

## VALMISTEYHTEENVETO

### 1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Postafen 25 mg tabletti

### 2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Yksi tabletti sisältää 25 mg meklotsiinihydrokloridia.

Apuaineet, joiden vaikutus tunnetaan: Yksi tabletti sisältää 75 mg laktoosimonohydraattia.

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

*Aikuiset ja yli 12-vuotiaat nuoret*

1 tabletti 1–2 kertaa vuorokaudessa.

Mikäli 25 mg:n annos ei ole riittävä, voidaan tunnin kuluttua ottaa toinen 25 mg:n annos, vuorokausiannos enintään 50 mg. Matkapahoinvoinnin ja merisairauden ehkäisyssä alkuannos suositellaan otettavaksi 1 tunti ennen matkan alkamista. Tarvittaessa annos uusitaan 24 tunnin kuluttua.

##### *Lapset*

Saatavilla oleva tieto on riittämätöntä ajatellen meklotsiinin käyttöä alle 12-vuotiaille 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 vaikuttavalle aineelle (meklotsiinille) tai kohdassa 6.1 mainituille apuaineille, 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
- myasthenia gravis
- dementia

Läkkäät 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 allergeetestausta, jottei se vaikuttaisi testitulosten tulkintaan.

Potilaiden, joilla on harvinainen perinnöllinen galaktoosi-intoleranssi, saamelaisilla esiintyvä laktaasinpuutos 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 Hedelmällisyys, raskaus ja imetys

##### Raskaus

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.

## Imetys

Meklotsiini ilmeisesti erittyy äidinmaitoon. Lääkettä 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.

#### Haittavaikutukset taulukkomuodossa

Raportoidut haittavaikutukset esitetään taulukossa 1. Yleisyyskategoriat ovat: hyvin yleinen ( $\geq 1/10$ ); yleinen ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ); melko harvinainen ( $\geq 1/1\,000$ ,  $< 1/100$ ); harvinainen ( $\geq 1/10\,000$ ,  $< 1/1\,000$ ) tai hyvin harvinainen ( $< 1/10\,000$ ), sekä tuntematon (koska saatavissa oleva tieto ei riitä arviointiin). Haittavaikutukset on esitetty kussakin yleisyysluokassa haittavaikutuksen vakavuuden mukaan alenevassa järjestyksessä.

#### **Taulukko 1. Havaitut haittavaikutukset**

<b>Elinjärjestelmäluokka</b>	<b>Esiintymistiheys</b>	<b>Haittavaikutukset</b>
<b>Immuunijärjestelmä</b>	Hyvin harvinainen	Anafylaktinen sokki
<b>Aineenvaihdunta ja ravitseminen</b>	Tuntematon	Ruokahaluttomuus, lisääntynyt ruokahalu
<b>Psyykkiset häiriöt</b>	Melko harvinainen	Hallusinaatiot, unettomuus, psykoottinen häiriö
	Tuntematon	Ahdistus, euforinen mieliala, kihtymys
<b>Hermosto</b>	Hyvin yleinen	Uneliaisuus, sedaatio
	Yleinen	Heitehuimaus, päänsärky
	Melko harvinainen	Liikehäiriöt (mukaan lukien parkinsonismi)
	Harvinainen	Tuntoharha
<b>Silmät</b>	Harvinainen	Kaksoiskuvat, näön hämärtyminen
<b>Kuulo ja tasapainoelin</b>	Melko harvinainen	Tinnitus
	Tuntematon	Kiertohuimaus
<b>Sydän</b>	Melko harvinainen	Sydämen tykytys, takykardia
<b>Verisuonisto</b>	Harvinainen	Verenpaineen aleneminen
<b>Hengityselimet, rintakehä ja välikarsina</b>	Tuntematon	Nielun tai nenän kuivuminen
<b>Ruoansulatuselimistö</b>	Yleinen	Suun kuivuminen
	Melko harvinainen	Ummetus
	Harvinainen	Vatsakipu, ripuli, pahoinvointi, oksentelu
<b>Iho ja ihonalainen kudos</b>	Melko harvinainen	Ihottuma
	Harvinainen	Urtikaria

<b>Munuaiset ja virtsatiet</b>	Melko harvinainen	Polyuria, virtsaumpi
	Tuntematon	Dysuria
<b>Yleisoireet ja antopaikassa todettavat haitat</b>	Hyvin yleinen	Uupumus, heikkouden tunne
<b>Tutkimukset</b>	Tuntematon	Painon nousu

#### Epäilyistä haittavaikutuksista ilmoittaminen

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

Vaikkea 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.

Vaikutusmekanismi

Meklotsiinin vaikutusmekanismeja 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 ydinjatkkeen kemosensoriseen alueeseen saattaa olla antiemeettistä ominaisuutta edistävä vaikutus.

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

## 5.2 Farmakokineetiikka

### *Imeytyminen*

Meklotsiini imeytyy nopeasti ruoansulatuskanavasta siirapin tai tabletin muodossa tyhjään mahaan otettuna. Huippupitoisuus plasmassa ( $C_{max}$ ) 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.

### *Biotransformaatio*

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

### *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.

### *Kineetiikka erityisryhmillä*

Meklotsiinin farmakokineetiikkaa iäkkäiden ja lasten elimistössä ei ole tutkittu.

### *Munuaisten vajaatoiminta*

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

### *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  
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, pakkausseoste.  
10 ja 100 tablettia  
Kaikkia pakkauskokoja ei välttämättä ole myynnissä.

### **6.6 Erityiset varotoimet hävittämiselle**

Ei erityisvaatimuksia.

## **7. MYYNTILUVAN HALTIJA**

CampusPharma AB  
Karl Gustavsgatan 1A  
411 25 Göteborg  
Ruotsi

## **8. MYYNTILUVAN NUMERO**

3393

**9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

4.5.1966 / 2.8.2004 / 15.5.2008

**10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

30.09.2019