

ГРИППАЛЕК КИДС

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Гриппалек Кидс.

Международное непатентованное название: Хлорфенирамин + Фенилэфрин + Парацетамол.

Лекарственная форма: сироп для приема внутрь.

Состав: каждые 5 мл содержат:

Хлорфенирамина малеат ВР	1 мг;
Фенилэфрина гидрохлорид ВР	5 мг;
Парацетамол ВР	125 мг;
Ароматизированная сиропная основа	q.s.

Фармакотерапевтическая группа: Парацетамол в комбинации с другими препаратами. Анилиды в комбинациях.

Код АТХ: N02BE51.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Комбинированное средство, действие которого обусловлено входящими в его состав компонентами; оказывает жаропонижающее, альфа - адреностимулирующее, вазоконстрикторное и антигистаминное действие, устраняет симптомы "простуды".

Парацетамол инактивирует циклооксигеназы (ЦОГ1 и ЦОГ2) преимущественно в центральной нервной системе, что влияет на центр терморегуляции и центр боли – уменьшает возбуждение центра терморегуляции в гипоталамусе, повышает порог болевой чувствительности. С этим связаны два его основных действия: жаропонижающее и обезболивающее. Противовоспалительное действие у парацетамола незначительное, так как в очаге воспаления клеточные пероксидазы нейтрализуют инактивирующее действие парацетамола на ЦОГ.

Хлорфенирамина малеат блокатор H1-гистаминовых рецепторов, который уменьшает действие гистамина. Оказывает противоаллергическое и противоотечное действие. При применении уменьшает отёк, красноту (гиперемия) слизистой оболочки носоглотки, придаточных пазух носа (лобных, гайморовых), конъюнктивы глаз, чихание, зуд в области носа и глаз, неприятные ощущения (першение) в горле, уменьшает слезотечение и выделение слизи из носа и придаточных пазух носа. Обладает слабым успокаивающим действием. Возможна сонливость.

Фенилэфрин является альфа-адреномиметиком (стимулятором альфа-адренорецепторов), сужает кровеносные сосуды слизистой оболочки носа, устраняя, таким образом, отёк и покраснение слизистой оболочки носоглотки, придаточных пазух носа, евстахиевой трубы, восстанавливает носовое дыхание и уменьшает выделения из носа.

Фармакокинетика:

Парацетамол быстро и почти полностью абсорбируется в ЖКТ, преимущественно в тонкой кишке. После однократного приема в дозе 500 мг Стах в крови достигается через 10–60 мин. Парацетамол быстро и равномерно распределяется в большинстве тканей организма. Около 25% парацетамола в крови связывается с белками плазмы крови. Парацетамол метаболизируется с помощью микросомальной ферментативной системы печени. Около 80–85 % парацетамола в организме подвергается конъюгации в основном с глюкуроновой кислотой и в меньшей степени — с серной кислотой. Т½ составляет 1–3 ч. Парацетамол выводится с мочой в основном в виде парацетамол-глюкуронида с небольшими количествами парацетамол - сульфата, меркаптата и в неизменном виде.

Хлорфенирамина малеат абсорбируется относительно медленно ЖКТ, Стах в плазме крови достигается через 2,5–6 ч после приема внутрь. Биодоступность — 25–50%. Хлорфенирамин подвергается значительному метаболизму при первом прохождении через печень. Около 70% хлорфенирамина в системном кровотоке связывается с белками плазмы крови. Т½ колеблется от 2 до 43 ч. Хлорфенирамин распределяется по всему организму, проникает через ГЭБ. Хлорфенирамин активно метаболизируется. Метаболиты включают десметил и дидесметилхлорфенирамин. Неизмененный хлорфенирамин и метаболиты выводятся в основном с мочой на протяжении 4–6 ч. У детей отмечают быструю и более значительную абсорбцию, более быстрый клиренс и более короткий Т½.

Фенилэфрин неравномерно абсорбируется в ЖКТ и легко метаболизируется. После приема внутрь его действие проявляется через 15–20 мин и сохраняется в течение 2–4 ч. Биодоступность фенилэфрина низкая. Фенилэфрин биотрансформируется в стенках кишечника при абсорбции и в печени. Менее 16% дозы выводится в неизменном виде вместе с метаболитами с мочой.

Показания к применению:

Симптоматическое лечение ОРВИ и гриппа, которые сопровождаются головной болью, повышением температуры, мышечной болью, лихорадкой, слезотечением, ринитом, заложенностью носа.

Противопоказания:

- гиперчувствительность к компонентам препарата;
- пациентам с астмой;
- избегать одновременного приема с ингибиторами моноаминоксидазы (МАО) и в течение 14 дней после их отмены;
- большинство случаев сердечно - сосудистых заболеваний, при артериальной гипотензии, заболеваниях щитовидной железы, повышенной возбудимости;
- в случаях следующих заболеваний: феохромоцитомы, закрытоугольная глаукома, сахарный диабет, язвенная болезнь, эпилепсия.

С осторожностью:

- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- заболевания крови;
- печеночная и/или почечная недостаточность;
- врожденные гипербилирубинемии (синдромы Жильбера, Дубина-Джонсона и Ротора);
- ХОБЛ (эмфизема легких, хронический бронхит).

Способ применения и дозы:

Детям в возрасте от 1 до 6 лет: по 1,25-2,5 мл сиропа 3 раза в сутки (дозатор прилагается).

Детям в возрасте от 6 до 12 лет: по 5 мл 3 раза в сутки.

Взрослым и детям старше: 12 лет по 10 мл 3 раза в сутки.

Интервал между приемами должен быть не менее 4–6 ч.

При симптоматической терапии ОРВИ и гриппа, длительность лечения — 3 дня;

Продолжительность приема в качестве жаропонижающего средства - не более 3 дней;

В качестве обезболивающего - не более 5 дней.

Побочное действие:

- аллергические реакции (кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек), тошнота, эпигастральная боль;
- анемия, тромбоцитопения, агранулоцитоз;
- повышенная возбудимость, головокружение, повышение АД, нарушение засыпания;
- мириаза, парез аккомодации, повышение внутриглазного давления, сухость слизистой оболочки полости рта;
- задержка мочи;
- при длительном применении в больших дозах - гепатотоксическое действие, гемолитическая анемия, апластическая анемия, метгемоглобинемия, панцитопения;
- нефротоксичность (почечная колика, глюкозурия, интерстициальный нефрит, папиллярный некроз).

Передозировка:

Симптомы: бледность кожных покровов, снижение аппетита, тошнота, рвота; гепатонекроз; повышение активности "печеночных" трансаминаз, увеличение протромбинового времени (симптомы обусловлены парацетамолом, проявляются после приема свыше 10-15 г).

Лечение: промывание желудка в первые 6 ч, введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона - метионина через 8-9 ч после передозировки и N-ацетилцистеина через 12 ч.

Взаимодействие лекарственных средств:

Усиливает эффекты ингибиторов МАО, седативных ЛС, этанола. Этанол усиливает седативное действие антигистаминных ЛС. Антидепрессанты, фенотиазиновые производные, противопаркинсонические и антипсихотические ЛС повышают риск развития задержки мочи, сухости во рту, запоров. ГКС увеличивают риск развития глаукомы.

Парацетамол снижает эффективность урикозурических ЛС.

Хлорфенирамин одновременно с ингибиторами МАО, фуразолидоном может привести к гипертоническому кризу, возбуждению, гиперпирексии. Трициклические антидепрессанты усиливают адренормиметическое действие фенилэфрина, одновременное назначение галатана повышает риск развития желудочковой аритмии. Снижает гипотензивное действие гуанетидина, который в свою очередь усиливает альфа-адреностимулирующую активность фенилэфрина.

Особые указания:

При гипертермии, продолжающейся более 3 дней, и болевом синдроме более 5 дней, требуется консультация врача.

Искажает показатели лабораторных исследований при количественном определении глюкозы и мочевой кислоты в плазме.

В случае длительного лечения проводят контроль показателей периферической крови и функционального состояния печени.

В период лечения необходимо воздерживаться от употребления этанола (возможно развитие гепатотоксического действия), вождения автотранспорта и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска:

Сироп для приема внутрь 60 мл в бутылке. Одна бутылка в комплекте с дозатором 10 мл, вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С и в местах, недоступных для детей. Не замораживать.

Срок хранения:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

Без рецепта.

GRIPPALEK KIDS

Instruction for use of the drug

Trade name: Grippalek Kids.

International Nonproprietary Name: Chlorpheniramine + Phenylephrine + Paracetamol.

Dosage Form: syrup for oral use.

Composition: each 5 ml contains:

Chlorpheniramine maleate BP	1 mg;
Phenylephrine HCL BP	5 mg;
Paracetamol BP	125 mg;
Flavoured syrupy base	q.s.

Pharmacotherapeutic group: Paracetamol in combination with other drugs. Anilides in combinations.

ATC Code: N02BE51.

Pharmacologic property:

Pharmacodynamics:

Paracetamol chemically named as N-acetyl-p-aminophenol, is a widely used over-the-counter analgesic (pain reliever) and antipyretic (fever reducer).

Paracetamol is classified as a mild analgesic. It is commonly used for the relief of headaches and other minor aches and pains and is a major ingredient in numerous cold and flu remedies.

Chlorpheniramine maleate is part of a class of drugs called antihistamines. Specifically, it is an H1 receptor antagonist. This means that it blocks a specific type of histamine receptor in the body known as H1 receptors. Since allergic reactions are partly caused by the release of histamine from certain cells in the body, chlorpheniramine maleate can help relieve or prevent allergy symptoms.

Chlorpheniramine maleate also blocks acetylcholine receptors, an action that produces some of the unpleasant side effects of the medication, such as dry mouth or difficulty urinating, but also helps to relieve a runny nose.

Phenylephrine has predominantly post-synaptic alpha-adrenergic effects at therapeutic doses. At usual doses it has negligible beta effects, but beta effects can occur at high doses.

Phenylephrine (HCL) is used for the temporary relief of stuffy nose, sinus, and earsymptoms caused by the common cold, flu, allergies, or other breathing illnesses (e.g., sinusitis, bronchitis). This medication works by decreasing swelling in the nose and ears, thereby lessening discomfort and making it easier to breathe.

Pharmacokinetics:

Paracetamol is well absorbed in the gastrointestinal tract. Oral bioavailability is dose dependant: with larger doses, the hepatic first pass effect is reduced due to overwhelming of the liver enzymatic capacity; and therefore, bioavailability is increased.

Paracetamol is distributed throughout the body fluids in a homogeneous way. The analgesic activity is attributable to the small fraction that penetrates into the brain. Paracetamol given at therapeutic doses binds to plasma proteins at less than 20%. In case of intoxication, this proportion may increase to up to 50%.

Paracetamol is essentially metabolized in the liver by conjugation with glucuronic acid (55%) and sulfuric acid (35%). Hepatotoxic metabolites are produced in small amounts by the cytochrome P450 (isoenzyme CYP2E1). In the therapeutic plasma concentration range, this metabolite is detoxified by conjugation with glutathione. In case of intoxication the amount of this toxic metabolite increases and outweighs the amount of available glutathion, which can lead to hepatic failure and renal tubular necrosis.

Metabolites are excreted through the kidneys in the urine. Only 2-5% of the dose is excreted in an unchanged form in the urine. As a consequence of its short elimination half-life (1-3h), 24 hours after the ingestion of a single dose of paracetamol, 98% of the dose is eliminated.

Chlorpheniramine maleate is absorbed relatively slowly from the gastrointestinal tract, with peak plasma concentrations occurring about 2.5 to 6 hours after oral administration. Chlorpheniramine appears to undergo considerable first-pass metabolism. Bioavailability is low, values of 25 to 50% having been reported. About 70% of chlorpheniramine in the circulation is bound to plasma proteins. There is wide inter-individual variation in the pharmacokinetics of chlorpheniramine; half-life values ranging from 2 to 43 hours have been reported. Chlorpheniramine is widely distributed in the body and enters the CNS.

Chlorpheniramine maleate is metabolised extensively. Unchanged drug and metabolites are excreted primarily in the urine; excretion is dependent on urinary pH and flow rate.

A duration of action of 4 to 6 hours has been reported; this is shorter than may be predicted from pharmacokinetic parameters.

More rapid and extensive absorption, faster clearance, and a shorter half-life have been reported in children compared to adults.

After oral administration, *phenylephrine* is rapidly metabolized in the GI tract and cardiovascular effects are generally unattainable via this route of administration.

Less than 16% of the dose is excreted unchanged with the metabolites in the urine.

Indications for use:

Symptomatic treatment for acute respiratory viral infections and influenza. Temporary relief of sneezing, itchy, watery eyes, itchy nose or throat, and runny nose caused by hay fever (allergic rhinitis), or other respiratory allergies.

Contra-indications:

- hypersensitivity to the drug;
- patients with asthma;
- avoid co-administration with inhibitors of monoamine oxidase (MAO), and within 14 days after their cancellation;
- most cases of cardio-vascular diseases, arterial hypotension, diseases thyroid gland, increased excitability;
- in cases of the following diseases: pheochromocytoma, angle-closure glaucoma, diabetes, peptic ulcer disease, epilepsy.

Precautions:

- deficiency of glucose-6-phosphate dehydrogenase;
- blood diseases;
- liver and / or kidney failure;
- congenital hyperbilirubinemia (Gilbert syndrome, Dubin-Johnson and Rotor);
- COPD (emphysema, chronic bronchitis).

Dosage and direction for use:

For children from 1 to 6 years: 1.25-2.5 ml of a syrup, 3 times per day (dozator is attached).

For children from 6 to 12 years: 5 ml, 3 times a day.

For adults and children over 12 years: 10 ml, 3 times a day.

The interval between doses should be at least 4-6 hours;

Symptomatic treatment of URTI and influenza, the duration of treatment - 3 days;

as an antipyretic - no more than 3 days;

As analgesic - not more than 5 days.

Side effects:

- allergic reactions (rash, pruritus, urticaria, angioneurotic edema), nausea, epigastric pain;
- anemia, thrombocytopenia, agranulocytosis;
- irritability, dizziness, increased blood pressure, sleep disturbance;
- mydriasis, paresis of accommodation, increased intraocular pressure, dry mucous membranes the mouth;
- urinary retention;
- long-term use at high doses - hepatotoxic effects, hemolytic anemia, aplastic anemia, methemoglobinemia, pancytopenia;
- renal toxicity (renal colic, glycosuria, interstitial nephritis, papillary necrosis).

Overdose:

Symptoms: pale skin, loss of appetite, nausea, vomiting; hepatonecrosis; improving activity of "liver" transaminases, increased prothrombin time (symptoms caused by paracetamol manifested after receiving more than 10-15 g).

Treatment: gastric lavage in the first 6 h, the introduction of donators of SH-groups and precursor synthesis glutathione-methionine after 8-9 hours after the overdose and N-acetylcysteine at 12 hours.

Drug interactions:

Do not use if you are now taking a prescription monoamine oxidase inhibitor (MAOI) (certain drugs for depression, psychiatric, or emotional conditions, or Parkinson's disease), or for 2 weeks after stopping the MAOI drug. If you do not know if your prescription drug contains an MAOI, ask a doctor or pharmacist before taking this product.

Paracetamol.

There is probable potentiation of hepatotoxicity following an overdose from the paracetamol metabolite NAPQI by enzyme-inducing drugs. There is considerable controversy regarding the possible interaction with warfarin in its potential to increase its anticoagulant effects because of discrepancies between observational studies and those in healthy volunteers.

Chlorpheniramine.

Increased toxicity (CNS depression): CNS depressants, MAO inhibitors, tricyclic antidepressants, phenothiazines.

CYP3A4 inhibitors: May increase the levels/effects of chlorpheniramine. Example inhibitors include azole antifungals, ciprofloxacin, clarithromycin, diclofenac, doxycycline, erythromycin, imatinib, isoniazid, nefazodone, nicardipine, propofol, protease inhibitors, quinidine, and verapamil.

Phenylephrine.

Is known to interact with other drugs like Acebutolol, Adrenaline, Doxepin (Hcl), Ergotamine (Tartrate), Guanethidine, Methylamphetamine, Methyldopa, Methylergonovine, Moclobemide, Rauwolfia Reserpine, Tranylcypromine (Sulphate), Trimipramine (Maleate).

These interactions are sometimes beneficial and sometimes may pose threats to life. Always consult your physician for the change of dose regimen or an alternative drug of choice that may strictly be required.

Cautions:

Checking with physician if symptoms persist after medication has been used for 5 days or if high fever, skin rash, or continuing headache is present with cough.

You may get drowsy or dizzy. Do not drive, use machinery, or do anything that needs mental alertness until you know how this medicine affects you. Do not stand or sit up quickly, especially if you are an older patient. This reduces the risk of dizzy or fainting spells. Alcohol may interfere with the effect of this medicine. Avoid alcoholic drinks.

Presentation:

1x1 Pet Bottle 60ml, 10ml dozator and instruction for use in cardboard box.

Storage:

Keep in dry place protected from light at a temperature below 25°C. Keep out of reach of children. Do not freeze.

Shelf life:

Labeled. Do not use after expiry date.

Distribution condition:

Non-prescribed medicine.

NEO UNIVERSE

Manufactured for:
NEO UNIVERSE LLP
 London, United Kingdom
 Manufactured by:
 Brawn Laboratories Ltd.
 India