

baclofeno – baclofen

Authored by
memjavad

November 4, 2025

RECOMMENDED CITATION

memjavad (2025). *baclofeno – baclofen*. Spanish Psychological Databases. Retrieved from <https://spanish.arabpsychology.com/?p=2762>

Baclofeno

Campo(s) Disciplinario(s) Primario(s): Farmacología; Neurología Clínica; Medicina del Dolor.

1. Definición Central y Clasificación

El baclofeno, conocido químicamente como ácido β -(4-clorofenil)- γ -aminobutírico, es un agente farmacológico clasificado primariamente como un relajante muscular de acción central y un potente agente antiespástico. Estructuralmente, es un derivado del neurotransmisor inhibitor ácido gamma-aminobutírico (**GABA**), lo que explica su mecanismo de acción fundamental en el sistema nervioso central (SNC). A diferencia de los relajantes musculares que actúan en la unión neuromuscular, el baclofeno ejerce su efecto terapéutico al modular la neurotransmisión dentro de la médula espinal y el tronco encefálico, reduciendo la hiperactividad refleja y el tono muscular excesivo que caracteriza a la espasticidad. Su introducción en la práctica clínica representó un avance significativo en el manejo de condiciones neurológicas crónicas asociadas con rigidez muscular severa.

La espasticidad, la principal indicación clínica para el baclofeno, es un trastorno motor caracterizado por un aumento dependiente de la velocidad en los reflejos tónicos de estiramiento (tono muscular) con reflejos tendinosos exagerados, resultado de la hiperexcitabilidad del arco reflejo de estiramiento. Esta condición puede ser debilitante, limitando severamente la movilidad, la higiene y la calidad de vida de los pacientes. El baclofeno ha demostrado ser particularmente efectivo en el tratamiento de la espasticidad que resulta de lesiones de la médula espinal, **esclerosis múltiple** y otras enfermedades cerebrovasculares o cerebrales. Su eficacia se debe a su capacidad para penetrar la barrera hematoencefálica, aunque con limitaciones que han impulsado el desarrollo de métodos de administración alternativos, como la vía intratecal.

Es crucial diferenciar el baclofeno de otros agentes que también actúan sobre el tono muscular. Mientras que fármacos como las benzodiazepinas tienen un efecto sedante más pronunciado y actúan sobre los receptores GABA-A, el baclofeno es altamente selectivo para el receptor **GABA-B**. Esta selectividad confiere al baclofeno un perfil de efectos secundarios distinto y una mayor especificidad terapéutica para la espasticidad crónica. Además de su uso antiespástico, el baclofeno ha sido objeto de intensa investigación y uso *off-label* para tratar trastornos de adicción, particularmente el alcoholismo, debido a su influencia en los circuitos de recompensa mediados por GABA.

2. Farmacodinámica: Mecanismo de Acción

El mecanismo de acción del baclofeno es la agonización selectiva del receptor GABA-B. Los receptores GABA-B son metabotrópicos, lo que significa que su activación no conduce a la

apertura directa de un canal iónico (como ocurre con GABA-A), sino que inicia una cascada de señalización intracelular mediada por proteínas G. Cuando el baclofeno se une al receptor GABA-B presináptico en la médula espinal, se inhibe la liberación de neurotransmisores excitadores, como el glutamato y el aspartato, al reducir la entrada de calcio. Esta acción reduce la excitabilidad de las neuronas motoras alfa y, consecuentemente, disminuye el tono muscular y la frecuencia de los espasmos.

A nivel postsináptico, la activación de los receptores GABA-B por el baclofeno provoca la apertura de canales de potasio. La salida de iones de potasio hiperpolariza la membrana neuronal, haciendo que la neurona sea menos susceptible a la excitación y, por lo tanto, inhibiendo la transmisión monosináptica y polisináptica en la médula espinal. Esta doble acción, tanto presináptica (inhibiendo la liberación de excitadores) como postsináptica (hiperpolarizando la neurona), es fundamental para su potente efecto antiespástico. La eficacia clínica está directamente correlacionada con la modulación de estos circuitos reflejos hiperactivos que se originan tras una lesión neurológica.

Es importante destacar que la acción del baclofeno no se limita a la médula espinal. Aunque su efecto antiespástico principal ocurre a este nivel, también tiene efectos en centros cerebrales superiores, lo que puede contribuir a sus efectos secundarios como la somnolencia o la sedación. La distribución de los receptores GABA-B en el cerebro, incluyendo áreas como el hipocampo y el cerebelo, explica por qué el baclofeno puede influir en funciones cognitivas, el estado de ánimo y los circuitos de adicción. La comprensión de esta farmacodinámica ha permitido optimizar las vías de administración; por ejemplo, la administración intratecal permite concentraciones significativamente más altas en la médula espinal, minimizando los efectos sistémicos y cerebrales no deseados.

3. Farmacocinética

La farmacocinética del baclofeno oral presenta ciertas características que influyen en su dosificación y perfil de seguridad. Tras la administración oral, el baclofeno se absorbe de manera rápida y casi completa en el tracto gastrointestinal. Sin embargo, existe una variabilidad significativa en la absorción y biodisponibilidad entre individuos, lo que a menudo requiere una titulación cuidadosa de la dosis para alcanzar el efecto terapéutico óptimo. La concentración plasmática máxima (C_{max}) se alcanza generalmente entre 2 y 3 horas después de la ingestión.

El baclofeno atraviesa la **barrera hematoencefálica**, pero su lipofilicidad relativamente baja limita la cantidad que llega al SNC. La cantidad que cruza es suficiente para ejercer un efecto antiespástico sistémico, pero las dosis necesarias para controlar la espasticidad severa a menudo se acercan o superan el umbral de los efectos secundarios sistémicos, como la sedación. La semivida de eliminación plasmática es relativamente corta, oscilando entre 3 y 4 horas, lo que

generalmente requiere la administración del fármaco varias veces al día para mantener niveles terapéuticos constantes.

La eliminación del baclofeno se produce principalmente a través de la excreción renal, con aproximadamente el 70-80% de la dosis excretada sin cambios en la orina. Solo una pequeña fracción del fármaco (alrededor del 15%) se metaboliza en el hígado. Esta dependencia de la función renal implica que los pacientes con insuficiencia renal requieren ajustes de dosis significativos para evitar la acumulación del fármaco y la toxicidad asociada. La interrupción abrupta de la terapia, especialmente después de dosis altas o administración prolongada, puede provocar un síndrome de abstinencia grave, lo que subraya la necesidad de una retirada gradual y supervisada.

4. Aplicaciones Terapéuticas Clave

La indicación principal y más establecida del baclofeno es el manejo de la **espasticidad**. Esta condición puede ser consecuencia de una amplia gama de trastornos neurológicos, siendo los más comunes la esclerosis múltiple, las lesiones traumáticas de la médula espinal, la parálisis cerebral, y los accidentes cerebrovasculares. El objetivo del tratamiento con baclofeno es reducir el tono muscular excesivo y la frecuencia de los espasmos dolorosos, lo que a su vez facilita la fisioterapia, mejora la movilidad funcional y alivia el dolor asociado.

En casos de espasticidad severa o intratable, donde la administración oral no logra el control adecuado o provoca efectos secundarios sistémicos intolerables, se recurre a la administración intratecal de baclofeno. Esta técnica implica la implantación quirúrgica de una bomba programable que administra el fármaco directamente en el espacio subaracnoideo de la médula espinal a través de un catéter. La administración intratecal permite el uso de dosis mucho menores (a menudo menos del 1% de la dosis oral) para lograr concentraciones terapéuticas elevadas en el sitio de acción, minimizando así los efectos adversos centrales. Esta modalidad ha transformado el manejo de la espasticidad grave, especialmente en pacientes pediátricos y adultos con parálisis cerebral o lesiones medulares extensas.

Más allá de la espasticidad, el baclofeno ha sido investigado y utilizado en otras condiciones. Se ha empleado en el manejo de ciertas formas de dolor neuropático, particularmente la neuralgia del trigémino, aunque típicamente como tratamiento de segunda línea. Además, existe una creciente evidencia, aunque aún objeto de debate, sobre su utilidad en el tratamiento de trastornos de adicción. Específicamente, se ha utilizado *off-label* para reducir el deseo (*craving*) y el consumo de alcohol en pacientes con dependencia alcohólica, basándose en la hipótesis de que la modulación de los receptores GABA-B puede influir en los circuitos de recompensa dopaminérgicos alterados por el alcohol.

5. Efectos Secundarios y Perfil de Seguridad

El baclofeno es generalmente bien tolerado cuando se titula correctamente, pero su perfil de efectos secundarios está dominado por la depresión del SNC. El efecto adverso más común es la **somnolencia** o sedación, que a menudo es dependiente de la dosis. Otros efectos frecuentes incluyen mareos, debilidad muscular y fatiga. Estos efectos a menudo disminuyen con el tiempo a medida que el paciente desarrolla tolerancia, pero pueden ser limitantes, especialmente al inicio del tratamiento. La debilidad muscular es una preocupación particular en pacientes cuya movilidad residual depende de un cierto grado de tono muscular, lo que requiere un equilibrio cuidadoso entre la reducción de la espasticidad y la preservación de la función motora.

A nivel gastrointestinal, pueden presentarse náuseas, estreñimiento o sequedad de boca. En dosis elevadas o en pacientes sensibles, el baclofeno puede inducir efectos psiquiátricos, como confusión, insomnio o incluso alucinaciones, particularmente en pacientes de edad avanzada o con deterioro cognitivo preexistente. Debido a su excreción renal, la toxicidad puede manifestarse rápidamente en pacientes con insuficiencia renal si la dosis no se ajusta adecuadamente, lo que puede llevar a un estado de coma o depresión respiratoria severa.

Un riesgo significativo asociado al baclofeno, especialmente en la administración intratecal, es el síndrome de abstinencia por interrupción abrupta. Este síndrome es una emergencia médica y se caracteriza por hipertermia, rigidez muscular exacerbada, rabdomiólisis, alteración del estado mental, e incluso convulsiones y fallo orgánico. La interrupción repentina del suministro de baclofeno (por ejemplo, debido a un mal funcionamiento de la bomba intratecal o al olvido de dosis orales) elimina el potente efecto inhibitorio sobre los receptores GABA-B, lo que resulta en una rebote de la excitabilidad neuronal. Por esta razón, la educación del paciente y la monitorización estricta son componentes esenciales de la terapia con baclofeno.

6. Desarrollo Histórico

El baclofeno fue sintetizado por primera vez en la década de 1960 por el químico suizo Heinrich Keberle en los laboratorios de Ciba-Geigy (actualmente Novartis). Inicialmente, el compuesto fue desarrollado con la intención de que actuara como un agente tranquilizante y antiepiléptico, basándose en su similitud estructural con el GABA. La idea era que, al ser más lipófilo que el GABA, el baclofeno podría cruzar eficazmente la barrera hematoencefálica, lo cual el GABA endógeno no logra hacer en cantidades significativas.

Sin embargo, los ensayos iniciales para la epilepsia no arrojaron resultados positivos. Fue durante la reevaluación de sus efectos que se identificó su poderosa propiedad antiespástica. El baclofeno fue aprobado para el tratamiento de la espasticidad en la década de 1970, marcando un hito al ser el primer agente con actividad específica sobre los receptores GABA-B en el SNC en ser utilizado clínicamente. Este descubrimiento impulsó el estudio del sistema GABA-B y su papel en la

modulación de la excitabilidad neuronal.

El desarrollo posterior más significativo fue la introducción de la terapia intratecal en la década de 1980. Los desafíos asociados con los efectos secundarios sistémicos de las altas dosis orales llevaron a la exploración de vías de administración más directas. El desarrollo de bombas de infusión implantables permitió que el baclofeno intratecal se estableciera como el estándar de oro para el tratamiento de la espasticidad grave y resistente, mejorando drásticamente la calidad de vida de los pacientes con parálisis cerebral o lesiones medulares crónicas.

7. Controversias y Usos Off-Label

Una de las áreas de mayor controversia y estudio reciente del baclofeno es su uso *off-label* en el tratamiento de la dependencia al alcohol. Esta aplicación ganó notoriedad a partir de la década de 2000, particularmente tras informes de casos y estudios que sugerían que dosis altas de baclofeno podrían eliminar completamente el deseo compulsivo de beber (**anhedonia**) en algunos alcohólicos crónicos. La hipótesis es que, al modular la actividad GABAérgica, el baclofeno puede normalizar los circuitos de recompensa alterados por el consumo crónico de alcohol.

No obstante, la evidencia clínica sobre su eficacia en la dependencia al alcohol es mixta. Mientras que algunos ensayos clínicos y metaanálisis sugieren beneficios, especialmente en la reducción de la ingesta de alcohol y el mantenimiento de la abstinencia, otros estudios no han encontrado una superioridad clara sobre el placebo, o han reportado tasas significativas de efectos secundarios al utilizar las dosis altas requeridas para esta indicación. Esta falta de consenso ha generado un debate considerable en la comunidad médica, y aunque el baclofeno está aprobado para la dependencia al alcohol en algunos países (como Francia), su uso sigue siendo considerado experimental o de segunda línea en gran parte del mundo.

Otra área de debate se centra en el manejo de la dosis y el riesgo de abuso. Aunque el baclofeno no está clasificado como una sustancia controlada en la mayoría de las jurisdicciones, se han reportado casos de uso recreativo, particularmente en combinación con otros depresores del SNC. La alta dosis necesaria para el tratamiento de la adicción al alcohol también plantea preocupaciones de seguridad, dada la estrecha ventana terapéutica entre la dosis efectiva y la dosis que induce sedación severa o depresión respiratoria, especialmente en pacientes con comorbilidades. Por lo tanto, cualquier uso de baclofeno fuera de sus indicaciones aprobadas requiere una vigilancia clínica rigurosa y una evaluación de riesgo-beneficio exhaustiva.

8. Lecturas Adicionales

[Baclofeno \(Wikipedia en español\)](#)

[Receptor GABA-B \(Wikipedia en español\)](#)

[Baclofen \(DrugBank\)](#)

[Espasticidad \(Wikipedia en español\)](#)

ARABPSYCHOLOGY.COM