

Uso: Interno e Externo.

CAS: 1134-47-0

Fator de Correção: Não se aplica.

PM: 213,66

Fator de Equivalência: Não se aplica.

FM: C₁₀H₁₂ClNO₂

BACLOFENO RELAXANTE MUSCULAR

Baclofeno é um análogo do ácido δ-aminobutírico (GABA).

Recomendação de uso

O tratamento com Baclofeno deve sempre ser iniciado com baixas doses que são gradualmente elevadas até que se atinja a dose diária ótima.

Adultos: As doses variam de 5 a 80mg, sendo que a dose usual fica entre 15 a 30mg ao dia.

Crianças: A dose inicial deve ser 2,5 a 5 mg/dia, atingindo-se, no máximo, 30mg (crianças de 2 a 7 anos) a 60mg (naquelas maiores de 8 anos).

Dose para tratamento de viciados em drogas: pode ser maior que o usual, mas inicia-se com 40mg ao dia.

Baclofeno também pode ser utilizado por via tópica transdérmica nas mesmas dosagens da via oral, normalmente essa via de aplicação é para controle da dor local.

Ações

Em doenças neurológicas associadas a espasmo dos músculos esqueléticos, os efeitos clínicos são benéficos sobre contrações musculares reflexas e proporcionam acentuado alívio sobre espasmo doloroso. Baclofeno melhora a mobilidade do paciente, facilitando o gerenciamento das atividades diárias (incluindo cateterização) e fisioterapia. Prevenção e melhoria de úlceras de decúbito, melhoria no padrão de sono (devido a eliminação dos espasmos musculares dolorosos) e nas funções da bexiga e esfíncter, têm também sido observadas como efeitos indiretos do tratamento com Baclofeno, levando a uma melhor qualidade de vida do paciente.

Aplicações

- ✓ Espasticidade dos músculos esqueléticos na esclerose múltipla.
- ✓ Estados espásticos nas mielopatias de origem infecciosa, degenerativa, traumática, neoplásica ou desconhecida.
- ✓ Espasmo muscular de origem cerebral, especialmente decorrente de paralisia cerebral infantil, assim como decorrentes de acidentes cerebrovasculares ou na presença de doença cerebral degenerativa ou neoplásica.
- ✓ Usado para tratamento do vício de cocaína segundo estudo realizado por pesquisadores do Instituto de Neuropsiquiatria da UCLA.

Mecanismo de ação

Baclofeno é um antiespástico de ação medular. Ele deprime a transmissão do reflexo monossináptico e polissináptico através da estimulação dos receptores GABA-B. Esta estimulação, por sua vez, inibe a liberação dos aminoácidos excitatórios, glutamato e aspartato. A transmissão neuromuscular não é afetada pelo Baclofeno. Exerce efeito antinociceptivo.

Contraindicações

Baclofeno é contraindicado a pacientes com alguma doença mental acompanhada por confusão ou depressão; portadores de epilepsia (convulsões); com problemas respiratórios, doença no rim ou no fígado, e diabéticos.

Precauções

Baclofeno deve ser administrado com precaução em distúrbios psiquiátricos e do sistema nervoso, pacientes portadores de distúrbios psicóticos, esquizofrenia, distúrbios maníaco ou depressivo, estados confusionais ou mal de Parkinson. Deve-se dar também atenção especial a pacientes portadores de epilepsia, já que pode ocorrer a redução no limiar de convulsão, havendo registros ocasionais de crises após a descontinuação do tratamento ou com superdose, portanto a terapia anticonvulsivante adequada deve ser continuada e o paciente monitorado.

Advertências

Baclofeno pode causar tontura, sedação, sonolência e distúrbios visuais; pacientes que apresentarem essas reações adversas devem evitar dirigir ou operar máquinas.

Gravidez e lactação

Não há até o momento estudos conclusivos sobre o uso do produto em gestantes. Sabe-se que o Baclofeno atravessa a barreira placentária e não deveria, portanto, ser utilizado durante a gravidez, a não ser que o benefício potencial para a mãe supere o risco potencial para o feto. Baclofeno, administrado em doses terapêuticas, passa para o leite materno, mas em quantidades tão pequenas que não se prevê efeitos indesejáveis ao lactente.

Interações medicamentosas

Não deve ser administrado concomitantemente com outras drogas que atuam sobre o sistema nervoso central (SNC), opiáceos sintéticos ou álcool pois pode ocorrer aumento da sedação.

O risco de depressão respiratória é também aumentado. É necessário um monitoramento cauteloso nas funções respiratórias e cardiovasculares, especialmente em pacientes com doenças cardiopulmonares e fraqueza no músculo respiratório.

Durante o tratamento concomitante com antidepressivos tricíclicos, o efeito de Baclofeno pode ser potencializado. Não se deve ingerir álcool durante o tratamento com Baclofeno.

Reações adversas

As reações adversas mais frequentes são sedação, sonolência, depressão respiratória, delírios, tontura, fadiga, confusão mental, vertigem, dor de cabeça, insônia, depressão, fraqueza muscular, tremores, alucinações, pesadelos e boca seca.

Comprovação de eficácia

Estudos – dependência química

Um estudo envolveu 70 pacientes dependentes de cocaína que passaram por um programa de tratamento com 16 semanas de duração. Metade dos participantes receberam Baclofeno e aconselhamento e outra metade receberam placebo e aconselhamento. O uso de cocaína era monitorado por meio de 3 testes semanais de urina ao longo do estudo. Os pesquisadores descobriram que o grupo do Baclofeno, comparado ao grupo placebo, de um modo geral, apresentaram um menor número de amostras de urina indicando uso recente de cocaína, particularmente para aqueles participantes que começaram o estudo com altas taxas de uso de cocaína e crack. O *National Institute on Drug Abuse* financiou estudos que avaliaram 60 medicamentos para tratamento da dependência em cocaína. Baclofeno é o terceiro medicamento a ser recomendado para um estudo multicentro de larga escala.

Outro estudo apresentado na *Alc.Clin.Exp.Rep.issue (2000)* indicou que Baclofeno reduz o desejo pelo álcool.

Numa pesquisa sobre opiáceos, Baclofeno foi testado em comparação com a Clonidina para o tratamento da abstinência. Publicado no *J.Clin.Pharm.Ther.(2001)*, o estudo se deu com 62 dependentes que foram tratados com Baclofeno e Clonidina por 14 dias em um estudo duplo cego. A dose máxima foi de 40mg de Baclofeno e 0,8mg de Clonidina ao dia (esta parece ser uma dose relativamente baixa para o tratamento de retirada de opióides). Os resultados mostraram não haver diferenças significantes entre os dois grupos como permanência no tratamento e efeitos colaterais, mas o grupo da Clonidina mostrou maiores problemas com hipotensão.

Sugestão de formulações

Excipiente para capsulas

Componentes	Qtd
Dióxido de silício coloidal	1%
Estearato de magnésio	0,5%
Lauril sulfato de sódio	1%
Celulose microcristalina	qsp 100%

Outros excipientes indicados: amido e povidona.

Xarope

Componentes	Qtd
Baclofeno	5mg
Xarope simples	5ml
Aroma cereja	qs

Referências bibliográficas

1. Fonseca, S. C.; Ferreira, A. O. Novidades Magistrais. 1^a ed. São Paulo: Pharmabooks, 2004. p.5.
2. Quagliato E, *et al*. Associação Médica Brasileira e Conselho Federal de Medicina. Espasticidade: Tratamento Medicamentoso. 2006.
3. BATISTUZZO, J.A; ITAYA, M; ETO, Y. Formulário Médico-Farmacêutico. São Paulo/SP:Tecnopress, 3^a Ed. 2006.
4. SWEETMAN, S.C; et al; MARTINDALE – Guia Completo de Consulta farmacoterapeutica. Barcelona. 2^a Ed. 2005.
5. Psychopharmacology (Berl). Early methylphenidate exposure enhances cocaine selfadministration but not cocaine-induced conditioned place preference in young adult rats. 2011 January ; 213(1): 43–52.
6. <http://alcoholism.about.com/cs/coke/a/blucla031215.htm>
7. <http://www.apa.org/pubs/journals/features/pha-16-6-458.pdf>
8. <http://www.oasas.ny.gov/AdMed/FYI/fyibaclofen.cfm>

Última atualização 27/06/2017 BM.