin alterar por vía urinaria. La semivida de eliminación es de 2.5 a 4 horas. Entre el 75-80% de la dosis se excreta por vía renal, en forma de fármaco sin alterar o de metabolitos y el resto se elimina en las heces.

### **8. Posología:**

**Bacloflex®** se utiliza en Cuadros severos espásticos de cualquier etiología, incluyendo la espasticidad en la en los desórdenes de la médula espinal (isquemia espinal, tumor espinal, mielitis transversa, espondilosis cervical, parálisis cerebral o mielopatía degenerativa); así como la espasticidad de la Esclerosis Múltiple.

#### **Administración oral:**

-Adultos: Inicialmente, 5 mg tres veces al día, aumentando las dosis gradualmente cada tres días en 5 mg en cada administración (o sea 15 mg/día) hasta alcanzar las dosis de 40 a 80 mg al día.

-Niños > 8 años: Inicialmente entre 10 y 15 mg/día en dosis divididas. Luego aumentar gradualmente hasta un máximo de 60 mg al día.

-Niños entre 2 y 7 años: inicialmente 10-15 mg/día en 3 dosis divididas. Las dosis se pueden aumentar gradualmente hasta un máximo de 40 mg al día

-Tratamiento del hipo persistente (singulto): Se han utilizado dosis de 10 mg por vía oral cuatro veces al día

-Tratamiento de la neuralgia del trigémino: Se recomiendan dosis iniciales de 5 mg por vía oral

	<b>INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)</b>			<b>CODIGO: R-VE-74</b>
				<b>VERSION: 01</b>
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 4 de 6	Firma de aprobación: 

tres veces al día, aumentando estas dosis si fuera necesario en incrementos de 5 mg en cada dosis cada tres días hasta conseguirse una respuesta adecuada o la dosis máxima de 80 mg/día.

-Tratamiento de la crisis de Migraña: 20 mg dosis de ataque y repetir hasta tres veces al día. Aumentar la dosis, si fuese necesario hasta 80 mg diarios.

### 9. Efectos Adversos:

Las reacciones adversas más frecuentes observadas con el baclofeno administrado por vía oral son: Mareos, vértigo, debilidad, cefaleas, náuseas/vómitos, hipotensión, constipación, letargia/fatiga, confusión, insomnio y aumento de la frecuencia urinaria.

Otros efectos secundarios asociados al tratamiento con baclofeno son:

*Sistema nervioso central:* Euforia, excitación, depresión, alucinaciones, parestesias, mialgia, tinnitus, desórdenes de la coordinación, tremor, distonía, ataxia, nistagmus, estrabismo, miosis, midriasis y diplopía

*Sistema gastrointestinal:* Anorexia, disgeusia, dolor abdominal, diarrea, sangre en las heces.

*Sistema cardiovascular:* Palpitaciones, angina, diaforesis, síncope.

*Sistema genitourinario:* Enuresis (incontinencia urinaria), retención urinaria, disuria, impotencia, disfunción de la eyaculación, nicturia, hematuria (rara).

*Sistema respiratorio:* Disnea, congestión nasal, neumonía

*Otros:* Rash, prurito, edema del tobillo, aumento de peso. Se han descrito elevaciones de las transaminasas y de la fosfatasa alcalina en los pacientes tratados con baclofeno, así como aumento de la glucosa en sangre.

En algunos pacientes con la función renal disminuida se ha descrito toxicidad al baclofeno (manifestada por encefalopatía, dolor abdominal y en algunos casos convulsiones con dosis de tan solo 15 a 30 mg/día. Por lo tanto, los pacientes con disfunción renal severa (creatinina sérica > 2 mg/dl) deberá evitar el tratamiento con baclofeno. Si un paciente desarrolla toxicidad al baclofeno, la hemodiálisis puede aliviar los síntomas clínicos.

### 10. Precauciones y Advertencias:

Los pacientes ancianos con desórdenes psiquiátricos son más susceptibles a la toxicidad del baclofeno sobre el sistema nervioso central.

El baclofeno ha mostrado empeorar el control de las convulsiones y los cambios del EEG en los sujetos epilépticos y, por tanto, deberán ser prescritos con precaución.

El baclofeno puede aumentar la glucosa en sangre y, por tanto, se deberá administrar con precaución a los pacientes diabéticos. Igualmente, se ha detectado sangre en las heces de pacientes tratados con baclofeno por lo que este fármaco se usará con precaución en los

	<b>INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)</b>		<b>CODIGO: R-VE-74</b>
			<b>VERSION: 01</b>
Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 5 de 6	Firma de aprobación: 

sujetos con historia de úlcera péptica.

### **Uso durante el Embarazo y Lactancia.**

El baclofeno aumenta la incidencia de onfaloceles (hernias ventrales) en los fetos de ratas tratadas con 13 veces la dosis máxima recomendada en el hombre. Estas dosis ocasionan una reducción significativa de la ingesta de alimento y de la ganancia de peso en las crías. En los ratones y en los conejos no se observan estas anomalías.

Con dosis 7 veces la humana, también se observó un aumento de osificaciones incompletas de los esternones de los fetos de las ratas y núcleos de osificación de las falanges ausentes en los miembros superiores e inferiores.

No se han realizado estudios controlados sobre los efectos del baclofeno en el embarazo humano. Por lo tanto, no se recomienda su uso a menos que los beneficios para la madre justifiquen el posible riesgo para el feto.

### **11. Contraindicaciones:**

En los pacientes con insuficiencia renal severa (creatinina sérica > 2 mg/dl), el baclofeno puede mostrar efectos tóxicos a dosis relativamente bajas a las 24-48 horas de iniciarse el tratamiento y, por consiguiente el baclofeno está contraindicado en estos pacientes (ver interacciones medicamentosas).

También está relativamente contraindicado en pacientes que hayan experimentado hemorragias intracraneales o un accidente cerebro-vascular anteriores debido al riesgo de un aumento de la depresión del sistema nervioso central, respiratoria o cardiovascular.

### **12. INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:**

Es importante recalcar que la mayoría de precauciones van dirigidas a prevenir una depresión marcada del sistema nervioso central.

Así por ejemplo, debe tenerse precaución del uso concomitante de baclofeno con otros fármacos depresores del sistema nervioso central como el etanol, los agonistas opiáceos, el butorfanol, nalbufina, pentazocina, antipsicóticos, ansiolíticos, sedantes, antihistamínicos H<sub>2</sub>, sedantes, tinazidina, tramadol o hipnóticos puede aumentar la depresión del SNC. El baclofeno se debe administrar con precaución en los pacientes tratados con antidepresivos. Además de los efectos aditivos que se pueden dar sobre el sistema nervioso central, los antidepresivos tricíclicos pueden aumentar la hipotonía muscular.

El uso concomitante del baclofeno con inhibidores de la monoaminoxidasa puede aumentar la depresión sobre el sistema nervioso central y ocasionar hipotensión.

Dado que el baclofeno puede aumentar la glucosa en sangre, los pacientes diabéticos tratados con baclofeno pueden necesitar reajustes en las dosis de insulina o de antidiabéticos orales.

Las hierbas medicinales valeriana (*Valeriana officinalis*) o kava kava (*Pipermethysticum*)

	<b>INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)</b>			CODIGO: R-VE-74
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 6 de 6	VERSION: 01 Firma de aprobación: 

pueden aumentar los efectos depresores del baclofeno sobre el SNC. Los pacientes que consuman estas plantas deberán ser vigilados cuando se instaure un tratamiento con **Bacloflex®** (baclofeno).

### **13. RECOMENDACIONES EN CASO DE SOBREDOSIFICACIÓN.**

Vía oral: El Baclofeno está relacionado en una sobredosis con los siguientes síntomas: Vómitos, hipotonía muscular, somnolencia, coma, depresión respiratoria, convulsiones. El tratamiento sugerido consiste en remoción del principio activo por lavado gástrico o vaciado de la bomba de infusión; intubación en los casos en que se presente depresión respiratoria.

### **14. Bibliografía:**

- USP 38 NF 33
- [http://www.whocc.no/atc\\_ddd\\_index/?code=M03BX01](http://www.whocc.no/atc_ddd_index/?code=M03BX01)
- **MANUAL WASHINGTON DE TERAPÉUTICA HUMANA. 34ª Edición.**
- **GOODMAN & GILMAN. LAS BASES FARMACOLÓGICAS DE LA TERAPÉUTICA. A 12ª EDICIÓN.**
- **VELÁSQUEZ. FARMACOLOGÍA BÁSICA Y CLÍNICA. 18ª EDICIÓN.**
- **HARRISON PRINCIPIOS DE MEDICINA INTERNA. 17ª EDICIÓN.**

**Fecha de Revisión de la Monografía:** 31 de Enero de 2017.