

Inhibitors of calcium channel

Látky blokující kalciový kanál (blokátory kalciového kanálu) snižují tok kalcia přes membránu do buňky blokem L-typu vápníkového kanálu a způsobují tím **dlouhodobou dilataci hladkého svalu**. Nejcitlivější je sval cévní, především arteriální, jehož uvolnění vede ke snížení cévní rezistence. Dilatace nastává i u mimocévního hladkého svalstva bronchů, GIT a dělohy. V srdci jsou na kalcium závislé „**struktury pomalé odpovědi**“ (SA a AV uzel), ale také **kontraktilní mechanismy**. Blokádou kalciového kanálu **klesá vodivost** a **inotropie myokardu – klesá minutový srdeční výdej**. Dilatují koronární tepny a brání dalším projevům ischemie. Ovlivněním SA a AV uzlu potlačují supraventrikulární tachyarytmie. Dilatace v systémovém řečišti způsobuje pokles tlaku krve a může vést k reflexnímu zvýšení srdeční frekvence, zejména u krátkodobě působícího nifedipinu.

Terapeuticky se používají u anginy pectoris, hypertenze a arytmií.

Vzhledem k tomu, že se jedná o farmaka značně odlišná fyzikálními i chemickými vlastnostmi, liší se i jejich **afinita** k receptorům cílové struktury.

Rozdělení

1. **Blokátory Ca^{2+} kanálů I. generace = non-dihydropyridiny**: nifedipin (je z první generace, ale patří mezi dihydropyridiny, stejně jako nicardipin), verapamil, diltiazem.
2. **Blokátory Ca^{2+} kanálů II. generace = dihydropyridiny**: isradipin, felodipin, nitrendipin, nisoldipin. Jedná se o dihydropyridinové deriváty, které oproti nifedipinu vykazují vyšší vaskulární selektivitu (výraznější vazodilatace při nižším negativně chronotropním a dromotropním účinku) a výhodnější farmakokinetické vlastnosti – delší působení.
3. **Blokátory Ca^{2+} kanálů III. generace = dihydropyridiny**: amlodipin, lacidipin, barnidipin. Jsou vysoce selektivní k cévám a mají pomalý nástup účinku, nedochází k reflexní aktivaci sympatiků. Působí dlouhodobě a antioxidačně.

Zástupci

Nifedipin

Podle struktury se řadí mezi tzv. dihydropyridiny. Ovlivňuje především **hladký cévní sval**. Indikován je proto v terapii **hypertenze**. Je lékem volby v úvodu do terapie hypertenzní krize. Po per os podání se účinek objeví už za 10 minut, s maximem po 20–30 min. Podává se obvykle ve 3 denních dávkách. Kontraindikací podání nifedipinu je těhotenství (relaxační vliv na dělohu).

Verapamil a diltiazem

Působí především na receptory v myokardu. Prodlužují AV vedení vzruchu a zpomalují sinusový rytmus. Potlačují supraventrikulární tachykardii a odpověď komor na pokles TK. Oba se považují také za vhodné léky k prevenci srdeční ischemie, v akutní fázi infarktu myokardu se však neosvědčily, patrně také pro současný negativně inotropní efekt. Mohou se rovněž použít jako antihypertenziva. Verapamil může vyvolat ve vyšších dávkách blok AV vedení a kontraindikován u převodních poruch a současném podávání beta-blokátorů.

Amlodipin

U pacientů se srdečním selháním snižuje mortalitu, neovlivňuje plazmatické koncentrace glycidů a lipidů a podává se jednou denně.

Srovnání farmakodynamiky Ca blokátorů první generace ^[1]			
	NIFEDIPIN*	DILTIAZEM	VERAPAMIL
dilatace koronárních artérií	++	++	++
dilatace periferních artérií	++++	++	+++
negativně inotropní efekt	+	++	+++
zpomalení AV vedení	bez SZ	+++	++++
srdeční frekvence	vzestup, bez SZ	pokles, bez SZ	pokles, bez SZ
pokles krevního tlaku	++++	++	+++
deprese SA uzlu	bez SZ	++	++
vzestup srdečního výdeje	++	bez SZ	bez SZ

* nebo jiné dihydropyridiny, bez SZ = bez signifikantní změny

Odkazy

Související články

- Renin-angiotenzin-aldosteronový systém
- ACEI
- Blokátory receptorů pro angiotenzin II
- Hypertenze
- Hypertenzní krize

Externí odkazy

- Blokátory kalciového kanála a EKG (TECHmED) (<https://www.techmed.sk/blokatory-kalcioveho-kanala-intoxikacia/>)

Zdroj

-
-

Reference

- 1.

Template:Pahýl

Kategorie:Patofyziologie Kategorie:Kardiologie Kategorie:Farmakologie Kategorie:Vnitřní lékařství