

باکلوفن

(Baclofen)

دسته دارویی: مشتقات کلروفنیل - شل کننده عضلات اسکلتی

شکل دارویی: قرص های ۱۰ و ۲۵ میلی گرمی با روکش فیلم (FC)

نحوه عملکرد

مکانیسم عمل دقیق باکلوفن به طور کامل شناسایی نشده است. باکلوفن یک اسپاسمولیتیک مؤثر در سطح نخاع است که آگونیست GABA (گیرنده نوع b) به شمار می آید. باکلوفن جزء اسپاسمولیتیک های مؤثر بر اسپاسم نخاع مزمن است. این دارو احتمالاً اثر شل کننده عضلات اسکلتی خود را از طریق مهار انتقال رفلکس های مونوسیناپسی (تک سیناپسی) و پلی سیناپسی (چند سیناپسی) در سطح نخاع اعمال می کند و بوسیله هایپرپولاریزه کردن انتهای رشته عصبی آوران مانع از آزاد شدن واسطه های محرک احتمالی (اسید گلوتامیک و اسید آسپارتیک) می گردد. این دارو ممکن است بر نواحی فوق نخاعی نیز اثر بگذارد.

مشخصات فارماکوکینتیکی

باکلوفن از راه خوراکی به سرعت و به طور کامل جذب می شود. غلظت حداکثر آن پس از ۲ ساعت ایجاد می شود. باکلوفن می تواند از سد خونی- مغزی عبور کند و غلظت آن در مایع مغزی- نخاعی حدود ۱۲٪ غلظت پلاسمایی آن است. در خون کمتر از ۳۰٪ به پروتئین ها متصل شده و وسیعاً در بدن منتشر می شود. ۸۵٪ دارو به صورت دست نخورده از ادرار و مدفوع دفع می شود و ۱۵٪ آن بوسیله دآمیننه شدن در کبد متابولیزه می شود. نیمه عمر حذف باکلوفن در فرد با کلیه های سالم ۲ تا ۴ ساعت در پلاسما و حدود ۵ ساعت در مایع مغزی- نخاعی است.

موارد مصرف

- باکلوفن در درمان اسپاسم عضلانی ناشی از ضایعات نخاعی (تومورها و دیگر ضایعات نخاعی)، اسپاسم های عضلانی ناشی از مولتیپل اسکلروزیس، بیماری موتور نورون، سکتة مغزی، فلج مغزی، مننژیت و صدمات ناشی از ضربه به سر استفاده می شود.
- باکلوفن به منظور کاهش تعداد و شدت حملات درد عصب ۳ قلو در بیمارانی که قادر به تحمل کاربامازپین نیستند و به اثرات آن مقاوم می باشند نیز مصرف می گردد.
- در بعضی از بیماران مصرف همزمان باکلوفن با کاربامازپین می تواند سبب افزایش اثر درمانی شود.

مقدار و روش مصرف دارو

میزان مصرف باکلوفن جهت کاهش عوارض ناخواسته دارو معمولاً از دوزهای کم شروع شده و به تدریج تا رسیدن به پاسخ درمانی مناسب افزایش می یابد. در صورت عدم رسیدن به پاسخ درمانی مناسب پس از یک دوره درمان، دارو باید به تدریج قطع شود.

در بزرگسالان در درمان اسپاسم و درد عصب سه قلو افزایش دوز باکلوفن به صورت زیر توصیه شده است: ابتدا ۵ میلی گرم سه بار در روز مصرف می شود. سپس هر ۳ روز یک بار ۱۵ میلی گرم به مقدار مصرف روزانه اضافه می شود. (به هر نوبت مصرف دارو ۵ میلی گرم) تا پاسخ درمانی مناسب به دست آید. بیشترین مقدار مصرف در بزرگسالان ۸۰ میلی گرم در روز می باشد. در بعضی از بیماران ممکن است مقادیر بیشتری مورد نیاز باشد. در بیماران سالمند باید افزایش دوز تدریجی باشد. اگر درمان با دوز بسیار بالا آغاز شود یا در صورتی که دوز دارو با سرعت بیش از حد افزایش یابد ممکن است عوارض جانبی بیشتری بروز کند.

قطع درمان باید همیشه در پی کاهش دوز در طی دوره حدود ۱ تا ۲ هفته ای صورت گیرد و قطع ناگهانی دارو جز در مواقع خاص اورژانسی توصیه نمی گردد. در بیماران با اختلالات عملکرد کلیوی ممکن است تنظیم و کاهش دوز نیاز باشد.

موارد منع مصرف

- در صورت حساسیت به باکلوفن و یا سایر اجزای دارو
- این دارو در بیماران مبتلا به مشکلات عروق مغزی ، پارکینسون ، فلج مغزی یا ترومای حاصل از مشکلات مغزی و همچنین بیماران مبتلا به زخم معده نباید مصرف شود.

موارد احتیاط

- در بیماران مبتلا به بیماریهای گوارشی ، اختلال عملکرد کبدی ، مصرف این دارو باید با احتیاط و با مشورت پزشک صورت گیرد.
- در بیماران مبتلا به اختلال عملکرد کلیوی و یا تحت درمان با همودیالیز مزمین می بایست دوز دارو کاهش یابد و حتی الامکان در مورد نارسایی کلیه از مصرف دارو خودداری شود.
- اختلالات روانی ، اسکیزوفرنی ، افسردگی و یا اختلال جنون ممکن است توسط درمان با باکلوفن تشدید شوند. در این موارد دارو باید با احتیاط مصرف شود.
- باکلوفن ممکن است علائم صرع را تشدید کند؛ در بیماران مصروع مصرف دارو باید با احتیاط فراوان صورت گیرد.
- در بیماران تحت درمان فشار خون ، بیماران مبتلا به حوادث عروق مغزی و اختلالات تنفسی این دارو باید با مراقبت شدید مصرف شود.

- در بیماران با دیابت ملیتوس به دلیل افزایش میزان قند خون دارو باید با احتیاط مصرف شود.

عوارض جانبی

عوارض جانبی که در صورت بروز نیازمند مراقبت فوری پزشکی می باشند.

عوارض با شیوع کم:

- هماچوری (ادرار خونی و یا تیره)، درد قفسه سینه، سمیت عصبی (توهمات دیداری و یا شنیداری، افسردگی، عدم آگاهی به زمان و مکان، تغییرات خلق و خوی، وزوز گوش)، درماتیت آلرژیک (راش و خارش پوستی)، کیست های تخمدان، سنکوپ

عوارضی که در صورت تداوم و یا بدتر شدن نیازمند به مراقبت پزشکی می باشند.

عوارض با شیوع بیشتر

- خواب آلودگی، گیجی، ضعف، خستگی، سردرد، بی خوابی، بی حسی، احساس سبکی سر، ضعف عضلانی، تهوع، سختی و سفتی عضلات، تکرر ادرار، احتباس ادرار، شب ادراری، ادرار دردناک، ناتوانی جنسی، یبوست، استفراغ، درد شکمی، خشکی دهان، کاهش اشتها، کاهش فشار خون، افزایش ضربان قلب، گرفتگی و احتقان بینی، تاری دید.

تداخل اثر

- مصرف همزمان باکلوفن با داروهای ضد افسردگی سه حلقه ای سبب افزایش اثر باکلوفن و کاهش چشمگیر تون عضلات می شود.

- باکلوفن ممکن است سبب افزایش قند خون شود، مقدار مصرف داروهای خوراکی پائین آورنده قند خون و انسولین در صورت مصرف همزمان با باکلوفن باید تنظیم گردد.

- مصرف همزمان باکلوفن با داروهای ضد فشار خون و یا سایر داروهایی که سبب کاهش فشار خون می شوند ممکن است ریسک افت فشار خون را افزایش دهد، تنظیم دوز در این موارد ضروری می باشد.

- مصرف همزمان باکلوفن با داروهای تضعیف کننده سیستم عصبی مرکزی نظیر الکل، آنتی هیستامین ها، مخدرها و داروهای خواب آور سبب افزایش اثر سداتیو این داروها می شود.

- در صورت مصرف همزمان باکلوفن با مهارکننده های مونوآمینواکسیداز (MAOIs)، اثر تضعیف کننده اعصاب مرکزی و هیپوتانسیون (کاهش فشار خون) ناشی از آن تشدید می گردد.

- تداخلات آزمایشگاهی:

باکلوفن می تواند سبب افزایش سطح آنزیم های آلانین آمینوترانسفراز [ALT(SGPT)]، آلکالین فسفاتاز و آسپاراتات آمینوترانسفراز [AST(SGOT)] شود.

این دارو می تواند غلظت قند خون را در بیماران افزایش دهد

مصرف دارو در دوران حاملگی و شیر دهی

باکلوپن در FDA Pregnancy Category در گروه C قرار دارد. و مصرف آن در دوران حاملگی و شیردهی توصیه نمی شود.

نکات آموزشی درباره این دارو

- در طول درمان با باکلوپن خطر بروز مسمومیت CNS که منجر به توهمات، اغتشاش شعور ، افسردگی ، سایر آشفتگی های روانی و یا تسکین مفرط می شود، وجود دارد. ریسک بروز این اثرات در افراد مسن بیشتر می باشد.
- در بیماران مبتلا به اختلالات کلیوی ، کبدی ، تنفسی ، افسردگی ، همچنین بیماریهای مغزی نظیر سکتة مغزی و تشنج ، دارو باید با احتیاط مصرف شود.
- در طول مصرف این دارو از مصرف نوشیدنی های حاوی الکل و سایر داروهای تضعیف کننده سیستم عصبی مرکزی خودداری نمایید.
- این دارو ممکن است سبب گیجی ، اختلالات بینایی و خواب آلودگی شود ، بنابراین در طول مصرف این دارو ، هنگام رانندگی یا کار با وسایلی که نیاز به هوشیاری کامل دارد ، احتیاط شود.
- با کم کردن تدریجی مقدار مصرف دارو ، احتمال بروز عوارض جانبی کاهش می یابد. قطع ناگهانی مصرف دارو می تواند موجب توهم یا حملات ناگهانی و تشدید اسپاسم شود.
- در بیماران مبتلا به صرع، احتمال افزایش حملات ناگهانی وجود دارد ، وضعیت این بیماران با EEG ، مشاهدات بالینی و سؤال از بیمار در مورد از دست دادن کنترل و حملات ناگهانی باید به دقت پیگیری شود.
- در صورت عدم ظهور علائم بهبودی طی ۱-۲ ماه ، مصرف دارو قطع شود.
- قبل از مصرف هرگونه داروی بدون نسخه ، حتماً با پزشک خود مشورت کنید.
- در بعضی از بیماران، مصرف مقادیر منقسم چهار بار در روز ممکن است سبب بروز پاسخ خفیف تری شود.

مصرف دوز بیش از حد دارو و درمان آن

بیمار را در اسرع وقت به مراکز کنترل و درمان مسمومیت منتقل نمایید.
تظاهرات بالینی : سمیت عصبی ، اختلالات بینایی ، تشنج ، ضعف شدید عضلانی ، ضعف تنفسی و اغماء، استفراغ ، عدم وجود رفلکس ها ، افزایش بزاق دهان

درمان : در صورت هوشیار بودن بیمار ، باید القای استفراغ و به دنبال آن شستشوی معده صورت گیرد و در صورت بیهوش بودن بیمار نباید القای استفراغ کرده و از طریق (NG-Tube) باید معده را شستشو داد. از محرک های تنفسی نباید استفاده کرد. علائم حیاتی بیمار باید به دقت کنترل شود. درمان ویژه : تجویز آتروپین جهت افزایش تهویه و سرعت ضربان قلب و فشار خون پیشنهاد می شود.

شرایط نگهداری دارو

دارو دور از نور و رطوبت و در دمای زیر ۳۰ درجه سانتیگراد نگهداری شود.

نوع بسته بندی دارو

جعبه حاوی بلیسترهای ۱۰ عددی