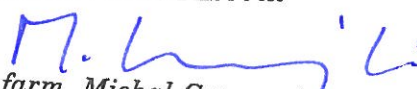


CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

SPRAWDZONO
POD WZGLĘDEM
MERYTORYCZNYM


mgr farm. Michał Czarnogórski

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

NEFOPAM JELFA 30 mg, tabletki powlekane

2009-11-19

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki powlekana zawiera 30 mg nefopamu chlorowodoru (*Nefopamum hydrochloridum*).
Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka powlekana.
Białe, okrągłe, obustronnie wypukłe tabletki powlekane.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Nefopam może być stosowany jako lek przeciwbólowy w łagodnych i umiarkowanych bólach ostrych, np. bólach pooperacyjnych. Ponadto w niezbyt nasilonych bólach przewlekłych, np. ból w chorobach nowotworowych.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Produkt leczniczy stosuje się od 1 do 3 tabletek 3 razy na dobę w zależności od reakcji organizmu. Początkowo stosuje się 60 mg (2 tabletki) 3 razy w ciągu doby. U osób w podeszłym wieku należy stosować dawki mniejsze tj. 30 mg (1 tabletkę) 3 razy w ciągu doby. Produkt leczniczy należy przyjmować podczas jedzenia lub po posiłkach.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub którykolwiek składnik produktu leczniczego.
Padaczka.
Nie należy stosować nefopamu u dzieci do 12 lat.
Ze względu na możliwość wystąpienia poważnych interakcji lekowych, nie należy przyjmować nefopamu podczas stosowania inhibitorów monoaminooksydazy oraz w ciągu trzech tygodni po ich odstawieniu.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy zachować szczególną ostrożność podczas stosowania produktu leczniczego u osób z chorobami wątroby lub nerek.
Ponieważ nie więcej niż 5% produktu leczniczego wydalane jest w postaci nie zmienionej, poza przypadkami ciężkiej niewydolności nerek nie ma konieczności modyfikacji dawki. U osób w podeszłym wieku stosowanie produktu leczniczego należy rozpoczynać od małych dawek. U pacjentów w podeszłym wieku notowano wystąpienie działań niepożądanych ze strony ośrodkowego układu nerwowego takich jak omamy, dezorientacja.
Nefopam może spowodować różowe zabarwienie moczu, które nie jest wynikiem krwinkomoczu czy uszkodzenia nerek. Nefopam może spowodować bezobjawowe zwiększenie aktywności transaminaz, podczas długotrwałego stosowania produktu leczniczego należy kontrolować czynność wątroby. Ostrożnie stosować u pacjentów z przerostem gruczołu krokowego i trudnościami w oddawaniu moczu.

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej
i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15

4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Poważne interakcje lekowe mogą wystąpić w przypadku równoczesnego stosowania nefopamu z inhibitorami monoaminooksydazy. Należą do nich: hipertermia, nadciśnienie złośliwe, tachykardia i zaburzenia rytmu serca.

Ostrożnie należy stosować nefopam z trójpierścieniowymi lekami przeciwdepresyjnymi.

Nefopam może nasilać działanie leków cholinolitycznych lub sympatykomimetycznych, potęgując ich działanie niepożądane.

W przypadku równoczesnego stosowania nefopamu w dawce 24 mg/kg/24 h oraz paracetamolu, nefopam zwiększa możliwość uszkodzenia wątroby.

Rezerpina hamuje działanie przeciwbólowe nefopamu. Nie zostały udowodnione interakcje z alkoholem, lekami nasennymi, przeciwhistaminowymi, jednak nie należy stosować tych środków równocześnie z nefopamem.

4.6 Ciąża i laktacja

Ciąża

Ze względu na nieustalone do końca bezpieczeństwo stosowania produktu leczniczego podczas ciąży, stosowanie nefopamu dopuszcza się jedynie w przypadku, gdy jego zastosowanie jest bezwzględnie konieczne, a stosowanie innego produktu leczniczego jest niemożliwe lub przeciwwskazane.

Laktacja

Nefopam przenika do mleka matki, dlatego nie należy stosować produktu leczniczego podczas karmienia piersią.

W przypadku stosowania produktu leczniczego podczas karmienia piersią, dawka produktu leczniczego jaką otrzymuje niemowlę wynosi 3% dawki przyjmowanej przez matkę (0,05 mg/kg mc. niemowlęcia).

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Działanie nefopamu na OUN nie zostało dokładnie określone, wiadomo jednak, iż może on powodować zarówno pobudzenie i euforię, jak również działanie sedatywne. Nie wiadomo czy działania te zależą od przyjętej dawki. Dlatego zaleca się by pacjenci przyjmujący nefopam nie prowadzili pojazdów mechanicznych i nie obsługiwali urządzeń mechanicznych w ruchu.

4.8 Działania niepożądane

Działania niepożądane są stosunkowo liczne, ale łagodne.

Zaburzenia żołądka i jelit:

Najczęściej występują nudności (10 – 30% leczonych), które w większości przypadków nie prowadzą do wymiotów, suchość w ustach, trudności w przełykaniu.

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania:

Nadmierne pocenie się (10 – 30% leczonych).

Zaburzenia układu nerwowego:

Zawroty głowy, roztargnienie, nadmierne pobudzenie, bezsenność, lęk, utrata łaknienia.

Zaburzenia serca:

Tachykardia.

Zaburzenia oka:

Zaburzenia widzenia.

Zaburzenia nerek i dróg moczowych:

Trudności w oddawaniu moczu.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej:

Czasami mogą występować wysypki skórne.

Uważa się, że nefopam może powodować uzależnienie psychiczne typu amfetaminowego, chociaż nie zostało to udowodnione.

4.9 Przedawkowanie

W przypadku znacznego przedawkowania mogą wystąpić drgawki, podniecenie, omamy, zaburzenia czynności serca (tachykardia, nadciśnienie), zwiększenie temperatury ciała, obfite pocenie się.

Dawka śmiertelna dla człowieka nie jest znana.

W przypadku przedawkowania należy zastosować leczenie objawowe tzn. dożylnie podanie 10 mg diazepam w przypadku drgawek oraz 10 mg propranololu w przypadku znacznej tachykardii, nadciśnienia i innych objawów nadmiernej stymulacji adrenergicznej.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki przeciwbólowe

Kod ATC: N 02 BG 06

Nefopam jest nienarkotycznym lekiem przeciwbólowym słabszym od morfiny, ale silniejszym od kwasu acetylosalicylowego. Po podaniu doustnym siła działania przeciwbólowego nefopamu odpowiada $\frac{1}{3}$ siły działania równoważnej wagowo dawki morfiny (zakres 0,18 – 0,56) lub 8,4 do 10,4 razy większej dawce kwasu acetylosalicylowego. Wydaje się, że w przypadku dawek ponad 300 mg krzywa działania przeciwbólowego ulega spłaszczeniu.

Dokładny mechanizm działania nefopamu nie jest znany. Wiadomo, że nefopam jest silnym inhibitorem zwrotnego wychwytu serotoniny i noradrenaliny. Prawdopodobnie punktem uchwytu działania nefopamu są zstępujące drogi serotoninergiczne.

W większych dawkach nefopam wykazuje również działanie cholinolityczne, przeciwhistaminowe oraz miejscowo znieczulające. Na skutek zwiększenia stężenia endogennych katecholoamin w szczelinach synaptycznych wywołuje działanie chronotropowo i inotropowo-dodatnie. Po dożylnym podaniu nefopamu w dawce 0,3 mg/kg masy ciała stwierdzano wzrost średniego ciśnienia tętniczego o 13%, zaś pojemności minutowej serca o 10%.

Działanie nefopamu na OUN nie zostało dokładnie określone, wiadomo, że może ono powodować zarówno pobudzenie i euforię, jak również działanie sedatywne. Nie wiadomo czy działania te są zależne od przyjętej dawki.

Nefopam nie działa hamująco na ośrodek oddechowy. Nie działa przeciwzapalnie ani przeciwgorączkowo, może natomiast wpływać na obniżenie temperatury ciała po wysiłku fizycznym, co prawdopodobnie jest związane z silnym działaniem wzmagającym pocenie się i parowanie potu z powierzchni ciała. Nefopam nie działa zapierająco, może natomiast powodować opóźnienie opróżniania żołądka.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Nefopam dobrze się wchłania po podaniu doustnym (95 – 100% dawki). Lek ulega znacznemu efektowi pierwszego przejścia. Po doustnym podaniu 60 mg nefopamu chlorowodoru maksymalne stężenie w surowicy krwi występuje po okresie około 1 – 3 h i osiąga wartość 48 $\mu\text{g/l}$ (zakres 29 do 67 $\mu\text{g/l}$).

Nefopam w dużym procencie wiąże się z białkami surowicy krwi (71 – 76%). Część niezwiązana ulega szerokiej dystrybucji do tkanek i płynów ustrojowych, również do płynu mózgowo-rdzeniowego, gdzie osiąga stężenie rzędu 25% maksymalnego stężenia w surowicy krwi. Objętość dystrybucji wynosi około 10 kg/l.

Nefopam przenika przez łożysko i do mleka matki. Nefopam jest metabolizowany w wątrobie, głównie w procesie N-dezmetylacji i N-oksydacji. Zidentyfikowano 7 metabolitów, z których 5 jest

całkowicie pozbawionych działania przeciwbólowego, 2 pozostałe zaś wykazują działanie przewyższające o 2% siłę działania substancji macierzystej.

Okres półtrwania leku w surowicy krwi wynosi średnio około 4 h (zakres 3 – 8 h) i nie zmienia się po 7 dniach regularnego stosowania leku. Okresy półtrwania metabolitów wynoszą 2,2 – 9,2 h.

W procesie metabolizmu II fazy metabolity łączą się z kwasem glukuronowym i są wydalone z organizmu wraz z moczem (87%) oraz z kałem (8%). Około 5% podanej dawki leku wydalone jest w postaci nie zmienionej. Całkowita eliminacja leku z organizmu następuje w ciągu 5 dni.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Brak istotnych danych nieklinicznych o znaczeniu klinicznym, nie wymienionych w innych punktach charakterystyki produktu leczniczego.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Wapnia wodorofosforan dwuwodny

Skrobia ziemniaczana

Hydroksypropyloceluloza

Talk

Magnezu stearynian

Hypromeloza

Makrogol 6000

Tytanu dwutlenek

Substancja o działaniu przeciwpłynnym (wodna emulsja oleju silikonowego)

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata.

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość pojemnika

Bliстер PVC/Al w tekturowym pudełku. Bliстер zawiera 20 tabletek, w tekturowym pudełku znajduje się 1 bliстер.

6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Przedsiębiorstwo Farmaceutyczne Jelfa S A
58-500 Jelenia Góra, ul. Wincentego Pola 21

8. NUMER(-Y) POZWOLENIA(-Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr 9281

**9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU /
DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA**

27.03.2002 r. / 17.01.2007 r.

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**

2008 -12- 16

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej
i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15