

## CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

### 1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

NEFOPAM JELFA, 30 mg, tabletki powlekane

### 2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki powlekana zawiera 30 mg nefopamu chlorowodorku (*Nefopamum hydrochloridum*).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

### 3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki powlekane.

Białe, okrągłe, obustronnie wypukłe tabletki powlekane.

### 4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

#### 4.1 Wskazania do stosowania

Nefopam Jelfa 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

##### Dawkowanie

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.

##### Sposób podawania

Produkt leczniczy należy przyjmować podczas jedzenia lub po posiłkach.

#### 4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą, wymienioną w punkcie 6.1.

Padaczka.

Dzieci w wieku 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 aminotransferaz, podczas długotrwałego stosowania produktu leczniczego należy kontrolować czynność wątroby.

Ostrożnie stosować u pacjentów z przerostem gruczołu krokowego i trudnościami w oddawaniu moczu.

#### **4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji**

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

Nefopam może nasilać działanie produktów leczniczych 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 produktów leczniczych równocześnie z nefopamem.

#### **4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację**

##### 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.

##### Karmienie piersią

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 i obsługiwanie maszyn**

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 maszyn.

#### **4.8 Działania niepożądane**

Działania niepożądane są stosunkowo liczne, ale łagodne.

Częstość występowania działań niepożądanych została uszeregowana według klasyfikacji układów i narządów MedDRA, zgodnie z następującą konwencją: bardzo często ( $\geq 1/10$ ) i nieznaną (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Układy i narządy	Częstość występowania działań niepożądanych	
	Bardzo często	Nieznana częstość
Zaburzenia psychiczne		stan splątania
Zaburzenia układu nerwowego	-	zawroty głowy, roztargnienie, nadmierne pobudzenie, bezsenność, lęk, utrata łaknienia, śpiączka
Zaburzenia oka	-	zaburzenia widzenia
Zaburzenia serca	-	tachykardia
Zaburzenia żołądka i jelit	nudności, które w większości przypadków nie prowadzą do wymiotów	suchość w jamie ustnej, trudności w przełykaniu
Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej	-	wysypki skórne
Zaburzenia nerek i dróg moczowych	-	trudności w oddawaniu moczu
Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania	nadmierne pocenie się	-

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

#### Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych.

Al. Jerozolimskie 181 C, 02-222 Warszawa

Tel.: +48 22 49 21 301

Faks: + 48 22 49 21 309

Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

#### **4.9 Przedawkowanie**

W przypadku znacznego przedawkowania mogą wystąpić drgawki, podniecenie, omamy, śpiączka, 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: inne leki przeciwbólowe i przeciwgorączkowe  
kod ATC: N02B G06.

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.

#### Mechanizm działania

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

#### Rezultat działania farmakodynamicznego

W większych dawkach nefopam wykazuje również działanie cholinolityczne, przeciwhistaminowe oraz miejscowo znieczulające. Na skutek zwiększenia stężenia endogennych katecholamin 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**

#### Wchłanianie

Nefopam dobrze się wchłania po podaniu doustnym (95 – 100% dawki).

#### Dystrybucja

Nefopam 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  $\text{kg/l}$ .

Nefopam przenika przez łożysko i do mleka matki.

#### Metabolizm

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

W procesie metabolizmu II fazy metabolity łączą się z kwasem glukuronowym i są wydalane z organizmu wraz z moczem (87%) oraz z kałem (8%).

#### Eliminacja

Około 5% podanej dawki produktu leczniczego wydalane jest w postaci nie zmienionej. Całkowita eliminacja produktu leczniczego 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  
Emulsja symetykonowa

### **6.2 Niezgodności farmaceutyczne**

Nie dotyczy.

### **6.3 Okres ważności**

3 lata

### **6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania**

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

### **6.5 Rodzaj i zawartość pojemnika**

Blister PVC/Al w tekturowym pudełku.  
Opakowanie zawiera jeden blister po 20 tabletek powlekanych.

### **6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania**

Bez specjalnych wymagań.

## **7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Bausch Health Ireland Limited  
3013 Lake Drive

Citywest Business Campus  
Dublin 24, D24PPT3  
Irlandia

**8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Pozwolenie nr 9281

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

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 27.03.2002 r.

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 12.06.2014 r.

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