

## **Antiparazitika**

**= látky používané k terapii parazitárních nemocnění**

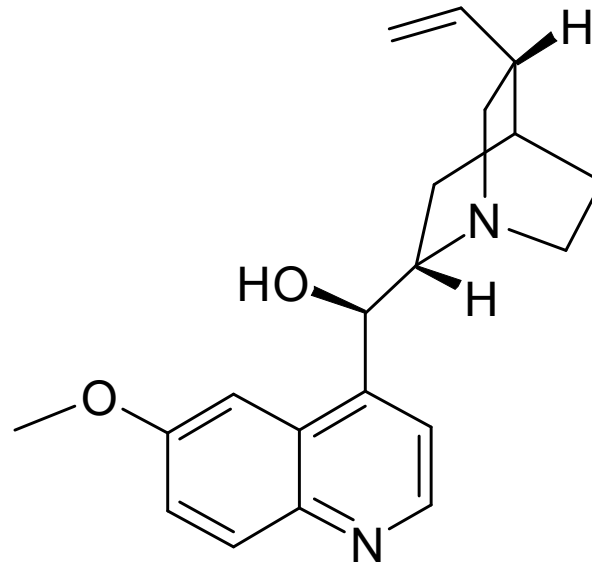
1. **Antoprotosoika**
2. **Anthelmintika**
3. **Insekticida a repelenty**

## Antiprotozoika

= látky působící proti patogenním prvokům

### Antimalarika

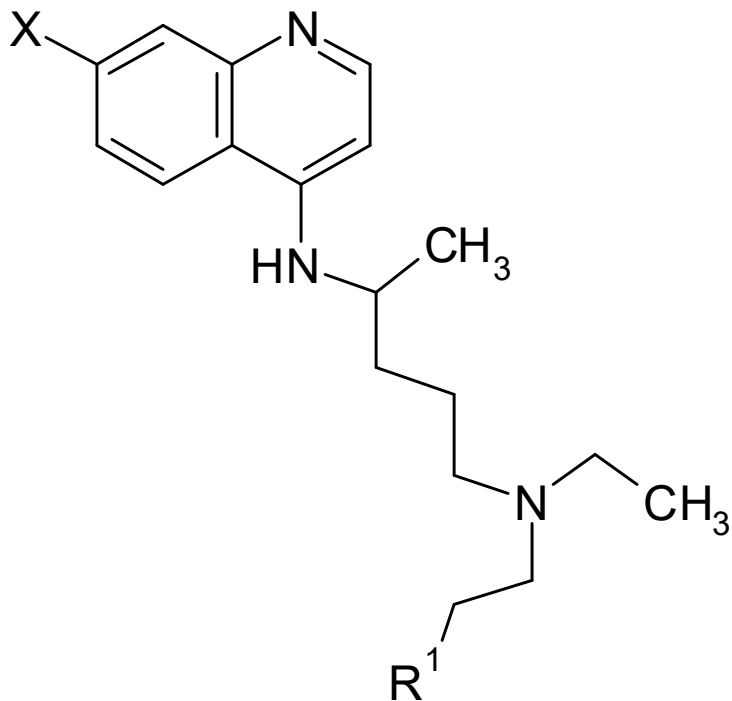
•původce malarie – prvoci rodu Plasmodium: P. vivax, P. falciparum, P. malariae, P. ovale



**chinin**

- izolace z *Cortex chinae* (+ chinidin, cinchonin, cinchonidin)
- kromě antimalarických též antirevmatické a antipyretické účinky
- „lead compound“ pro tvorbu dalších antimalarik s chinolinovým skeletem

## Antimalarika Deriváty chinolinu



X = Cl    R<sup>1</sup> = H    **chlorochin**

Delagil® tbl.

X = F    R<sup>1</sup> = H    **fluorochin**

X = Cl    R<sup>1</sup> = OH    **hydroxychlorochin**

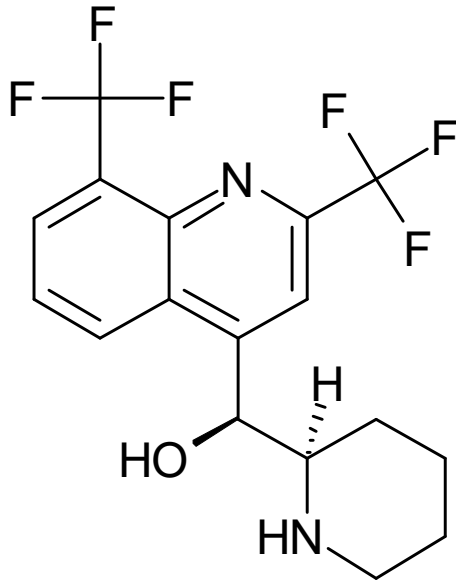
Plaquenil® drg.

•též léčba reumatoidní arthritidy

•mech. účinku: inhibice přeměny pro parazita toxického hemu na hemozoin (= „malarický pigment“ - pro *Plasmodium* netoxický)

## Antimalarika

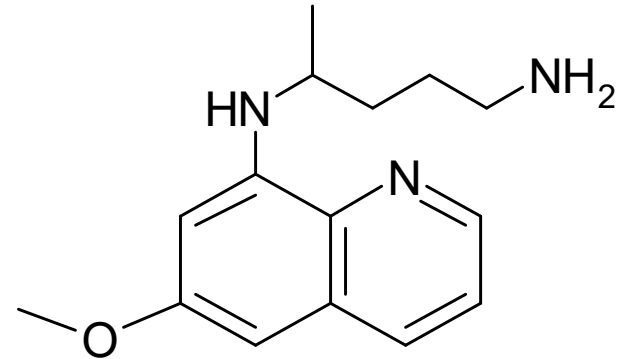
### Deriváty chinolinu



**meflochin**

Lariam® tbl.

• i jako profylaxe před cestou do tropických oblastí

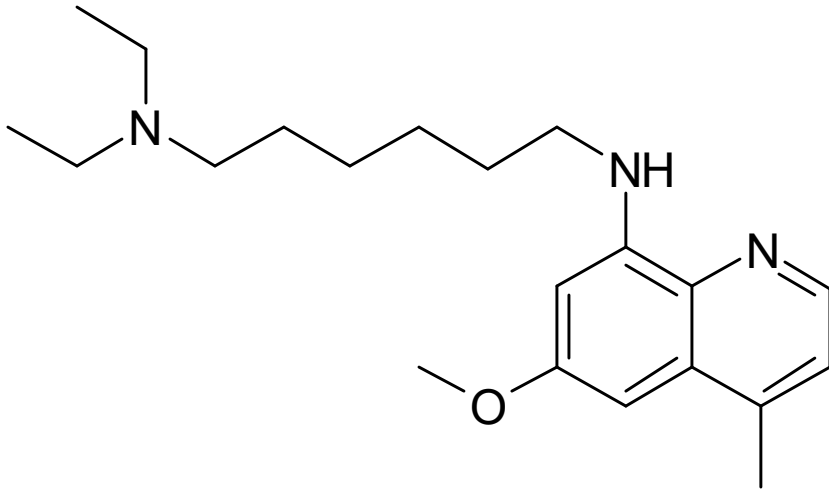


**primachin**

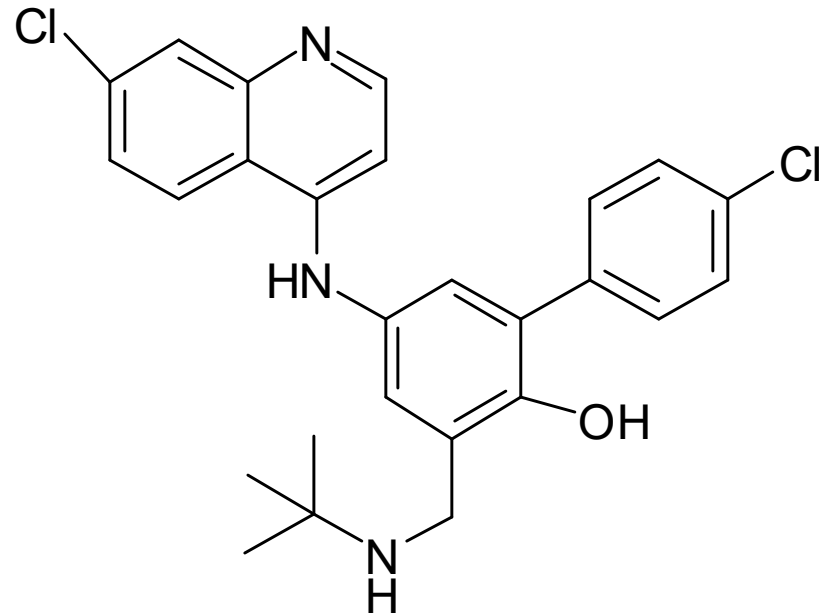
Primaquine® tbl. obd.

Antimalarika

**Deriváty chinolinu**



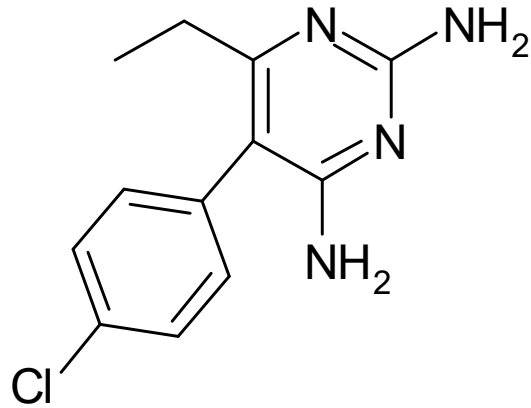
**simatachin**



**tebuchin**

Antimalarika

**Deriváty pyrimidinu**

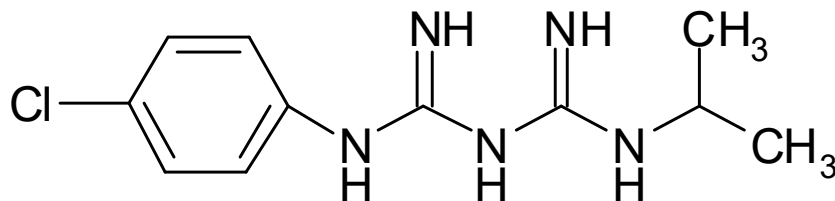


**pyrimethamin**

Daraprim®

Antimalarika

## Deriváty biguanidu



### **proguanil**

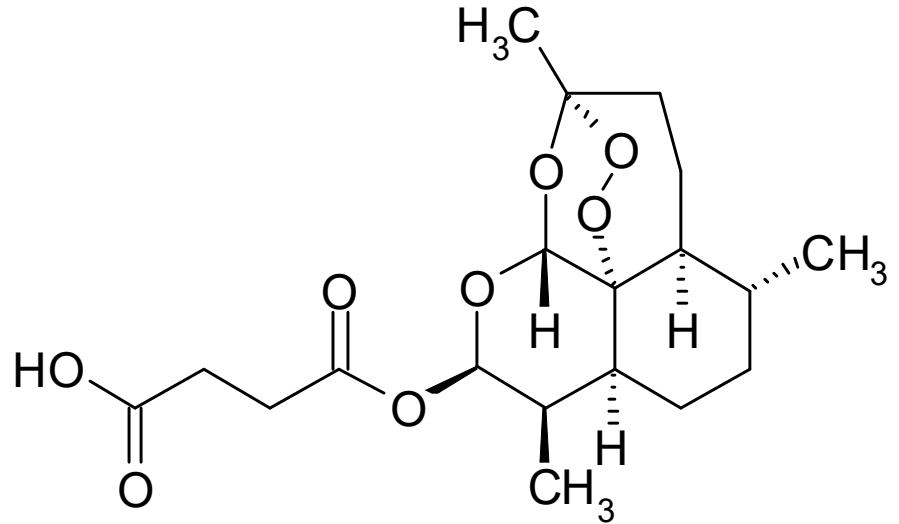
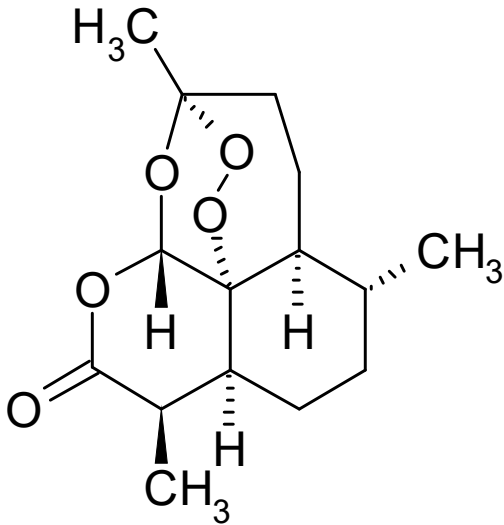
Paludrine®

- spektrum: *P. falciparum*
- mech. účinku: inhibice dihydrofolátreduktasy
- zabraňuje vzniku tkáňových schizontů

Antimalarika

## Artemisinin a jeho analogy

- cyklické endoperoxidy
- mech. účinku: tvorba volných radikálů katalyzovaná Fe z hemu



### artesunát

- používán jako sodná sůl pro i.m. podání

### artemisinin

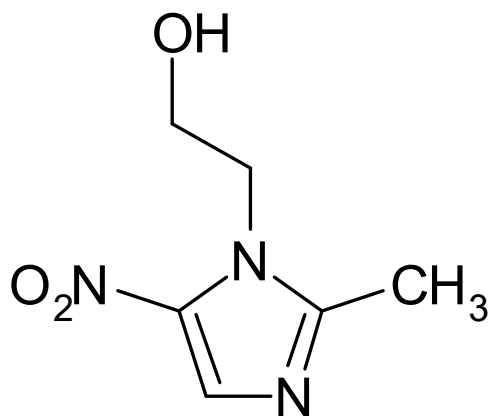
izolován z *Artemisia annua*

špatná biol. dostupnost

„znovuobjevila“ Jou-jou Tchu (You-you Tu), Nobelova cena za medicínu 2015



Antiprotozoika  
**Deriváty 5-nitroimidazolu**

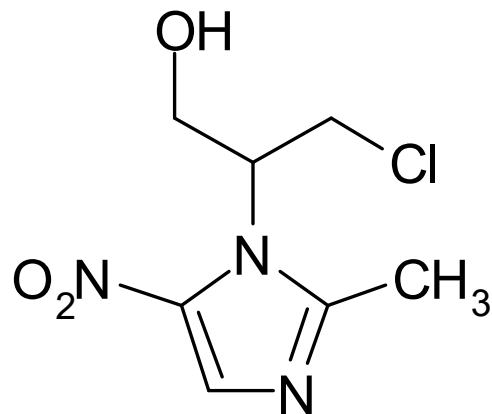


**metronidazol**

Entizol<sup>®</sup> tbl., tbl. vag.

•spektrum: Trichomonas vaginalis, Entamoeba histolytica, anaerobní mikroby

•mechanismus: narušení metabolismu



**ornidazol**

Avrazor<sup>®</sup> inj.

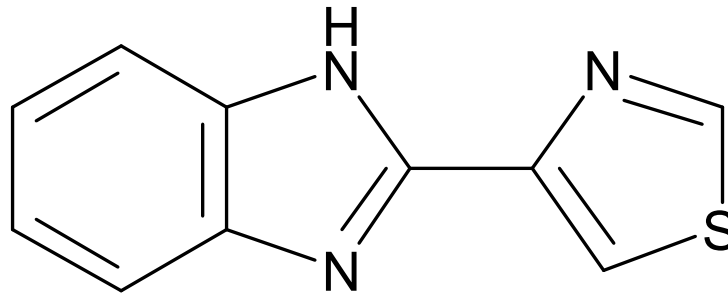
•spektrum: Trichomonas vaginalis, Entamoeba histolytica, Giardia intestinalis, Bacteroides, anaerobní mikroby

•mechanismus: narušení metabolismu

## Anthelmintika

= látky působící proti cizopasným červům

### Deriváty benzimidazolu



### thiabendazol

Mintezol® tbl.

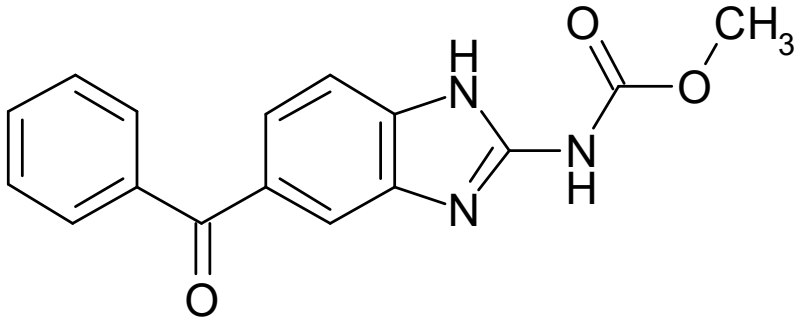
•též fungicidní účinky

# Anthelmintika

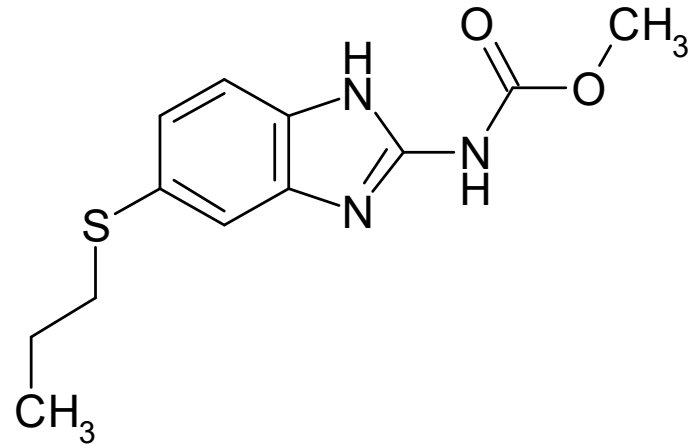
## Deriváty benzimidazolu

### Methyl-1H-benzimidazol-2-karbamáty

• mech. účinku: selektivní inhibice mitózy helmintů a prvoků (vazba na tubulin)



**mebendazol**  
Vermox<sup>®</sup> tbl.

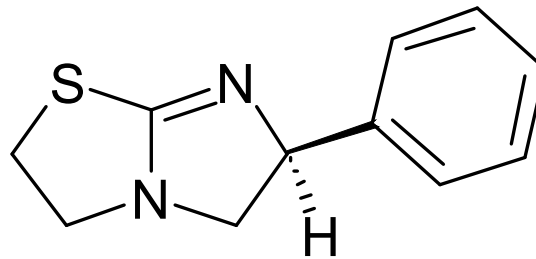


**albendazol**  
Zentel<sup>®</sup> por. sus.

•spektrum: *Enterobius vermicularis*, *Trichuris trichiura*, *Ascaris lumbricoides*, *Ancylostoma duodenale*, *Strongyloides strercoralis*, *Taenia spp. aj.*, též prvoci *Girardia lamblia*, *Trichomonas vaginalis*

# Anthelmintika

## Deriváty imidazothiazolu



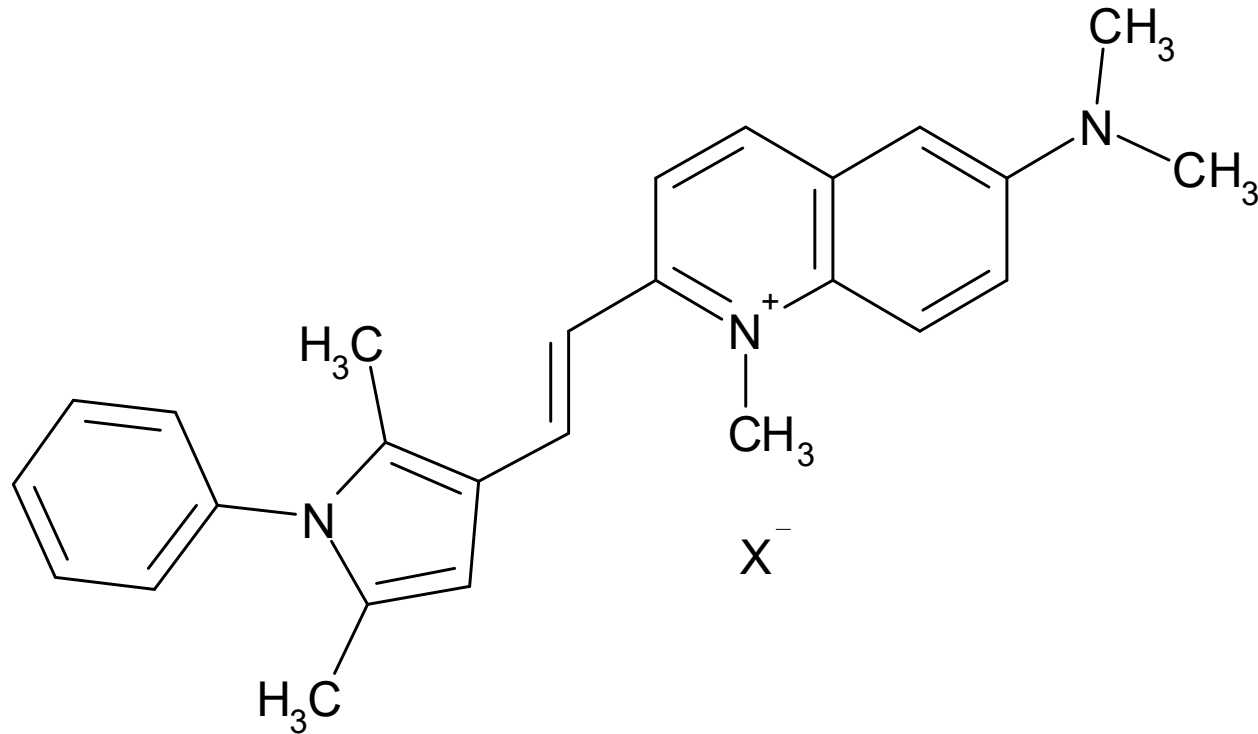
### levamizol

Decaris® tbl.

- askaridóza, ankylostomóza, strongyloidóza, trichocefalóza
- též imunomodulační účinky – použitelný při reumatoidní arthritidě, lupus erythematodes

Anthelmintika

**Deriváty chinolinu**

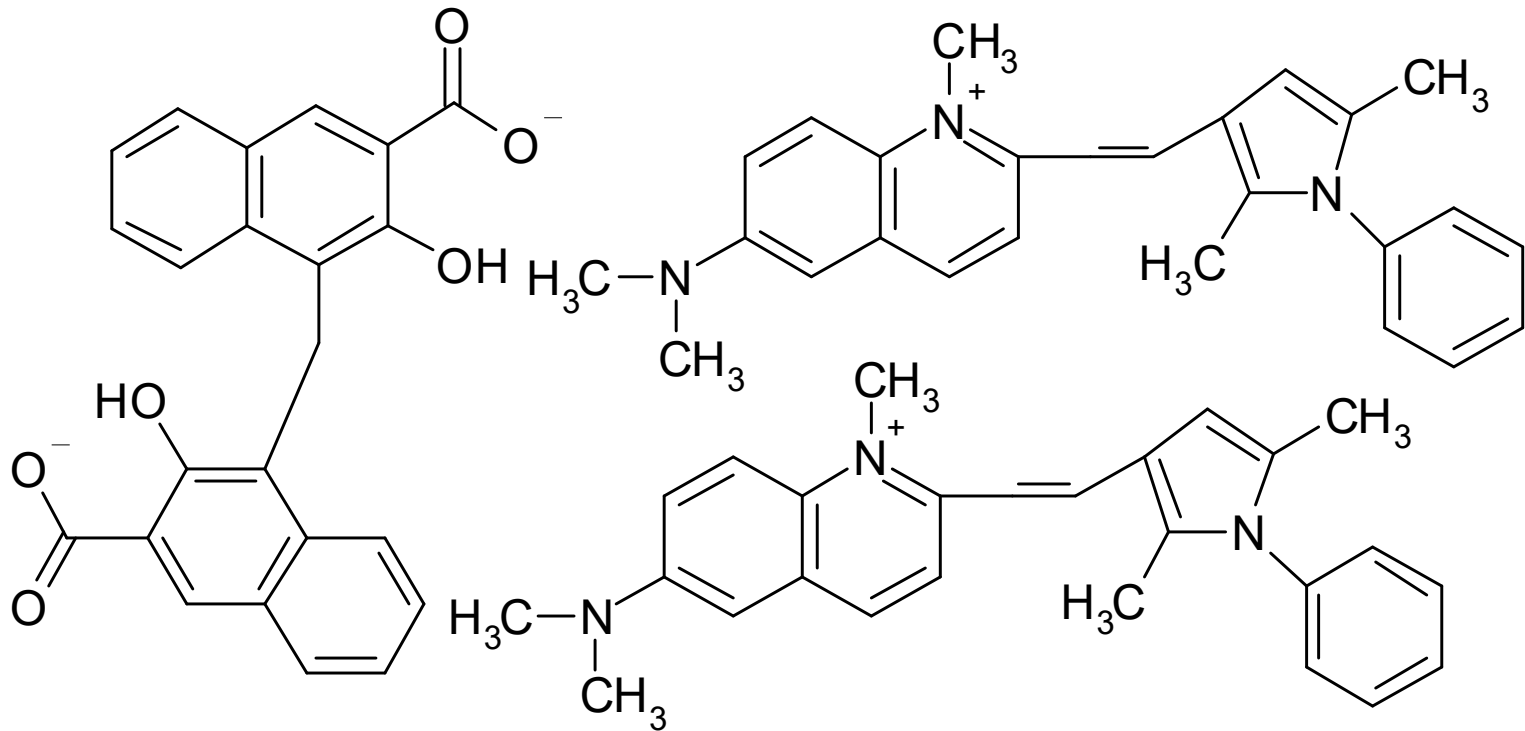


**pyrvinium**

Pyrvinium<sup>®</sup> susp. (jako embonát, tj. sůl s 4,4-methylenbis(3-hydroxynaftalen-2-karboxylovou) kyselinou)

•*Enterobius vermicularis*

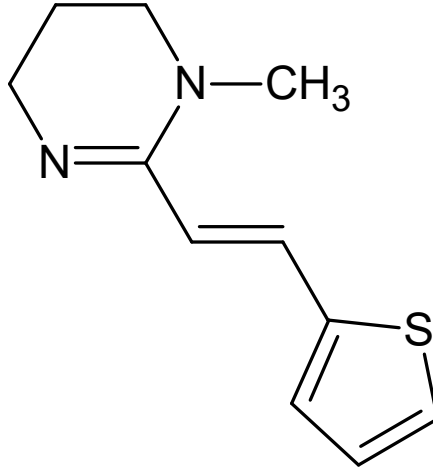
# Pyrvinium embonát



•pyrvinium embonát (syn. pamoát)

# Anthelmintika

## Deriváty tetrahydropyrimidinu



1-methyl-2-[(*E*)-2-(thiophen-2-yl)ethenyl]-1,4,5,6-tetrahydropyrimidine

### **pyrantel**

- mechanism of action: depolarizing neuromuscular-blocking agent, that causes persistent nicotinic activation resulting in spastic paralysis of susceptible nematodes
- drug of second-choice after benzimidazoles for treatment of ascariasis, hookworm, and pinworm infections léčbu askariázy, infekcí měchovci a roupy
- effective after a single dose

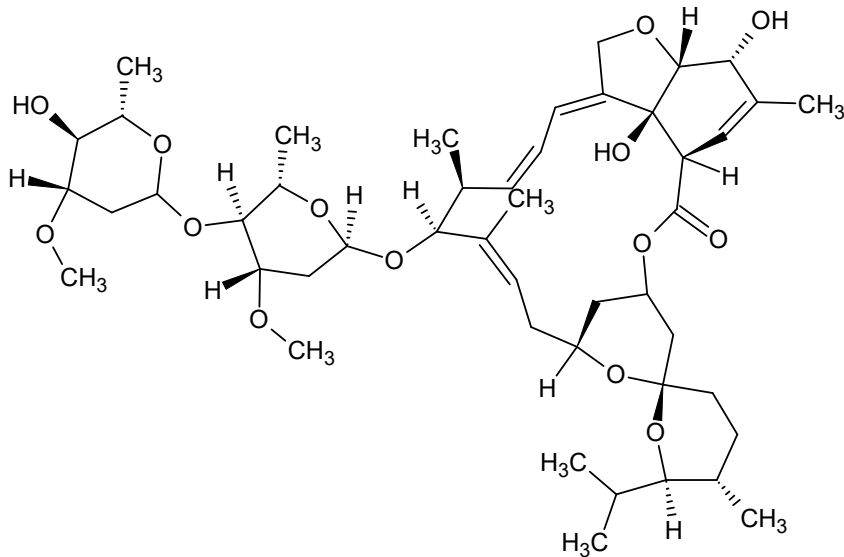




# Anthelmintika

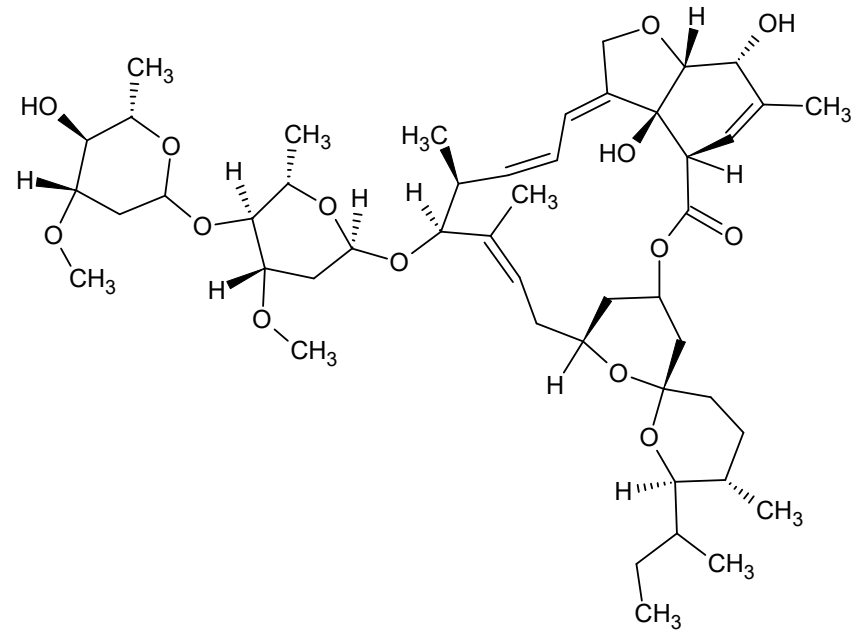
## Makrolidy

### Ivermektin



avermektin H2B1a

- většina

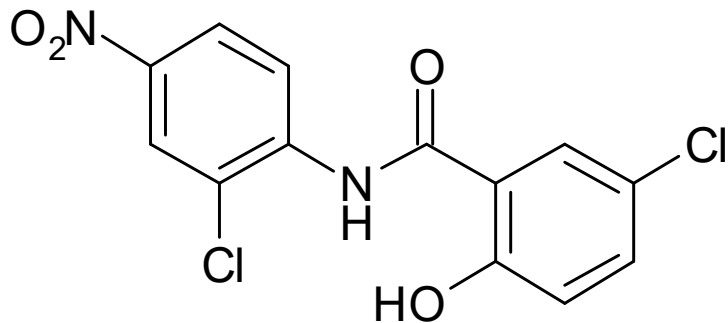


avermektin H2B1b

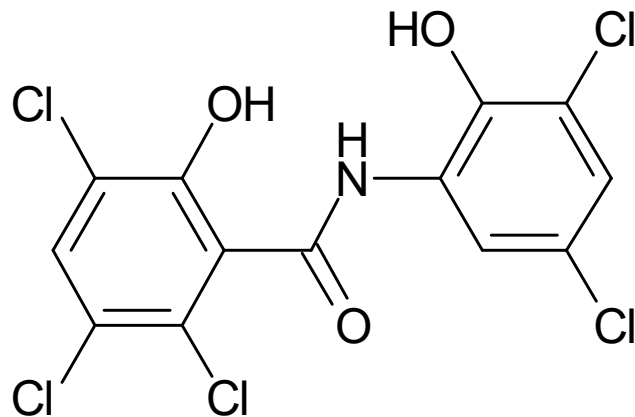
- příměs

- ze *Streptomyces avermitilis* izoloval Satoshi Omura
- Nobelova cena za medicínu 2015 (+William Campbell, Jou-jou Tchu)
- proti *Onchocerca volvulus* (filariáza), zasahuje pouze mikrofilarie, ne dospělce
- MÚ: vazba na Glu-řízený Cl<sup>-</sup> kanál ⇒ ↑permeabilita + hyperpolarizace nervových a svalových bb.; interaguje i s dalšími Cl<sup>-</sup> kanály

Anthelmintika  
**Halogenované salicylanilidy**

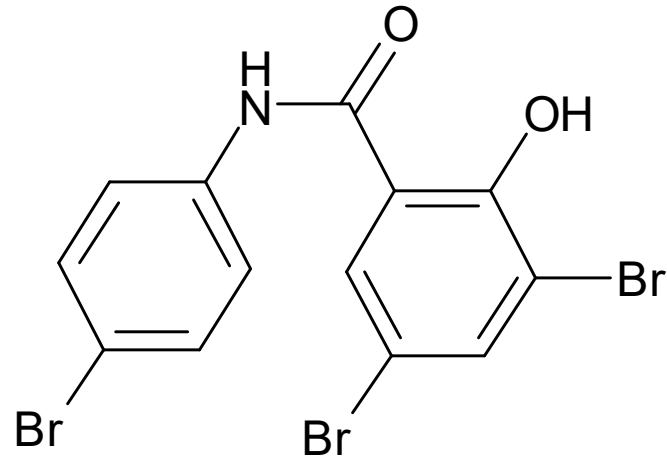


**niklosamid**



**oxyklozanid**

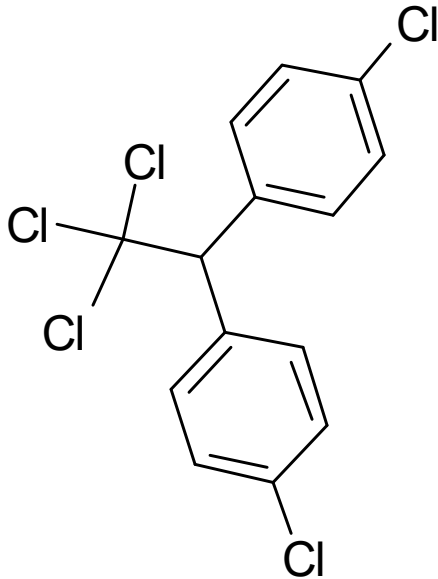
Anthelmintika  
**Halogenované salicylanilidy**



**tribromsalan**

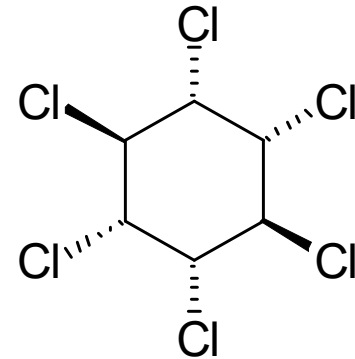
# Insekticida

## Chlorované sloučeniny



### DDT

- zásadní podíl na vyhubení komárů šířících malárii a žlutou zimnici
- kumuluje se v organismu i v přírodě ⇒  
**nepoužíván**



$\gamma$ -hexachlorcyklohexan

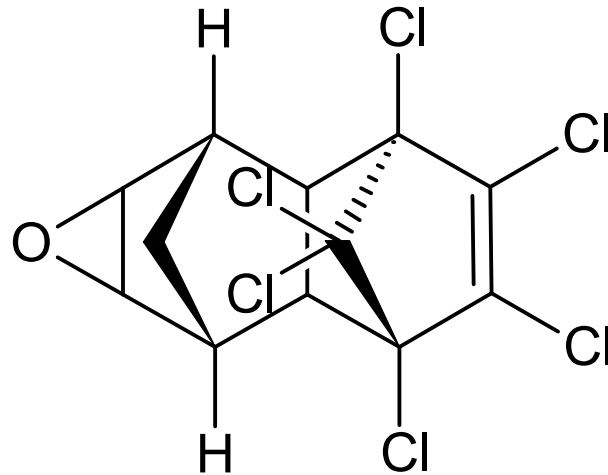
### lindan

Skabacid® drm. eml.

- spektrum: *Sarcoptes scabiei*, *Phthirus pubis*, *Pediculus capitis*
- povrchová léčba svrabu

•kontaktní, alimentární a inhalační nervové jedy pro hmyz

Insekticida  
Chlorované sloučeniny



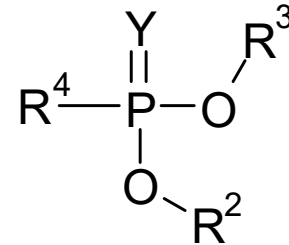
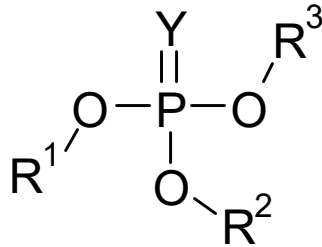
**dieldrin**

- MÚ: inhibice GABA-receptorů
- obsolentní; rezistence, rezidua v přírodě

## Insekticida

Organické sloučeniny fosforu

**Estery kyseliny (thio)fosforečné, kyselin (thio)fosfonových a jejich prekurzory**



Y= O, S

R<sup>1</sup>- R<sup>4</sup> = alkyl, aryl

**organofosfáty,  
organothiofosfáty**

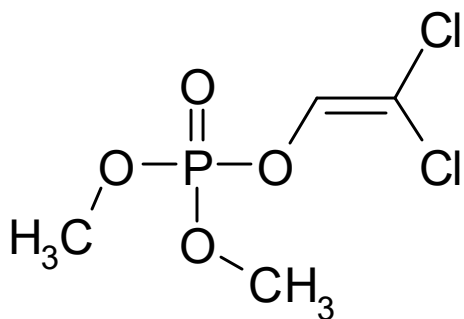
**organofosfonáty,  
organothiofosfoáty**

·irreverzibilní inhibitory cholinesterasy

# Insekticida

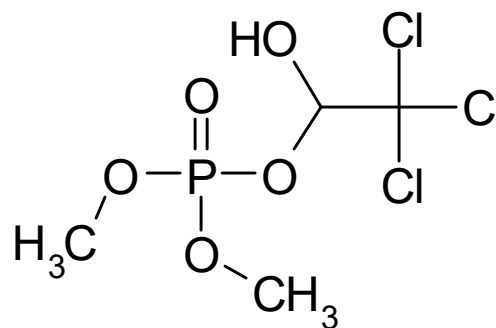
Organické sloučeniny fosforu

## Estery kyseliny fosforečné a kyselin fosfonových



**dichlorvos**

Nuvan Top<sup>®</sup> spray a.u.v.



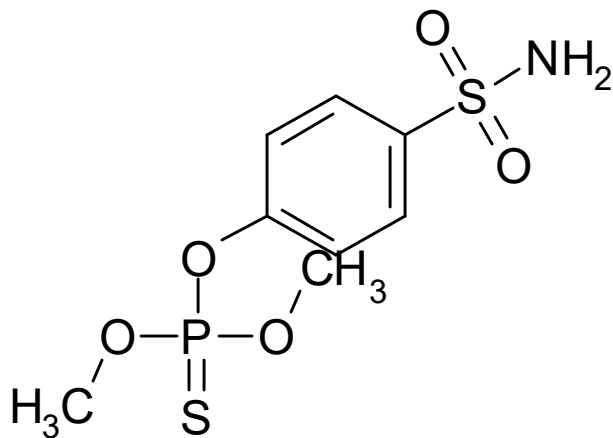
**metrifonát**

Arpalit<sup>®</sup> spray a.u.v.

# Insekticida

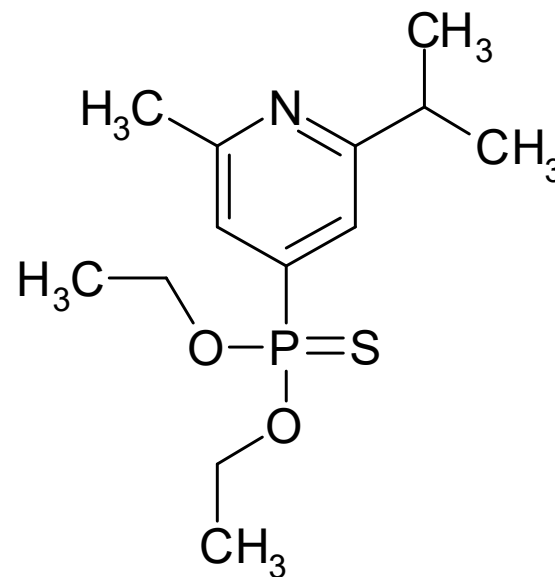
Organické sloučeniny fosforu

## Estery kyseliny thiofosforečné a kyselin thiofosfonových



**cythiotát**

Cyflée® sol. a.u.v.



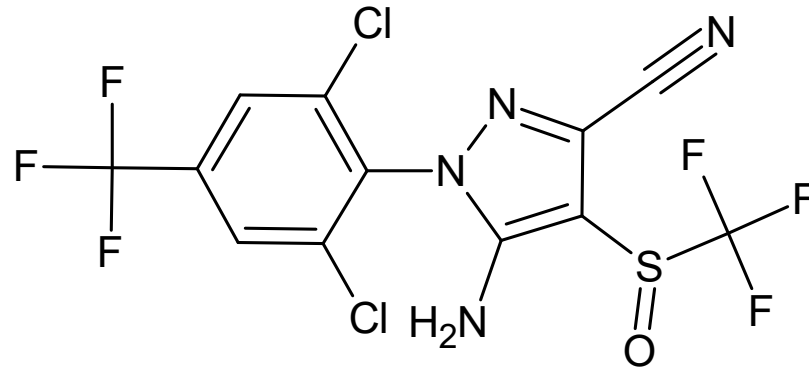
**dimpylát**

Droplix® a.u.v.

·absorbuje se transkutánně, hubí parazity na celém těle



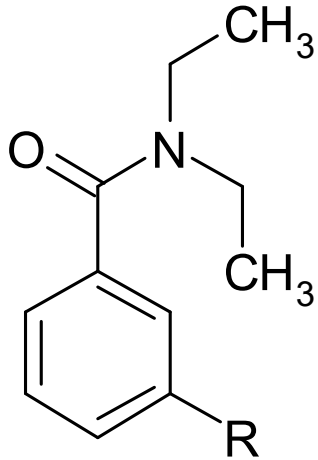
Insekticida  
Selektivní inhibitory GABA-receptorů



**fipronil**

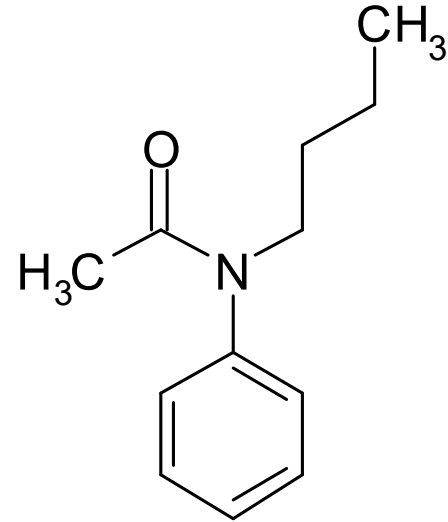
- blokuje hmyzí GABA-receptory, které se zásadně strukturou i funkcí liší od savčích
- vysoká selektivní toxicita pro hmyz

## Repelenty



R = H  
N,N-diethylbenzamid

R = CH<sub>3</sub>  
N,N-diethyl-*m*-toluamid  
(= diethylamid 3-methylbenzoové kys.)



N-butylacetanilid  
(= N-butyl-N-fenylacetamid)

- používány v repelentních gelech, krémech a roztocích v koncentracích 10 – 20 %