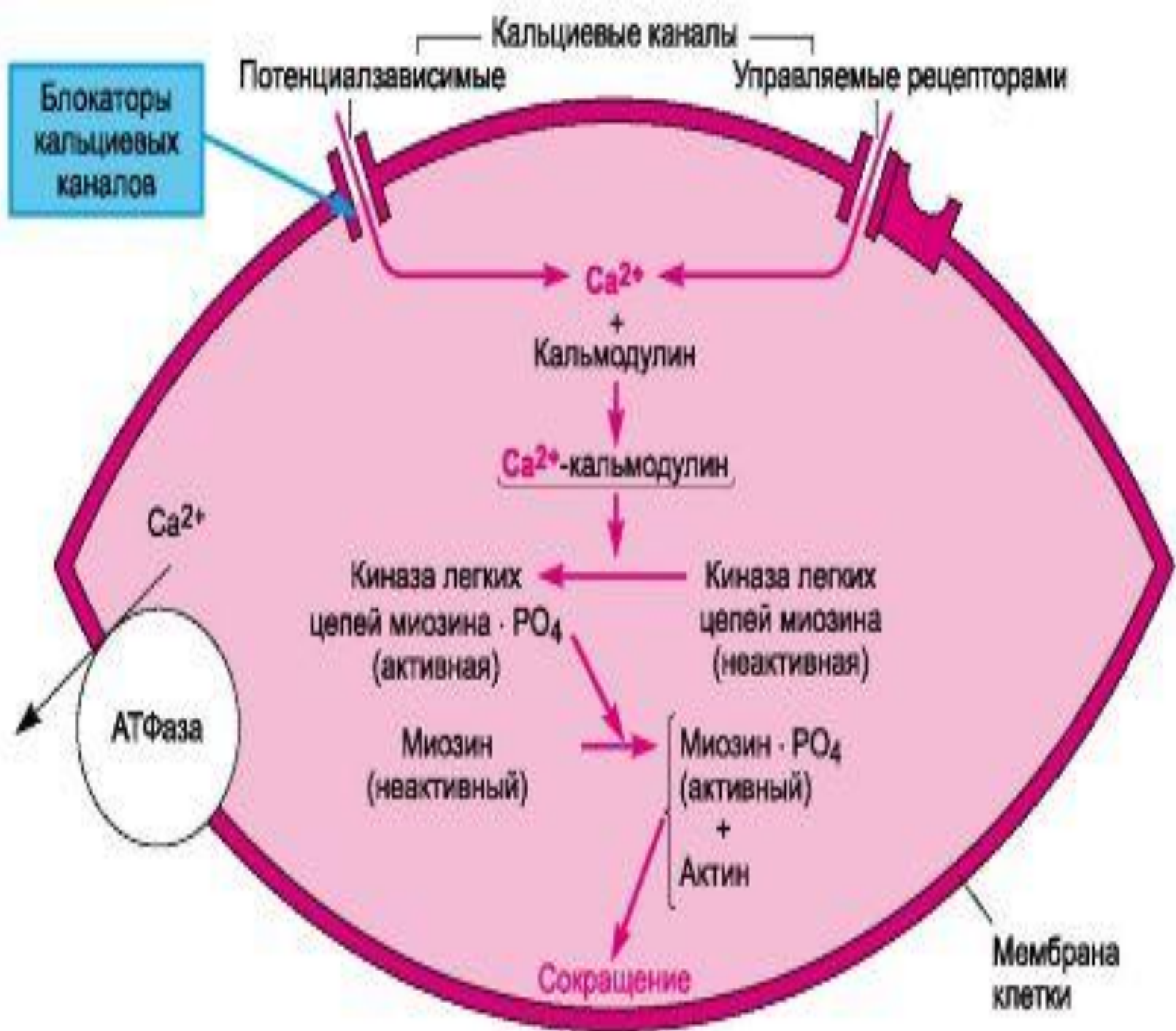


Кальций каналының блокаторы

Орындаған: Есіркесінова Н

- Кальций ионы жасушалық процесстерді қалпында ұстауда маңызды рөл атқарады.
- Кальций ионының маңызды рөлі – біріңғай салалы бұлшықетте, миокард жасушаларында импульстың қозуын ж/е жиырылуын қамтамасыз етеді.



Кальций каналы құрылысына ж/е электрофизиологиялық құрылысына б/ты:

- L – типті кальций каналы
- T – типті кальций каналы
- P – типті кальций каналы
- N – типті кальций каналы
- R - типті кальций каналы

L – типті кальций каналы

- Жиырылғыш кардиомиоциттерде , синус түйінінде, АВ түйінінде, біріңғай салалы бұлшық еттің **цитоплазматикалық мембранасының бетінде** орналасқан.
- Бұл каналдың электрофизиологиялық ерекшелігі – активтенудің жоғары табалдырығы ж/е баяу инактивация.

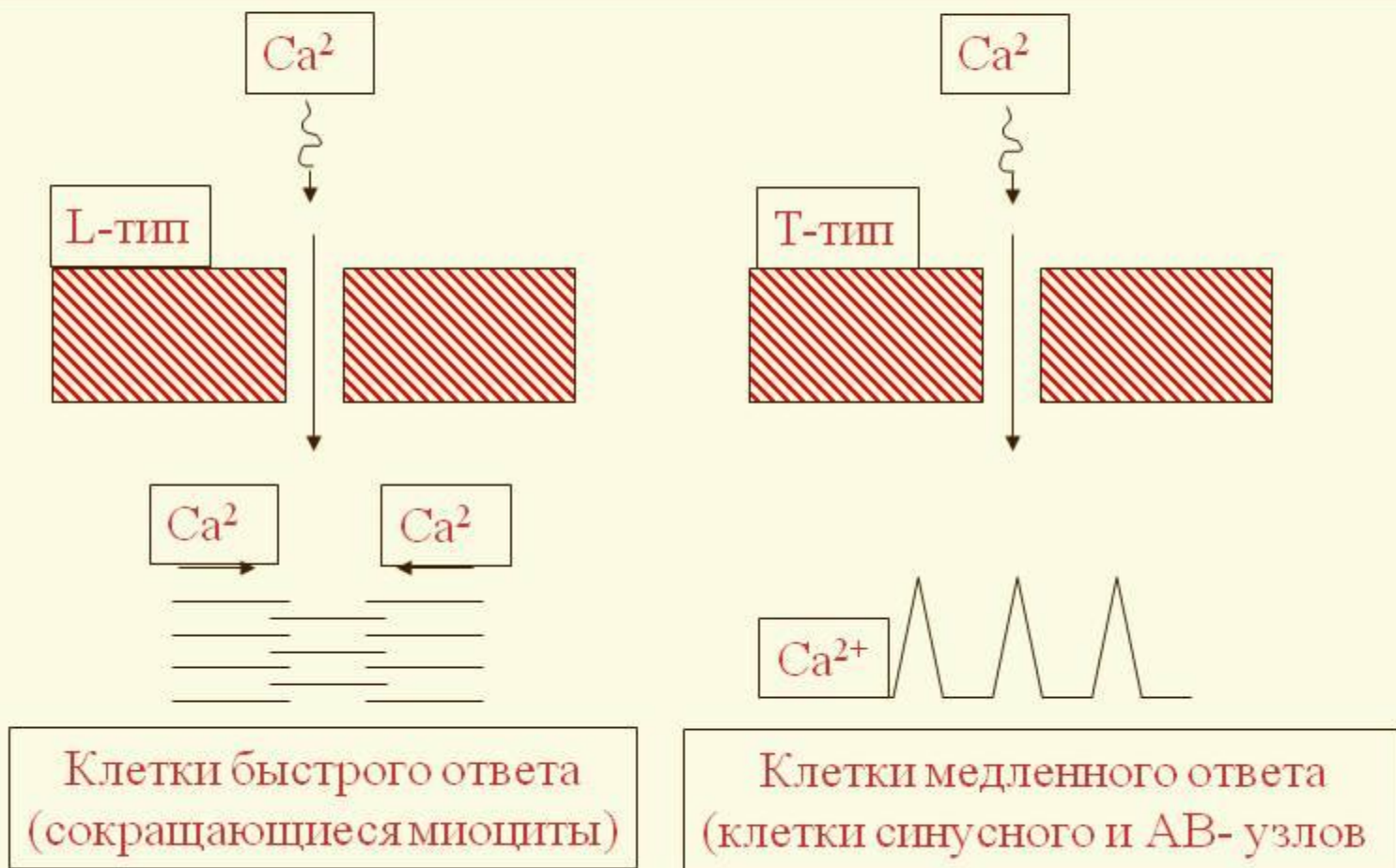
- L – типті кальций каналының миокардта, біріңғай салалы бұлшықетте негізгі қызметі – қозу ж/е жиырылудың арақатынасын сақтау
- Синустық түйінде – пейсмейкерлік белсенділік;
- АВ түйінде – АВ өткізгіштікті қамтамасыз ету.

T – типті кальций каналы

- Ол біріңғай салалы бұлшық етте, синустүйінінде, ұрықтың миокардында ж/е Пуркинье жасушаларында орналасады.
- Ересек адамдардың T-каналының тығыздығы төмен, сондықтан бұлшық еттің қозуы мен жиырылуына айтарлықтай маңызы жоқ.

- Электрофизиологиялық ерекшелігіне қарай – төмен табалдырықты деп аталады, себебі: мембраналық потенциал жағдайында, яғни тыныштық потенциалына жақын кезде активацияланады (60мВ) , ал инактивациясы тез жүреді.

L-ТИП Ca^{++} -КАНАЛОВ



Әсер ету механизмі ж/е фармакодинамикасы

- Кальций каналы блокаторы негізінде – цитоплазматикалық потенциалтәуелді L-типті кальций каналы арқылы, кальций ионының жасуша ішіне кіруін тежеу жатады.
- Цитоплазма астылық мембранада кальцийдің концентрациясы төмен болады, соған байланысты саркоплазматикалық ретикулумда кальций ионының босатылуы жүрмейді; цитоллизде тропонин С-тің кальций ионымен байланысы болмай, жиырылуы жүрмейді, нәтижесінде миокард жиырылуы бәсеңдейді.

Фармакокинетика

- Кальций каналының блокаторы – липофильді құрылымды, АІЖ оңай сіңіріледі. Абсорбциясы препараттың дәрілік формасына байланысты. мыс: нифедепин абсорбциясы таблетка түріне қарағанда, желатинді капсула түрінде жылдам сіңіріледі.
- ДП қан плазмасындағы максимальды концентрациясы маңызды, себебі терапиялық эффектісінің басталуын көрсетеді. Нифедепин 20-40мин., никардипин 60мин., амлодипин 6-12сағ.
- ДП ағзадан жартылай шығарылу уақыты қысқа. 4-6сағ., сол себептен оларды тәулігіне 3-4 рет тағайындайды.
- Кальций каналының блокаторлары бауыр арқылы біріншілік өтуіне байланысты, бауыр функциясының бұзылысы бар науқастарға абайлап қолдану керек. Бауыр арқылы айқын өтетін: верапамил, фелодипин, галлопамил. Айқын емес: нифедепин, амлодипин, нитрендипин.

Классификациясы:

- Фенилалкиламин туындылары н/е верапамил тобы
- Бензотиазепин туындылары н/е дилтиазем тобы
- Дигидропиридин н/е нифедипин
- Дифенилпиперазин н/е циннаризин тобы

Бұл топтар өзінің фармакокинетикалық ерекшеліктеріне қарай – I, II, III ұрпақтарға бөлінеді.

Группа БКК	Поколение препарата и представители класса (МНН)	
<i>Фенилалкиламины</i>	<i>I-поколение</i>	<i>II-поколение</i>
	Верапамил	Анипамил Галлопамил Тиопамил Фалипамил
<i>Бензотиазепины</i>	Дилтиазем	Клентиазем
<i>Дифенилперазины</i>	Циннаризин	Флунаризин

Группа БКК	Поколение препарата и представители класса (МНН)		
<i>Дигидропиридины</i>	<i>I-поколение</i>	<i>II-поколение</i>	<i>III-поколение</i>
	Никардипин Нифедипин	Амлодипин Исрадипин Нимодипин Нисолдипин Нитрендипин Рнодипин Фелодипин	Лацидипин Лерканидипин

Көрсеткіштер:

- Артериалды гипетензия
- Жүрек ритмінің бұзылыстары
 - суправентрикулярлы экстрасистолис
 - суправентрикулярлы тахикардия
 - жыпылықтаушы аритмия
- ЖИА
- Кіші қан айналым шеңберінің гипертензиясы

Жанама әсерлері:

- АҚ қатты төмендеп кетуі нәтижесінде:
 - бас ауруы
 - құлақтағы шуыл
 - естен тану
- Фенилалкиламин ж/е бензотиазепин тобының
 - тахикардия
 - қарыншаүстілік аритмия
 - симпатоадреналды жүйе активациясы нәтижесінде ренин-ангиотензин-альдестерон активациясының әсерінен: алақандарында пастозность
- Дигидропиридин тобының
 - брадикардия, асистолияға дейін
 - P-Q интервалының ұзаруы