

# LITERATURA

## BACLOFENO

### RELAXANTE MUSCULAR

**Uso:** Interno e Externo.

**CAS:** 1134-47-0

**Fator de Correção:** Não se aplica.

**DCB:** 01012

**Fator de Equivalência:** Não se aplica.

**FM:** C<sub>10</sub>H<sub>12</sub>ClNO<sub>2</sub>

**PM:** 213,66

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.

# LITERATURA

## 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.

# LITERATURA

## 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.

# LITERATURA

## Xarope

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

## Referências

1. Fonseca, S. C.; Ferreira, A. O. Novidades Magistrais. 1ª 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, 3ª Ed. 2006.
4. SWEETMAN, S.C; et al; MARTINDALE – Guia Completo de Consulta farmacoterapeutica. Barcelona. 2ª 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 26.03.2012 APF  
15.10.2015 AVAO