

H₂-ANTIHISTAMINIKA

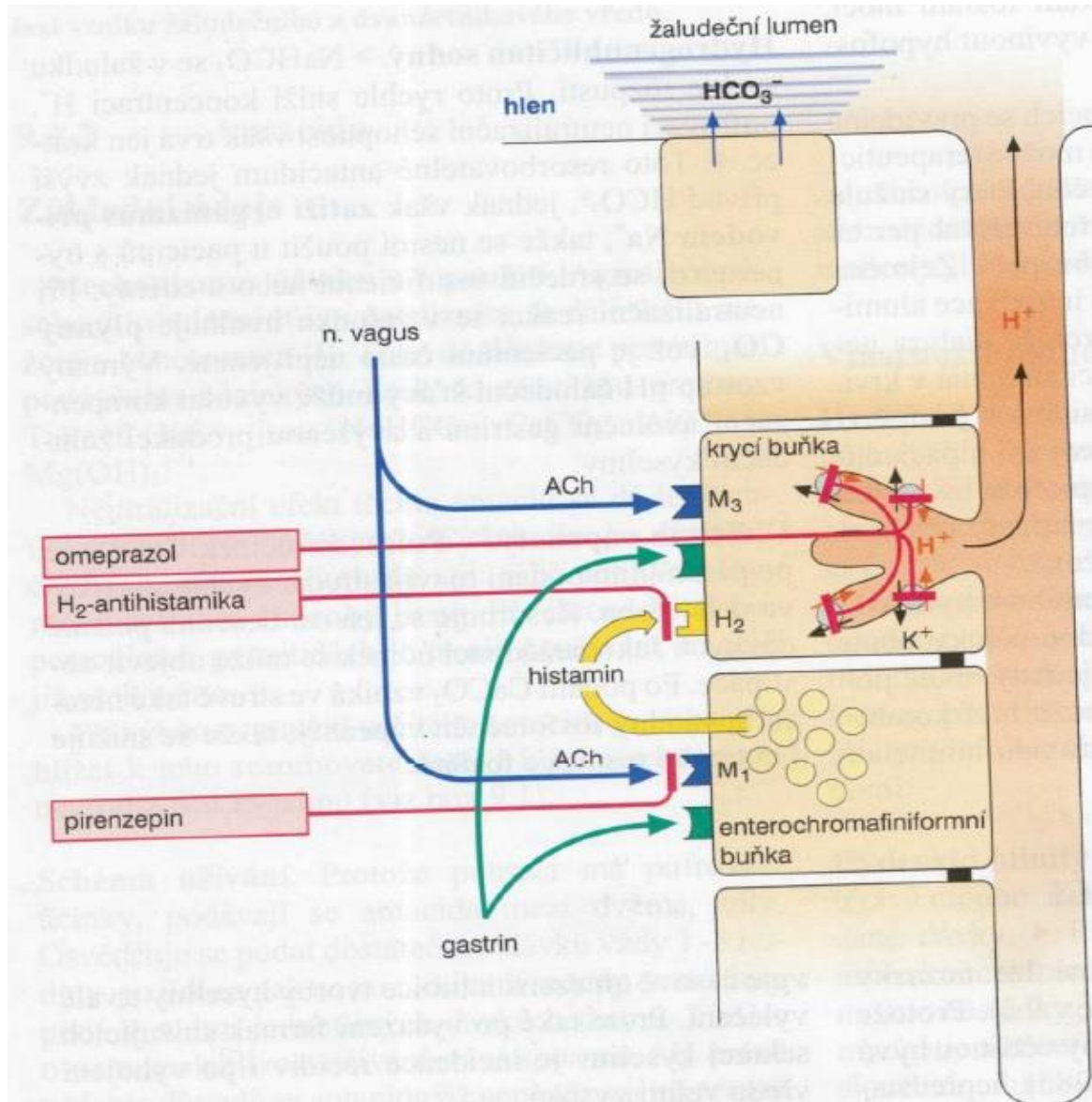
Funkce žaludeční sliznice

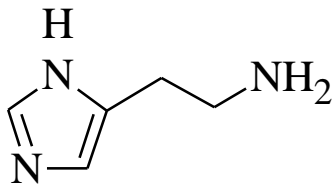
Hlavní buňky produkují působením prostaglandínů hlen a ionty HCO_3^- .

Krycí buňky (parietální) prostřednictvím H^+/K^+ -ATPáz mohou do žaludečního lumen secernovat H^+ (přednostně stimuluje histamin vazbou na H_2 receptory).

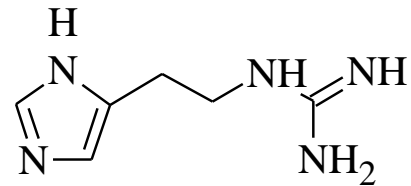
Histamin uvolňují sousední buňky podobné enterochromafinním buňkám.

Funkce žaludeční sliznice a jejich farmakologické ovlivnění

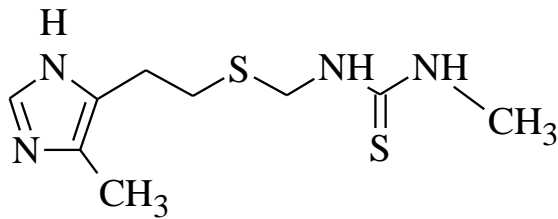




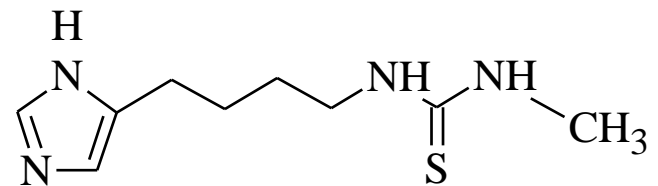
histamin



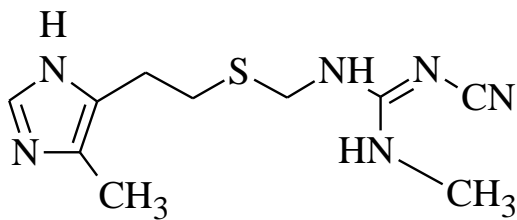
N-guanylhistamin



metiamid



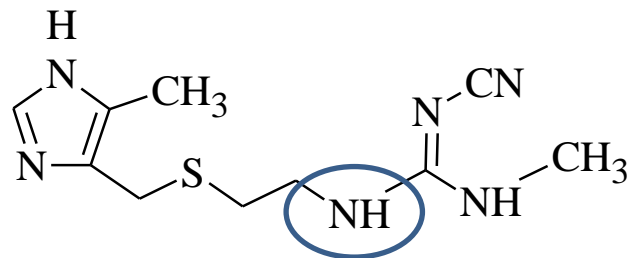
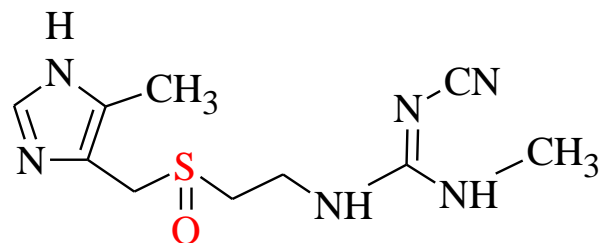
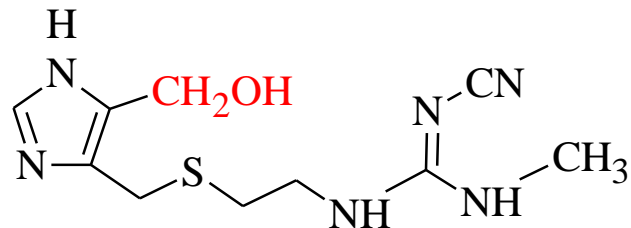
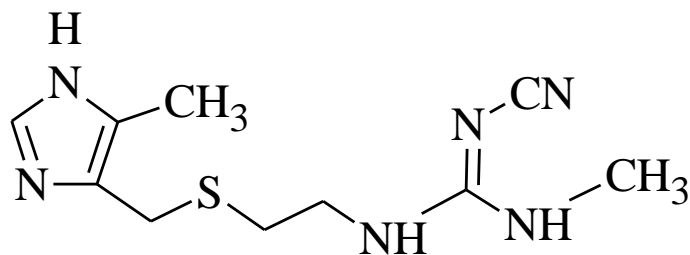
burimamid



cimetidin

CIMETIDIN

METABOLISMUS



N-glukuronid

- pro účinek nutná přítomnost methylu na C_5
- potvrzené vodíkové můstky mezi N imidazolu a postranní methylaminovou skupinou - náhrada vodíku methylom \downarrow účinek

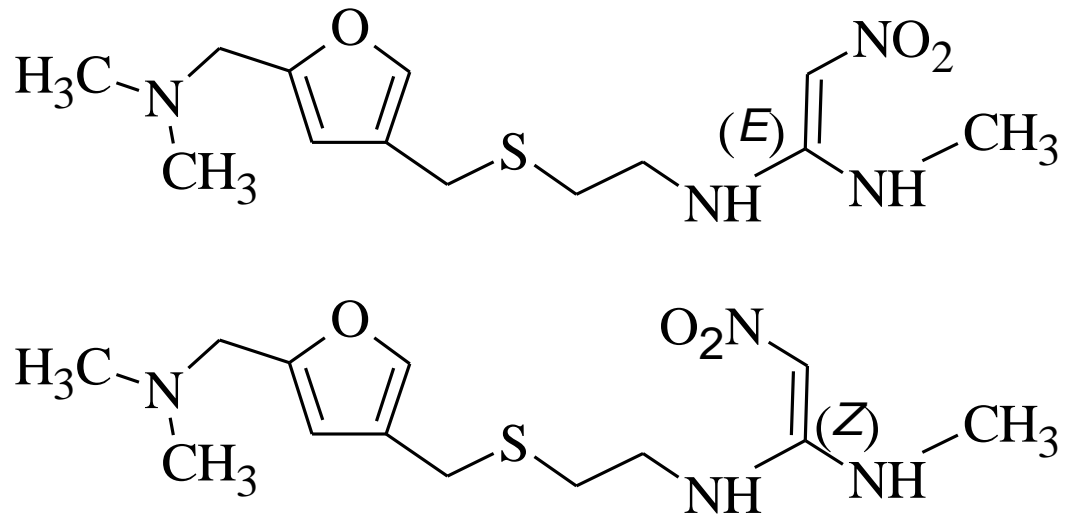
Vlastnosti

- bazální a stimulovanou sekreci HCl žaludeční sliznicí **snižuje**, protože produkce HCl je v nočních hodinách zvýšená
- cimetidin a ostatní H₂ antihistaminika sa podávají ve večerních hodinách
- při dlouhodobé aplikaci se objevují gynecomastie a u mužů impotence

Indikace

Žaludeční a duodenální vředy, stavy hyperaciditity, refluxní ezofagitída

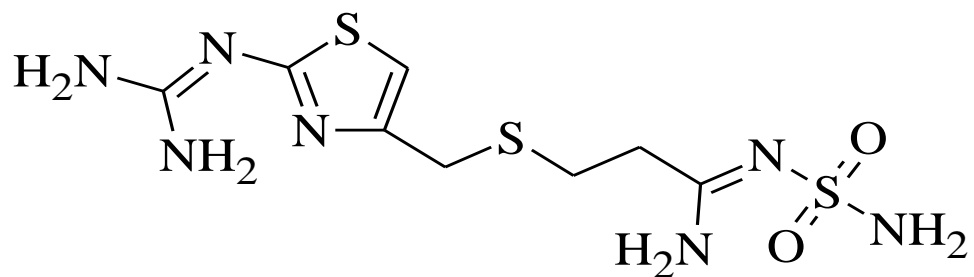
RANITIDIN - oproti cimetidinu účinnější



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).

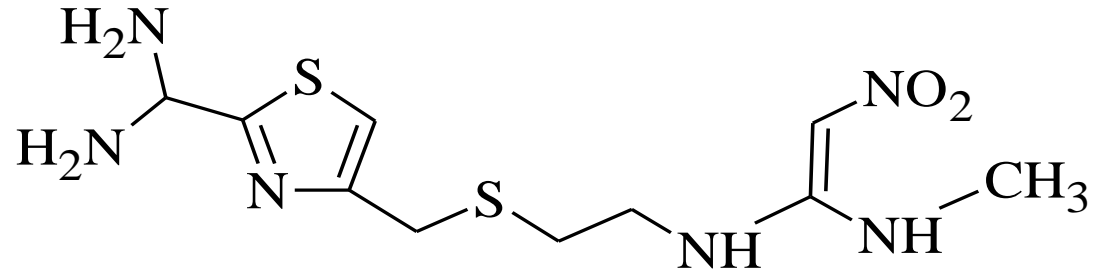
FAMOTIDIN - antihistaminikum s prodlouženým účinkem



INDIKACE

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

NIZATIDIN

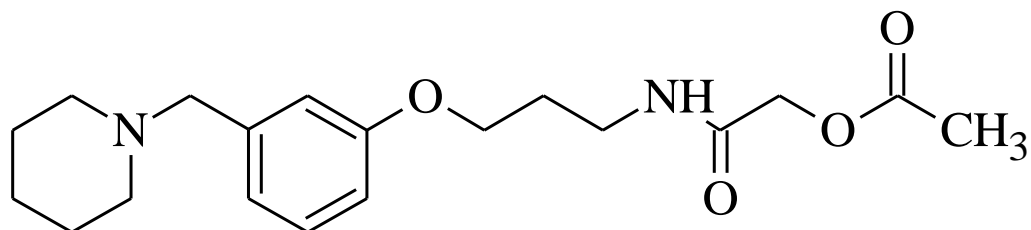


Indikace

Je podobná famotidinu

Deriváty a analoga fenoxypopylamínu

ROXATIDINACETÁT



INDIKACE

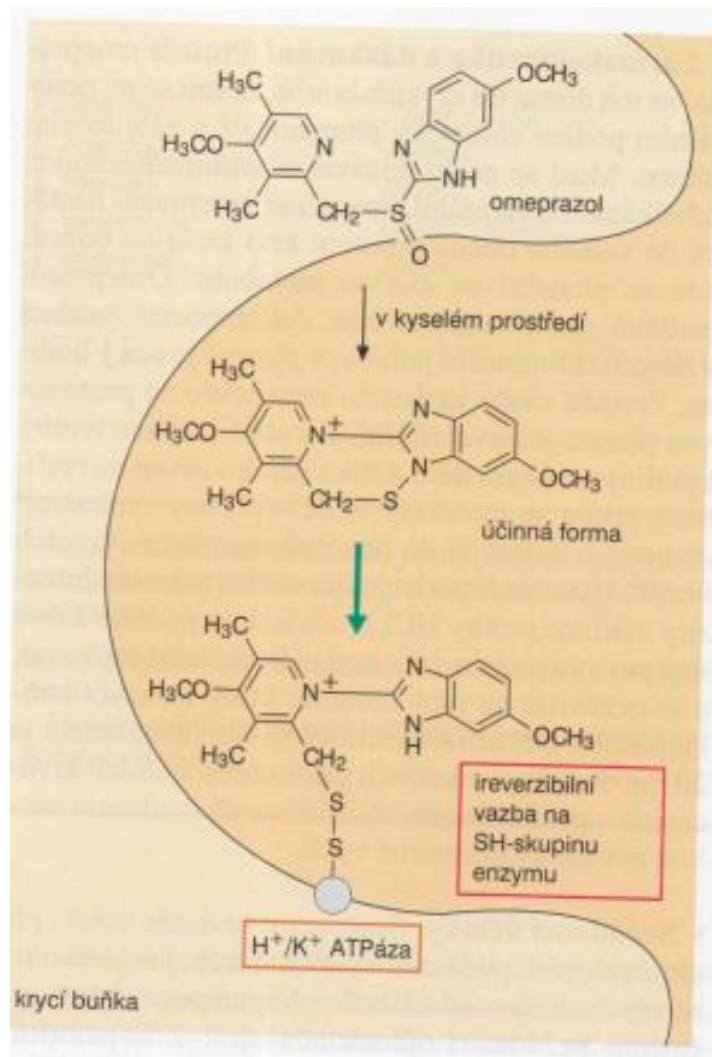
Terapie žaludečních vředů , Zollinger-Ellisonův syndrom , erozivní esofagitida , gastroezofageální reflux, a gastritidy

Inhibitory $H^+/K^+ATPázy$ - protonové pumpy

Enzym je lokalizován na luminální straně krycích buněk a transportuje protony proti koncentračnímu gradientu z buňky do žaludeční šťávy.

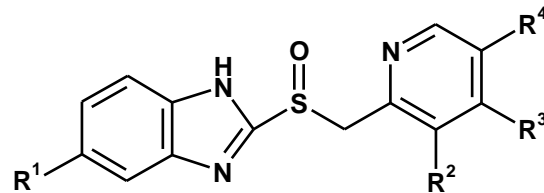
MÚ: benzimidazolový derivát se hromadí v silně kyselém prostředí kanalikulárního aparátu krycí buňky a přeměňuje se na reaktivní metabolit, který se kovalentně váže na $H^+/K^+ATPázu$ krycí buňky.

Aktivace omeprazolu na účinný inhibitor H^+/K^+ ATPázy



H. Lüllmann et. al. Farmakologie a toxikologie str. 273

Prazoly



R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
	-CH ₃		-CH ₃	omeprazol (1979)
H	-CH ₃		H	lansoprazol (1986)
			H	pantoprazol (1986)
H	-CH ₃		H	rabeprazol (1988)

Indikace: Gastroduodenální vředová choroba, gastritida, gastroezofageální reflux, Zollingerův-Ellisonův syndrom - nadbytek gastrinu - aj.
Z vedlejších projevů se mohou dostavit poruchy GIT. Zvýšená opatrnost je nutná při podávání vyšších dávek pro nebezpečí vzniku očních a ušních poruch.