

## VALMISTEYHTEENVETO

### 1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Postafen 25 mg tabletti

### 2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Yksi tabletti sisältää 25 mg meklotsiinihydrokloridia.  
Täydellinen apuaineluettelo, ks. kohta 6.1

### 3. LÄÄKEMUOTO

Tabletti

Valkoinen, pyöreä tabletti, halkaisija noin 7 mm, paksuus 3 mm, tabletti painaa noin 145 mg, toisella puolella jakouurre.

### 4. KLIINISET TIEDOT

#### 4.1 Käyttöaiheet

Matkapahoinvoinnin ja merisairauden ehkäisyyn ja lievittämiseen aikuisille ja yli 12-vuotiaille nuorille.

#### 4.2 Annostus ja antotapa

##### Annostus

Päivittäinen annostus on esitetty taulukossa. Matkapahoinvoinnin ja merisairauden ehkäisyssä alkuannos suositellaan otettavaksi 1 tunti ennen matkan alkamista. Tarvittaessa annos uusitaan 24 tunnin kuluttua.

INDIKAATIO	AIKUISET JA YLI 12-VUOTIAAT
LIIKESAIRAUDET	1 tabletti 1-2 kertaa vuorokaudessa 1)

1) mikäli 25 mg:n annos ei ole riittävä, voidaan tunnin kuluttua ottaa toinen 25 mg:n annos, vuorokausiannos enintään 50 mg.  
Saatavilla oleva tieto on riittämätöntä ajatellen meklotsiinin käyttöä lapsille (ks. kohta 5.2)

Annoksen pienentäminen voi olla tarpeen, jos meklotsiinia käytetään yhdessä seuraavien lääkkeiden kanssa: keskushermostoa lamaavat, antikolinergisesti vaikuttavat, MAO:n estäjät (ks. kohta 4.5).

#### 4.3 Vasta-aiheet

Yliherkkyys meklotsiinille, jollekin muulle valmisteeseen aineosalle tai piperatsiinijohdoksille.

Maksan vajaatoiminta (ks. kohta 5.2).

#### 4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Meklotsiinin antikolinergisten ominaisuuksien vuoksi sitä on annettava varoen potilaille, joilla on:

- prostatahypertrofia

- virtsateiden obstruktio
- glaukooma
- mahanportin ahtauma
- vähentynyt ruoansulatuskanavan motiliteetti
- myastenia gravis
- dementia

Ikääntyneet ovat herkkiä meklotsiinin antikolinergiselle vaikutukselle; lääkettä on käytettävä varoen ja hoito voidaan aloittaa pienimmällä suositellulla annoksella.

Postafenia on käytettävä varoen potilaille, jotka sairastavat epilepsiaa.

Samanaikaista alkoholin käyttöä tulee välttää.

Meklotsiini voi voimistaa keskushermostoa lamaavien, antikolinergisten ja MAO:n estäjien vaikutuksia (ks. kohdat 4.2 ja 4.5).

Meklotsiinin käyttö pitää lopettaa 4 päivää ennen allergiatestausta, jottei se vaikuttaisi testitulosten tulkintaan.

Potilaiden, joilla on harvinainen perinnöllinen galaktoosi-intoleranssi, saamelaisilla esiintyvä laktaasipuutos tai glukoosi-galaktoosi-imeytymishäiriö, ei tule käyttää tätä lääkettä.

#### **4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset**

Käytettäessä meklotsiinia samanaikaisesti alkoholin tai keskushermostoa lamaavien aineiden kanssa, saattavat näiden aineiden tai meklotsiinin lamaavat vaikutukset voimistua.

Antikolinergit, MAO:n estäjät tai muut antikolinergisiä vaikutuksia omaavat lääkkeet saattavat voimistaa meklotsiinin antikolinergisiä vaikutuksia (ks. kohdat 4.2 ja 4.4).

*In vitro*- tai *in vivo*-interaktiotutkimuksia ei ole tehty. Interaktiomahdollisuus on olemassa maksaentsyymejä indusoivien tai estävien aineiden kanssa (ks. kohta 5.2).

#### **4.6 Raskaus ja imetys**

Rotilla tehdyissä lisääntymistutkimuksissa on ilmennyt kitalakihalkioita 25–50-kertaisilla annoksilla ihmiselle annettaviin annoksiin verrattuna, muilla lajeilla tätä ei ilmennyt (ks. kohta 5.3). Epidemiologiset tutkimukset raskaana olevilla naisilla eivät kuitenkaan viittaa minkäänlaisiin epämuodostumariskeihin raskauden aikaisessa käytössä.

Meklotsiinia voidaan käyttää raskauden aikana ainoastaan hyvin perustelluista syistä. Hoidon kesto on syytä rajoittaa mahdollisimman lyhyeksi, eikä vuorokausiannos saa ylittää 50 mg.

Meklotsiini ilmeisesti erittyy äidinmaitoon. Läkettä ei pitäisi käyttää imetyksen aikana.

#### **4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn**

Meklotsiini saattaa vaikuttaa henkistä valppautta ja liikkeiden koordinaatiokykyä edellyttävien tehtävien suorittamiseen, kuten autolla ajamiseen ja koneiden käsittelyyn. Samanaikainen alkoholin tai muiden väsyttävästi vaikuttavien lääkkeiden käyttö voimistaa vaikutusta (ks. kohta 4.5).

#### **4.8 Haittavaikutukset**

Haittavaikutukset liittyvät useimmiten keskushermostolamaan tai paradoksiseen stimuloivaan vaikutukseen, antikolinergisiin vaikutuksiin tai yliherkkyyteen. Tavallisimpia haittavaikutuksia ovat

uneliaisuus tai sedaatio. Suun kuivumista esiintyy yleisesti. Näön hämärtyminen, pahoinvointi ja oksentelu ovat harvinaisia haittoja.

Sydän	sydämen tykytys, takykardia
Kuulo ja tasapainoelin	tinnitus, kierto huimaus
Silmät	kaksoiskuvat, näön hämärtyminen
Ruoansulatuselimistö	vatsakipu, ummetus, ripuli, suun kuivuminen, pahoinvointi, oksentelu
Yleisoireet ja antopaikassa todettavat haitat	uupumus, heikkouden tunne
Immuunijärjestelmä	anafylaktinen sokki
Tutkimukset	painon nousu
Aineenvaihdunta ja ravitsemus	ruokahaluttomuus, lisääntynyt ruokahalu
Hermosto	heitehuimaus, päänsärky, tuntoharha, väsymys, uneliaisuus, liikehäiriöt (mukaan lukien parkinsonismi)
Psyykkiset häiriöt	ahdistus, euforinen mieliala, kiihtymys, hallusinaatiot, unettomuus, psykoottinen häiriö
Munuaiset ja virtsatiet	dysuria, polyuria, virtsaumpi
Hengityselimet, rintakehä ja välikarsina	nielun tai nenän kuivuminen
Verisuonisto	verenpaineen lasku
Iho ja ihonalainen kudος	ihottuma, urtikaria

#### Epäillyistä haittavaikutuksista ilmoittaminen

On tärkeää ilmoittaa myyntiluvan myöntämisen jälkeisistä lääkevalmisteen epäillyistä haittavaikutuksista. Se mahdollistaa lääkevalmisteen hyöty-haitta- tasapainon jatkuvan arvioinnin. Terveystieteiden ammattilaisia pyydetään ilmoittamaan kaikista epäillyistä haittavaikutuksista seuraavalle taholle:

www-sivusto: [www.fimea.fi](http://www.fimea.fi)

Lääkealan turvallisuus- ja kehittämiskeskus Fimea Lääkkeiden haittavaikutusrekisteri

PL 55

00034 FIMEA

## 4.9 Yliannostus

### Oireet

Meklotsiinin yliannostus saattaa aiheuttaa keskushermoston lamaa tai stimulaatiota kuten muutkin antihistamiinit. Antikolinerginen ylikuormitus voi ilmetä pupillien valojäykkyytenä ja laajentumisena, kasvojen punoituksena, suun kuivumisena, kiihtymyksenä, hallusinaatioina ja toonis-kloonisina kohtauksina. Ekstrapyramidaalista oireyhtymää on esiintynyt. Antihistamiiniyliannostuksen yhteydessä esiintyy myös ataksiaa, vapinaa, psykooseja, hypertermiaa, hypotensiota, hypertensiota, takykardiaa ja rytmihäiriöitä. Aikuisille yliannostus saattaa aiheuttaa keskushermostolamaa, johon liittyy uneliaisuus, kooma tai kiihtymys, epileptiset kohtaukset ja kohtauksen jälkeinen masennus. Pienillä lapsilla keskushermoston stimulaatio on vallitseva.

Vaikea myrkytys voi aikuisilla ja lapsilla johtaa aivoödeemaan, syvään tajuttomuuteen, hengityslamaan, sydämen ja verenkierron lamaantumiseen ja kuolemaan.

### Hoito

Meklotsiinimyrkytyksen hoito on oireenmukaista ja elintoimintoja ylläpitävää. Spesifistä antidoottia ei ole. Morfiinin tai muiden hengityslamaa aiheuttavien lääkkeiden käyttöä on ehdottomasti vältettävä.

## 5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

### 5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä: systeemiset antihistamiinit, piperatsiinijohdokset, ATC-koodi R06AE05

Huimaus, pahoinvointi ja oksentelu eivät ole sairauksia, vaan oireita jotka viittaavat elimistön toiminnalliseen häiriöön tai jonkin elimen vajaatoimintaan. Taustalla olevan syyn hoito riippuu kyseessä olevasta sairaudesta. Meklotsiinia käytetään yllämainittujen oireiden hoitoon.

Meklotsiinin vaikutusmekanismia antiemeettinä, huimauksen hoidossa ja liikesairauksissa ei täysin tunneta, mekanismin oletetaan liittyvän aineen sentraaliseen antikolinergiseen vaikutukseen sekä lamaavaan vaikutukseen keskushermostotasolla.

Meklotsiini vähentää tasapainoelimen ärtyvyyttä ja vaikuttaa sen toimintaa lamaavasti, samalla se vähentää impulssin johtumista sisäkorvasta pikkuaivoihin. Meklotsiinin vaikutuksella ydinjatkeen kemosensoriseen alueeseen saattaa olla antiemeettistä ominaisuutta edistävä vaikutus.

Meklotsiinilla on antihistamiini-, spasmolyttinen, antikolinerginen sekä keskushermostoa lamaava ja paikallispuuduttava vaikutus.

## 5.2 Farmakokinetiikka

### *Imeytyminen*

Meklotsiini imeytyy nopeasti ruoansulatuskanavasta siirapin tai tabletin muodossa tyhjään mahaan otettuna. Huippupitoisuus plasmassa (C<sub>max</sub>) saavutetaan 2,2 tunnissa (tablettina) oraalisen annon jälkeen. Tablettina annetun 50 mg kerta-annoksen jälkeen plasman huippupitoisuus aikuisten elimistössä on tyypillisesti 92 ng/ml.

### *Jakautuminen*

Tietoa meklotsiinin jakautumisesta ihmiselimistöön ei ole. Eläimissä aineen jakautumistilavuus on suuri, mikä viittaa siihen, että meklotsiinipitoisuus kudoksissa on suurempi kuin pitoisuus plasmassa.

### *Vaikutuksen kesto*

Meklotsiinin vaikutus alkaa noin tunnin kuluessa lääkkeen ottamisesta. Meklotsiinin antiemeettinen vaikutus ja vaikutus tasapainoelimeen kestää 12–24 tuntia.

### *Metabolia*

Suuri osa meklotsiinista metaboloituu. Metaboliiteita ovat N-oksidaatio, oksidatiivinen N-dealkylaatio, metyylioksidaatio, aromaattinen hydroksylaatio ja O-metylaatio sekä glukuronidi- ja tauriinikonjugaatio.

### *Eliminaatio*

Meklotsiinin puoliintumisaika on aikuisilla 5,7–11,1 tuntia. Laskennallinen kokonaispuhdistuma on 11 ml/min/kg 50 mg:n kerta-annoksella. Meklotsiini ei erity muuttumattomana virtsaan.

### *Kinetiikka erityisryhmillä*

Meklotsiinin farmakokinetiikkaa iäkkäiden ja lasten elimistössä ei ole tutkittu.

### *Munuaisten vajaatoiminta*

Koska meklotsiini ei erity muuttumattomana virtsaan, ei munuaisten vajaatoiminta juurikaan vaikuta meklotsiinin farmakokinetiikkaan.

### *Maksan vajaatoiminta*

Maksan vajaatoiminnan vaikutusta kinetiikkaan ei ole tutkittu. Koska maksa osallistuu meklotsiinin eliminaatioon, on sen vajaatoiminnalla vaikutusta aineen kinetiikkaan. Meklotsiinin käyttö on vasta-aiheista maksan vajaatoiminnassa.

## 5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Tavanomaiset akuutin toksisuuden ja toistuvan altistuksen aiheuttaman toksisuuden tutkimukset rotilla ja koirilla eivät viittaa erityiseen riskiin ihmiselle. Lisääntymistoksisuustutkimuksissa meklotsiini osoittautui rotille teratogeeniseksi annoksilla, jotka olivat 25–50-kertaisia suurimpaan ihmiselle suositeltavaan annokseen verrattuna. Muilla eläinlajeilla teratogeenisuutta ei ilmennyt. Eläinkokeissa meklotsiinilla havaittiin antiarytmista aktiivisuutta ja vaikutusta sydämen johtokykyyn annoksilla, jotka olivat suurempia kuin ihmiselle annettava maksimiannos, joten havainnon kliininen merkitys on vähäinen.

## **6. FARMASEUTTISET TIEDOT**

### **6.1 Apuaineet**

laktoosimonohydraatti 75 mg/tabletti  
maissitärkkelys  
talkki  
povidoni  
kalsiumstearaatti  
vedetön kolloidinen piidioksidi

### **6.2 Yhteensopimattomuudet**

Ei oleellinen.

### **6.3 Kesto aika**

5 vuotta.

### **6.4 Säilytys**

Säilytä alle 25 °C.  
Säilytä alkuperäispakkauksessa. Herkkä kosteudelle.

### **6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoot**

Läpipainopakkaus (PVC/alumiini), pahvikotelo, pakkausseloste.  
10 ja 100 tablettia  
Molempia pakkauskokoja ei välttämättä ole myynnissä.

### **6.6 Erityiset varotoimet hävittämiselle**

Ei erityisvaatimuksia.

## **7. MYYNTILUVAN HALTIJA**

TERALI  
23 rue Christophe Plantin  
ZA La Haute Limougeère  
37230 Fondettes  
Ranska

## **8. MYYNTILUVAN NUMERO(T)**

3393

**9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

4.5.1966 / 2.8.2004 / 15.5.2008

**10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

28.07.2016