

Spis treści

1. Wiadomości ogólne	1
1.1. Rys historyczny rozwoju chemii leków – <i>Maria Gorczyca</i>	1
1.2. Klasyfikacja i nazewnictwo substancji leczniczych – <i>Alfred Zejc</i>	5
1.3. Wpływ czynników fizykochemicznych na trwałość, wchłanianie i dystrybucję leków – <i>Maria Gorczyca</i>	7
1.4. Mechanizm działania leków – <i>Alfred Zejc</i>	13
1.4.1. Mechanizm fizykochemiczny działania leków	14
1.4.2. Mechanizm chemiczny działania leków	16
1.5. Biotransformacja leków – <i>Maria Gorczyca</i>	31
1.5.1. Przemiany fazy pierwszej	33
1.5.2. Przemiany fazy drugiej	37
1.6. Współczesne metody projektowania i otrzymywania leków – <i>Paweł Zajdel</i>	40
1.6.1. Poszukiwania leków	40
1.6.2. Metody otrzymywania leków – biosynteza i biotransformacja	51
1.6.3. Biotechnologia oraz metody inżynierii genetycznej w badaniach nad lekiem	52
1.7. Wybrane zagadnienia z toksykologii leków i niektórych substancji chemicznych – <i>Paweł Zajdel</i>	53
1.7.1. Ogólne aspekty niepożądanych działań leków	53
1.7.2. Toksyczność substancji chemicznych	59
1.8. Analityczna kontrola jakości leków – <i>Katarzyna Kulig</i>	62
2. Leki działające na ośrodkowy układ nerwowy	65
2.1. Neuroprzekazniki, neurohormony, neuromodulatory, neuromediatory i inne substancje biorące udział w przewodzeniu bodźców w o.u.n. – – <i>Maciej Pawłowski</i>	65
2.2. Leki psychotropowe – <i>Maciej Pawłowski</i>	71
2.2.1. Leki o działaniu neuroleptycznym	71
2.2.2. Leki przeciwdepresyjne	87

2.2.3.	Leki o działaniu anksjolitycznym (leki przeciwlękowe)	102
2.2.4.	Leki o działaniu stymulującym o.u.n.	114
2.3.	Leki o działaniu analeptycznym – <i>Maciej Pawłowski</i>	125
2.4.	Leki uspokajające i nasenne – <i>Jolanta Obniska</i>	133
2.4.1.	Pochodne kwasu barbiturowego	134
2.4.2.	Leki działające przez receptor benzodiazepinowy	136
2.4.3.	Leki o innej budowie	141
2.5.	Leki przeciwpadaczkowe – <i>Jolanta Obniska</i>	142
2.5.1.	Pochodne hydantoiny	143
2.5.2.	Pochodne kwasu barbiturowego	145
2.5.3.	Pochodne pirolidyno-2,5-dionu	146
2.5.4.	Pochodne iminostilbenu	146
2.5.5.	Pochodne 1,4- i 1,5-benzodiazepiny	148
2.5.6.	Pochodne kwasu walproinowego	149
2.5.7.	Nowa generacja leków przeciwpadaczkowych	151
2.6.	Leki stosowane w chorobie Parkinsona – <i>Maciej Pawłowski</i>	163
2.6.1.	Leki o działaniu cholinolitycznym	164
2.6.2.	Leki dopaminergiczne	168
2.6.3.	Leki o różnej budowie chemicznej	173
2.7.	Leki przeciwbólowe, przeciwgorączkowe i przeciwzapalne – <i>Maciej Pawłowski</i>	174
2.7.1.	Narkotyczne leki przeciwbólowe (egzogenne opioidy)	176
2.7.2.	Nienarkotyczne leki przeciwbólowe, przeciwgorączkowe i przeciwzapalne	190
2.8.	Środki znieczulające ogólnie – <i>Alfred Zejc</i>	222
2.8.1.	Wziewne środki znieczulające ogólnie (środki inhalacyjne)	222
2.8.2.	Środki znieczulające ogólnie do stosowania dożylnego	226
2.8.3.	Leki stosowane w neuroleptanalgezji	228

3. Leki wpływające na obwodowy układ nerwowy 230

3.1.	Leki pobudzające układ współczulny (sympatyczny) – adrenomimetyki, sympatykomimetyki – <i>Barbara Malawska</i>	231
3.1.1.	Leki α -adrenergiczne (α -sympatykomimetyki, α -adrenomimetyki)	236
3.1.2.	Leki β -adrenergiczne (β -adrenomimetyki)	239
3.1.3.	Leki α -, β -adrenergiczne (α -, β -adrenomimetyki)	245
3.1.4.	Leki sympatykomimetyczne (adrenergiczne) o działaniu pośrednim	246
3.2.	Leki hamujące układ współczulny – adrenolityki (sympatykolityki, sympatolityki) – <i>Barbara Malawska</i>	248
3.2.1.	Leki α -adrenolityczne (blokujące receptory α -adrenergiczne)	248
3.2.2.	Leki β -adrenolityczne (leki blokujące receptory β -adrenergiczne, β -bloker)	253
3.2.3.	Leki α - i β -adrenolityczne (blokujące receptory α i β)	262
3.2.4.	Leki sympatykolityczne o innym mechanizmie działania	262
3.3.	Leki pobudzające układ przywspółczulny – leki cholinergiczne (parasympatykomimetyki, parasympatykolityki, parasympatykotoniki, parasympatomi-metyki)	262

3.3.1.	Bezpośrednie leki parasympatykomimetyczne	266
3.3.2.	Parasympatykotoniki o działaniu pośrednim – inhibitory acetylo- cholinoesterazy	268
3.4.	Leki hamujące układ przywspółczulny – leki cholinolityczne (parasympaty- kolityki, parasympatolityki) – <i>Barbara Malawska</i>	279
3.4.1.	Alkaloidy tropanowe i półsyntetyczne pochodne	279
3.4.2.	Leki cholinolityczne o innej budowie	285
3.5.	Leki spazmolityczne muskulotropowe i neuromuskulotropowe	288
3.5.1.	Alkaloidy izochinolinowe i ich pochodne	289
3.5.2.	Estry aminoalkoholi i kwasów aromatycznych oraz leki o różnej budowie	292
3.6.	Leki działające na zwoje układu autonomicznego (wegetatywnego) – <i>Barbara Malawska</i>	293
3.7.	Leki zwiotczające mięśnie szkieletowe – <i>Barbara Malawska</i>	294
3.7.1.	Leki wywołujące blok niedepolaryzacyjny	294
3.7.2.	Leki wywołujące blok depolaryzacyjny	300
3.7.3.	Leki miorelaksacyjne o działaniu ośrodkowym	301
3.8.	Leki znieczulające miejscowo – <i>Hanna Byrtus</i>	305
3.8.1.	Leki o budowie estrowej	306
3.8.2.	Leki o budowie amidowej	310
3.8.3.	Leki o innej budowie	314
4.	Leki przeciwhistaminowe – <i>Barbara Malawska</i>	317
4.1.	Histamina	317
4.2.	Leki przeciwhistaminowe blokujące receptory H ₁	321
4.2.1.	Pochodne diaryloalkiloamin	323
4.2.2.	Pochodne tryklicznych alkiloamin	329
4.2.3.	Pochodne piperydiny	332
4.2.4.	Leki o różnej budowie	335
4.3.	Leki przeciwhistaminowe blokujące receptory H ₂	336
5.	Leki działające na układ krążenia i wpływające na krzepli- wość krwi	341
5.1.	Leki nasercowe – <i>Maciej Pawłowski</i>	341
5.1.1.	Glikozydy nasercowe	341
5.1.2.	Pochodne metyloksantyn	348
5.1.3.	Inhibitory fosfodiesterazy o działaniu inotropowo dodatnim	349
5.2.	Leki przeciwartmyczne – <i>Hanna Byrtus</i>	351
5.2.1.	Leki pochodzenia naturalnego	353
5.2.2.	Leki zawierające wiązania amidowe	356
5.2.3.	Pochodne aryloksyamino-2-propanolu	361
5.2.4.	Leki przeciwartmyczne o różnej budowie	362
5.3.	Leki stosowane w chorobie niedokrwiennej serca – <i>Maria Gorczyca</i>	370
5.3.1.	Azotany organiczne i leki pokrewne	371
5.3.2.	Leki β-adrenolityczne	375

5.3.3.	Leki blokujące kanały wapniowe	376
5.3.4.	Inhibitory konwertazy angiotensyny	384
5.4.	Leki obniżające ciśnienie krwi – <i>Maria Gorczyca</i>	384
5.4.1.	Leki hamujące aktywność układu współczulnego	385
5.4.2.	Leki blokujące kanały wapniowe	397
5.4.3.	Inhibitory konwertazy angiotensyny	398
5.4.4.	Leki otwierające kanały potasowe	404
5.4.5.	Leki działające bezpośrednio na mięśniówkę naczyń krwionośnych	405
5.4.6.	Leki o innych mechanizmach działania	407
5.4.7.	Leki diuretyczne	409
5.5.	Leki rozszerzające naczynia obwodowe i mózgowe – <i>Maria Gorczyca</i>	409
5.5.1.	Kwas nikotynowy i jego pochodne	409
5.5.2.	Pochodne dimetyloksantyn	409
5.5.3.	Leki β -sympatykomimetyczne	412
5.5.4.	Leki α -adrenolityczne	413
5.5.5.	Prostaglandyny i prostacykliny	414
5.5.6.	Leki o różnej budowie i mechanizmach działania	415
5.5.7.	Leki stosowane głównie w zaburzeniach krążenia mózgowego	415
5.6.	Leki zmniejszające stężenie lipidów (leki hipolipemiczne) – <i>Maria Gorczyca</i>	418
5.6.1.	Inhibitory reduktazy hydroksymetyloglutarylo-koenzymu A (HMG-CoA)	419
5.6.2.	Pochodne kwasów aryloksyalkilokarboksylowych (pochodne kwasu kłobrowego)	421
5.6.3.	Pochodne kwasu nikotynowego	423
5.6.4.	Leki o różnej budowie	424
5.6.5.	Środki hamujące wchłanianie cholesterolu z jelit	425
5.7.	Leki wpływające na krzepliwość krwi i środki krwiozastępcze – <i>Alfred Zejc</i>	426
5.7.1.	Leki hamujące krzepliwość krwi (leki przeciwzakrzepowe)	427
5.7.2.	Leki zwiększające krzepliwość krwi	435
5.7.3.	Środki krwiozastępcze	437
5.7.4.	Leki stosowane w niedokrwistości	439

6. Leki moczopędne (diuretyki) – *Maria Gorczyca* 442

6.1.	Leki moczopędne typu sulfonamidów	443
6.1.1.	Leki moczopędne hamujące anhidrazę węglanową (dehydratazę węglanową)	443
6.1.2.	Leki moczopędne sulfonamidowe hamujące reabsorpcję elektrolitów	444
6.2.	Saluretyki o innej budowie	450
6.3.	Diuretyki oszczędzające potas	451
6.3.1.	Antagoniści aldosteronu	452
6.3.2.	Cykliczne amidyny	453
6.4.	Leki moczopędne ksantynowe	454
6.5.	Leki moczopędne o działaniu osmotycznym	454

7. Leki stosowane w chorobach układu oddechowego –	
<i>Grażyna Chłoń-Rzepa</i>	456
7.1. Leki stosowane w astmie oskrzelowej	456
7.1.1. Leki rozszerzające oskrzela	456
7.1.2. Leki hamujące wytwarzanie mediatorów stanu zapalnego (glikokortykosteroidy)	459
7.1.3. Leki hamujące uwalnianie mediatorów stanu zapalnego	462
7.1.4. Antagoniści receptorów leukotrienowych i inhibitory syntezy leukotrienów	464
7.1.5. Przeciwciała monoklonalne	467
7.2. Leki przeciwkaszlowe	468
7.2.1. Leki przeciwkaszlowe o działaniu ośrodkowym	468
7.2.2. Leki przeciwkaszlowe o działaniu obwodowym	472
7.3. Leki wykrztuśne	473
7.3.1. Leki sekretolityczne	473
7.3.2. Leki mukolityczne	475
8. Leki stosowane w chorobach przewodu pokarmowego –	
<i>Grażyna Chłoń-Rzepa</i>	478
8.1. Leki pobudzające wydzielanie soku żołądkowego	478
8.1.1. Kwasy nieorganiczne i organiczne	478
8.1.2. Związki pochodzenia naturalnego	479
8.2. Leki stosowane w chorobie wrzodowej	479
8.2.1. Leki zmniejszające stężenie kwasu solnego w żołądku	480
8.2.2. Leki mukozo- i cytoprotekcyjne	486
8.2.3. Leki stosowane w eradykacji <i>Helicobacter pylori</i>	490
8.2.4. Leki regulujące motorykę przewodu pokarmowego	490
8.3. Leki stosowane w chorobach wątroby i dróg żółciowych	492
8.3.1. Leki żółciotwórcze i żółciopędne	493
8.3.2. Leki zapobiegające tworzeniu się kamieni żółciowych (leki antylitogenne) oraz rozpuszczające kamienie żółciowe	497
8.3.3. Leki ochraniające komórkę wątrobową	498
8.4. Leki przeczyszczające	500
8.4.1. Leki działające na drodze fizycznej	501
8.4.2. Leki działające na drodze chemicznej	503
8.5. Leki przeciwbiegunkowe	507
8.5.1. Leki adsorbujące (pochłaniające)	507
8.5.2. Środki ściągające	508
8.5.3. Leki hamujące perystaltykę jelit	509
8.5.4. Leki spazmolityczne i regulujące motorykę przewodu pokarmowego	510
8.6. Leki przeciwwymiotne	510
8.6.1. Parasympatykolityki	511
8.6.2. Antagoniści receptorów histaminowych H_1	511
8.6.3. Neuroleptyki	512

8.6.4.	Pochodne benzamidu i benzimidazolonu	513
8.6.5.	Antagoniści receptorów serotoninowych 5-HT ₃	513
8.6.6.	Syntetyczne kanabinoidy	515
8.6.7.	Antagoniści receptorów neurokininy-1 (NK ₁)	515
8.6.8.	Leki o innej budowie	516
8.7.	Leki stosowane w przewlekłych chorobach zapalnych jelit	516
8.7.1.	Kwas 5-aminosalicylowy (5-ASA) i jego pochodne (aminosalicylany)	517
8.7.2.	Glikokortykosteroidy	518
8.7.3.	Leki immunosupresyjne	518
8.7.4.	Leki przeciwbakteryjne	518
8.7.5.	Przeciwciała monoklonalne	518

9. Hormony – Alfred Zejc 520

9.1.	Hormony podwzgórza	520
9.2.	Hormony przysadki	523
9.2.1.	Hormony przedniego płata przysadki	523
9.2.2.	Hormony tylnego płata przysadki	524
9.3.	Hormony tarczycy i leki stosowane w chorobach tarczycy	525
9.3.1.	Leki przeciwtarczycowe (tyreostatyki)	528
9.3.2.	Parathormon i kalcytonina	529
9.3.3.	Bifosfoniany	530
9.4.	Hormony o budowie steroidowej	531
9.4.1.	Hormony kory nadnerczy (kortykosteroidy)	534
9.4.2.	Hormony płciowe	543
9.5.	Hormony wysp trzustkowych	554
9.5.1.	Insulina	554
9.5.2.	Glukagon	559
9.6.	Doustne leki przeciwcukrzycowe	560
9.6.1.	Pochodne sulfonilomocznika	560
9.6.2.	Nowa generacja doustnych leków przeciwcukrzycowych	562
9.6.3.	Pochodne biguanidu	563
9.6.4.	Inhibitory α -glukozydazy	564
9.6.5.	Inhibitory lipazy trzustkowej	565

10. Witaminy – Hanna Byrtus 566

10.1.	Retinol i retinoidy	566
10.2.	Witaminy z grupy B	571
10.2.1.	Tiamina	571
10.2.2.	Ryboflawina	574
10.2.3.	Pirydoksyna	575
10.2.4.	Kobalaminy	577
10.2.5.	Kwas pantotenowy	579
10.2.6.	Nikotynamid	580
10.2.7.	Biotyna	581
10.2.8.	Kwas foliowy	582

10.3. Kwas askorbowy	584
10.4. Witamina D i jej analogi	586
10.5. Tokoferole	592
10.6. Witaminy K	594
10.7. Inne witaminy	597
10.7.1. Kwas pangamowy	597
10.7.2. Kwas tioktanowy	598
10.7.3. Witamina F	598
10.7.4. Ubichinon	599
10.7.5. Flawonoidy	600
11. Leki działające na drobnoustroje chorobotwórcze	603
11.1. Środki dezynfekujące i odkażające – <i>Barbara Łucka-Sobstel</i>	603
11.1.1. Związki nieorganiczne	604
11.1.2. Alkohole	608
11.1.3. Aldehydy	609
11.1.4. Fenole	610
11.1.5. Tlenek etylenu i β -propiolakton	611
11.1.6. Pochodne guanidyny	612
11.1.7. Związki amoniowe	613
11.1.8. Związki N-heterocykliczne	615
11.2. Sulfonamidy, pochodne nitrofuranu i chinolony – <i>Barbara Łucka-Sobstel</i>	617
11.2.1. Sulfanilamid i jego N_1 -niecykliczne pochodne	621
11.2.2. N_1 -Podstawione pochodne sulfanilamidu z pięciocząłowym układem heterocyklicznym	621
11.2.3. N_1 -Podstawione pochodne sulfanilamidu z sześciocząłowym układem heterocyklicznym	622
11.2.4. N_1 , N_4 -Dwupodstawione pochodne sulfanilamidu	623
11.2.5. Sulfonamidy o różnej budowie	624
11.2.6. Leki złożone zawierające sulfonamidy	625
11.2.7. Pochodne nitrofuranu	626
11.2.8. Chinolony i fluorochinolony – <i>Jolanta Obniska</i>	628
11.3. Antybiotyki – <i>Alfred Zejc</i>	635
11.3.1. Antybiotyki β -laktamowe	636
11.3.2. Antybiotyki aminoglikozydowe	666
11.3.3. Tetracykliny	674
11.3.4. Chloramfenikol	679
11.3.5. Antybiotyki makrolidowe	682
11.3.6. Antybiotyki peptydowe	688
11.3.7. Antybiotyki ansamycynowe	693
11.3.8. Linkozamidy	696
11.3.9. Antybiotyki o różnej budowie	697
11.4. Leki przeciwgruźlicze i przeciwtrądzikowe – <i>Barbara Łucka-Sobstel</i>	699
11.4.1. Aromatyczne kwasy karboksylowe i ich pochodne	699
11.4.2. Aminoalkohole	702

11.4.3. Antybiotyki	702
11.4.4. Leki przeciwtwardowe	704
11.5. Leki przeciwwirusowe – <i>Barbara Łucka-Sobstel</i>	705
11.5.1. Antymetabolity	706
11.5.2. Pochodne cykloalkilamin	710
11.5.3. Kwasy fosfonowe	711
11.5.4. Leki o różnej budowie	711
11.5.5. Interferony i substancje indukujące interferon	712
11.5.6. Leki stosowane w zakażeniach HIV – <i>Jolanta Obniska</i>	714
11.6. Leki przeciwgrzybicze – <i>Barbara Łucka-Sobstel</i>	726
11.6.1. Antybiotyki przeciwgrzybicze	727
11.6.2. Pochodne imidazolowe i triazolowe	729
11.6.3. Pochodne naftalenoaminy i morfoliny	734
11.6.4. Antymetabolity	735
11.6.5. Pochodne pirydynonu	735
11.6.6. Kwasy karboksylowe	736
11.6.7. Leki o innej budowie	736
11.6.8. Środki niespecyficzne	737
11.7. Leki przeciwprzemiennie – <i>Barbara Łucka-Sobstel</i>	738
11.7.1. Leki przeciwmienne	739
11.7.2. Leki stosowane w rzęsistkowicy	744
11.7.3. Leki stosowane w leczeniu lambliozy, toksoplazmozy, amebiozy, trypanosomozy i zapalenia płuc wywołanego przez <i>Pneumocystis carinii</i>	745
11.8. Leki przeciwpasożytnicze – <i>Barbara Łucka-Sobstel</i>	749
11.8.1. Leki stosowane w zakażeniach robakami obłymi	750
11.8.2. Leki stosowane w tasiemczycy oraz w zakażeniach przywrami	753

12. Chemioterapia chorób nowotworowych. Leki przeciwnowotworowe – *Maria Gorczyca*

12.1. Leki alkilujące	759
12.1.1. Pochodne β -chloroetyloaminy i etylenoiminy (azyrydyny)	759
12.1.2. Estrы kwasu metanosulfonowego	763
12.1.3. Pochodne nitrozomocznika	763
12.1.4. Środki alkilujące o innej budowie	764
12.2. Antymetabolity zasad pirymidynowych, purynowych i kwasu foliowego	767
12.2.1. Antymetabolity zasad pirymidynowych	767
12.2.2. Antymetabolity zasad purynowych	769
12.2.3. Antymetabolity kwasu foliowego	772
12.3. Antybiotyki przeciwnowotworowe	773
12.3.1. Mitomycyny	774
12.3.2. Antybiotyki antracyklinowe	775
12.3.3. Aktynomycyny	778
12.3.4. Bleomycyny	778
12.4. Alkaloidy, pseudoalkaloidy i lignany o działaniu przeciwmiotycznym	779
12.4.1. Alkaloidy barwinka różowego	779

12.4.2. Pseudoalkaloidy – taksony	781
12.4.3. Inhibitory topoizomerazy I i II	781
12.5. Leki o różnej budowie	783
12.5.1. Pochodne akrydyny	783
12.5.2. Pochodne mocznika i fosfocholiny	784
12.6. Enzymy	784
12.7. Hormony i antyhormony	785
12.7.1. Estrogeny	785
12.7.2. Antyestrogeny	786
12.7.3. Androgeny	788
12.7.4. Antyandrogeny	789
12.7.5. Gestageny	790
12.7.6. Hormony peptydowe	791
12.8. Immunoterapia – przeciwciała monoklonalne	791
13. Leki immunotropowe – Maria Gorczyca	793
13.1. Leki immunosupresyjne	794
13.2. Leki immunostymulujące	798
14. Radiofarmaceutyki i środki cieniujące stosowane w diagnostyce obrazowej – Katarzyna Kulig	800
14.1. Radiofarmaceutyki	800
14.1.1. Radiofarmaceutyki stosowane w terapii	801
14.1.2. Radiofarmaceutyki stosowane w diagnostyce	805
14.2. Środki stosowane w diagnostyce obrazowej	810
14.2.1. Środki cieniujące stosowane w badaniach rentgenograficznych	810
14.2.2. Środki cieniujące stosowane w badaniach rezonansu magnetycznego	813
14.2.3. Środki cieniujące stosowane w badaniach ultrasonograficznych	816
Piśmiennictwo	817
Skorowidz	819