

Blokátory receptorů pro angiotenzin II

Blokátory receptorů pro angiotenzin II patří společně s inhibitory angiotenzin konvertujícího enzymu (ACEI) mezi **inhibitory systému renin-angiotensin-aldosteron (RAAS)**. Blokátory AT₁ receptorů patří mezi antihypertenziva první volby, jsou indikována v terapii srdečního selhání. Jejich nechráněné názvy (INN) jsou zakončeny příponou "-sartan", z toho důvodu bývají označovány jako **sartany**.

Selektivní **blokádu AT₁ receptorů pro angiotenzin II** mnohem výrazněji potlačujeme účinky RAAS na organismus, protože tvorba angiotenzinu II ve tkáních není úplně závislá na vyplavování reninu. Efekt terapie je srovnatelný s ACEI. Nedochází ovšem k nežádoucím účinkům vyplývajícím z kumulace bradykininu ve tkáních (kašel, angioedém).

Mechanismus účinku

Sartany působí jako kompetitivní (příp. nekompetitivní) **antagonisté na AT₁ receptorech pro angiotenzin II**, jejich účinek je širší než ACEI, neboť inhibují účinky angiotenzinu II vzniklého i jinou cestou než přeměnou z angiotenzinu I prostřednictvím ACE. **Není přitom ovlivněna degradace bradykininu** a dalších působení, díky čemuž mají méně nežádoucích účinků. Na druhou stranu některé prameny uvádí, že jejich účinek tudíž není tak komplexní jako u ACEI.

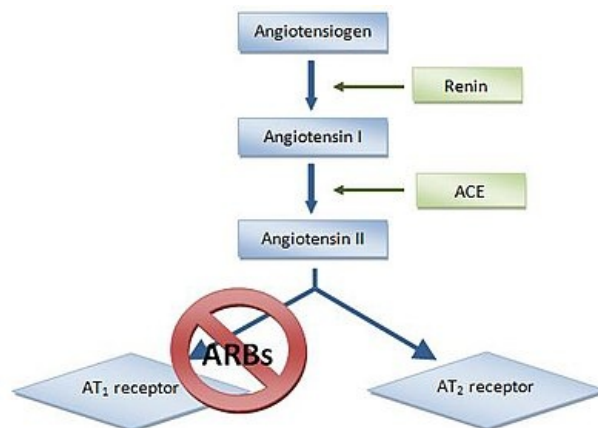


Schéma blokády AT₁ receptorů pro angiotenzin II (ARBs – Angiotensin II Receptor Blockers)

Účinky

Snižují celkovou periferní rezistenci – **snížují afterload i preload**; vedou k **poklesu** systolického i diastolického **krevního tlaku** a to bez vzniku reflexní tachykardie. Nástup účinku je pomalý a většinou nedochází ke vzniku hypotenze po 1. dávce. Mají obdobný efekt stran vazodilatace, ovlivnění renálních funkcí a utilizace glukózy jako ACEI.

Z větší části jsou eliminovány žlučí, mají nízké riziko farmakokinetických interakcí. Jejich poločas je průměrně 6 až 13 hodin (telmisartan 24 hodin). Jedná se o lipofilní molekuly, z čeho vyplývá vysoká biologická dostupnost.

Indikace

- **Arteriální hypertenze**
- **Chronické srdeční selhání**
- **Sekundární prevence** infarktu myokardu nebo cévní mozkové příhody
- Prevence a zpomalení progresu **nefropatií (včetně diabetické)**, hlavně telmisartan a valsartan

Blokátory receptorů pro angiotenzin II jsou považovány za alternativu při **nesnášenlivosti ACEI**. Používají se jak v monoterapii, tak v kombinacích s dalšími antihypertenzivy. Často jsou používány ve fixní kombinaci s hydrochlorothiazidem. Kombinace s ACEI je naopak nevhodná.

Nežádoucí účinky

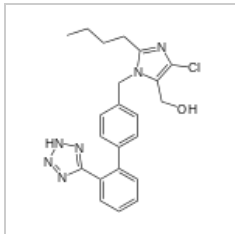
Léky ze skupiny blokátorů receptorů pro angiotenzin II mají nízký výskyt nežádoucích účinků. Může se vyskytnout hypotenze (při vysoké aktivitě reninu), akutní renální selhání, **hyperkalémie**. Stejně jako ACEI z důvodu mechanismu působení **mírně snižují glomerulární filtraci**, z dlouhodobého hlediska mají ovšem renoprotektivní efekt.

Kontraindikace

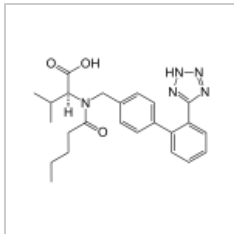
- Těhotenství (u žen ve fertilním věku nutné zajištění antikoncepcí), laktace.

Zástupci

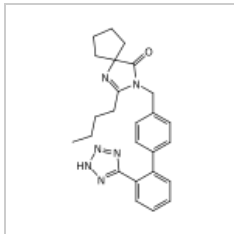
- **Losartan** – dobře se vstřebává z GITu, v játrech dochází k jeho přeměně na účinný metabolit
- **Valsartan** – vyšší afinita, lepší biologická dostupnost a delší účinek než losartan
- **Irbesartan**
- **Telmisartan** – nejdéle působící zástupce této skupiny antihypertenziv
- **Kandesartan**



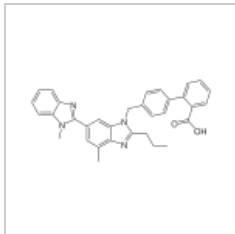
Chemický vzorec
losartanu



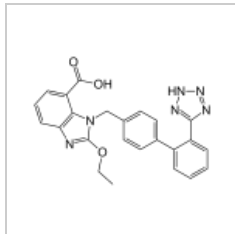
Chemický vzorec
valsartanu



Chemický vzorec
irbesartanu



Chemický vzorec
telmisartanu



Chemický vzorec
kandesartanu

Odkazy

Související články

- Renin-angiotenzin-aldosteronový systém
- ACEI
- Léčba ischemické choroby srdeční
- Hypertenze
- Hypertenzní krize

Zdroj

- MARTÍNKOVÁ, Jiřina, Stanislav MIČUDA a Jolana CERMANOVÁ. *Vybrané kapitoly z klinické farmakologie pro bakalářské studium : Kardiovaskulární systém* [online]. ©2000. [cit. 2010-07-01]. <<https://www.lfhk.cuni.cz/farmakol/predn/bak/kapitoly/prednasky/kardio-bak.ppt/>>.
- <https://farm.lf1.cuni.cz/zaloha>
- LINCOVÁ, Dagmar a Hassan FARGHALI, et al. *Základní a aplikovaná farmakologie*. 2. vydání. Praha : Galén, 2007. 672 s. ISBN 978-80-7262-373-0.
- TILŠER, Ivan. *Léčba srdečního selhání* [přednáška k předmětu Farmakologie, obor Farmacie, Farmaceutická fakulta v HK Univerzita Karlova v Praze]. Hradec Králové. 2011.
- TILŠER, Ivan. *Antihypertenziva* [přednáška k předmětu Farmakologie, obor Farmacie, Farmaceutická fakulta v HK Univerzita Karlova v Praze]. Hradec Králové. 2011.