

## FICHA TÉCNICA

### 1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

Efortil 5 mg comprimidos

### 2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Cada comprimido contiene 5 mg de hidrocloreuro de etilefrina.

**Excipientes con efecto conocido:** cada comprimido contiene 31,8 mg de lactosa y 0,5 mg de metabisulfito de sodio (E-223).

Para consultar la lista completa de excipientes ver sección 6.1.

### 3. FORMA FARMACÉUTICA

Comprimidos.

Comprimidos redondos, biplanos, de color blanco, con borde biselado en ambas caras. La cara superior lleva el grabado 05E/05E y ranura de partición y la cara inferior lleva el símbolo de la empresa.

### 4. DATOS CLÍNICOS

#### 4.1. Indicaciones terapéuticas

Tratamiento de la hipotensión ortostática sintomática, cuando la respuesta a las medidas dietéticas (ingesta adecuada de sal y líquidos) e higiénico-posturales ha resultado insuficiente.

#### 4.2. Posología y forma de administración

Vía oral.

Deben seguirse las recomendaciones siguientes, a menos que el médico prescriba lo contrario:

#### Posología

##### Adultos

La dosis recomendada de inicio es de 1 comprimido (5 mg), 3 veces al día. La dosis podrá aumentarse hasta 2 comprimidos (10 mg) 3 veces al día, en caso necesario. La dosis diaria total no debe sobrepasar los 30 mg (6 comprimidos).

##### Niños

La posología recomendada en niños mayores de 5 años es igual a la de adultos.

No existe experiencia de utilización en niños menores de 5 años, por lo que el uso de Efortil en niños menores de 5 años no está recomendado.

##### Ancianos

No hay datos para recomendar un ajuste de la dosis en este tipo de pacientes.

##### Insuficiencia renal

No hay datos para recomendar un ajuste de la dosis en este tipo de pacientes. La etilefrina y sus conjugados se excretan principalmente por la vía renal, por lo que no puede descartarse un posible efecto acumulativo en pacientes con insuficiencia renal (ver sección 5.2).

#### Insuficiencia hepática

No hay datos para recomendar un ajuste de la dosis en este tipo de pacientes.

#### Forma de administración

Los comprimidos de Efortil deben ingerirse con líquidos. Se consigue un efecto especialmente rápido si los comprimidos se toman antes de las comidas.

### **4.3. Contraindicaciones**

Efortil está contraindicado en:

- Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes incluidos en la sección 6.1
- Hipertensión o reacciones hipertensivas ortostáticas.
- Tirotoxicosis.
- Feocromocitoma.
- Glaucoma de ángulo estrecho.
- Hipertrofia prostática o adenoma prostático con retención urinaria.
- Enfermedad coronaria.
- Insuficiencia cardiaca descompensada.
- Cardiomiopatía hipertrófica obstructiva.
- Estenosis de las válvulas cardiacas o de las arterias centrales.
- El primer trimestre del embarazo así como durante la lactancia (ver sección Fertilidad, embarazo y lactancia).

### **4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo**

Antes de iniciar el tratamiento con Efortil deben excluirse otras causas de hipotensión, tales como la estenosis de las válvulas del corazón o de las arterias principales, enfermedades neurológicas o tratamientos concomitantes con antihipertensivos o psicofármacos.

Efortil debe utilizarse con precaución en pacientes con taquicardia, arritmias cardiacas y trastornos cardiovasculares graves.

Debe utilizarse con precaución en pacientes con diabetes mellitus (ver sección Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción) y en pacientes con hipertiroidismo.

#### Información sobre excipientes

Este medicamento contiene lactosa. Los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, deficiencia total de lactasa o problemas de absorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

Este medicamento puede producir reacciones alérgicas graves y broncoespasmo porque contiene metabisulfito de sodio (E-223).

Este medicamento contiene menos de 1 mmol de sodio (23 mg) por comprimido; esto es, esencialmente “exento de sodio”.

#### Advertencia a los deportistas

Se debe informar a los deportistas que este medicamento contiene etilefrina, que puede establecer un resultado analítico positivo en los test de control del dopaje.

#### **4.5. Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción**

El efecto de Efortil puede potenciarse por la administración simultánea de guanetidina, mineralocorticoides, reserpina, hormonas tiroideas, antihistamínicos, otros simpaticomiméticos (por ejemplo efedrina, fenilefrina), o cualquier otra sustancia con efectos simpaticomiméticos, tales como los antidepresivos tricíclicos o los inhibidores de la monoaminoxidasa (IMAO).

El linezolid puede aumentar el efecto hipertensivo producido por la etilefrina debido a que tiene un efecto inhibitor no selectivo de la monoaminoxidasa. Se recomienda evitar la asociación a menos que sea posible una estrecha observación y monitorización del paciente.

Los hidrocarburos alifáticos halogenados en anestésicos administrados vía inhalatoria (por ejemplo halotano, isoflurano) y los glucósidos cardíacos en dosis altas pueden aumentar los efectos de los agentes simpaticomiméticos sobre el corazón, provocando la aparición de arritmias cardíacas.

La dihidroergotamina aumenta la absorción entérica de Efortil y por tanto potencia su acción.

La atropina puede potenciar el efecto de Efortil e incrementar el ritmo cardiaco.

Los agentes bloqueantes adrenérgicos ( $\alpha$ -bloqueantes y  $\beta$ -bloqueantes) pueden anular parcial o totalmente el efecto de la etilefrina. El tratamiento con  $\beta$ -bloqueantes puede producir bradicardia refleja.

Efortil puede disminuir el efecto hipoglucemiante de los fármacos antidiabéticos (ver sección Advertencias y precauciones especiales de empleo).

#### **4.6. Fertilidad, embarazo y lactancia**

##### Embarazo

Efortil está contraindicado en el primer trimestre del embarazo ya que los datos clínicos son insuficientes y los datos no clínicos han demostrado un efecto teratogénico (ver secciones Contraindicaciones y Datos preclínicos sobre seguridad). Durante el segundo y tercer trimestre de embarazo, Efortil sólo debe utilizarse después de una valoración minuciosa de los riesgos y beneficios del tratamiento. Etilefrina puede deteriorar la perfusión uteroplacentaria y provocar relajación uterina.

##### Lactancia

No puede excluirse el paso del fármaco a la leche de la madre. Por consiguiente, Efortil está contraindicado durante la lactancia (ver sección Contraindicaciones). En el caso de que el tratamiento con Efortil sea imprescindible para la madre, se le aconsejará que evite la lactación.

##### Fertilidad

No se han realizado estudios preclínicos con etilefrina respecto a la fertilidad. No se han realizado estudios sobre el efecto en la fertilidad en humanos.

#### 4.7. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No se han realizado estudios de los efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas. Sin embargo, los pacientes deben ser advertidos que pueden experimentar efectos indeseables como mareo durante el tratamiento con Efortil. Por lo tanto, se recomienda precaución al conducir o utilizar maquinaria.

#### 4.8. Reacciones adversas

Las reacciones adversas han sido ordenadas según frecuencias utilizando la siguiente clasificación: muy frecuentes ( $\geq 1/10$ ); frecuentes ( $\geq 1/100$ ,  $<1/10$ ); poco frecuentes ( $\geq 1/1.000$ ,  $<1/100$ ); raras ( $\geq 1/10.000$ ,  $<1/1.000$ ); muy raras ( $<1/10.000$ ); frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

Las reacciones adversas se presentan en orden decreciente de gravedad dentro de cada intervalo de frecuencia.

##### Trastornos del sistema inmunológico:

Frecuencia no conocida: hipersensibilidad (reacción alérgica).

##### Trastornos psiquiátricos:

Poco frecuentes: ansiedad, insomnio.

##### Trastornos del sistema nervioso:

Frecuentes: dolor de cabeza.

Poco frecuentes: temblor, inquietud.

##### Trastornos del oído y del laberinto:

Poco frecuentes: mareo.

##### Trastornos cardíacos:

Poco frecuentes: palpitaciones, taquicardia, arritmia.

Frecuencia no conocida: angina de pecho, aumento de la presión arterial.

##### Trastornos gastrointestinales:

Poco frecuentes: náuseas.

##### Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración:

Frecuencia no conocida: hiperhidrosis.

##### Notificación de sospechas de reacciones adversas

Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas a través del Sistema Español de Farmacovigilancia de medicamentos de Uso Humano: <https://www.notificaram.es>.

#### 4.9. Sobredosis

En adultos, la ingestión de 100-150 mg dio lugar a intoxicación moderada, mientras que 500-625 mg dieron lugar a intoxicación grave.

Los síntomas de sobredosis aguda pueden incluir midriasis, dolor de cabeza, vómitos, temblor, agitación, palpitaciones, aumento de la presión arterial y taquicardia. En casos graves puede haber convulsiones, arritmias, hipertermia y rabdomiolisis. En lactantes y niños pequeños, la sobredosis puede ser causa de depresión respiratoria central y coma.

Debe administrarse un tratamiento sintomático adecuado, incluyendo las medidas generales de soporte, el lavado gástrico y administración de carbón activo en caso necesario. En caso de sobredosis grave deben adoptarse medidas propias de cuidados intensivos.

El aumento de la presión arterial puede tratarse con labetalol, complementándose en caso necesario con fentolamina. Si existe taquicardia pronunciada pueden administrarse betabloqueantes tales como metoprolol o atenolol.

## **5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS**

### **5.1. Propiedades farmacodinámicas**

Grupo farmacoterapéutico: C01CA: Estimulantes cardíacos: adrenérgicos y dopaminérgicos.  
Código ATC: C01CA01.

La etilefrina, sustancia activa de Efortil, es un agente simpaticomimético de acción directa con elevada afinidad para los receptores  $\alpha_1$  y  $\beta_1$ . Los receptores  $\beta_2$  también pueden activarse a dosis altas. Por este motivo es capaz de potenciar la contractilidad cardíaca y aumentar el gasto cardíaco elevando el volumen sistólico. Por otra parte, eleva el tono venoso y la presión venosa central y provoca un aumento del volumen sanguíneo circulante. Se ha demostrado un efecto inotrópico positivo en pacientes con gasto cardíaco normal o ligeramente alterado.

El fármaco eleva la presión sistólica en mayor grado que la diastólica y se observó un ligero efecto cronotrópico. Por consiguiente, en caso de alteraciones cardiovasculares funcionales el fármaco puede dar lugar a una mejoría de los síntomas subjetivos (tales como mareo, sensación de fatiga y tendencia al desmayo), así como estabilizar los parámetros hemodinámicos.

### **5.2. Propiedades farmacocinéticas**

#### Absorción

Como resultado del efecto de primer paso hepático, la biodisponibilidad de la solución oral es de aproximadamente el 8%, mientras que la del comprimido es de aproximadamente el 12%.

#### Distribución

Aproximadamente el 23% del fármaco se fija a proteínas del plasma. Después de la administración oral de una dosis de 10 mg (comprimidos y solución oral), las concentraciones máximas en plasma (medianas) se alcanzan a los 20 minutos aproximadamente para los comprimidos (8 ng/ml) y después de unos 30 minutos para la solución oral (5 ng/ml). No se ha podido comprobar el paso del fármaco a través de la barrera hematoencefálica al administrarlo en forma radiomarcada a ratas. Se desconoce si la etilefrina atraviesa la barrera placentaria o aparece en la leche de la madre.

#### Metabolismo o Biotransformación

La etilefrina se metaboliza principalmente en el hígado. El principal metabolito en humanos es el conjugado de ácido sulfúrico. No se dispone de datos que demuestren si algunos de los metabolitos son activos.

## Eliminación

La semivida de eliminación terminal es de 2 horas aproximadamente. Después de la administración de etilefrina marcada con tritio, se recuperó el 75-80% de la radiactividad total en la orina.

## Datos de farmacocinética/ farmacodinamia(s)

Ya que la etilefrina y sus conjugados se excretan principalmente por la vía renal, es posible que los conjugados puedan acumularse en pacientes con fallo renal.

### **5.3. Datos preclínicos sobre seguridad**

Los datos de los estudios no clínicos no muestran riesgos especiales para los seres humanos según los estudios convencionales de genotoxicidad.

En estudios de toxicidad con dosis repetidas con etilefrina de hasta de 26 semanas de duración, se observaron los siguientes efectos a dosis orales de 1 a 8 veces más altas que la dosis oral clínica máxima:

- disminución de la frecuencia cardíaca y glucosa en sangre (rata)
- elevación de la tensión arterial y de la presión intraocular, midriasis y elevada actividad de TGP (ALT) (perros)
- alteraciones fibróticas en el miocardio y válvulas mitrales (rata y perro)
- aumento del peso cardíaco e hiperplasia de la media en arterias pequeñas (perro).

No se dispone de estudios de carcinogenicidad.

En ratones, ratas y conejos, dosis orales de hasta 15 mg/kg de etilefrina no tuvieron efectos embriofetales ni teratógenos. Con dosis tóxicas maternas (> 30 mg/kg p.o.) se observaron retrasos del desarrollo fetal en ratas y una mayor incidencia de malformaciones en ratones. Estos defectos congénitos se consideran consecuencia de la malnutrición fetal debida a una reducción en la irrigación sanguínea uterina a dosis tóxicas maternas.

En conejos, etilefrina fue bien tolerada tras la administración tópica y produjo irritación moderada tras la administración intramuscular.

## **6 . DATOS FARMACÉUTICOS**

### **6.1. Lista de excipientes**

Lactosa

Metabisulfito de sodio (E 223)

Almidón de maíz

Sílice coloidal anhidra

Boeson vp (aceite de palma hidrogenado y mono y diglicéridos de ácidos grasos de aceite de palma)

### **6.2. Incompatibilidades**

No procede.

### **6.3. Periodo de validez**

5 años

### **6.4. Precauciones especiales de conservación**

No requiere condiciones especiales de conservación.

### **6.5. Naturaleza y contenido del envase**

Envases de 20 comprimidos en blisters de PVC/aluminio.

### **6.6. Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones**

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con la normativa local.

## **7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN**

Sanofi - aventis, S.A.

C/ Josep Pla, 2

08019 - Barcelona

## **8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN**

21.030

## **9. FECHA DE LA PRIMERA AUTORIZACIÓN/ RENOVACIÓN DE LA AUTORIZACIÓN**

Fecha de la primera autorización: 27 de marzo de 1.954

Fecha de la renovación de la autorización: 31 de marzo de 2008

## **10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO**

Junio 2020