

## FARMAKOLOGIE TRÁVICÍ SOUSTAVY

Úlohou GIT je zpracování přijímané potravy tak, aby došlo k uvolnění složek nezbytných pro organismus (trávení) a k jejich vstřebání

**PERISTALTIKA** = pohyb trávicí soustavy zajišťující posun potravy

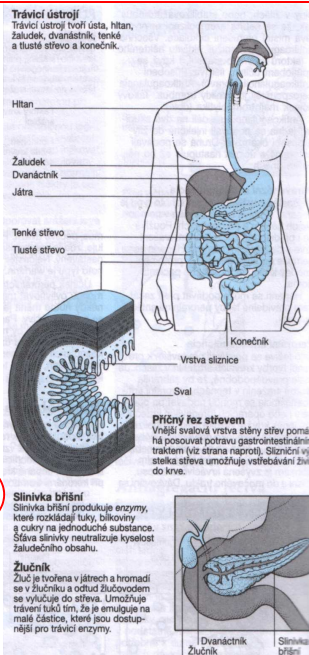
**SEKRECE TRÁVICÍCH ŠŤÁV** = nezbytná pro rozklad potravy

### REGULACE ČINNOSTI

- **NERVOVÁ** nervové pleteně + VNS  
peristaltika hladké svaloviny  
aktivace - **parasympatikus**  
inhibice - **sympatikus**

spojení s CNS

- **HUMORÁLNÍ** vlastní endokrinní systém –  
sekrece enzymů rozptýlené buňky (netvoří žlázy)  
motilita žaludku **enterohormony** (sekrece stimulována  
motilita střev) potrava, tlak, napětí, psychika, teplota aj.



## LÉČIVA OVLIVŇUJÍCÍ ČINNOST ŽALUDKU

### STOMACHIKA

Látky zvyšující sekreci slin a žaludečních šťáv  
Zlepšení chuti k jídlu

Rostlinné drogy STOMARAN

**ANOREKTIKA (=ANOREXIKA)**

Léčiva tlumící chuť k jídlu  
Léčení obezity

Mazindol DEGONAL

Ovlivnění CNS - psychofarmaka

### ACIDA

zvyšují kyselost ž. šťáv – indikace achlorhydrie  
ACIPEPSOL, ENZYNORM

### ŽALUDEK

- Dutý orgán
- Zadržuje potravu po dobu fyziologicky nutnou k enzymatické úpravě tráveniny
- povrchové buňky vylučují Mucin, který chrání sliznici před HCl a trávicími enzymy
- HCl – pH = 1.7: aktivace pepsinogen pepsin denaturace bílkovin ničí plísňe a kvasinky podporuje vstřebávání Fe<sup>2+</sup> a Ca<sup>2+</sup>

ŽALUDEČNÍ ŠŤÁVA  
PEPSIN (proteáza)  
LIPÁZY  
Na<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>, Mg<sup>2+</sup>, SO<sub>4</sub><sup>2-</sup>  
„vnitřní faktor“ (pozn. B<sub>12</sub>)  
Gastroferrin (pozn. Fe<sup>2+</sup>)

ŽALUDEČNÍ SEKRECE = reflexní děj

## LÉČIVA OVLIVŇUJÍCÍ ČINNOST ŽALUDKU

### ANTACIDA

Léčiva schopná různými mechanismy kompenzovat zvýšenou hladinu HCl

**HYPERACIDITA** → vznik PEPTIDICKÉHO VŘEDU

- Produkce nadměrného množství HCl („pálení žáhy“)
- Chronická hyperacidita *versus* Akutní hyperacidita (nikotin, alkohol, kofein)

Mechanismus účinku:

- A/ neutralizační Antacida (NaHCO<sub>3</sub>)
- B/ absorpční Antacida (Al(OH)<sub>3</sub>)
- ANACID, GASTROGEL

### ANTIULCERÓZA

Léčiva pro prevenci a terapii peptidického vředu (slizniční defekt, autodigestce)

Pirenzepin **GASTROZEPIN** (ovlivnění sekrece HCl prostřednictvím VNS)

*Helicobacter pylori*

## LÉČIVA OVLIVŇUJÍCÍ TRÁVICÍ POCHODY VE DVANÁCTNÍKU

### DIGESTIVA

Léčiva obsahující jednotlivé nebo kombinované trávicí enzymy  
Používají se při substituční terapii

Pepsin ACIPEPSOL

Pankreatické trávicí šťávy  
PANCREOLAN, PANZYFORM ad. – enterosolventní (acidorezistentní) lékové formy

### CHOLAGOGA

Léčiva zvyšující sekreci žluči jaterními buňkami (CHOLERETIKA), a usnadňující vyprazdňování žlučníku (CHOLEKINETIKA)

FEBICHOL, CHOLAGOL, CHOLASPAN

### HEPATOPROTEKTIVA

léčiva stabilizující a regenerující jaterní buňky

Do duodena ústí:

- vývod pankreatu
- vývod žlučníku

pH cca 8,5

Pankreatické trávicí enzymy  
Trypsin, chymotripsin  
Pankreatická lipáza  
Pankreatická amyláza  
Žluč (emulpace tuků)

## LÉČIVA POUŽÍVANÁ PŘI PORUŠENÉ FUNKCI STŘEV

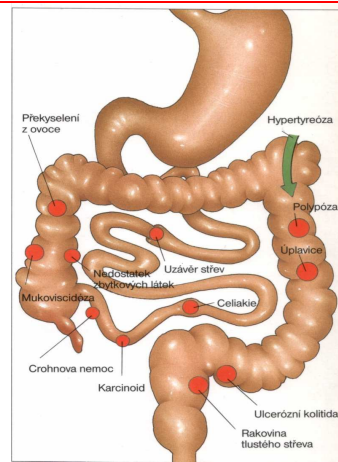
### STŘEVNÍ TRAKT:

#### TENKÉ STŘEVO

- dokončení trávení
- vstřebávání živin, vitamínu a H<sub>2</sub>O
- tráveniny se zahušťují
- periodické vyprazdňování
- přítomnost celé palety enzymů

#### TLUSTÉ STŘEVO

- skladování zbytků potravy
- resorpce elektrolytů vitamínu a H<sub>2</sub>O



#### PORUCHY STŘEV

#### DŮSLEDKEM

- Zastavení (zpomalení) peristaltiky ⇒ ZÁCPA (= OBSTIPACE) LAXATIVA
- Spazmy
- Zrychlení střevní motility ⇒ PRŮJEM (= DIAREA) OBSTIPANCIA
- Zánět střevní sliznice
- Produkce nadměrného množství

## LAXATIVA

## LÁTKY USNADŇUJÍCÍ ODCHOD STOLICE

### Používají se při

- funkční zácpě akutní povahy
- vyprazdnění střev před vyšetřením nebo chirurgickým zákrokem

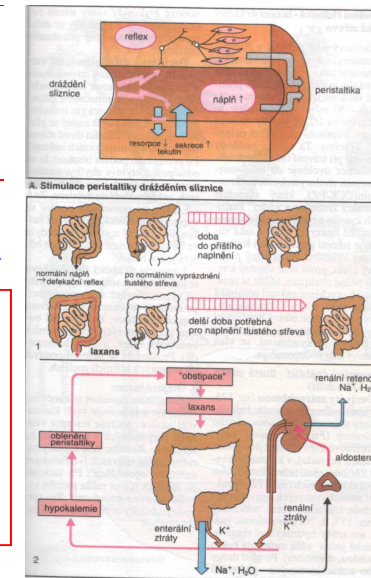
### Důležité je nalézt příčinu zácpy

### Dlouhodobé užívání – ztráta přirozené peristaltiky

#### PODLE MECHANISMU ÚČINKU SE DĚLÍ:

#### A/ LAXATIVA ZVĚTŠUJÍCÍ A ZMĚKČUJÍCÍ STŘEVNÍ OBSAH

#### B/ LAXATIVA DRÁŽDIVÁ



## LAXATIVA ZVĚTŠUJÍCÍ A ZMĚKČUJÍCÍ STŘEVNÍ OBSAH

ad) A

### PRINCIP:

- Zvětšením střevního obsahu dochází ke zvýšení tlaku na střevní stěnu, což vede ke zlepšení peristaltiky
- Zvětšení střevního obsahu se docílí zadržováním vody, čímž se střevní obsah naředí a usnadní se jeho vyprazdňování.

Osmoticky aktivní soli = salinická projímadla.

- MgSO<sub>4</sub>, Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, sulfidy (Šarátice), vinany

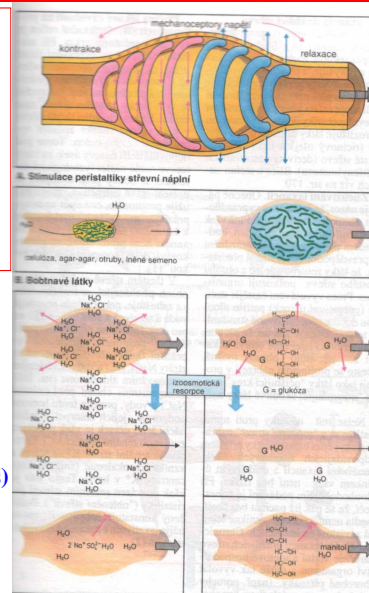
tekutý parafin LAFINOL

#### GLYCEROL

Agar (nestavitelný polysacharid z mořských řas)

Lactulosa LACTULOSA  
(nevstřebatelný disacharid působící osmoticky)

deriváty celulosy



## DRÁŽDIVÁ LAXATIVA

ad) B

### PRINCIP:

Dráždí střevní sliznici, snižuje se resorpce tekutin (zvyšuje se sekrece tekutin), zvětšuje se střevní obsah → stimulace peristaltiky, podráždění senzitivních nervových vláken → reflexy vedoucí k zesílení střevní motoriky

Antrachinony

AGIOLAX

Fenolftalein

LAFINOL

Pikosulfát sodný

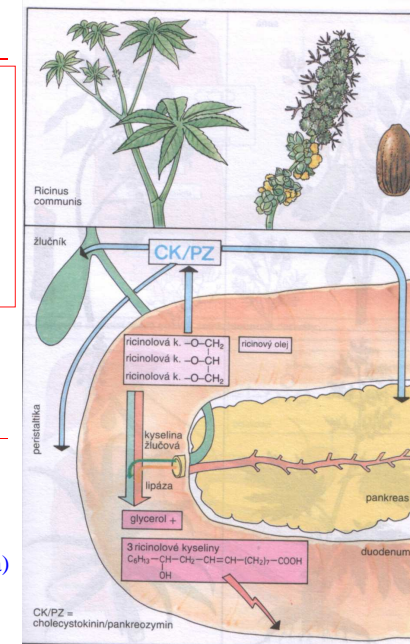
GUTTALAX

Používají se rovněž:

SPASMOLYTIKA (spastická zácpa)

PARASYMPATOMIMETIKA (atonická zácpa)

PSYCHOFARMAKA (psychogenní zácpa)





## OBSTIPANCIA

Léčiva tlumící nespecifický průjem

Průjem – zvýšená frekvence defekace a tekutá konsistence stolice (dehydratace a demineralizace – ohrožení života)

Symptomatická léčiva

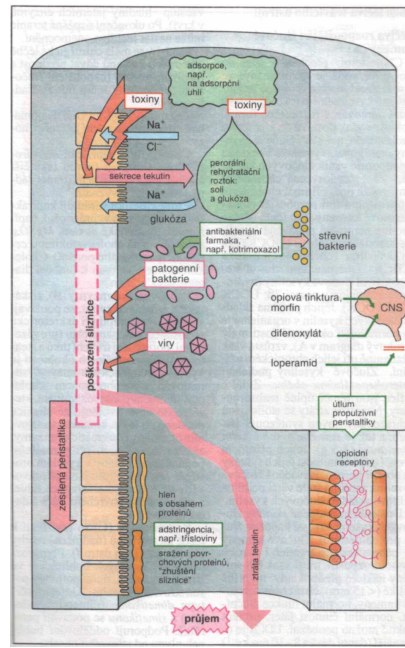
- odstraňují vysilující symptomy onemocnění v 1. fázi
- následuje léčba kauzální

Akutní průjem: Dieta + Obstipancia + Antiinfektiva + Analgetika + Spazmolytika

A/ Adsorbencia (adsorbce škodlivin vyvolávajících průjem; netoxické)  
Adsorpční uhlí CARBOSORB

B/ Opioidy Difenoxylát REASEC

C/ Léčivé čaje



## STŘEVNÍ ANTIINFEKTIVA (= STŘEVNÍ DESINFICIENCIA)

Mají zasáhnout v případech, kdy průjem má bakteriální, či jiný infekční původ

Ftalylsulfathiazol FTALAZOL

Cloroxinu ENDIARON

Oxifenonium ENDIFORM

## SPAZMOLYTIKA

Léčiva používaná k uvolnění stahů hladké svaloviny

Ovlivňují vegetativní nervstvo – NEUROTROPNÍ SPAZMOLYTIKA

Vyvíjí účinek přímo na hladký sval – MYOTROPNÍ SPAZMOLYTIKA

## KOMPOZITNÍ PŘÍPRAVKY

CONTRASPAM

ALGIFEN

SPASMOVERALGIN

## FARMAKOLOGIE VYLUČOVACÍ SOUSTAVY

EXKRECE – odstraňování nepotřebných látek z těla

LEDVINY – hl. exkretční orgán (homeostáze)  
Hospodaření s elektrolyty, H<sub>2</sub>O a vyloučení xenobiotik

## ŘÍZENÍ ČINNOSTI LEDVIN

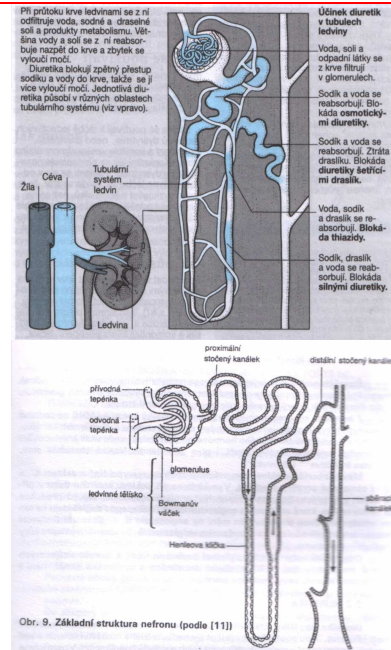
NERVOVÉ (VNS)

HUMORÁLNÍ

ADH – antidiuretický hormon, aldosteron

NEFRON – základní funkční a anatomická jednotka ledvin

- glomerulus, proximální tubulus, H. klíčka, distální tubulus, sběrný kanálek



## DIURETIKA

Léčiva různými mechanismy zvyšujícími diurézu (tvorbu a vyloučení moči)

Indikace:

1/ Hypertenze

2/ Vylučování nadbytečných tekutin (otoky)

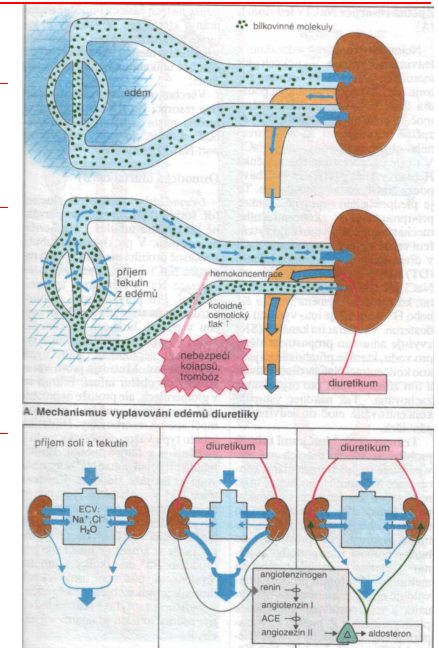
3/ Odstranění xenobiotik (intoxikace)

Dělí se:

A/ Saluretika

B/ Osmotická diuretika

C/ Ostatní diuretický působící látky



## SALURETIKA

Zvyšují vylučování  $\text{Na}^+$  a  $\text{Cl}^-$  (vyvolávají i vylučování  $\text{K}^+$  jehož ztráty jsou nebezpečné)

Nutná substituce  $\text{K}^+$

KALIUM CHLORATUM nebo KALINOR

### A/ DIURETIKA SULFONAMIDOVÁ

Furosemid **FUROSEMID**  
Klopamid **CRYPEPIN**

### B/ DIURETIKA THIAZIDOVÁ

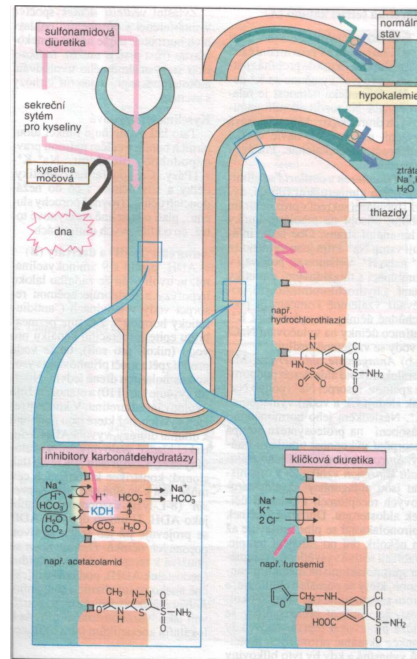
Hydrochlorthiazid **HYDROCHLORTHIAZID**

### C/ KYSELINA ETHAKRYNOVÁ

UREGYT

KALIUM ŠETRÍČÍ DIURETIKA

Spironolakton **ALDACTONE**



## OSMOTICKÁ DIURETIKA

Jsou filtrována do moči a svým osmotickým tlakem zvyšují objem vylučované moči

Zvyšují prokrvení ledvin a glomerulární filtraci

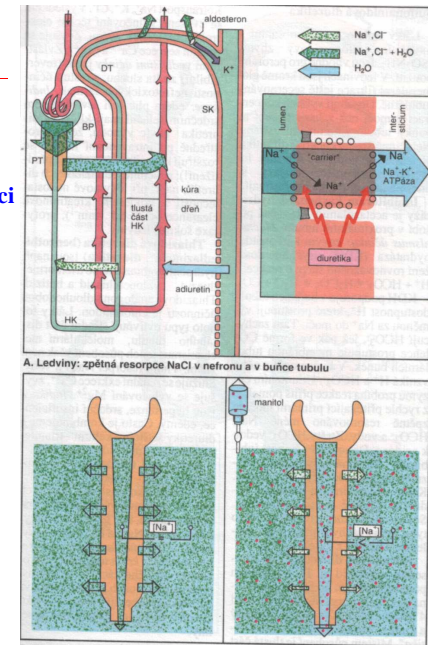
Silná diuretika

Mínimální vylučování  $\text{NaCl}$

Podávají se i.v. v infúzi při:

- 1/ selhání ledvin
- 2/ intoxikace látkami vylučovanými ledvinami
- 3/ mozkový edém

Mannitol **INFUSIO MANNITOLI**  
Močovina **UREA**  
Sorbitol **INFUSIO SORBITOLI**

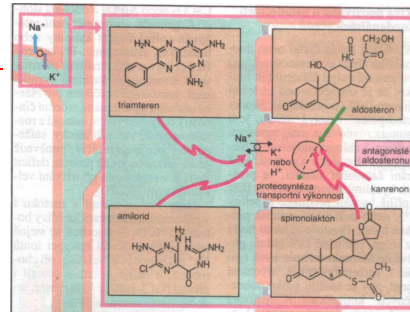


## OSTATNÍ DIURETICKY ÚČINNÉ LÁTKY

Diuretické účinky mají veškerá léčiva, která zvyšují prokrvení ledvin.

Periferní vazodilatancia  
Kardiotonika

Diuretické čaje



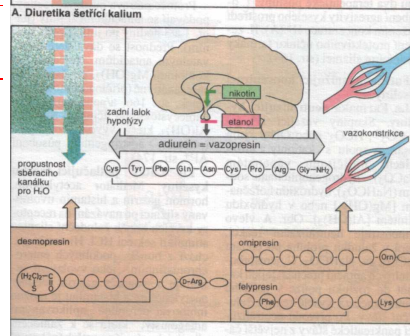
## ANTIDIURETIKA

Léčiva, která snižují diurézu

Desmopresin **ADIURETIN**

Použití k léčbě *Diabetes insipidus* („žíznivka“) a polynurie

Aplikace nosní sliznicí



## HISTAMIN

BIOGENNÍ AMIN – vyskytuje se téměř ve všech tkáních

Neurotransmitter v mozku, mediátor v žaludku

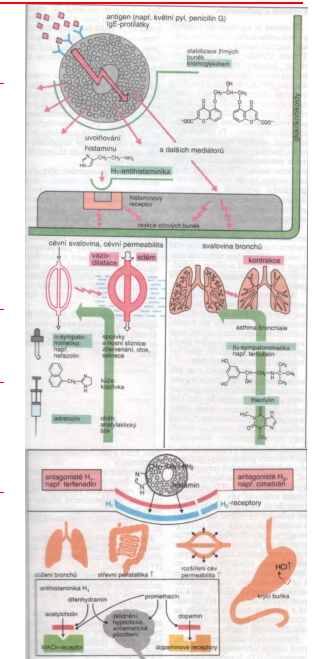
Uvolňuje se při alergických reakcích

Uvolňuje se při tkáňovém poškození

Podtypy receptorů  $\text{H}_1$ ,  $\text{H}_2$  a  $\text{H}_3$

Je uvolňován řadou podnětů, které poškozují buňky a tkáň (chlad, ozáření, mechanické poškození)

- Dilatace drobných cév (zarudnutí kůže)
- Pokles krevního tlaku
- Zvýšení permeability cév
- Dráždí nervová zakončení (svědění)





## ANTI-HISTAMINIKA

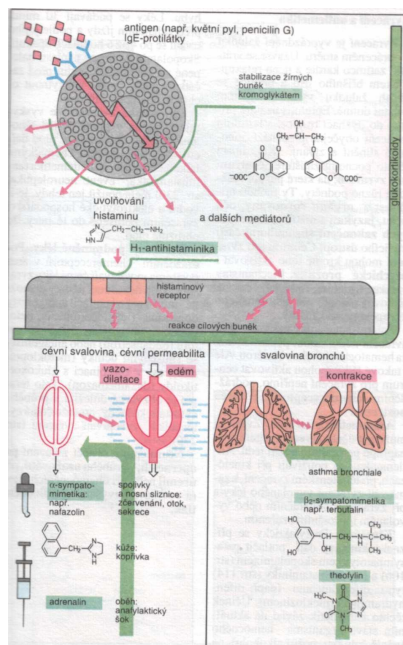
### LÉČIVA ANTAGONIZUJÍCÍ PŮSOBNÍ HISTAMINU

Použití – alergické reakce

Nežádoucí účinky:

sedativní až hypnotické účinky

Loratadin	CLARITINE
Cetirizin	ZYRTEC
Bisulepin	DITHIADEN



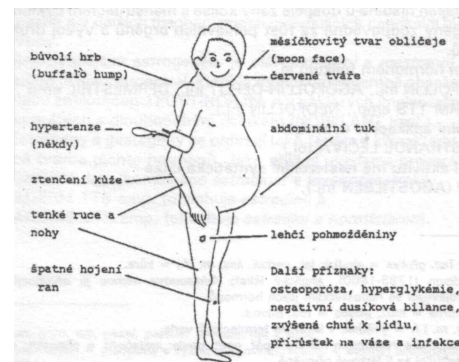
## ANTIFLOGISTIKA A ANTIREVMATIKA

Léčiva, která působí tlumivě na zánětlivou reakci tkáně

Léčiva používající se při terapii revmatických onemocnění

**Calor (teplota)  
Rubor (červenění)  
Tumor (otok)  
Dolor (bolest)  
et Functio Laesa (funkce poškozené části)**

### 0/ GLUKOKORTIKOIDY



### ZÁNĚT:

Reakce organismu na poškození (mechanické, chemické, mikrobiální)

Při poškození tkáně dochází k uvolnění mediátorů zánětu (histamin, serotonin, bradykinin, prostaglandiny ad.)

Glukokortikoidy

- nejvýraznější AF účinek

- nepoužívají se – výrazné N.Ú.

## ANTIFLOGISTIKA A ANTIREVMATIKA

### 1/ deriváty KYSELINY SALICYLOVÉ

ASPIRIN ACYLPYRIN

Dávka 4 g/den → N.Ú. krvácení, poruchy sluchu, poruchy CNS, ledvinové poruchy atd.,

### 2/ deriváty PYRAZOLONU

Pouze krátkodobé použití; vysoká toxicita

Kebuzon KETAZON

### 3/ deriváty KYSELINY OCTOVÉ, PROPIONOVÉ

Diklofenak VOLTAREN  
Ibuprofen BRUFEN

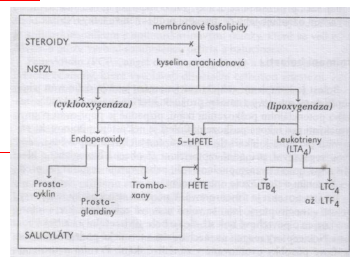
### 4/ Fenamáty, deriváty Karboxamidů a jiná NSPZL

CLOTAM, PIROX, RUMALON

### NSPZL

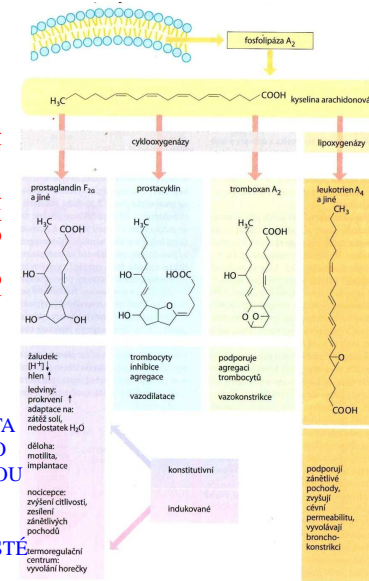
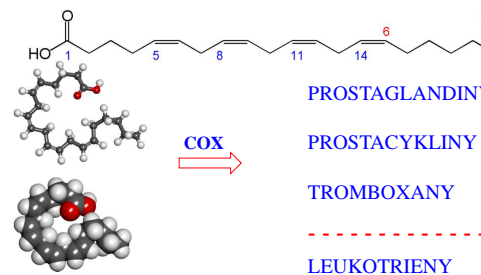
Nesteroidní protizánětlivé látky

Inhibice syntézy prostaglandinů

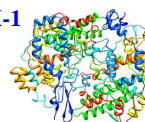


## ANTIFLOGISTIKA A ANTIREVMATIKA

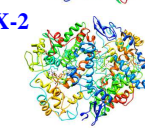
### KYSELINA ARACHIDONOVÁ



### COX-1



### COX-2



### KYKLOOXYGENÁZY

V MOLEKULE ENZYMU JE PŘÍTOMNA DLOUHÁ KAVITA (PÓR) – AKTIVNÍ MÍSTO PRO KYSELINU ARACHIDONOVOU

INHIBITORY COX = KOMPETITIVNÍ ANTAGONISTÉ REVERZIBILNÍ INHIBICE

## ANTIFLOGISTIKA A ANTIREVMATIKA

**COX-1** – KONSTITUTIVNÍ, INHIBICE VYVOLÁVÁ N.Ú.

(PORUCHY SLIZNIC, FCE LEDVIN, KVS, ...)

**COX-2** – INDUKUJE SE ZÁNĚTLIVÝMI PROCESY

(KONSTITUTIVNÍ JEN V URČITÝCH ČÁSTECH ORGANISMU)

**NESELEKTIVNÍ INHIBITORY COX**

INHIBUJÍ OBĚ IZOFORMY COX

ODVOZENY OD SALICYLOVÉ K.

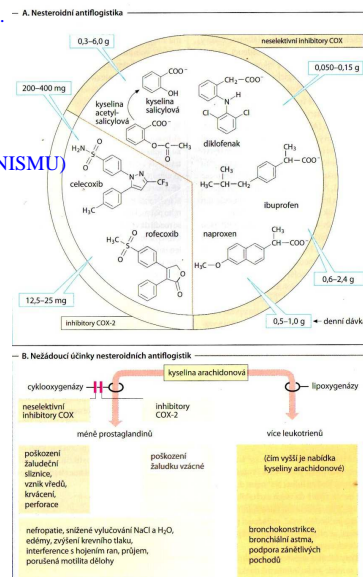
**SELEKTIVNÍ INHIBITORY COX-2**

INHIBUJÍ COX-2 >> COX-1

NEPORUŠUJÍ SLIZNICE

ANTIREVMATICKÁ TERAPIE

N.Ú. – SRDEČNÍ INSUFICIENCE, JÁTRA, LEDVINY



## TERAPIE ZHOUBNÉHO BUJENÍ

V PRŮMYSLOVĚ VYSPĚLÝCH ZEMÍCH KAŽDÝ PÁTÝ ČLOVĚK UMÍRÁ NA ZHOUBNÝ NÁDOR

**BENIGNÍ (= nezhoubné) NÁDOR**  
**MALIGNÍ (= zhoubné) NÁDOR**

procesy **INFILTRACE** (do okolí),  
**DESTRUKCE** (okolní tkáně)  
**TVORBA METASTÁZ**

Nádory (Tumory) – vznikají z různých tkání

Nejčastější nádor **KARCINOM** (z epitelu)  
**SARKOM, ADENOM** aj.

**Mechanismus vzniku neznámý**

- (onkogenní viry, nekontrolovaně probíhající imunitní procesy aj.)
- přispívající faktory (biologické, chemické, fyzikální)

**ZMĚNA GENETICKÉ INFORMACE**  
**ZODPOVĚDNÉ ZA DĚLENÍ BUNĚK**

**CYTOSTATIKA**

- léčiva, která různými mechanismy zastavují růst a množení buněk
- některé látky se používají i jako imunosupresiva
- problém: metabolismus nádorových a zdravých buněk je shodný → nežádoucí účinky na zdravé buňky
- každé cytostatikum – potenciální teratogen

## CYTOSTATIKA

**A/ POLYFUNKČNÍ ALKYLUJÍCÍ LÁTKY**

Mechanismus – přenos alkylového radikálu na molekulu NK nebo bílkoviny (potlačení dělení)

Cyklofosamid **CYTOXAN**

**B/ ANTIMETABOLITY**

Látky chemicky příbuzné prekurzorům biosyntézy NK a proteinů

Methotrexat **METHOTREXAT**

**C/ ROSTLINNÉ ALKALOIDY**

„mitotické jedy“ (inhibice mitotického dělení)

Vincristin **VINCRISTIN**  
Vinblastin **VINBLASTIN**

## CYTOSTATIKA

**D/ CYTOSTATICKÁ ANTIBIOTIKA**

Mechanismus – vazbou na molekulu DNA poškozují funkci buňky

Doxorubicin **ADRIBLASTINA**

**E/ JINÁ CYTOSTATIKA**

Deriváty platiny; Mechanismus účinku je nejasný

Cisplatina **CISPLATYL**  
Karboplatina **CYCLOPLATIN**

**F/ HORMONY A LÁTKY BLOKUJÍCÍ JEJICH ÚČINEK**

Pohlavní hormony, kortikosteroidy a jejich deriváty

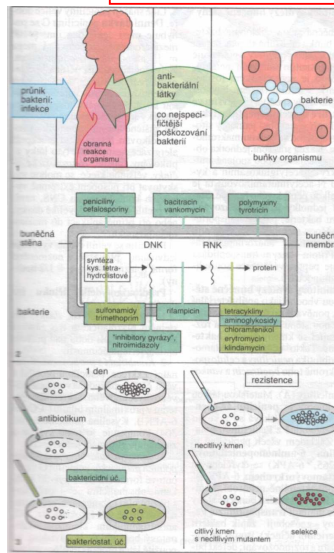
Prednison **PREDNISON**  
Tamoxifen **TAMOXIFEN**

# TERAPEUTIKA BAKTERIÁLNÍCH INFEKČÍ

**ANTIINFEKTIVA  
= PREVENCE A  
TERAPIE INFEKČNÍCH  
ONEMOCNĚNÍ**

**ANTIBIOTIKA** (přirodní produkty mikroorganismů)  
**CHEMOTERAPEUTIKA** (uměle syntetizované látky)

- Působí na mikroorganismy bakteriostaticky  
nebo baktericidně



**INFEKČNÍ ONEMOCNĚNÍ**  
Charakteristická proniknutím choroboplodných  
zárodků, kde se rozmnoží a po určité době  
(inkubační doba) se projeví příznaky

**MECHANISMUS ÚČINKU – cílem je:**  
**SELEKTIVNÍ OVLIVNĚNÍ SPECIFICKÝCH  
PROCESŮ MIKROORGANISMU BEZ  
VÁŽNĚJŠÍHO OVLIVNĚNÍ MAKROORGANISMU**

## PENICILINY

= BETALAKTÁMOVÁ ANTIBIOTIKA

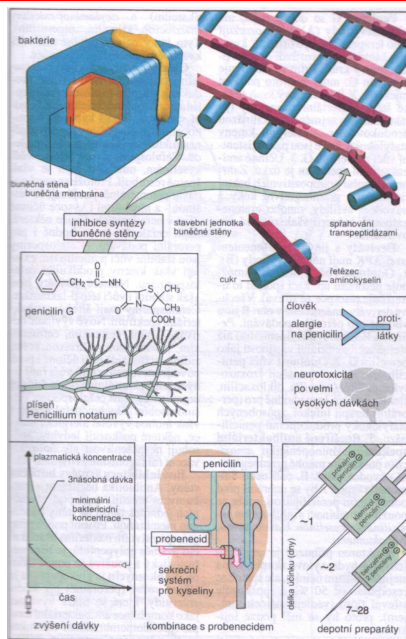
- PENICILIN G
- PENDEPON (dlouhodobý účinek)
- V-PENICILIN
- PENCLLEN
- OXACILIN

Širokospektré Peniciliny  
AMOCLEN

infekce respiračního traktu  
infekce močových a trávicích cest

Kombinace s inhibitory beta-laktamáz  
Kyselina klavulámová

AUGMENTIN



## M.Ú. ANTIINFEKTIV A JEJICH N.Ú.

- 1/ INHIBICE BUNĚČNÉ STĚNY
- 2/ POŠKOZENÍ FUNKCE BUNĚČNÉ MEMBRÁNY
- 3/ PORUCHA SYNTÉZY BÍLKOVIN
- 4/ PORUCHA METABOLISMU NUKLEOVÝCH KYSELIN

### NEŽÁDOUCÍ ÚČINKY ANTIBIOTIK

Používané antimikrobiální látky patří mezi relativně bezpečné léky, přesto existují určité typy toxicity

- Poškození krevetvorby (aplastická anémie)
- Ototoxicita a nefrotoxicita
- Hepatotoxické reakce
- Neurotoxicita
- Alergické reakce

- Chloramfenikol
- Aminoglykosidy a polypeptidová A.
- Tetracykliny
- Peniciliny

Rezistence, dysmikrobie, superinfekce a ovlivnění imunitních dějů.

## CEFALOSPORINY

= BETALAKTÁMOVÁ ANTIBIOTIKA

používají se na kmeny rezistentní  
na penicilinová antibiotika

CEFALOSPORINY 1 – 3. generace

Parenterální aplikace  
Nízká toxicita  
Alergie

CEFALEN  
CEDAX

cefaleksín	kyselé pH	penicilináza	spektrum	koncentrace potřebná k inhibici bakterií citlivých vůči penicilinu G
penicilin V	rezistentní	citlivý	úzké	
oxacilin	rezistentní	rezistentní	úzké	
amoxicilin	rezistentní	citlivý	široké	
cefaleksín	rezistentní	rezistentní, ale citlivý vůči cefalosporináze	široké	



## TETRACYKLINY

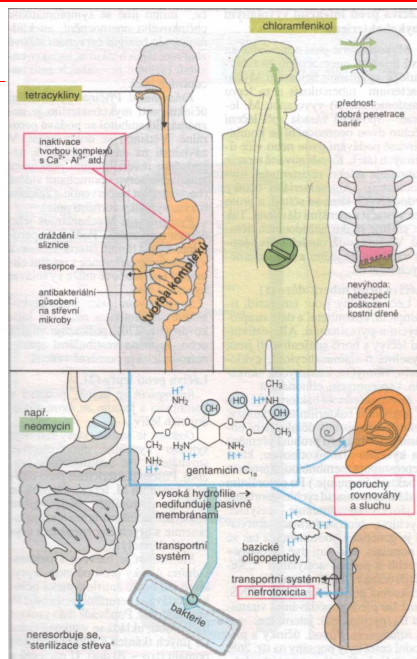
### ŠIROKOSPEKTRÁ ANTIBIOTIKA

VYSOKÝ VÝSKYT N.Ú.  
(ukládání do zubů a kostí)

Infekce vyvolané Chlamidiemi

### DEOXYMYKOIN

CHLORAMPHENICOL  
poškození krevetvorby  
Břišní tyfus, paratyfus, salmonelózy a meningitidy.



## MAKROLIDOVÁ ANTIBIOTIKA

INHIBICE PROTEOSYNTÉZY  
BEZPEČNÁ ANTIBIOTIKA

ERYTHROMYCIN  
SUMAMED

### AMINOGLYKOSIDY

RYCHLÝ BAKTERICIDNÍ ÚČINEK  
NEFROTOXICITA, OTOTOXICITA

GENTAMYCIN

SULFONAMIDY „KLASICKÁ CHEMOTERAPEUTIKA“

Řada N.Ú.

BISEPTOL

## LINKOSAMIDY

PODOBNÉ LINKOSAMIDŮM

KLIMICIN

Používají se při terapii uroinfekcí

## PROTITUBERKULÓZNÍ LÉČIVA

*Mycobacterium tuberculosis*

Tuberkulostatika (bakteriostatický efekt)

Výskyt neustále roste (souvislost s AIDS)

Velmi rychle na uvedená léčiva vzniká resistance (2-3 měsíce)

Používají se kombinace

MYCOBUTIN, NIDRAZID, TUBOCIN

## ANTIMYKOTIKA

Lokalizace na kůži nebo ve vlasech

Celková antimykotika:

nystatin FUNGICIDIN  
ketokonazol NIZORAL

## VIROSTATIKA (ANTIVIROTIKA)

Většinou se řeší prevencí – imunizací

Existuje pouze omezená paleta léčiv

Acyklovir HERPESIN  
ZOVIRAX

PÁSOVÝ OPAR  
Zidovudin AZITIDIN  
RETROVIR

