

Scheda riassuntiva delle Caratteristiche dell'Amiodarone

Conversione in formato pdf realizzata dal [Dott. Luigi Vicari](#)

E' un farmaco antiaritmico dotato di molteplici effetti elettrofisiologici: accanto ad un prevalente effetto di classe III possiede un effetto di blocco dei canali del sodio (classe I) e un'azione antiadrenergica (classe II). Inoltre parte degli effetti antiaritmici e della sua tossicità possono essere attribuiti alla sua interazione con i recettori dell'ormone tiroideo.

Caratteristiche farmacocinetiche

Tempo di assorbimento: 2-12 ore

Biodisponibilità: 30-50%

Legame proteico plasmatico: >90%

Metabolismo: in tutti i tessuti (soprattutto fegato) con formazione di disetil-amiodarone

Eliminazione: minima, per via biliare

Volume di distribuzione: molto ampio (> 500 litri)

Emivita: 14-129 giorni. Ne consegue che:

- 1) l'effetto terapeutico viene raggiunto in tempi lunghi (2-6 settimane), abbreviati dalla somministrazione di dosi carico (600-1200 mg);
- 2) dopo la sospensione del farmaco, i suoi effetti permangono a lungo;
- 3) sono possibili numerose interazioni con altri farmaci.

Interazioni farmacologiche

Fenitoina: riduzione delle concentrazioni plasmatiche dell'Amiodarone (32-49%).

Cimetidina: incremento della concentrazione plasmatica di Amiodarone.

Anticoagulanti dicumarolici (Warfarin): potenziamento dell'azione (rischio di emorragie).

Digossina: incremento della concentrazione plasmatica della Digossina, la cui dose dovrebbe essere dimezzata.

Farmaci che prolungano l'intervallo QT (Chinidina, Sotalolo, fenotiazine, antidepressivi triciclici, diuretici tiazidici): ulteriore prolungamento dell'intervallo QT (torsioni di punta).

Beta-Bloccanti, Diltiazem, Verapamil: potenziamento dell'effetto depressivo sul nodo del seno e nodo AV.

Indicazioni

La particolare farmacocinetica limita l'uso dell'Amiodarone per via endovenosa alle situazioni in cui non sia necessario ottenere il controllo dell'aritmia in tempi brevi. Infatti il suo effetto a livello del miocardio di lavoro e del sistema di His-Purkinje comincia a manifestarsi solo dopo alcune ore di infusione. La sua azione iniziale consiste in una semplice depressione della conduzione del nodo atrioventricolare.

Per via orale l'Amiodarone è un antiaritmico ad ampio spettro, efficace nel trattamento della maggior parte delle tachiaritmie sopraventricolari e ventricolari. A causa della sua scarsa tollerabilità cronica (nel trattamento a lungo termine il farmaco deve essere sospeso in circa il 40% dei casi) il suo impiego è comunemente riservato al trattamento delle aritmie refrattarie ad altri farmaci o associate a disfunzione ventricolare sinistra. Il farmaco infatti, a differenza degli altri antiaritmici, ha uno scarso effetto inotropo negativo.

In alcuni studi riguardanti pazienti con tachiaritmie ventricolari sopravvissuti ad infarto miocardico (BASIS, CAMIAT, EMIAT) l'Amiodarone ha ridotto la mortalità improvvisa ma non quella totale.

Dosaggio

Somministrazione endovenosa: 5 mg/Kg in 15 min, seguiti da infusione (15 mg/Kg/die).

Somministrazione orale: 600 mg/die per 10 - 15 giorni con graduale riduzione fino a 100 - 200 mg/die .

DOSE DI CARICO: da effettuarsi in ambiente ospedaliero: 1200 mg/die per 3 giorni con graduale riduzione nell'arco di 2 - 3 settimane fino a 200 mg/die o meno.

Effetti indesiderati

- a) per via endovenosa: bradicardia, ipotensione (rara), tromboflebiti (frequenti; usare solo vene centrali per infusioni protratte), epatite (rarissima)
- b) per somministrazione orale

Apparato cardiovascolare: l'Amiodarone può produrre un aggravamento delle tachiaritmie ventricolari (raro), e causare torsione di punta (rarissimo, nei primi giorni di terapia)

Sistema endocrino (tiroide): la molecola di Amiodarone contiene una elevata quantità di iodio e presenta analogie strutturali con la tiroxina, pertanto esercita influenze complesse sul metabolismo degli ormoni tiroidei. Durante la terapia cronica è quindi necessario controllare la funzione tiroidea ed il TSH ogni 3 - 4 mesi.

Il farmaco può provocare ipotiroidismo o ipertiroidismo che in genere rendono necessaria la sospensione del trattamento. Nel caso in cui il proseguimento della terapia venga giudicato indispensabile, l'Amiodarone può essere continuato associandolo a Tiroxina (ipotiroidismo) o a Metimazolo (ipertiroidismo).

Apparato respiratorio: l'Amiodarone può provocare polmonite interstiziale e successiva fibrosi polmonare anche mortale. Tale complicanza è descritta soprattutto nei paesi anglosassoni e sembra dose-correlata. Pertanto, soprattutto in pazienti in terapia molto protratta con dosaggi elevati, sono indicati periodici test di funzionalità polmonare (in particolare la diffusione del CO) e controlli radiologici del torace.

Apparato visivo: microdepositi corneali di lipofusina, che molto raramente causano disturbi visivi e non costituiscono di per sé motivo di interruzione della terapia.

Apparato cutaneo: fotosensibilità, colorazione bluastra della pelle.

Apparato gastro-enterico: epatite (rara).

Sistema nervoso: debolezza muscolare, neuropatia periferica.

Leopoldo Bianconi, Div. Cardiologia, Dipartimento Malattie del Cuore, Ospedale San Filippo Neri, Roma