

OBSAH

	Předmluva	3
1.	Úvod	13
2.	Historie léčiv	17
3.	Základní pojmy z farmakologie	23
3.1	Farmakokinetika	23
3.1.1	Mechanismy transportu léčiv v organismu	23
3.1.2	Osud léčiva v organismu	25
3.2	Farmakodynamika	28
3.2.1	Specifické mechanismy účinku léčiv	28
3.2.2	Nespecifické mechanismy účinku léčiv	29
4.	Vývoj nových léčiv	33
4.1	Metody vyhledávání biologicky aktivních látek	33
4.1.1	Metoda strukturních variací	33
4.1.2	Využití kvantitativních vztahů mezi strukturou a biologickou aktivitou (QSAR)	38
4.1.3	Orientační metody v hledání nových biologicky aktivních látek	41
4.1.4	Molekulové modelování a 3D QSAR	44
4.1.5	Kombinatoriální chemie a chemické knihovny	45
4.1.6	Izolace látek z přírodních zdrojů	48
4.2	Testování a hodnocení nových léčiv	49
4.2.1	Farmakologický screening	49
4.2.2	Preklinické testy bezpečnosti a nežádoucích účinků	50
4.2.3	Klinické zkoušení	51
5.	Výroba léčiv	55
5.1	Registrace léčiv	55
5.1.1	Úvod, typy registračních procedur a legislativní podklady	56
5.1.2	Obsah a členění registrační dokumentace	57
5.1.3	Požadavky na informace o účinné látce	61
5.1.3.1	Nové účinné látky	61
5.1.3.2	Drug Master File	64
5.1.3.3	Účinné látky již existující, avšak nepopsané v Evropském lékopisu ani v lékopisech členských států Evropské unie	66
5.1.3.4	Účinné látky popsané v lékopisu	66
5.2	Správná výrobní praxe	68
5.2.1	Úvod, legislativní podklady	68
5.2.2	Předpoklady správné výrobní praxe	69
5.2.2.1	Řízení jakosti	69
5.2.2.2	Pracovníci	70
5.2.2.3	Prostory a jejich zařízení	71
5.2.2.4	Dokumentace	72
5.2.2.5	Výroba	73

5.2.2.6	Kontrola jakosti	74
5.2.2.7	Smluvní výroba a kontrola	75
5.2.2.8	Reklamace a stahování výrobku	75
5.2.2.9	Vnitropodniková inspekce	76
6.	Analgetika	79
6.1	Nenarkotická analgetika	80
6.1.1	Deriváty anilinu	80
6.1.2	Deriváty kyseliny salicylové	81
6.1.3	Deriváty kyseliny anthranilové	83
6.1.4	Arylalkanové kyseliny	84
6.1.5	Deriváty pyrazolonu a pyrazolidindionu	87
6.1.6	Arylsulfonamidy (oxikamy)	89
6.1.7	Inhibitory COX-2	90
6.2	Narkotická analgetika	92
7.	Léčiva ovlivňující centrální nervový systém	101
7.1	Princip vzniku a vedení nervového signálu	101
7.2	Celková anestetika	105
7.2.1	Inhalační anestetika	105
7.2.2	Intravenózní anestetika	107
7.3	Sedativa a hypnotika	111
7.3.1	Karbamáty	112
7.3.2	Alifatické acylmočoviny (alifatické ureidy)	113
7.3.3	Deriváty barbiturové kyseliny a dioxopiperidiny	113
7.3.4	Benzodiazepiny	117
7.3.5	Hypnotika 3. generace	120
7.4	Psychofarmaka	123
7.4.1	Neuroleptika	124
7.4.2	Antidepresiva	130
7.4.2.1	Thymoleptika	130
7.4.2.2	Thymoeretika	138
7.4.3	Anxiolytika	140
7.4.4	Psychostimulancia	141
7.4.5	Nootropika a léčiva Alzheimerovy choroby	143
7.4.6	Psychodysleptika	150
7.5	Antiepileptika	151
7.6	Antiparkinsonika	153
7.7	Antimigrenika	158
8.	Léčiva ovlivňující vegetativní nervový systém	165
8.1	Adrenergika	167
8.1.1	α -Adrenergika	168
8.1.2	α_2 -Adrenergika	172
8.1.3	β_1 -Adrenergika	173
8.1.4	β_2 -Adrenergika	174
8.1.5	Nepřímá adrenergika	178

8.2	Antiadrenergika	178
8.2.1	α -Antiadrenergika	178
8.2.2	β -Antiadrenergika	181
8.3	Cholinergika	183
8.3.1	Přímá cholinergika	184
8.3.2	Nepřímá cholinergika - inhibitory acetylcholinesterasy	185
8.3.3	Ireverzibilní inhibitory acetylcholinesterasy	188
8.4	Anticholinergika	190
8.4.1	Neurotropní a neurotropně-myotropní spasmolytika	190
8.4.2	Myotropní spasmolytika	195
9.	Lokální anestetika a myorelaxancia	199
9.1	Lokální anestetika	199
9.2	Myorelaxancia	203
9.2.1	Periferní myorelaxancia - kurarimimetika	203
9.2.2	Centrální myorelaxancia	205
10.	Antialergika a antihistaminika	211
10.1	Alergická reakce	211
10.2	Antialergika	214
10.2.1	Hypohistaminika	214
10.2.2	H ₁ Antihistaminika	215
10.3	H ₂ Antihistaminika	224
11.	Léčiva oběhové soustavy	229
11.1	Antihyperlipidemika	229
11.1.1	Pryskyřice vázící žlučové kyseliny	230
11.1.2	Léčiva ovlivňující syntézu lipoproteinů	231
11.1.3	Deriváty α -aryloxyalkanových kyselin - fibráty	232
11.1.4	Inhibitory HMG-CoA reduktasy - statiny	234
11.1.5	Ostatní antihyperlipidemika	236
11.2	Léčiva ovlivňující srážlivost krve	236
11.2.1	Antitrombotika	236
11.2.2	Hemostatika	239
11.3	Vasodilatancia	240
11.3.1	Estery kyseliny dusité a dusičné	240
11.3.2	Antagonisté iontů vápníku	243
11.3.3	Periferní vasodilatancia	246
11.3.4	Léčiva erektilních poruch	247
11.4	Antihypertenziva	249
11.4.1	Látky blokující sympatikus	249
11.4.2	Přímá antihypertenziva	250
11.4.3	Inhibitory angiotensin konvertujícího enzymu (ACE) a antagonisté angiotensinu II	251
11.5	Léčiva ovlivňující činnost srdečního svalu	253
11.5.1	Kardiotonika	253
11.5.2	Antidysrytmika	254

12.	Léčiva trávicí a vylučovací soustavy	259
12.1	Antacida, antiulceróza a cytoprotektiva	259
12.1.1	Antacida	260
12.1.2	Antiulceróza	260
12.1.3	Cytoprotektiva	262
12.2	Léčiva používaná k terapii jaterních poruch	263
12.2.1	Cholagoga	264
12.2.2	Hepatoprotektiva	265
12.3	Perorální antidiabetika	268
12.3.1	Deriváty sulfonylmočoviny	268
12.3.2	Deriváty biguanidu	269
12.3.3	Thiazolidindiony	270
12.4	Léčiva ovlivňující vylučování	271
12.4.1	Diuretika a saluretika	271
12.4.1.1	Deriváty thiazidiazolu	272
12.4.1.2	<i>o</i> -Chlorbenzensulfonamidy	273
12.4.1.3	Deriváty benzothiadiazinu	275
12.4.1.4	Ostatní diuretika	275
12.4.2	Laxativa	277
12.4.2.1	Prostředky změkčující (lubrikancia, lubrikanty)	277
12.4.2.2	Objemová činidla	277
12.4.2.3	Laxativa dráždicí střevní stěnu	278
12.4.3	Antidiaroeika	279
13.	Antitusika a expektorancia	283
13.1	Antitusika	283
13.1.1	Antitusika opioidního typu	283
13.1.2	Antitusika neopoidního typu	284
13.2	Expektorancia	286
14.	Látky používané k prevenci a terapii infekčních a parazitárních chorob	293
14.1	Dezinfekční látky a antiseptika	294
14.1.1	Oxidační činidla	294
14.1.2	Halogeny a látky uvolňující „aktivní halogeny“	295
14.1.3	Sloučeniny kovů	296
14.1.4	Alkoholy, fenoly, aldehydy a kyseliny	297
14.1.5	Povrchově aktivní látky	302
14.1.6	Trifenylmethanová barviva	303
14.2	Antibakteriální chemoterapeutika	304
14.2.1	Sulfonamidy	304
14.2.2	Deriváty chinolonů	309
14.3	Antimykotika (antifungální látky)	312
14.3.1	Karboxylové kyseliny a jejich deriváty	312
14.3.2	Deriváty imidazolu	313
14.3.3	Ostatní antimykotika	315

14.4	Antimykobakteriální léčiva	316
14.5	Antiprotozoární léčiva	319
14.5.1	Antimalarika	320
14.5.2	Ostatní antiprotozoika	322
14.6	Antibiotika	323
14.6.1	β -Laktamová antibiotika	324
14.6.2	Tetracykliny a anthracykliny	326
14.6.3	Aminoglykosidy	327
14.6.4	Makrolidy	328
14.6.5	Peptidová antibiotika	328
14.6.6	Ostatní antibiotika	330
14.7	Antivirotika	331
15.	Cytostatika	343
15.1	Alkylační činidla	344
15.2	Antimetaboly	352
15.3	Ostatní protinádorová léčiva	354
16.	Vitaminy	359
16.1	Vitaminy rozpustné v tucích	359
16.1.1	Vitaminy skupiny A	359
16.1.2	Vitaminy skupiny D	361
16.1.3	Vitaminy skupiny E (tokoferoly)	362
16.1.4	Vitaminy skupiny K	363
16.2	Vitaminy rozpustné ve vodě	365
16.2.1	Vitaminy skupiny B	365
16.2.1.1	Vitamin B ₁ – thiamin	365
16.2.1.2	Vitamin B ₂ – riboflavin	366
16.2.1.3	Vitamin B ₃ – nikotinamid	367
16.2.1.4	Vitamin B ₅ – kyselina pantothenová	368
16.2.1.5	Vitamin B ₆ – pyridoxin	368
16.2.1.6	Vitamin B ₁₂ - kobalamin	369
16.2.2	Kyselina listová - vitamin M	370
16.2.3	Vitamin C - kyselina askorbová	371
16.2.4	Vitamin H - biotin	372
16.2.5	Ostatní sloučeniny s účinky vitaminů	373
17.	Hormony	377
17.1	Hormony – aminokyseliny	379
17.2	Peptidové hormony	381
17.2.1	Hormony hypothalamu a hypofýzy	381
17.2.2	Hormony slinivky břišní	383
17.3	Steroidní hormony	384
17.3.1	Estrogeny	385
17.3.2	Inhibitory estrogenů	387
17.3.3	Gestageny	389
17.3.4	Androgeny a anabolika	389

17.3.5	Hormony kůry nadledvin (adrenokortikosteroidy)	390
18.	Informační zdroje ve farmakochemii	395
	Literatura	397
	Rejstřík	401