

# Lerkanidipin

**Lerkanidipin**  je léčivo snižující krevní tlak neboli **antihypertenzivum**.

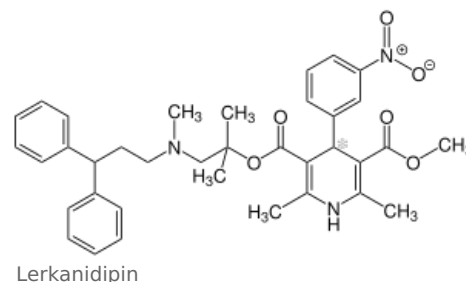
Řadíme ho do skupiny **blokátorů kalciového kanálu** 3. generace, konkrétně **dihydropyridinový** typ. Blokátory kalciového kanálů jsou léky první volby při terapii esenciální arteriální hypertenze. Působí selektivně na cévy vazodilatací, a tak pomáhá snižovat tlak krve (snížení periferní rezistence).

## Chemická struktura

Jedná se o 1,4-dihydropyridinový derivát. Je **vysoce lipofilní** a tato vlastnost umožňuje vytvořit v cytoplazmatické membráně depo, ze kterého je farmakum kontinuálně uvolňováno. **Levotočivý izomer** vykazuje lepší farmakologické vlastnosti (100-200x vyšší afinita k receptoru).

## Farmakodynamika

Působí antagonisticky na **L-typ napětově řízeného vápníkového kanálu** (pozn. L = long-term activation), zejména na **hladké svalové buňky** (na arterie periferní, ale i např. koronární). Ovlivňuje tak hlavně srdce, cévy a mozek. **Zabraňuje influxu kalcia** do leiomyocytů, a tak vazbě na kalmodulin (komplex kalmodulin-Ca) a jeho spřažené signalizaci přes MLCK (myosin-light-chain kinase). Oproti ostatním blokátorům kalcia prokazuje velmi nízký proarytmogenní vliv (zanedbatelná interakce s  $\text{Na}^+$  a  $\text{K}^+$  kanály).



Kromě antihypertenzního účinku vykazuje lerkanidipin i **protektivní účinky na endotel**, antianginózní účinky, neuroprotektivní a antioxidační vliv.

## Farmakokinetika

Maximální plazmatická koncentrace je po 2-3 h po podání léčiva. Majoritně se váže na plazmatické bílkoviny. Po absorpci je intenzivně biotransformován hlavně CYP 450 (izoforma **CYP 3A4**). Vylučován je **renálně a žlučí**, jeho eliminační poločas činí 8-10 h.

Vyrábí se ve dvou sílách **10 mg** a **20 mg**. V ČR se prodává pod obchodním jménem Kapidin® a Lerpin®.

## Nežádoucí účinky a kontraindikace

Lerkanidipin může vyvolávat perimaleolární edém (tj. kolem kotníků), reflexní tachykardii a hypotenzi. Tyto NÚ však často pozorovány nejsou. Neměl by být podáván u pacientů s obstrukcí výtoku levé komory, také pacientům s nestabilní anginou pectoris, nebo s těžkou renální nedostatečností.

## Související články

- Blokátory kalciového kanálu

## Použitá literatura

SOUČEK, Miroslav. *Lercanidipin*. - vydání. Maxdorf, 2012. 58 s. ISBN 9788073452926.

HEINZ, Lüllmann, Mohr KLAUS a Hein LUTZ. *Barevný atlas farmakologie : překlad 5. anglického vydání*. - vydání. Grada Publishing a.s., 2020. 400 s. ISBN 9788027122714.

JAN, Švihovec a Kolektiv KOLEKTIV. *Farmakologie*. - vydání. Grada Publishing a.s., 2018. 1008 s. ISBN 9788024755588.