

OBSAH

1. MYORELAXANCIA	9
1.1 Myorelaxancia – úvod	10
1.2 Nervosvalová (motorická) ploténka	10
1.3 Periferně působící myorelaxancia	11
1.3.1 Postsynapticky působící periferní myorelaxancia	11
1.3.1.1 Nedepolarizující, kompetitivní (pachykurarová) periferní myorelaxancia	11
1.3.1.2 Depolarizující (leptokurarová) periferní myorelaxancia	15
1.3.1.3 Klinické využití postsynapticky působících periferních myorelaxancií	16
1.3.2 Presynapticky působící periferní myorelaxancia	16
1.3.2.1 Látky inhibující syntézu acetylcholinu	16
1.3.2.2 Látky inhibující uvolňování acetylcholinu	17
1.4 Centrálně působící myorelaxancia	18
1.4.1 Spastická	18
1.4.2 Centrální myorelaxancia	18
1.5 Dantrolen – periferně působící myorelaxans	19
2. LOKÁLNÍ ANESTETIKA	21
2.1 Definice	21
2.2 Molekulární stavba lokálních anestetik	21
2.2.1 Aminoamidy, amidová lokální anestetika	22
2.2.2 Aminoestery, esterová lokální anestetika	23
2.3 Fyzikálně chemické vlastnosti lokálních anestetik	23
2.4 Mechanismus účinku lokálních anestetik	23
2.5 Farmakokinetika	25
2.5.1 Absorpce	25
2.5.2 Možnosti ovlivnění farmakokinetických vlastností lokálních anestetik	25
2.5.3 Distribuce a eliminace	25
2.6 Účinky lokálních anestetik	26
2.7 Klinické použití lokálních anestetik	27
2.8 Typy blokad	28
2.8.1 Topická (povrchová) anestézie	28
2.8.2 Lokální infiltrace	28
2.8.3 Periferní nervové blokády	28
2.8.4 Intravenózní regionální anestézie (Bierův blok)	28
2.8.5 Epidurální anestézie	29
2.8.6 Spinální anestézie	29
2.8.7 Analgézie, další využívané účinky	29

3. PŘEHLED LÁTEK OVLIVŇUJÍCÍCH TONUS HLADKÉHO SVALU	30
3.1 Princip ovlivnění tonu hladkého svalu	30
3.2 Látky uvolňující hladký sval	31
3.2.1 Látky uvolňující cévní hladký sval – vazodilatancia	31
3.2.2 Látky uvolňující mimocévní hladký sval – spazmolytika	32
3.3 Látky kontrahující hladký sval	32
4. LÁTKY POUŽÍVANÉ PŘI PORUCHÁCH METABOLISMU LIPIDŮ	34
4.1 Patofyziologický úvod	34
4.1.1 Lipoproteiny	35
4.1.2 Hyperlipoproteinémie	36
4.1.3 Význam dietních tuků	36
4.1.4 Farmakoterapie a dieta	37
4.2 Hypolipidemika	37
4.2.1 Látky snižující plazmatický cholesterol	37
4.2.1.1 Látky snižující intestinální absorpci cholesterolu – iontoměničiče – cholestyramin, kolestipol a colesvelam	37
4.2.1.1.1 Látky snižující selektivně intestinální absorpci cholesterolu	38
4.2.1.3 Látky poškozující syntézu cholesterolu a VLDL – statiny – lovastatin, pravastatin, fluvastatin, simvastatin, atorvastatin a cerivastatin	38
4.2.1.4 Kyselina nikotinová (niacin)	38
4.2.1.5 Látky zvyšující clearance cholesterolu – probukol	39
4.2.2 Látky snižující plazmatické triglyceridy – niacin	39
4.2.3 Látky poškozující konverzi plazmatických lipoproteinů – fibráty – gemfibrozil, fenofibrát, bezafibrát, ciprofibrát, klofibrát	39
5. NEUROMEDIÁTORY V CNS	41
5.1 Synaptická transmise	42
5.2 Acetylcholin	44
5.3 Katecholaminy	45
5.3.1 Dopamin	46
5.3.2 Noradrenalin	47
5.3.3 Adrenalin	48
5.3.4 Serotonin	48
5.4 Excitační aminokyseliny: glutamát (a aspartát)	49
5.5 Inhibiční aminokyseliny	51
5.5.1 GABA	51
5.5.2 Glycin	52
5.6 Histamin	52
5.7 Peptidy	53
5.8 Puriny	54
5.8.1 Adenosin	54
5.8.2 ATP	55
5.9 Endokanabinoidy	55
5.10 Oxid dusnatý	56
6. CELKOVÁ ANESTÉZIE	57
6.1 Definice	57
6.1.1 Lokalizace změn v nervovém systému, vyvolaných účinky celkových anestetik	57

6.1.2 Elektrofyziologické změny centrálního nervového systému, vyvolané působením celkových anestetik	58
6.2 Princip anestézie	59
6.3 Intravenózní anestetika	59
6.3.1 Úvod	59
6.3.2 Mechanismus účinku intravenózních anestetik	59
6.3.3 Farmakokinetika	60
6.3.4 Farmakodynamika	60
6.3.5 Účinek na jednotlivé systémy	61
6.3.6 Zástupci intravenózních anestetik	62
6.4 Inhalační anestetika	71
6.4.1 Úvod	71
6.4.2 Farmakokinetika inhalačních anestetik	71
6.4.3 Farmakodynamika inhalačních anestetik	73
6.4.4 Jednotlivá inhalační anestetika	74
7. HYPNOSEDATIVA A ANXIOLYTIKA	82
7.1 Fyziologie spánku a jeho ovlivnění; insomnie	83
7.2 Hypnosedativa a anxiolytika	83
7.2.1 Benzodiazepiny – chlórdiazepoxid, diazepam, oxazepam, bromazepam, flurazepam, alprazolam, flunitrazepam, triazolam, klobazam a klonazepam	84
7.2.2 Nebenzodiazepinová hypnotika – zopiklon, zolpidem a zaleplon	86
7.2.3 Azapirony – buspiron	87
7.2.4 Anxiolytika z jiných indikačních skupin	87
7.2.4.1 H ₁ – antihistaminika – hydroxyzin	87
7.2.4.2 Neuroleptika a tricyklická antidepresiva	87
7.2.4.3 β -adrenergní blokátory	87
7.2.5 Starší hypnosedativa a anxiolytika – barbituráty	88
7.2.6 Výjimečně užívané a obsoletní látky – meprobamát, guaifenezin, glutetimid, chloralhydrát	89
8. NEUROLEPTIKA	90
8.1 Schizofrenie	90
8.1.1 Patofyziologie schizofrenie	91
8.2 Neuroleptika – úvod	92
8.3 Mechanismy působení	92
8.4 Farmakodynamické působení	92
8.5 Farmakokinetika	93
8.6 Nežádoucí účinky	93
8.7 Lékové interakce	95
8.8 Klinické indikace	95
8.9 Přehled a vlastnosti jednotlivých skupin neuroleptik	96
8.9.1 Bazální (sedativní) neuroleptika	96
8.9.2 Incisivní neuroleptika	96
8.9.3 Atypická neuroleptika	97
9. LÉČIVA U PORUCH NÁLADY	99
9.1 Úvod	99
9.2 Etiopatogeneze, prognóza	100
9.3 Příznaky depresivní epizody	100

9.4 Klasifikace léčiv u poruch nálady	100
9.4.1 Tricyclická antidepressiva (TCA; thymoleptika)	101
9.4.2 Inhibitory monoaminoxidasy (MAOI; thymoeretika)	101
9.4.3 Selektivní inhibitory zpětného vychytávání serotoninu (SSRI)	102
9.4.4 „Atypická“ antidepressiva	103
9.4.5 Lithium	103
9.5 Nefarmakologické přístupy	104
10. ANTIPILEPTIKA	105
10.1 Epilepsie, definice, charakteristika	105
10.1.1 Patofysiologie	106
10.2 Antiepileptika	106
10.2.1 Mechanismus působení	107
10.2.2 Základní antiepileptika	107
10.2.3 Novější antiepileptika	108
10.3 Poznámky k léčbě	109
11. ANTIPARKINSONIKA	110
1.1 Úvod	111
11.2 Bazální ganglia	111
11.3 Fyziologie	112
11.4 Patofyziologie	112
11.5 Klinický obraz	113
11.6 Patogeneze	113
11.7 Farmakoterapie	114
11.7.1 Levodopa	114
11.7.2 Dopaminergní agonisté	115
11.7.3 Anticholinergika	117
11.7.4 Amantadin	118
11.7.5 Inhibitory COMT	118
11.7.6 Selegilin	118
11.7.7 Další léčiva	119
11.8 Pohybová rehabilitace	119
11.9 Chirurgická léčba	119
11.10 Parkinsonský syndrom	118
12. STIMULANCIA CNS; PSYCHOTOMIMETIKA (HALUCINOGENY)	121
12.1 Stimulancia CNS	121
12.1.1 Centrální analeptika	121
12.1.2 Psychomotorická stimulancia	122
12.2 Halucinogeny	125
12.2.1 LSD	126
12.2.2 Fencyklidin	126
12.2.3 delta-9-tetrahydrokanabinol	127
12.2.4 Další halucinogeny	127
13. OPIOIDNÍ ANALGETIKA	129
13.1 Úvod	130
13.2 Endogenní opioidy a opioidní receptory	130

13.3 Opioidní receptory	130
13.4 Mechanismus účinku	131
13.5 Strukturální charakteristika	132
13.5.1 Přirozené, semisyntetické opiody	132
13.5.2 Syntetické opiody	132
13.6 Farmakokinetika	133
13.6.1 Absorpce	133
13.6.2 Distribuce, redistribuce	133
13.6.3 Eliminace	133
13.7 Mí agonisté	133
13.7.1 Morfin (morphinum)	133
13.7.2 Kodein	138
13.7.3 Heroin	138
13.7.4 Hydromorfon	138
13.7.5 Oxymorfon	138
13.7.6 Meperidin, petidin	138
13.7.7 Fentanyl	139
13.7.8 Sufentanil	140
13.7.9 Alfentanil	141
13.7.10 Remifentanil	142
13.7.11 Metadon	143
13.8 Parciální agonisté a směšení agonisté–antagonisté	144
13.8.1 Pentazocin	144
13.8.2 Nalbufin	144
13.8.3 Butorfanol	145
13.8.4 Buprenorfin	145
13.8.5 Nalorfin	145
13.9 Opioidní antagonisté	145
13.9.1 Naloxon	145
13.9.2 Naltrexon	146
14. NESTEROIDNÍ ANTIFLOGISTIKA; ANTIREVMATIKA	147
14.1 Patofysiologický úvod	148
14.1.1 Eikosanoidy	148
14.1.2 Zánět	148
14.1.3 Biologické oxidanty	149
14.1.4 Cytokiny	149
14.2 Nesteroidní antiflogistika (NSAF)	150
14.2.1 Aspirin a salicyláty	151
14.2.2 Piroxikam, fenamáty, indometacin	151
14.2.3 Ibuprofen, diklofenak, naproxen	152
14.2.4 Nimesulid a meloxikam	152
14.2.5 Celecoxib a rofekoxib	152
14.2.6 Fenylbutazon	152
14.3 Analgetika – antipyretika	152
14.3.1 Paracetamol	152
14.3.2 Metamizol	153
14.4 Antireumatika	153
14.4.1 Steroidní antiflogistika	153

14.4.2 Hydrofilní deriváty zlata – auranofin a aurotioglukóza	152
14.4.3 Cytostatika – cyklofosamid a metotrexat	152
14.4.4 Aminochinolinová antimalarika – chlorochin a hydrochlorochin	153
14.4.5 Kovové chelátory– penicilamin	154
14.4.6 Leflunomid	154
14.4.7 TNF- α inhibitory – etanercept a infliximab	154
14.4.8 Antagonisté interleukinu-1-anakinra	154
14.4.9 Jiná novější antirevmatika – cyklosporin, minocyklin	155
15. LÉČIVA POUŽÍVANÁ U DNY	156
15.1 Dna (arthritis uratica)	156
15.1.1 Historie dny	157
15.1.2 Osud kyseliny močové	157
15.1.3 Kyselina močová a dna	158
15.1.4 Fagocytóza a dna	158
15.2 Léčba dny	158
15.2.1 Základní principy léčby dny	158
15.2.2 Látky používané v léčbě dny	159