

OBSAH

1	ÚVOD	7
1.1	Základní pojmy	7
1.2	Léčivá látka	7
1.2.1	Názvy léčivých látek	8
1.3	Léčivý přípravek	9
1.4	Třídění léčiv	10
1.5	Léková forma	11
1.5.1	Dělení lékových forem podle skupenství	11
1.5.2	Dělení lékových forem podle způsobu podání	12
1.5.3	Charakteristika nejběžnějších lékových forem	12
1.6	Další pojmy	14
1.7	Historie používání a vývoje léčiv	15
2	OBEČNÁ FARMAKOLOGIE	21
2.1	Farmakokinetika.....	21
2.1.1	Osud léčiva v organismu.....	21
2.1.2	Absorpce léčiv	22
2.1.3	Distribuce léčiv	27
2.1.4	Biotransformace léčiv	30
2.1.5	Eliminace léčiv.....	32
2.1.6	Dávkování léčiva	33
2.2	Farmakodynamika.....	35
2.2.1	Specifické mechanismy účinku léčiv	35
2.2.2	Nespecifické mechanismy účinku léčiv	37
3	VÝVOJ NOVÝCH LÉČIV	39
3.1	Metody vyhledávání biologicky aktivních látek.....	40
3.1.1	Izolace látek z přírodních zdrojů.....	40
3.1.2	Metoda strukturních variací	43
3.1.3	Selektivní optimalizace vedlejších účinků známých léčiv (SOSA)	45
3.1.4	Využití kvantitativních vztahů mezi strukturou a biologickou aktivitou (QSAR)	46
3.1.5	Orientační metody vycházející z klasických QSAR	48
3.1.6	Využití výpočetní techniky při návrhu nových léčiv	49
3.1.7	Kombinatoriální chemie a chemické knihovny	50
3.2	Testování a hodnocení nových léčiv	53
3.2.1	Farmakologický screening	54
3.2.2	Preklinické testy bezpečnosti a nežádoucích účinků	55
3.2.3	Klinické testování	55
3.2.4	Uvedení léčiva na trh	57
3.3	Registrace léčiv.....	58
3.3.1	Legislativní podklady.....	59
3.3.2	Typy registračních procedur	59
3.3.3	Obsah a členění registrační dokumentace pro léčivé přípravky.....	60
3.4	Správná výrobní praxe.....	62

3.5	Generická léčiva.....	63
4	CHEMICKÉ VLASTNOSTI LÉČIV.....	65
4.1	Nekovalentní interakce.....	65
4.2	Izomerie.....	67
4.3	Polarita.....	73
4.4	Acidobazické vlastnosti.....	74
4.5	Proléčiva.....	76
4.6	Polymorfie.....	81
5	ANALGETIKA.....	85
5.1	Neopioidní analgetika.....	86
5.1.1	Deriváty kyseliny salicylové.....	87
5.1.2	Arylalkanové kyseliny.....	88
5.1.2.1	Aryloctové kyseliny.....	88
5.1.2.2	Arylpropanové kyseliny.....	90
5.1.3	Deriváty pyrazolonu.....	91
5.1.4	Inhibitory COX-2.....	92
5.1.5	Další nenarkotická analgetika.....	94
5.2	Opioidní analgetika.....	95
5.2.1	Příklad aplikace přístupu SOSA (selektivní optimalizace vedlejších účinků)	
	102	
6	LÉČIVA OVLIVŇUJÍCÍ CENTRÁLNÍ NERVOVOU SOUSTAVU.....	103
6.1	Princip vzniku a vedení nervového signálu.....	103
6.2	Celková anestetika.....	107
6.2.1	Inhalační anestetika.....	108
6.2.2	Intravenózní anestetika.....	109
6.3	Sedativa a hypnotika.....	112
6.3.1	První generace sedativ–hypnotik.....	112
6.3.2	Benzodiazepiny – hypnotika druhé generace.....	113
6.3.3	Hypnotika třetí generace.....	116
6.4	Psychofarmaka.....	118
6.4.1	Antipsychotika.....	119
6.4.2	Antidepresiva.....	123
6.4.3	Psychostimulancia.....	129
6.4.4	Psychotropní, omamné a návykové látky.....	131
6.4.4.1	Látky euforizující a psychostimulancia.....	131
6.4.4.2	Látky tlumivé a hypnotika.....	133
6.4.4.3	Halucinogeny.....	134
6.4.4.4	Kanabinoidy.....	136
6.4.4.5	Nové syntetické drogy (<i>designer drugs</i>).....	136
7	LÉČIVA OVLIVŇUJÍCÍ VEGETATIVNÍ NERVOVOU SOUSTAVU.....	139
7.1	Sympatomimetika.....	141
7.1.1	Endogenní sympatomimetika.....	141
7.1.2	α_1 -Sympatomimetika.....	143
7.1.3	α_2 -Sympatomimetika.....	146
7.1.4	β_1 -Sympatomimetika.....	146
7.1.5	β_2 -Sympatomimetika.....	147

7.2	Sympatolytika	150
7.2.1	α -Sympatolytika.....	150
7.2.2	β -Sympatolytika.....	151
7.3	Parasympatomimetika	153
7.3.1	Přímá parasympatomimetika	153
7.3.2	Nepřímá parasympatomimetika – inhibitory acetylcholinesterasy	154
7.4	Parasympatolytika	156
8	LOKÁLNÍ ANESTETIKA, MYORELAXANCIA, SPASMOLYTIKA	159
8.1	Lokální anestetika	159
8.2	Myorelaxancia	163
8.2.1	Periferní myorelaxancia	163
8.2.2	Centrální myorelaxancia	164
8.3	Spasmolytika	165
9	LÉČIVA OBĚHOVÉ SOUSTAVY	169
9.1	Hypolipidemika	169
9.1.1	Inhibitory HMG-CoA reductasy – statiny	170
9.1.2	Deriváty α -aryloxyalkanových kyselin – fibráty	172
9.1.3	Ionexy (měniče iontů) vážící žlučové kyseliny.....	174
9.1.4	Léčiva ovlivňující vstřebávání cholesterolu	175
9.2	Perorální antidiabetika	175
9.3	Léčiva ovlivňující srážlivost krve	179
9.3.1	Antitrombotika.....	179
9.3.2	Hemostatika	184
9.4	Antihypertenziva	185
9.4.1	Látky blokuující sympatikus.....	185
9.4.2	Antihypertenziva ovlivňující systém renin–angiotensin–aldosteron	186
9.5	Vazodilatancia	189
9.5.1	Estery kyseliny dusičné.....	190
9.5.2	Blokátory vápníkových kanálů	191
9.5.3	Léčba erektilních poruch.....	194
10	LÉČIVA TRÁVICÍ A VYLUČOVACÍ SOUSTAVY	197
10.1	Antacida a antiulceróza	197
10.1.1	Inhibitory protonové pumpy	198
10.1.2	H ₂ -Antihistaminika	203
10.2	Laxativa	203
10.3	Antidiaroika	205
10.4	Antiemetika	208
10.5	Střevní protizánětlivá léčiva	208
10.6	Diuretika	210
11	ANTIALERGIKA	213
11.1	Hypohistaminika	214
11.2	H₁-Antihistaminika	215
12	LÉČIVA DÝCHACÍ SOUSTAVY	221
12.1	Antitusika	221
12.1.1	Antitusika opioidního typu	221

12.1.2	Antitusika neopioidního typu.....	222
12.2	Mukoaktivní látky.....	224
12.3	Antiastmatika.....	227
13	LÁTKY POUŽÍVANÉ K PREVENCI A TERAPII INFEKČNÍCH A PARAZITÁRNÍCH CHOROB.....	229
13.1	Antivirotika.....	230
13.2	Antibakteriální chemoterapeutika.....	238
13.2.1	Sulfonamidy.....	238
13.2.2	Chinolony.....	242
13.3	Antibiotika.....	245
13.3.1	β -Laktamová antibiotika.....	246
13.3.2	Tetracykliny.....	248
13.3.3	Aminoglykosidy.....	248
13.3.4	Makrolidy.....	249
13.3.5	Peptidová antibiotika.....	250
13.3.6	Ostatní antibiotika.....	250
13.4	Antimykotika (antifungální látky).....	252
13.4.1	Antifungální antibiotika.....	253
13.4.2	Deriváty imidazolu a triazolu.....	253
13.5	Antimykobakteriální léčiva.....	254
13.6	Antiprotozoární léčiva.....	256
13.6.1	Antimalarika.....	256
13.7	Dezinfekční látky a antiseptika.....	259
13.7.1	Oxidační činidla.....	259
13.7.2	Halogeny a látky uvolňující aktivní halogeny.....	259
13.7.3	Sloučeniny kovů.....	261
13.7.4	Alkoholy, fenoly, ethery, aldehydy a kyseliny.....	261
13.7.5	Povrchově aktivní látky.....	264
14	LITERATURA.....	266