

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

lääkkäät 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 allergeestestausta, 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 ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1000$) 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

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

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

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
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.

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 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_{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 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
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 pakkaus koot

Läpipainopakkaus (PVC/alumiini), pahvikotelo, pakkausseloste.
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

Myyntiluvan myöntämisen päivämäärä: 04.05.1966
Viimeisimmän uudistamisen päivämäärä: 15.05.2008

10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

07.12.2021

PRODUKTRESUMÉ

1. LÄKEMEDLETS NAMN

Postafen 25 mg tablett

2. KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

En tablett innehåller meklozinhydroklorid 25 mg.

Hjälpämnen med känd effekt: Varje tablett innehåller 75 mg laktosmonohydrat.

För fullständig förteckning över hjälpämnena, se avsnitt 6.1.

3. LÄKEMEDELFORM

Tablett

Vit, rund tablett med brytskåra på ena sidan, diameter 7 mm och tjocklek 3 mm, vikt cirka 145 mg.

4. KLINISKA UPPGIFTER

4.1 Terapeutiska indikationer

För förebyggande och lindring av åksjuka och sjösjuka hos vuxna och ungdomar över 12 år.

4.2 Dosering och administreringsätt

Dosering

Vuxna och ungdomar över 12 år

1 tablett 1-2 gånger om dagen.

Om en dos på 25 mg inte är tillräcklig kan en andra dos på 25 mg tas efter en timme. Maximal dos är 50 mg dagligen. För att förebygga åksjuka och sjösjuka rekommenderas att den första dosen tas 1 timme innan resans start. Vid behov upprepas dosen efter 24 timmar.

Barn

Det finns inte tillräckligt med data för att rekommendera användning av meklozin hos barn under 12 år (se avsnitt 5.2).

Dosreduktion kan krävas om meklozin används i kombination med följande läkemedel: CNS -depressiva medel, antikolinerga medel, MAO-hämmare (se avsnitt 4.5).

4.3 Kontraindikationer

Överkänslighet mot den aktiva substansen (meklozin) eller mot något hjälpämne som anges i avsnitt 6.1, eller mot piperazinderivat.

Nedsatt leverfunktion (se avsnitt 5.2).

4.4 Varningar och försiktighet

På grund av meklozins antikolinerga egenskaper ska läkemedlet användas med försiktighet till patienter som lider av:

- prostatahypertrofi
- urinvägsobstruktion
- glaukom
- pylorusstenos
- nedsatt gastrointestinal motilitet
- myasthenia gravis
- demens

Äldre personer är känsliga för de antikolinerga effekterna hos meklozin. Läkemedlet ska användas med försiktighet och behandlingen kan inledas med den lägsta rekommenderade dosen.

Postafen ska användas med försiktighet till patienter med epilepsi.

Samtidig användning av alkohol ska undvikas.

Meklozin kan förstärka effekterna av CNS-depressiva medel, antikolinergika och MAO-hämmare (se avsnitt 4.2 och 4.5).

Användning av meklozin ska avbrytas 4 dagar före allergitestning för att undvika att tolkningen av testresultaten påverkas.

Patienter med något av följande sällsynta ärftliga tillstånd ska inte använda detta läkemedel: galaktosintolerans, fullständig laktasbrist eller glukos-galaktosmalabsorption.

4.5 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

Den potentierande effekten av meklozin måste beaktas när det används samtidigt med alkohol eller andra CNS-dämpande medel, eftersom samtidig användning kan förstärka den dämpande effekten av dessa medel.

Antikolinergika, MAO-hämmare eller andra läkemedel med antikolinerg effekt kan förstärka de antikolinerga effekterna av meklozin (se avsnitt 4.2 och 4.4).

Inga interaktionsstudier har utförts *in vitro* eller *in vivo*. Det finns en risk för interaktion med läkemedel som man vet inducerar eller inhiberar leverenzymerna (se avsnitt 5.2).

4.6 Fertilitet, graviditet och amning

Graviditet

I reproduktionsstudier på råttor observerades gomspalt vid doser 25-50 gånger den humana dosen, men detta har inte observerats hos andra arter (se avsnitt 5.3). Epidemiologiska studier på gravida kvinnor tyder dock inte på någon risk för missbildningar under graviditeten.

Meklozin ska endast användas under graviditet om det är kliniskt motiverat. Behandlingstiden bör hållas så kort som möjligt och den dagliga dosen bör inte överstiga 50 mg.

Amning

Meklozin passerar troligen över i modersmjölk. Därför ska läkemedlet inte användas under amning.

4.7 Effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner

Meklozin kan påverka utförandet av uppgifter som kräver mental vakenhet och koordinering av rörelse som framförandet av fordon och användning av maskiner. Samtidig användning av alkohol eller andra sederande medel ska undvikas eftersom det förstärker deras effekt (se avsnitt 4.5).

4.8 Biverkningar

Biverkningar är huvudsakligen relaterade till CNS-dämpande eller paradoxala CNS-stimulerande effekter, till antikolinerga egenskaper eller till överkänslighetsreaktioner. Den vanligaste biverkningen är dåsig het eller sedation. Muntorrhet är vanligt förekommande. Dimsyn, illamående och kräkningar förekommer sällan.

Biverkningarna i tabellform

Rapporterade biverkningar visas i tabell 1. Biverkningsfrekvens definieras enligt följande: Mycket vanliga ($\geq 1/10$); Vanliga ($\geq 1/100$, $< 1/10$); Mindre vanliga ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); Sällsynta ($1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$), Mycket sällsynta ($< 1/10\ 000$), ingen känd frekvens (kan inte beräknas från tillgängliga data). Biverkningarna presenteras inom varje frekvensgrupp i fallande allvarlighetsgrad.

Tabell 1. Observerade biverkningar

Organsystemklass	Frekvens	Biverkningar
Immunsystemet	Mycket sällsynta	Anafylaktisk chock
Metabolism och nutrition	Ingen känd frekvens	Anorexi, ökad aptit
Psykiska störningar	Mindre vanliga	Hallucinationer, sömnlöshet, psykotiska störningar
	Ingen känd frekvens	Ångest, eufori, agitation
Centrala och perifera nervsystemet	Mycket vanliga	Dåsig het, sedering
	Vanliga	Yrsel, huvudvärk
	Mindre vanliga	Rörelsestörningar (inklusive parkinsonism)
	Sällsynta	Hallucinationer
Ögon	Sällsynta	Dubbelseende, suddig syn
Öron och balansorgan	Mindre vanliga	Tinnitus
	Ingen känd frekvens	Yrsel
Hjärtat	Mindre vanliga	Hjärtklappning, takykardi
Blodkärl	Sällsynta	Sänkt blodtryck
Andningsvägar, bröstorg och mediastinum	Ingen känd frekvens	Torrhet i hals eller näsa

Magtarmkanalen	Vanliga	Muntorrhet
	Mindre vanliga	Förstoppning
	Sällsynta	Magsmärta, diarré, illamående, kräkningar
Hud och subkutan vävnad	Mindre vanliga	Utslag
	Sällsynta	Urtikaria
Njurar och urinvägar	Mindre vanliga	Polyuri, urinretention
	Ingen känd frekvens	Dysuri
Allmänna symtom och/eller symtom vid administreringsstället	Mycket vanliga	Trötthet, kraftlöshet
Undersökningar	Ingen känd frekvens	Viktökning

Rapportering av misstänkta biverkningar

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar efter att läkemedlet godkänts. Det gör det möjligt att kontinuerligt övervaka läkemedlets nytta-riskförhållande. Hälso- och sjukvårdspersonal uppmanas att rapportera varje misstänkt biverkning till:

webbplats: www.fimea.fi

Säkerhets- och utvecklingscentret för läkemedelsområdet Fimea

Biverkningsregistret

PB 55

00034 FIMEA

4.9 Överdoser

Symptom

Liksom med andra antihistaminer kan överdosering av meklozin medföra dämpning och/eller stimulering av CNS. Effekter av antikolinerg överstimulering förekommer också, såsom fixerade och dilaterade pupiller, rodnad i ansiktet, muntorrhet, excitation, hallucinationer och tonisk-kloniska anfall. Extrapiramidalt syndrom har rapporterats. Andra symptom såsom ataxi, tremor, psykoser, hypertermi, hypotoni, hypertoni, takykardi och arrytmier har också rapporterats vid överdosering med antihistaminer. Överdoser hos vuxna kan orsaka CNS-påverkan med dåsighet, koma eller upphetsning, krampanfall och postiktal depression. Hos små barn är CNS-stimulering dominerande.

Allvarlig förgiftning hos barn och vuxna kan medföra cerebralt ödem, djup koma, andningsdepression, kardiopulmonär kollaps och död.

Behandling

Vid överdosering med meklozin ges huvudsakligen stödbehandling och symptomatisk behandling. Det finns inget specifikt motgift. Användning av morfin eller andra läkemedel som orsakar andningsdepression bör strikt undvikas.

5. FARMAKOLOGISKA EGENSKAPER

5.1 Farmakodynamiska egenskaper

Farmakoterapeutisk grupp: Antihistaminer för systemiskt bruk, piperazinderivat, ATC-kod: R06AE05

Yrsel, illamående och kräkningar är inte sjukdomar, utan symptom som indikerar en dysfunktion i kroppen eller ett misslyckande i ett organ. Behandlingen av den bakomliggande orsaken beror på den aktuella sjukdomen. Meklozin används för att behandla ovanstående symptom.

Verkningsmekanism

Verkningsmekanismen för meklozin som ett antiemetikum, vid behandling av yrsel och vid åksjuka är inte helt klarlagd. Mekanismen anses ha samband med ämnets centrala antikolinerga effekt samt den CNS-depressiva effekten.

Meklozin minskar balansorganets irritabilitet och har en hämmande effekt på dess funktion, samtidigt som det minskar ledningen av impulser från innerörat till lillhjärnan. Effekten av meklozin på den kemosensoriska regionen i kärnförlängningen kan ha en antiemetisk effekt.

Meklozin har antihistamin, spasmolytisk, antikolinerga, CNS-depressiva och lokalbedövande effekter.

5.2 Farmakokinetiska uppgifter

Absorption

Meklozin absorberas snabbt från magtarmkanalen i form av en sirap eller tablett som tas på tom mage. Maximal plasmakoncentration (C_{max}) uppnås inom 2,2 timmar (som tabletter) efter oral administrering. Efter en enstaka tablett dos på 50 mg är den maximala plasmakoncentrationen hos vuxna vanligtvis 92 ng/ml.

Distribution

Det finns ingen information om distributionen av meklozin i människokroppen. Hos djur är distributionsvolymen för ämnet stor, vilket tyder på att koncentrationen av meklozin i vävnader är högre än koncentrationen i plasma.

Effektens varaktighet

Effekten av meklozin börjar inom ungefär en timme efter att läkemedlet tagits. Den antiemetiska effekten av meklozin och effekten på balansorganet varar i 12 till 24 timmar.

Metabolism

Mycket av meklozin metaboliseras. Metaboliska vägar inkluderar N-oxidation, oxidativ N-dealkylering, metyloxidation, aromatisk hydroxylering och O-metylering samt glukuronid- och taurinkonjugering.

Eliminering

Halveringstiden för meklozin hos vuxna är 5,7 till 11,1 timmar. Den beräknade totala clearance är 11 ml/min/kg vid en engångsdos på 50 mg. Meklozin utsöndras inte oförändrat i urinen.

Kinetik i särskilda grupper

Meklozins farmakokinetik har inte undersökts hos äldre eller hos barn.

Nedsatt njurfunktion

Eftersom meklozin inte utsöndras oförändrat i urinen påverkas farmakokinetiken för meklozin inte signifikant av nedsatt njurfunktion.

Nedsatt leverfunktion

Effekten av nedsatt leverfunktion på farmakokinetiken har inte studerats. Eftersom levern är inblandad i eliminering av meklozin förväntas nedsatt leverfunktion ha farmakokinetiska effekter på meklozin.

Användning av meklozin är kontraindicerat vid nedsatt leverfunktion.

5.3 Prekliniska säkerhetsuppgifter

Konventionella akut- och upprepade dosstudier av toxicitet hos råttor och hundar tyder inte på någon speciell fara för människor. I reproduktionstoxicitetsstudier var meklozin teratogent hos råttor i doser 25-50 gånger den högsta rekommenderade humana dosen. Ingen teratogenicitet observerades hos andra djurarter. I djurstudier visade meklozin antiarytmisk aktivitet och en effekt på hjärtkonduktiviteten vid doser högre än den maximala humandosen. Den kliniska betydelsen av detta fynd är låg.

6. FARMACEUTISKA UPPGIFTER

6.1 Förteckning över hjälpämnen

laktosmonohydrat
majsstärkelse
talk
povidon
kalciumstearat
kolloidal vattenfri kiseldioxid

6.2 Inkompatibiliteter

Ej relevant.

6.3 Hållbarhet

5 år

6.4 Särskilda förvaringsanvisningar

Förvaras vid högst 25 °C.
Förvara i originalförpackningen. Känslig för fukt.

6.5 Förpackningstyp och innehåll

Blisterförpackning (PVC/aluminium) kartong, bipacksedel.
10 och 100 tabletter.

Eventuellt kommer inte alla förpackningsstorlekar att marknadsföras.

6.6 Särskilda anvisningar för destruktion och övrig hantering

Inga särskilda anvisningar.

7. INNEHAVARE AV GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

CampusPharma AB
Karl Gustavsgatan 1A
411 25 Göteborg

Sverige

8. NUMMER PÅ GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

3393

9. DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE/FÖRNYAT GODKÄNNANDE

Datum för det första godkännandet: 04.05.1966

Datum för den senaste förnyelsen: 15.05.2008

10. DATUM FÖR ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN

07.12.2021