

# Obsah

Seznam zkratek ..... XIII

## Obecná farmakologie

1

Dějiny farmakologie .....	2	Prostup membránami .....	26
Dějiny farmakologie .....	2	Transportéry léčiv .....	28
Myšlenka .....	2	Možné způsoby distribuce léčiva .....	30
Podnět .....	2	Vazba léčiv na plazmatické proteiny .....	32
O začátcích .....	3	<b>Eliminace léčiv</b> .....	34
Osamostatnění oboru .....	3	Játra jako eliminační orgán .....	34
Konsolidace – všeobecné uznání .....	3	Biotransformace léčiv .....	36
Status quo .....	3	Metabolismus léčiv působením enzymového systému cytochromu P450 .....	38
<b>Původ léčiv</b> .....	4	Enterohepatální cirkulace .....	40
Droga a účinná látka .....	4	Konjugační reakce .....	40
Cíle izolace účinných látek .....	4	Ledviny jako eliminační orgán .....	42
Rostliny jako zdroj účinných léků .....	6	Presystémová eliminace .....	44
<b>Vývoj léčiv</b> .....	8	<b>Farmakokinetika</b> .....	46
Vývoj léků .....	8	Koncentrace léčiva v organismu v závislosti na čase – exponenciální funkce .....	46
Analogické látky a nadměrné množství názvů .....	10	Časový průběh koncentrace léčiva v plazmě .....	48
<b>Aplikace léčiv</b> .....	12	Průběh koncentrací látky při pravidelném opakovaném podávání .....	50
Perorální aplikační formy .....	12	Časový průběh koncentrace léčiva při nepravidelném podávání .....	50
Inhalační aplikace léčiva .....	14	Kumulace: Dávka, interval mezi dávkami a cílené dosažení požadované hladiny .....	52
Dermatologika .....	16	Změny charakteru eliminace v průběhu podávání léčiva .....	52
Dermatologika pro ochranu kůže .....	16	<b>Kvantitativní zákonitosti účinků léčiv</b> .....	54
Dermatologika jako vehikula .....	16	Vztah mezi dávkou a účinkem .....	54
Od podání léčiva k jeho distribuci v organismu .....	18	Vztah mezi koncentrací a účinkem .....	56
<b>Cílová místa účinku v buňce</b> .....	20	Křivky vztahu mezi koncentrací a účinkem .....	56
Možná cílová místa působení farmak ...	20		
<b>Distribuce v organismu</b> .....	22		
Vnější bariéry organismu .....	22		
Bariéry mezi krví a tkáněmi .....	24		

<b>Interakce léčiva s receptorem</b> .....	58	<b>Nežádoucí účinky léčiv</b> .....	72
Křivky vztahu mezi koncentrací a vazbou .....	58	Nežádoucí účinky léčiv, vedlejší účinky .	72
Typy vazeb .....	60	Příčiny nechtěných a nežádoucích účinků .....	72
Kovalentní vazba .....	60	Alergie na léčiva .....	74
Nekovalentní vazba .....	60	Kožní reakce .....	76
Agonisté a antagonisté .....	62	Poškození plodu, resp. novorozence léčivem v průběhu těhotenství a kojení .	78
Modely molekulárních mechanismů působení agonistů a antagonistů .....	62	<b>Farmakogenetika</b> .....	80
Jiné formy antagonismu .....	62	Farmakogenetika .....	80
Enantioselektivita účinku léčiv .....	64	<b>Účinky nezávislé na léčivu</b> .....	82
Typy receptorů .....	66	Placebo .....	82
Mechanismus působení receptorů spřažených s G-proteinem .....	68		
Časový průběh plazmatických koncentrací a účinek léčiva .....	70		

## **Speciální farmakologie**

85

<b>Léčiva ovlivňující sympatikus</b> .....	86	Inhibice žlázné sekrece .....	108
Sympatický nervový systém .....	86	Relaxace hladkých svalů .....	108
Struktura sympatického nervového systému .....	88	Zrychlení srdeční činnosti .....	110
Adrenergní synapse .....	88	Útlum některých oblastí centrálního nervstva .....	110
Subtypy adrenergních receptorů a účinky katecholaminů .....	90	<b>Biogenní aminy</b> .....	112
Účinky na hladké svalstvo .....	90	Dopamin .....	112
Ovlivnění srdce .....	90	Histamin .....	114
Metabolické účinky .....	92	Serotonin .....	116
Desenzibilizace receptorů .....	92	Látky zvyšující účinky serotoninu ..	116
Vztahy mezi strukturou a účinkem sympatomimetik .....	94	Inhibitory účinku serotoninu .....	116
Nepřímá sympatomimetika .....	96	Substance P .....	118
$\alpha$ -sympatomimetika a $\alpha$ -sympatolytika .	98	Aminokyseliny .....	118
$\alpha$ -sympatomimetika .....	98	<b>Vazodilatancia</b> .....	120
$\alpha$ -sympatolytika .....	98	Vazodilatancia – přehled .....	120
$\beta$ -sympatolytika .....	100	Organické nitráty .....	122
<b>Léčiva ovlivňující parasimpatikus</b> ...	102	Antagonisté kalcia (blokátory kalciových kanálů) .....	124
Parasympatický nervový systém .....	102	Deriváty dihydropyridinu .....	124
Cholinergní synapse .....	104	Verapamil a jiní kationtický amfilní antagonisté vápníku .....	124
Parasympatomimetika .....	106		
Parasympatolytika .....	108		

<b>Inhibitory systému renin-angiotenzin-aldosteron</b> .....	126	<b>Antihiperlipidemika</b> .....	154
Inhibitory systému renin-angiotenzin-aldosteron .....	126	Léčiva snižující koncentraci lipidů v plazmě .....	154
<b>Léčiva působící na hladké svaly</b> .....	128	<b>Diuretika</b> .....	158
Léčiva ovlivňující hladkou svalovinu orgánů .....	128	Diuretika – přehled .....	158
<b>Léčiva ovlivňující srdce</b> .....	130	Zpětná resorpce NaCl v ledvinách .....	160
Léčiva ovlivňující srdce .....	130	Akvaporiny (AQP) .....	160
Srdeční glykozidy .....	132	Osmotická diuretika .....	160
Antiarytmika .....	134	Sulfonamidová diuretika .....	162
Léčiva ovlivňující cíleně sinoatriální a atrioventrikulární uzel .....	134	Diuretika šetřící kalium .....	164
Nespecifické ovlivnění tvorby a vedení vzruchu .....	134	Vazopresin (adiuretin, ADH) a jeho deriváty .....	164
Elektrofysiologické účinky antiarytmik typu blokátorů Na <sup>+</sup> -kanálu .....	136	<b>Poruchy hospodaření vodou a elektrolyty</b> .....	166
<b>Antianemika</b> .....	138	Poruchy hospodaření vodou a elektrolyty .....	166
Léčiva používaná k léčení anémií .....	138	Poruchy homeostázy Na <sup>+</sup> .....	166
Erytropoéza .....	138	Poruchy homeostázy K <sup>+</sup> .....	166
Vitamin B <sub>12</sub> .....	138	<b>Gastrointestinální trakt</b> .....	168
Kyselina listová .....	138	Terapie žaludečních a dvanáctníkových vředů .....	168
Anémie z nedostatku železa .....	140	Terapie hyperacidity .....	168
<b>Antitrombotika</b> .....	142	Projimadla (laxancia) .....	168
Profylaxe a terapie trombóz .....	142	Obstipancia .....	172
Vitamin K a jeho antagonisté .....	144	<b>Léčiva ovlivňující motorický systém</b> ..	174
Perorální antikoagulancia .....	144	Léčiva ovlivňující motorické funkce ..	174
Možnosti interakcí s hydroxykumariny .....	144	Centrální myorelaxancia a toxiny ..	174
Nová perorální antikoagulancia .....	144	Periferní myorelaxancia .....	176
Heparin .....	146	Depolarizující myorelaxancia .....	176
Hirudin a jeho deriváty .....	146	Nedepolarizující myorelaxancia .....	178
Fibrinolytika .....	148	Ovlivnění kontraktálního systému ..	178
Inhibitory agregace trombocytů .....	150	<b>Léčiva potlačující bolest</b> .....	180
Presystémové účinky kyseliny acetylsalicylové (ASA) .....	150	Vznik a dráha pocitu bolesti .....	180
<b>Náhražky plazmy</b> .....	152	Eikosanoidy .....	182
Náhražky plazmy .....	152	Analgetika-antipyretika a nesteroidní antiflogistika (NSA) .....	184
		Analgetika-antipyretika .....	184



Nesteroidní antiflogistika (NSA) . . . . .	184
Inhibitory cyklooxygenázy (COX) . . . . .	186
Lokální anestetika . . . . .	188
Opioidy = opiáty . . . . .	194
Speciální opioidy . . . . .	198
<b>Léčiva působící na CNS</b> . . . . .	200
Celková anestezie a celková anestetika . . . . .	200
Inhalační celková anestetika . . . . .	202
Injekční celková anestetika . . . . .	204
Benzodiazepiny . . . . .	206
Antagonista benzodiazepinů . . . . .	206
Farmakokinetika benzodiazepinů . . . . .	208
Farmakoterapie depresí . . . . .	210
Mánie . . . . .	214
Farmakoterapie manických stavů . . . . .	214
Farmakoterapie schizofrenie . . . . .	216
Neuroleptika . . . . .	216
<b>Hormony</b> . . . . .	220
Hormony hypotalamu a hypofýzy . . . . .	220
Terapie podáváním hormonů štítné žlázy . . . . .	222
Hypertyreóza a tyreostatika (antityreoidální látky) . . . . .	224
Terapie glukokortikoidy . . . . .	226
Substituční terapie . . . . .	226
Farmakodynamická terapie glukokortikoidy . . . . .	226
Androgeny, anabolika, antiandrogeny . . . . .	230
Inhibitory . . . . .	230
Zrání vajíčka a ovulace, tvorba estrogenů a gestagenů . . . . .	232
Přípravky s estrogeny . . . . .	232
Přípravky s gestageny . . . . .	232
Perorální kontraceptiva . . . . .	234
Antiestrogeny a antigestageny . . . . .	236
Inhibitory aromatázy . . . . .	238
Diabetes mellitus . . . . .	240
Inzulinové přípravky . . . . .	240
Různé aplikační formy . . . . .	240
Různé sekvence aminokyselin . . . . .	240
Dlouhodobě účinné inzulinové analogy . . . . .	240
Léčení inzulindependentního diabetes mellitus (diabetu typu I) . . . . .	242
Nežádoucí účinky inzulinu . . . . .	242
Terapie diabetu typu II . . . . .	244
Perorální anti-diabetika . . . . .	246
Léčiva zabezpečující homeostázu kalcia . . . . .	248
<b>Antibakteriální látky</b> . . . . .	250
Farmaka proti bakteriálním infekcím . . . . .	250
Inhibitory syntézy buněčné stěny . . . . .	252
Látky vytvářející póry v membráně . . . . .	256
Inhibitory syntézy kyseliny tetrahydrolistové . . . . .	256
Inhibitory funkce DNA . . . . .	258
Inhibitory proteosyntézy . . . . .	260
Látky proti infekcím vyvolaným mykobakteriemi . . . . .	264
Antituberkulózní látky . . . . .	264
Léčiva proti lepre . . . . .	264
<b>Antimykotika</b> . . . . .	266
Léčiva používaná při mykózách . . . . .	266
<b>Virostatika</b> . . . . .	268
Farmakoterapie virových infekcí . . . . .	268
Léčiva používaná při léčbě infekce HIV . . . . .	272
Inhibitory reverzní transkriptázy – nukleosidové inhibitory . . . . .	272
Nenukleosidové inhibitory . . . . .	272
Inhibitory HIV-proteázy . . . . .	272
Rezervní léčiva . . . . .	272
<b>Antiparazitární látky</b> . . . . .	274
Látky používané proti endoparazitům a ektoparazitům . . . . .	274
Antimalarika . . . . .	276
Terapie dalších tropických chorob . . . . .	278

<b>Léčiva používaná proti maligním tumorům</b> .....	280	<b>Antidota</b> .....	294
Léčiva používaná proti maligním tumorům .....	280	Antidota k léčení otrav .....	294
Interference se signálními mechanismy buněčné proliferace .....	284	<b>Omamné a zneužívané látky</b> .....	298
Speciální antineoplastické látky .....	286	Psychotomimetika, omamné jedy (psychedelika, halucinogeny) .....	298
Mechanismy rezistence na cytostatika .....	286	Účinky nikotinu .....	300
<b>Imunomodulátory</b> .....	288	Lokalizace nikotinových receptorů .....	300
Inhibice imunitních reakcí .....	288	Účinky nikotinu .....	300
Inhibitory kalcineurinu, sirolimus .....	290	Prostředky pro odvyknutí kouření .....	300
Inhibitory migrace leukocytů .....	292	Následky kouření tabáku .....	302
		Alkoholismus .....	304

## **Terapie vybraných onemocnění** **307**

<b>Terapie vybraných onemocnění</b> .....	308	Emeze a antiemetika .....	328
Hypertenze .....	308	Poruchy spánku a hypnotika .....	330
Angina pectoris .....	310	Lokální farmakoterapie glaukomu .....	332
Angina pectoris, antianginóza .....	312	Osteoporóza .....	334
Akutní koronární syndrom – infarkt myokardu .....	314	Dna a její léčba .....	336
Chronická srdeční insuficience .....	316	Obezita – následky a přístup k léčbě ..	338
Septický šok .....	318	Atopie a antialergické léčení .....	340
Antiparkinsonika .....	320	Bronchiální astma .....	342
Antiepileptika .....	322	Revmatická artritida .....	344
Migréna a její léčba .....	326	Chronická zánětlivá střevní onemocnění .....	346

## **Literatura pro další studium** **349**

## **Rejstřík** **351**



# Obecná farmakologie

Dějiny farmakologie	2
Původ léčiv	4
Vývoj léčiv	8
Aplikace léčiv	12
Cílová místa účinku v buňce	20
Distribuce v organismu	22
Eliminace léčiv	34
Farmakokinetika	46
Kvantitativní zákonitosti účinků léčiv	54
Interakce léčiva s receptorem	58
Nežádoucí účinky léčiv	72
Farmakogenetika	80
Účinky nezávislé na léčivu	82