

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

COLDREX JUNIOR CITRÓN

300 mg/5 mg/20 mg prášok na perorálny roztok

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedno vrecko (3 g) obsahuje:

Liečivá:

Paracetamol	300 mg
Fenylefrínium-chlorid	5 mg
Kyselina askorbová	20 mg

Pomocné látky so známym účinkom: sacharóza 1862 mg, glukóza 3,325 mg a sodík 56,43 mg v jednom vrecku.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Prášok na perorálny roztok

Biely až svetložltý prášok na prípravu perorálneho roztoku s citrónovou vôňou.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Krátkodobá liečba príznakov chrípky a akútnych zápalov horných dýchacích ciest, ku ktorým patria horúčka, bolesť hlavy, bolesť v hrdle, bolesti kĺbov a svalov, kongescia nosovej sliznice, sinusitída a s ňou spojená bolesť a akútny katarálny zápal nosovej sliznice.

Liek je určený deťom od 6 do 12 rokov s minimálnou telesnou hmotnosťou 20 kg.

Liek nie je indikovaný pre dospievajúcich vo veku 12 – 18 rokov, dospelých a starších ľudí.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Deti od 6 rokov do 12 rokov s minimálnou telesnou hmotnosťou 20 kg:

1 vrecko rozpustené v šálke horúcej vody každých 4 až 6 hodín podľa potreby. Neužíva sa viac ako 4 vrecká počas 24 hodín. Minimálny interval medzi jednotlivými dávkami sú 4 hodiny.

Maximálna dĺžka liečby bez konzultácie s lekárom sú 3 dni.

Deti mladšie ako 6 rokov a deti s telesnou hmotnosťou nižšou ako 20 kg

Liek nie je určený pre deti mladšie ako 6 rokov s telesnou hmotnosťou nižšou ako 20 kg.

Dospievajúci vo veku 12 – 18 rokov, dospelí a staršie osoby
Tento liek nie je indikovaný pre tieto vekové skupiny.

Odporúčané denné dávkovanie alebo špecifický počet dávok sa nemá prekročiť z dôvodu rizika poškodenia pečene (pozri časť 4.4 a 4.9).

Pacienti s poruchou funkcie pečene

U pacientov s miernou až stredne ťažkou poruchou funkcie pečene treba liek užívať s opatrnosťou. U pacientov s ťažkou poruchou funkcie pečene je podávanie lieku kontraindikované (pozri časť 4.3).

Pacienti s poruchou funkcie obličiek

U pacientov so zníženou funkciou obličiek je potrebné upraviť dávkovanie. Pri glomerulárnej filtrácii 10 - 50 ml/min sa interval medzi jednotlivými dávkami predlžuje na 6 hodín. Pri hodnote filtrácie nižšej ako 10 ml/min sa predlžuje až na 8 hodín.

Spôsob podávania

Na perorálne použitie.

Obsah 1 vrecka sa rozpustí v šálke horúcej vody (približne 125 ml). Dobré sa premieša, až do rozpustenia. Pridá sa studená voda a cukor alebo med podľa chuti. Teplý nápoj sa podá dieťaťu.

Ak bolesť alebo horúčka pretrváva počas viac 3 dní alebo sa zhoršuje alebo ak sa objavia iné príznaky, liečba sa má ukončiť a je potrebné poradiť sa s lekárom.

4.3 Kontraindikácie

- Precitlivosť na paracetamol, fenylefrínium-chlorid, kyselinu askorbovú alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.
- Závažná hypertenzia
- Hypertyreóza
- Feochromocytóm
- Glaukóm s uzavretým uhlom
- Závažná porucha funkcie pečene
- Akútna hepatitída
- Diabetes mellitus
- Kardiovaskulárne ochorenie
- Závažná ischemická choroba srdca
- Závažná hemolytická anémia
- Užívanie inhibítorov MAO v súčasnosti alebo počas posledných dvoch týždňov
- Použitie u pacientov užívajúcich tricyklické antidepresíva alebo betablokátory (pozri časť 4.5)
- Použitie u pacientov, ktorí v súčasnosti užívajú iné sympatomimetiká (ako napr. dekongestíva, lieky na potlačenie chuti do jedla, psychostimulanciá amfetamínového typu (pozri časť 4.5)).

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Aj keď je COLDREX JUNIOR CITRÓN určený deťom, sú v texte uvedené upozornenia, ktorá sa týkajú aj dospelých pacientov.

Pacientov je potrebné upozorniť, aby neužívali súbežne lieky na chrípku a prechladnutie alebo dekongestíva, najmä iné lieky obsahujúce paracetamol.

Pri nasledujúcich stavoch sa má liek podávať len s osobitnou opatnosťou:

- Hepatocelulárna insuficiencia
- Chronické požívanie alkoholu
- Zlyhanie obličiek ($\text{GFR} \leq 50 \text{ ml/min}$)
- Gilbertov syndróm (familiárna nehemolytická žltáčka)
- Súbežná liečba liekmi ovplyvňujúcimi funkciu pečene
- Deficiencia glukóza-6-fosfátdehydrogenázy
- Hemolytická anémia
- Deficiencia glutatiónu
- Dehydratácia
- Chronická podvýživa
- Zadržiavanie moču alebo hypertrofia prostaty
- Okluzívne ochorenie ciev (napr. Raynaudov syndróm).

Základné ochorenie pečene zvyšuje riziko poškodenia pečene súvisiace s paracetamolom. Pacienti, u ktorých sa diagnostikuje porucha funkcie pečene alebo obličiek, sa musia pred užitím tohto lieku poradiť s lekárom. Nebezpečenstvo predávkovania je väčšie u pacientov s necirhotickým alkoholickým ochorením pečene.

Pri podávaní paracetamolu pacientom s pečňovou dysfunkciou a u pacientov, ktorí dlhodobo užívajú vyššie dávky paracetamolu, sa odporúča pravidelná kontrola pečňových testov. Zvyšovanie dávky a predlžovanie liečby významne zvyšuje riziko závažných hepatotoxických účinkov.

Predávkovanie môže spôsobiť vážne poškodenie pečene. Napriek tomu, že sa pacient cíti dobre, je potrebné v prípade predávkovania sa okamžite poradiť s lekárom z dôvodu rizika poškodenia pečene pri predávkovaní.

Pri liečbe perorálnymi antikoagulanciami a súbežnom podávaní vyšších dávok paracetamolu je nutná kontrola protrombínového času.

Počas liečby sa nesmú piť alkoholické nápoje. Paracetamol môže byť už v dávkach nad 6 – 8 g denne hepatotoxický. Pečňové poškodenie sa však môže vyvinúť aj pri omnoho nižších dávkach, ak spolupôsobí alkohol, induktory pečňových enzýmov alebo iné hepatotoxické lieky, pričom najväčšie riziko sa týka chronických alkoholikov, ktorí pred užitím paracetamolu krátkodobo abstínujú (12 h). Dlhodobá konzumácia alkoholu významne zvyšuje riziko hepatotoxicity paracetamolu.

Vzhľadom na riziko nezvratného poškodenia pečene je potrebné v prípade predávkovania vyhľadať okamžitú lekársku pomoc, aj keď sa pacient cíti dobre (pozri časť 4.9).

U pacientov s astmou, ktorí sú citliví na kyselinu acetylsalicylovú, sa má postupovať s opatnosťou pretože v súvislosti s paracetamolom boli hlásené mierne formy bronchospazmov (skrížená reakcia).

Boli hlásené prípady metabolickej acidózy s vysokou aniónovou medzerou (*High anion gap metabolic acidosis*, HAGMA) v dôsledku pyroglutámovej acidózy u pacientov so závažným ochorením, ako je závažná porucha funkcie obličiek a sepsa, alebo u pacientov s podvýživou alebo s inými zdrojmi nedostatku glutatiónu (napr. chronickým alkoholizmom), ktorí boli liečení paracetamolom dlhodobo v terapeutickú dávku alebo kombináciou paracetamolu a flukloxacilínu. Ak vznikne podozrenie na HAGMA v dôsledku pyroglutámovej acidózy, odporúča sa okamžité prerušenie liečby paracetamolom a starostlivé monitorovanie pacienta. Meranie 5-oxoprolínu v moči môže byť užitočné na identifikáciu pyroglutámovej acidózy, ako základnej príčiny HAGMA u pacientov s viacerými rizikovými faktormi.

Tento liek obsahuje 1,862 g sacharózy a 3,325 mg glukózy v jednom vrecku. Musí sa to vziať do úvahy u pacientov s diabetes mellitus. Pacienti so zriedkavými dedičnými problémami intolerancie fruktózy, glukózo-galaktózovej malabsorpcie alebo deficitu sacharázy a izomaltázy nesmú užívať tento liek.

Tento liek obsahuje 56,43 mg sodíka v jednom vrecku, čo zodpovedá 3 % WHO odporúčaného maximálneho denného príjmu 2 g sodíka pre dospelú osobu.

4.5 Liekové a iné interakcie

Súbežné užívanie je kontraindikované s nasledujúcimi účinnými látkami (pozri časť 4.3):

- *Inhibitory monoaminoxidázy*: Medzi sympatomimetickými amínmi, ako je fenylefrín, a inhibitory monoaminoxidázy prebiehajú hypertenzné interakcie.
- *Sympatomimetické amíny*: Súčasné podávanie fenylefrínu so sympatomimetickými amínmi môže zvýšiť riziko kardiovaskulárnych vedľajších účinkov.
- *Beta-blokátory a ďalšie antihypertenzíva (vrátane debrizochínu, guanethidínu, reserpínu a metyldopy)*: Fenylefrín môže znížiť účinnosť beta-blokátorov a antihypertenzív. Súbežné užívanie fenylefrínu môže zvýšiť riziko hypertenzie a ďalších kardiovaskulárnych vedľajších účinkov.
- *Tricyklické antidepresíva (napr. amitriptylín)*: Súbežné užívanie s fenylefrínom môže zvýšiť riziko kardiovaskulárnych vedľajších účinkov.

Neodporúča sa súbežné užívanie s nasledujúcou účinnou látkou:

- *Probenecid*: znižuje klírens a výrazne predlžuje biologický polčas paracetamolu.

Súbežné užívanie je potrebné zvážiť s nasledujúcimi účinnými látkami:

- *Digoxín a iné srdcové glykozidy*: Súbežné užívanie fenylefrínu môže zvýšiť riziko nepravidelného srdcového rytmu alebo infarktu myokardu.
- *Námel'ové alkaloidy (napr. ergotamín a metysergid)*: Súbežné užívanie s fenylefrínom môže spôsobiť zvýšené riziko ergotizmu.
- *Metoklopramid*: Rýchlosť absorpcie paracetamolu môže byť zvýšená metoklopramidom (ktorý zvýši aj jeho maximálne plazmatické hladiny). Keďže celkové množstvo absorbovaného paracetamolu zostáva nezmenené, nie je pravdepodobné, že by táto interakcia bola klinicky významná.
- *Domperidón a kolestyramín*: Rýchlosť absorpcie paracetamolu môže byť zvýšená domperidónom, zatiaľ čo kolestyramín absorpciu znižuje. Kolestyramín sa nemá podávať v priebehu jednej hodiny po podaní paracetamolu.
- *Zidovudín*: Súbežné podávanie paracetamolu a zidovudínu zvyšuje riziko neutropénie.
- *Izoniazid*: Súbežné podávanie paracetamolu a isoniazidu zvyšuje riziko hepatotoxicity.
- *Kyselina acetylsalicylová a iné nesteroidné protizápalové lieky (NSAID)*: Súbežné dlhodobé užívanie paracetamolu a kyseliny acetylsalicylovej alebo iných NSAID môže viesť k poškodeniu obličiek.
- *Warfarín*: Antikoagulačný účinok warfarínu a iných kumarínových derivátov môže byť zvýšený dlhodobým pravidelným užívaním paracetamolu a môže tak byť zvýšené riziko krvácania. Pri príležitostnom užívaní paracetamolu však táto interakcia nie je klinicky významná.
- *Potenciálne hepatotoxické lieky alebo lieky, ktoré indukujú pečeňové mikrozomálne enzýmy*: Riziko toxicity paracetamolu môže byť zvýšené. Induktory mikrozomálnych enzýmov (napr. rifampicín, fenobarbital) môžu zvýšiť toxicitu paracetamolu pri jeho biotransformácii vznikom vyššieho podielu toxického epoxidu.
- *Chloramfenikol*: Existujú obmedzené dôkazy, ktoré naznačujú, že paracetamol môže ovplyvniť farmakokinetiku chloramfenikolu.
- *Lamotrigín*: Paracetamol môže znížiť biologickú dostupnosť lamotrigínu s možným znížením jeho účinku v dôsledku potenciálnej indukcie jeho metabolizmu v pečeni.

- *Flukloxacilín*: Ak sa paracetamol užíva súbežne s flukloxacilínom, má sa postupovať opatrne, keďže súbežné podávanie je spojené s metabolickou acidózou s vysokou aniónovou medzerou v dôsledku pyroglutámovej acidózy, najmä u pacientov s rizikovými faktormi (pozri časť 4.4).

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Prípravok je určený na použitie u detí. Informácie nižšie sú uvedené pre prípad, že by liek užívali tehotné alebo dojčiace ženy.

Gravidita

Veľké množstvo údajov od tehotných žien nepoukazuje na malformačnú ani fetoneonatálnu toxicitu paracetamolu. Epidemiologické štúdie týkajúce sa vývinu nervovej sústavy u detí vystavených paracetamolu *in utero* poskytujú nepresvedčivé výsledky.

Na základe skúseností u ľudí, fenylefrínium-chlorid spôsobuje vrodené chyby pri podávaní počas gravidity. Zároveň sa preukázalo, že má pozitívnu súvislosť s hypoxiou plodu. Fenylefrín sa nemá používať počas gravidity.

Užívanie tohto lieku počas gravidity sa neodporúča.

Dojčenie

Paracetamol sa vylučuje do materského mlieka, ale v množstvách, ktoré nie sú klinicky významné.

Fenylefrín sa môže vylučovať do materského mlieka.

Pre nedostatok údajov je lepšie sa počas dojčenia podávaniu lieku vyhnúť.

Ak dojčiaca žena liek užíva, má ho užívať len krátkodobo a dojčiť najskôr 3 hodiny po jeho užití. Nie je možné vylúčiť vplyv fenylefrínu na zníženie tvorby mlieka.

Fertilita

Relevantné údaje nie sú k dispozícii.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Aj keď je COLDREX JUNIOR CITRÓN určený deťom, sú v texte uvedené upozornenia, ktorá sa týkajú aj dospelých pacientov.

COLDREX JUNIOR CITRÓN nespôsobuje ospalosť, a preto nemá žiadny alebo má zanedbateľný vplyv na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje. COLDREX JUNIOR CITRÓN môže vyvolať závraty. Ak sa závraty vyskytnú, pacienti musia byť poučení, aby nevedli vozidlá ani neobsluhovali stroje.

4.8 Nežiaduce účinky

Liečivá paracetamol, fenylefrínium-chlorid a kyselina askorbová sú zvyčajne dobre znášané.

Nežiaduce reakcie hlásené z rozsiahlych skúseností s liekom po jeho uvedení na trh sú uvedené v tabuľke nižšie podľa triedy orgánového systému. Na klasifikáciu nežiaducich účinkov bola použitá nasledujúca konvencia: veľmi časté ($\geq 1/10$), časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), menej časté ($\geq 1/1000$ až $< 1/100$), zriedkavé ($\geq 1/10000$ až $< 1/1000$), veľmi zriedkavé ($< 1/10000$) a neznáme (z dostupných údajov).

Paracetamol

Systém	Frekvencia	Príznaky
Poruchy krvi a lymfatického systému	Zriedkavé	Poruchy krvných doštičiek (trombocytopénia), poruchy kmeňových buniek
Poruchy imunitného	Zriedkavé	Anafylaxia, alergie (okrem angioedému)

systemu		
Poruchy srdca a srdcovej činnosti	Zriedkavé	Edém
Poruchy ciev	Zriedkavé	Edém
Poruchy gastrointestinálneho traktu	Zriedkavé	Bolesť brucha, hnačka, nauzea, vracanie
Poruchy pečene a žlčových ciest	Zriedkavé	Porucha funkcie pečene, zlyhanie pečene, nekróza pečene, žltáčka
Poruchy kože a podkožného tkaniva	Zriedkavé	Svrbenie, vyrážka, potenie, purpura, angioedém, urtikária
	Veľmi zriedkavé	Stevensov-Johnsonov syndróm (SJS), toxická epidermálna nekrolýza (TEN), akútna generalizovaná exanthematózná pustulóza (AGEP), dermatitída vyvolaná liekom
Úrazy, otravy a komplikácie liečebného postupu	Zriedkavé	Predávkovanie a otrava
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína	Zriedkavé	Bronchospazmus u pacientov s precitlivosťou na kyselinu acetylsalicylovú alebo iné NSAID.
Poruchy metabolizmu a výživy	Neznáme	Metabolická acidóza s vysokou aniónovou medzerou

Fenylefrinium-chlorid

Systém	Frekvencia	Príznaky
Poruchy oka	Zriedkavé	Mydriáza, akútny glaukóm s uzavretým uhlom (najčastejšie u pacientov s glaukómom s úzkym uhlom)
Poruchy srdca a srdcovej činnosti	Neznáme	Tachykardia, palpitácie, zvýšenie krvného tlaku
Poruchy kože a podkožného tkaniva	Zriedkavé	Vyrážka
Poruchy obličiek a močových ciest	Zriedkavé	Dyzúria, retencia moču (tento nežiaduci účinok sa s väčšou pravdepodobnosťou objaví u pacientov s obštrukciou odtoku moču z močového mechúra, napr. pri hypertrofii prostaty)
Poruchy imunitného systému	Zriedkavé	Alergické reakcie (napr. urtikária, alergická dermatitída)
Poruchy gastrointestinálneho traktu	Neznáme	Nauzea, vracanie, hnačka
Poruchy nervového systému	Neznáme	Bolesť hlavy, závrat
Psychické poruchy	Neznáme	Nervozita, nespavosť

Opis vybraných nežiaducich reakcií

Metabolická acidóza s vysokou aniónovou medzerou

U pacientov s rizikovými faktormi, užívajúcich paracetamol, boli pozorované prípady metabolickej acidózy s vysokou aniónovou medzerou v dôsledku pyroglutámovej acidózy (pozri časť 4.4). Pyroglutámová acidóza sa môže vyskytnúť v dôsledku nízkej hladiny glutatiónu u týchto pacientov.

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na **národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V**.

4.9 Predávkovanie

V prípade predávkovania je potrebná okamžitá lekárska pomoc, aj vtedy, ak príznaky predávkovania nie sú prítomné.

Paracetamol

U detí, ktoré užili jednorazovo viac ako 150 mg/kg telesnej hmotnosti a u dospelých, ktorí užili paracetamol v dávke 10 g alebo viac môže dôjsť k poškodeniu pečene. Užitie paracetamolu v dávke 5 g alebo viac môže viesť k poškodeniu pečene, ak sa u pacienta vyskytujú rizikové faktory (pozri nižšie).

Rizikové faktory: ak pacient

- a) dlhodobo užíva karbamazepín, fenobarbital, fenytoín, primidón, rifampicín, ľubovník bodkovaný alebo iné liečivá, ktoré indukujú pečeňové enzýmy
- alebo
- b) pravidelne konzumuje nadmerný objem alkoholu
- alebo
- c) pravdepodobne trpí nedostatkom glutatiónu, napr. pri poruche príjmu potravy, cystickej fibróze, infekcii HIV, hladovaní alebo kachexii.

Príznaky:

Príznakmi predávkovania paracetamolom počas prvých 24 hodín sú bledosť, nevoľnosť, vracanie, anorexia a bolesť brucha. Poškodenie pečene môže byť zjavné po 12 až 48 hodinách po užití.

Môžu sa objaviť abnormality metabolizmu glukózy a metabolická acidóza.

Pri závažnej otrave môže zlyhanie pečene vyústiť do encefalopatie, hemorágie, hypoglykémie, opuchu mozgu a smrti.

Pri prvých prejavoch môžu byť príznaky u pacienta obmedzené na nevoľnosť alebo vracanie a nemusia odrážať závažnosť predávkovania ani riziko poškodenia orgánov.

Pri absencii závažného poškodenia pečene sa môže rozvinúť akútne zlyhanie obličiek s akútnou nekrózou tubulov, na ktoré výrazne poukazuje bolesť v bedrách, hematúria alebo proteinúria.

Hlásené boli srdcové arytmie a pankreatitída.

Liečba:

Pri predávkovaní paracetamolom je potrebná okamžitá liečba. Aj pri absencii významných skorých príznakov by pacienti mali byť neodkladne odoslaní do nemocnice na okamžité začatie liečby, ktorá musí byť v súlade so zavedenými liečebnými postupmi. Má byť vykonaný výplach žalúdka. Plazmatické koncentrácie paracetamolu by mali byť merané po 4 hodinách alebo neskôr po požití.

Špecifické antidotum N-acetylcysteín je možné použiť do 24 hodín po požití paracetamolu, avšak maximálny ochranný účinok je dosiahnutý do ôsmich hodín po požití. Účinnosť antidota po tejto dobe prudko klesá. N-acetylcysteín sa má podávať intravenózne v súlade so stanovenou dávkovacou schémou.

Ak pacient nevracia, môže byť perorálne podaný metionín vhodnou alternatívou v odľahlých oblastiach mimo nemocnice.

Fenylefrínium-chlorid

Príznaky:

Predávkovanie fenylefrínom pravdepodobne povedie k podobným príznakom, aké sú uvedené pri nežiaducich účinkoch (pozri časť 4.8). Ďalšie príznaky môžu zahŕňať podráždenosť, nepokoj, hypertenziu a prípadnú reflexnú bradykardiu. Tiež môže vyvolať nauzeu a vracanie. V závažných prípadoch sa môžu objaviť halucinácie, záchvaty a arytmie. Dávka potrebná na vyvolanie závažnej toxicity fenylefrínu by však bola väčšia ako dávka potrebná na vyvolanie hepatotoxicity súvisiacej s paracetamolom.

Liečba:

Liečba má byť symptomatická v súlade s klinickými prejavmi.

Kyselina askorbová

Príznaky:

Vysoké dávky kyseliny askorbovej (> 3000 mg) môžu spôsobiť dočasnú osmotickú hnačku a gastrointestinálne účinky ako je napr. nevoľnosť a nepríjemný pocit v bruchu. Účinky predávkovania kyselinou askorbovou by prispievali k závažnej hepatotoxicite spôsobenej predávkovaním paracetamolom.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Analgetiká, anilidy, ATC kód: N02BE51

Mechanizmus účinku:

Paracetamol:

Paracetamol je analgetikum a antipyretikum bez protizápalového účinku a s dobrou gastrointestinálnou znášanlivosťou.

- Analgetické účinky:

Mechanizmus analgetického účinku nebol doteraz plne stanovený. Paracetamol môže pôsobiť najmä tým, že inhibuje syntézu prostaglandínov v centrálnom nervovom systéme (CNS) a v menšej miere prostredníctvom periférneho účinku blokuje vznik bolestivých impulzov. Periférny účinok môže byť tiež dôsledkom inhibície syntézy prostaglandínov alebo inhibície syntézy alebo účinku iných látok, ktoré spôsobujú citlivosť receptorov bolesti na mechanické alebo chemické stimulácie. Relatívna absencia periférnej inhibície prostaglandínov dáva paracetamolu farmakologické vlastnosti, ako je napr. zachovanie protektívnych prostaglandínov v gastrointestinálnom trakte.

- Antipyretické účinky:

Paracetamol pravdepodobne pôsobí antipyreticky vplyvom na hypotalamické tepelné regulačné centrum a vyvoláva periférnu vazodilatáciu s následným zvýšením prekrvenia kože, potením a stratou tepla. Centrálny vplyv pravdepodobne zahŕňa inhibíciu syntézy prostaglandínov v hypotalame.

Kyselina askorbová (vitamín C):

Kyselina askorbová je základnou zložkou ľudskej stravy. Je tiež súčasťou kombinovaných prípravkov proti prechladnutiu a chrípke.

Kyselina askorbová má účinky na bunkový rast a diferenciáciu a je nevyhnutná na optimálne fungovanie imunitného systému. Preto sa v skorých štádiách akútnych vírusových infekcií používa na doplnenie

príjmu vitamínu C z potravy, aby pomohla udržať normálnu funkciu imunitného systému a znížiť únavu a vyčerpanie, pretože zásoby vitamínu C a chuť do jedla môžu byť v tom čase nízke.

Fenylefrínium-chlorid:

Fenylefrínium-chlorid je sympatomimetický amín, ktorý pôsobí na alfa-adrenergne receptory dýchacích ciest a vyvoláva vazokonstrikciu, ktorá dočasne zmierňuje opuch súvisiaci so zápalom nosovej sliznice a sliznice prínosových dutín. Umožňuje tak voľný odtok tekutiny z prínosových dutín.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Paracetamol

Absorpcia

Paracetamol je rýchlo absorbovaný z gastrointestinálneho traktu. Maximálne plazmatické koncentrácie sa dosahujú po 10 až 60 minútach po perorálnom podaní.

Distribúcia

Paracetamol je relatívne rovnomerne distribuovaný väčšinou telesných tekutín a vykazuje rôznu väzbu na bielkoviny.

Biotransformácia

Paracetamol sa metabolizuje prevažne v pečeni prostredníctvom dvoch hlavných metabolických ciest, s tvorbou konjugátov kyseliny glukurónovej a kyseliny sírovej. Pri druhej metabolickej ceste dochádza k rýchlej saturácii pri dávkach vyšších ako sú terapeutické dávky. Menej významná metabolická cesta katalyzovaná cytochrómom P 450 (najmä CYP2E1) vedie k tvorbe medziproduktu (N-acetyl-p-benzochinónimínu), ktorý je za normálnych podmienok používania rýchlo detoxikovaný glutatiónom a po konjugácii s cysteínom a kyselinou merkapturovou eliminovaný močom. Naopak pri rozsiahlej intoxikácii sa množstvo tohto toxického metabolitu zvyšuje.

Eliminácia

Menej ako 5 % sa vylučuje vo forme nezmeneného paracetamolu. Počas eliminácie sa pohybuje v rozmedzí od 1 do 4 hodín. K eliminácii dochádza v podstate močom. 90 % užitej dávky sa eliminuje obličkami do 24 hodín najmä vo forme konjugátu glukuronidu (60–80 %) a sulfátu (20–30 %). V prípade zlyhania obličiek (GFR $\leq$ 50 ml/min) je eliminácia mierne oneskorená s polčasom eliminácie v rozmedzí 2 až 2,5 hodín. Pri konjugátoch glukuronidu a sulfátu je rýchlosť eliminácie 3-násobne pomalšia u jedincov so závažnou poruchou funkcie obličiek ako u zdravých jedincov.

Kyselina askorbová

Kyselina askorbová sa rýchlo vstrebáva z gastrointestinálneho traktu a je v rozsiahlej miere distribuovaná do telesných tkanív, 25 % sa viaže na plazmatické bielkoviny. Nadbytočné množstvo kyseliny askorbovej, ktoré už organizmus nepotrebuje, sa vylúči do moču v podobe metabolitov alebo v nezmenenej podobe.

Fenylefrínium-chlorid

Absorpcia

Fenylefrínium-chlorid sa z gastrointestinálneho traktu absorbuje nepravidelne.

Biotransformácia

Fenylefrínium-chlorid je metabolizovaný monoaminoxidázou v tráviacom trakte a v pečeni pri prvom prechode, perorálne podávaný fenylefrín má preto zníženú biologickú dostupnosť.

Eliminácia

Fenylefrínium-chlorid sa takmer úplne vylučuje do moču ako sulfátový konjugát.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Dostupné neklinické údaje pre paracetamol neodhalili žiadne zvláštne riziko pre človeka na základe konvenčných štúdií genotoxicity a karcinogénneho potenciálu v rozmedzí terapeutických dávok.

Konvenčné štúdie paracetamolu využívajúce aktuálne prijímané štandardy pre hodnotenie toxicity pre reprodukciu a vývoj nie sú k dispozícii.

Toxicita paracetamolu bola hodnotená u mnohých druhov zvierat. Chronická toxicita u týchto druhov mnohonásobne presahujúca terapeutické dávky u človeka sa prejavuje degeneráciou a nekrózou pečeneového, obličkového a lymfoidného tkaniva a vedie k zmenám krvného obrazu. Metabolity, ktoré sú považované za zodpovedné za tieto účinky, boli tiež preukázané u človeka. Paracetamol by preto nemal byť užívaný dlhé časové obdobie a v maximálnych dávkach.

Existuje niekoľko údajov zaznamenávajúcich možný vplyv fenylefrínu na vznik malformácií.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

sacharóza
kyselina citrónová, bezvodá
citrónan sodný
kukuričný škrob
cyklamát sodný
sacharín, sodná soľ
farbivo - kurkumín 5% (obsahuje glukózu)
oxid kremičitý, koloidný, bezvodý

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

3 roky

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávať pri teplote do 25 °C.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Zatavené vrstvené vrečko (papier/PE/Al/PE alebo papier/PE/Al/Surlyn), papierová škatuľka.
Jedno vrečko obsahuje 3 g prášku na prípravu perorálneho roztoku.
Obsah balenia: 1, 3, 5, 10 alebo 12 vreciek v jednom balení.

Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu

Všetok nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

OMEGA PHARMA a.s.
Viedeňská 188/119d
619 00 Brno – Dolní Heršpice
Česká republika

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

07/0046/07-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 26. februára 2007
Dátum posledného predĺženia registrácie: 18. januára 2012

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

01/2025