

## Obsah

Předmluva.....	3
1 Definice a charakteristika disciplíny .....	5
2 Vývoj chemických léčiv .....	7
3 Názvosloví léčiv .....	11
4 Zdroje nových chemických léčiv.....	15
4.1 Nahodilý screening.....	15
4.2 Objevování ztraceného .....	15
4.3 Obměňování struktur stávajících léčiv .....	15
4.4 Kombinatoriální chemie.....	16
4.5 Využití poznatků příbuzných oborů .....	17
5 Strukturální faktory ovlivňující účinek léčiv .....	20
5.1 Uhlíková složka.....	21
5.2 Dusíkaté funkční skupiny .....	23
5.3 Kyslíkaté funkční skupiny.....	29
5.4. Sírné sloučeniny .....	39
5.5 Halogenderiváty .....	42
6 Modifikace struktury .....	46
6.1 Izomerie.....	46
6.1.1 Strukturální izomerie.....	46
6.1.2 Stereoizomerie.....	48
6.2 Homologie .....	59
6.3 Analogie .....	61
6.3.1 Hydrogenace a dehydrogenace.....	61
6.3.2 Analogie alkylová.....	64
6.3.3 Analogie radikálová .....	65
6.3.4 Izosterie .....	67
6.3.5 Analogie funkčních skupin.....	71
6.3.6 Analogie kruhů .....	73
6.3.7 Modely.....	75
6.3.8 Zdvojení molekul .....	76
6.4 Prekurzory léčiv .....	79
6.4.1 Prekurzory se zvýšenou rozpustností ve vodě.....	80
6.4.2 Prekurzory se zlepšeným vstřebáváním .....	81
6.4.3 Prekurzory se specifitější distribucí .....	83
6.4.4 Prekurzory se sníženou toxicitou a redukovanými vedlejšími účinky .....	85
6.4.5 Prekurzory s protražovaným účinkem.....	87
6.4.6 Prekurzory se zvýšenou stabilitou .....	89
7 Fyzikálně-chemické vlastnosti .....	90
7.1 Rozpustnost .....	90
7.1.1 Zvýšení rozpustnosti ve vodě .....	92
7.1.2 Snížení rozpustnosti ve vodě.....	96
7.1.3 Zvýšení rozpustnosti v lipidech.....	96
7.2 Bazicita a kyselost.....	97
7.3 Adsorpce na rozhraní fází .....	99
7.4 Kvantitativní vztahy mezi chemickou strukturou a biologickou aktivitou .....	99
Literatura .....	101