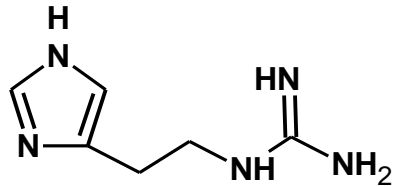
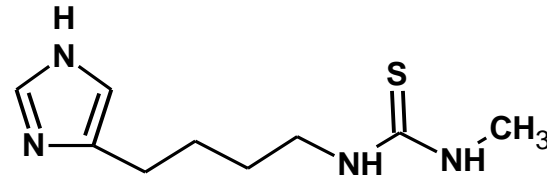


# H<sub>2</sub>-ANTIHISTAMINIKA

## GUANILHISTAMIN



## BURINAMID

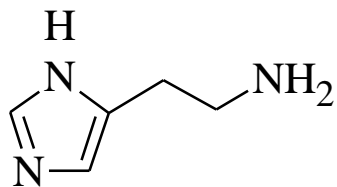


## Funkce žaludeční sliznice

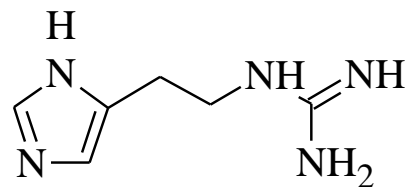
Hlavní buňky produkují působením prostaglandínů hlen a ionty  $\text{HCO}_3^-$ .

Křiví buňky (parietální) prostřednictvím  $\text{H}^+/\text{K}^+$ -ATPáz mohou do žaludčního lumen secernovat  $\text{H}^+$  (přednostně stimuluje histamin vazbou na  $\text{H}_2$  receptory).

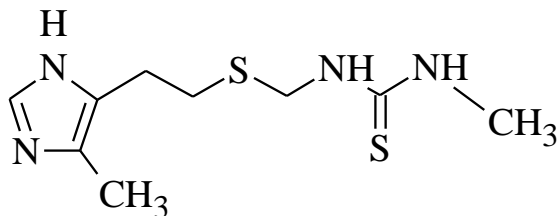
Histamin uvolňují sousední buňky podobné enterochromafinním buňkám.



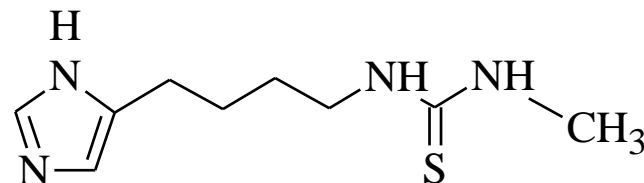
histamin



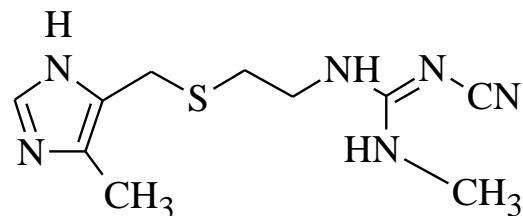
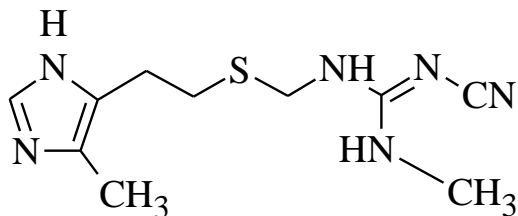
N-guanylhistamin



metiamid



burimamid

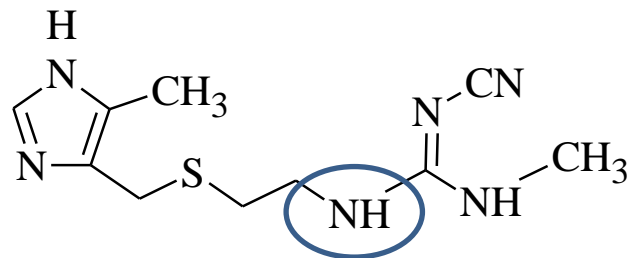
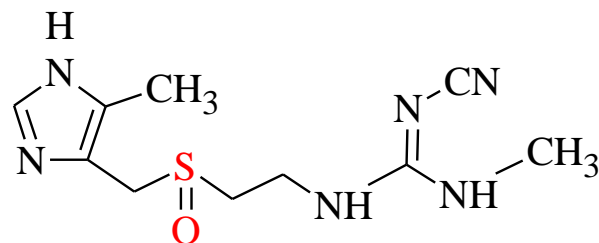
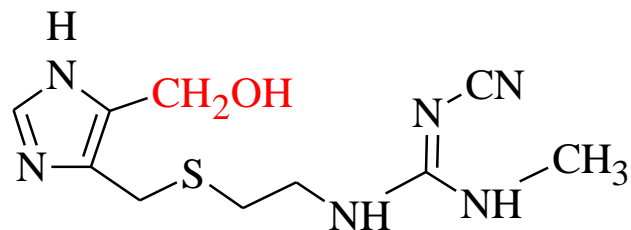
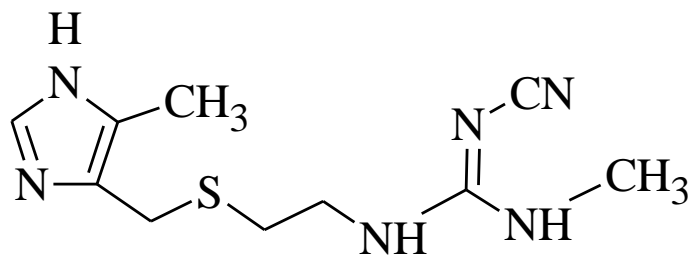


cimetidin

Vývoj cimetidinu je uváděn jako příklad „rational drug design: 1) Racionální myšlenka existence neznámého subtypu (H<sub>2</sub>) 2) Obměna přirozeného ligandu 3) Nalezení „lead“ - N-guanylhistamin 4) Obměna struktury vedoucí k burimamidu ... metiamidu (pak) 5) Odstranění nežádoucích účinků záměnou thiomocoviny za guanidin

# CIMETIDIN

## METABOLISMUS



N-glukuronid

- pro účinek nutná přítomnost methylu na C<sub>5</sub>
- potvrzené vodíkové můstky mezi N imidazolu a postranní methylaminovou skupinou - náhrada vodíku methylom ↓ účinek

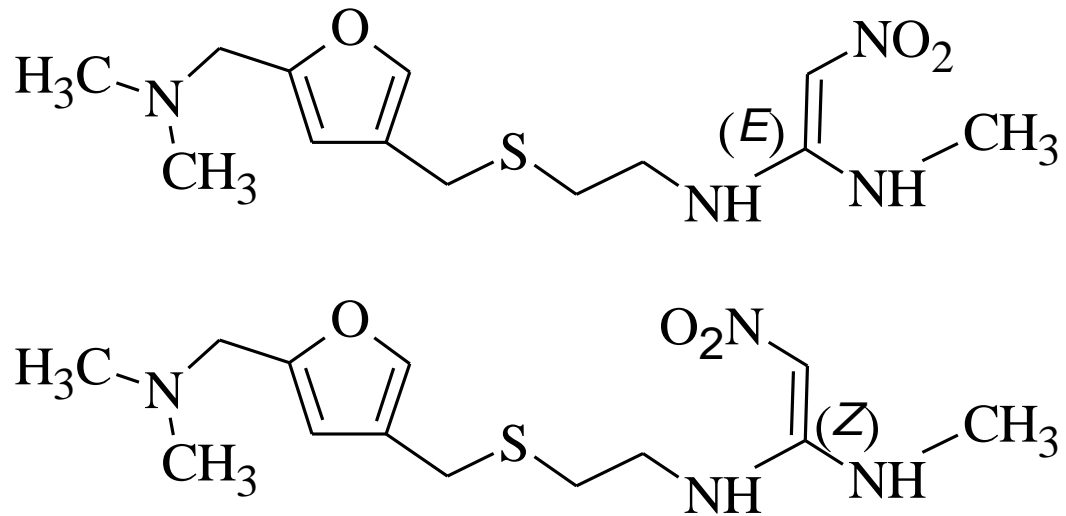
## Vlastnosti

- bazální a stimulovanou sekreci HCl žalúdoční sliznicí snižuje, pretože produkce HCl je v nočných hodinách zvýšená
- cimetidin a ostatní H<sub>2</sub> antihistaminika sa podávajú vo večerných hodinách
- při dlhodobé aplikaci se objevují gynekomastie a u mužov impotence

## Indikace

Žaludeční a duodenální vředy, stavy hyperacidity, refluxní ezofagitída

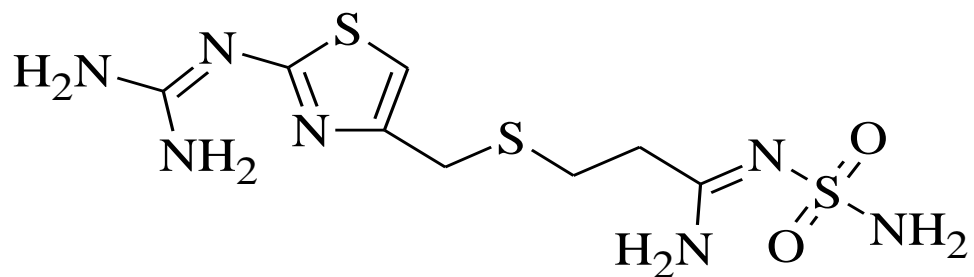
## RANITIDIN - oproti cimetidinu účinnější



### Indikace

Žaludeční a duodenální vředy, gastritidy - většinou jsou doprovázeny ↑ výskytem *helicobacter pylori*, dala podnět ke kombinaci s antibiotiky (peniciliny, tetracykliny), s nitroimidazoly (metronidazol) a doporučují se i soli bizmutu (citronan bizmutitý).

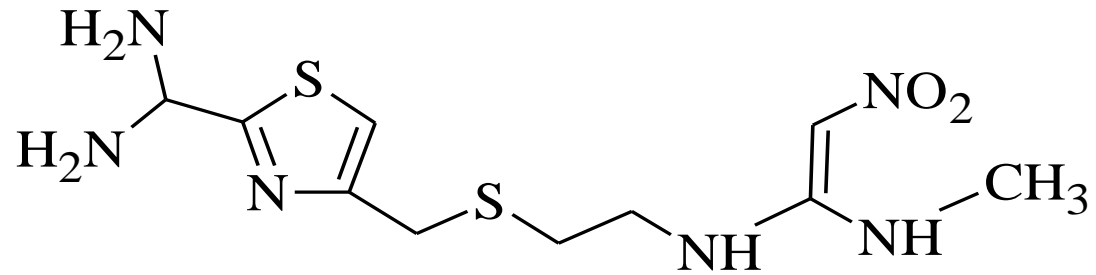
# FAMOTIDIN - antihistaminikum s prodlouženým účinkem



## INDIKACE

Vřed u GIT, hypersekrece, profylaxe při recidivujících gastritid a ulceróz.

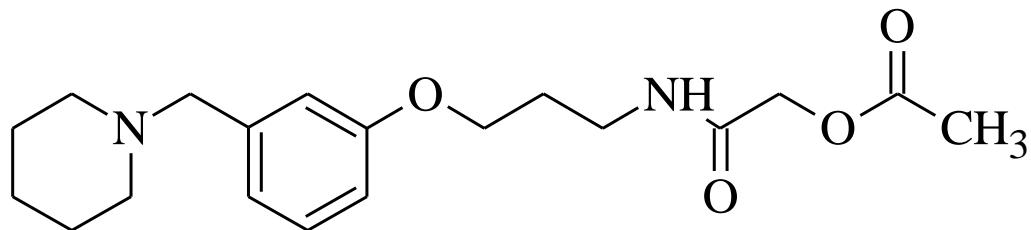
# NIZATIDIN



## Indikace

Je podobná famotidinu

# ROXATIDINACETÁT



## INDIKACE

Terapie žaludečních vředů , Zollinger-Ellisonův syndrom , erozivní esofagitida , gastroezofageální reflux, a gastritidy