

Antiparazitika

= látky používané k terapii parazitárních nemocnění

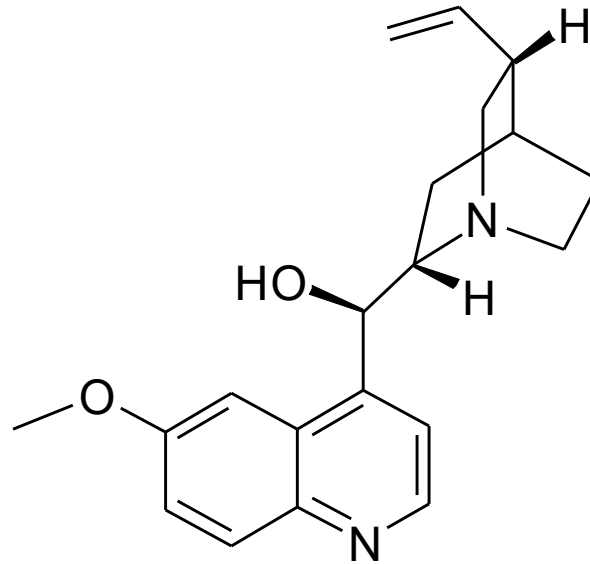
1. **Antoprotosoika**
2. **Anthelmintika**
3. **Insekticida a repelenty**

Antiprotozoika

= látky působící proti patogenním prvokům

Antimalarika

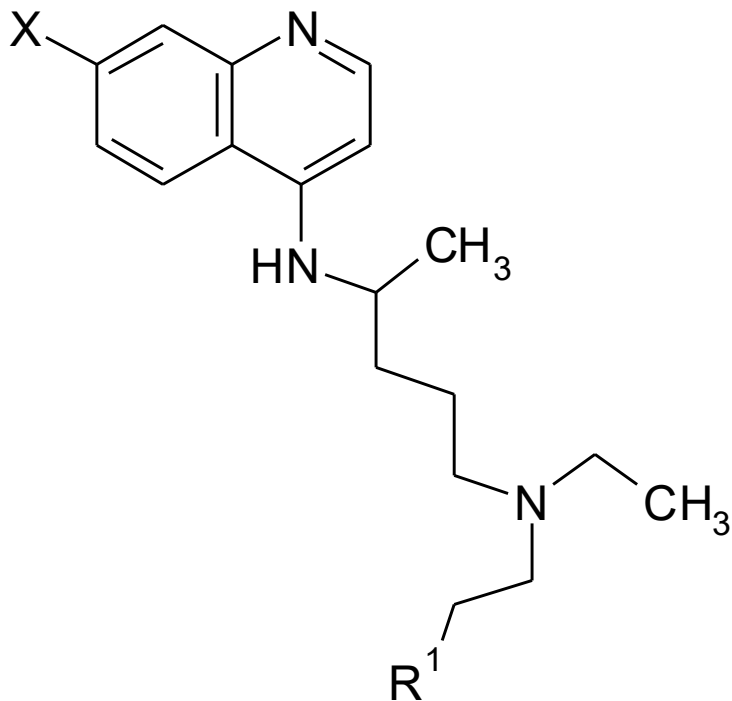
•původce malarie – prvoci rodu Plasmodium: P. vivax, P. falciparum, P. malariae, P. ovale



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 R¹ = H **chlorochin**

Delagil[®] tbl.

X = F R¹ = H **fluorochin**

X = Cl R¹ = OH **hydroxychlorochin**

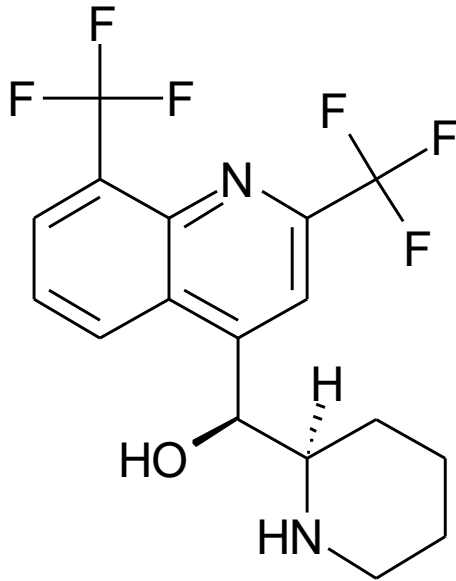
Plaquenil[®] drg.

•též léčba reumatoidní arthritidy

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

Antimalarika

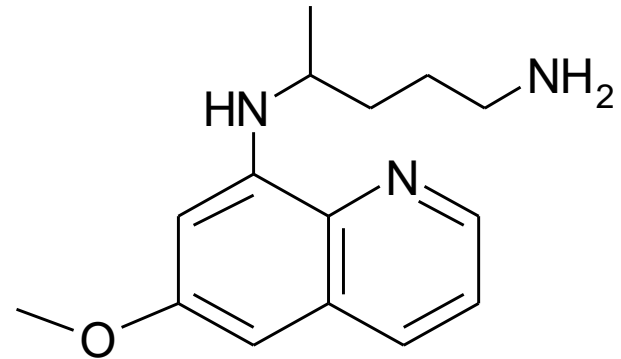
Deriváty chinolinu



meflochin

Lariam® tbl.

• i jako profylaxe před cestou do tropických oblastí

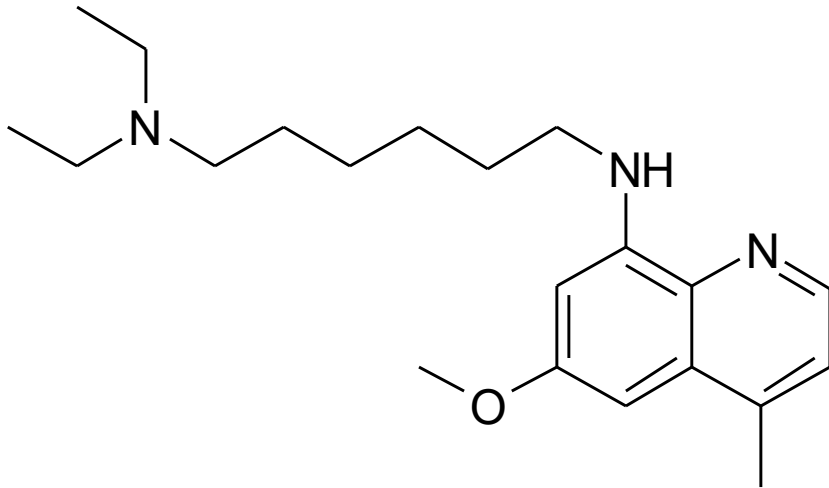


primachin

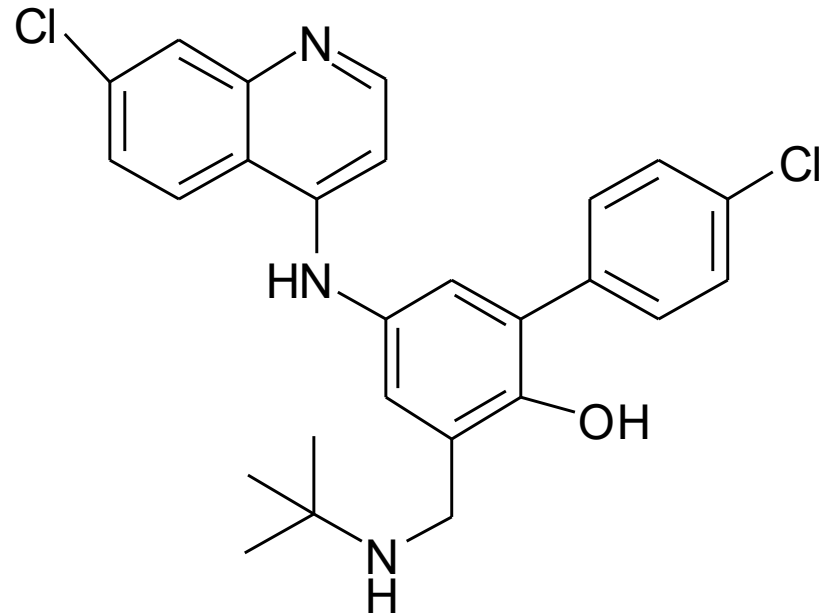
Primaquine® tbl. obd.

Antimalarika

Deriváty chinolinu



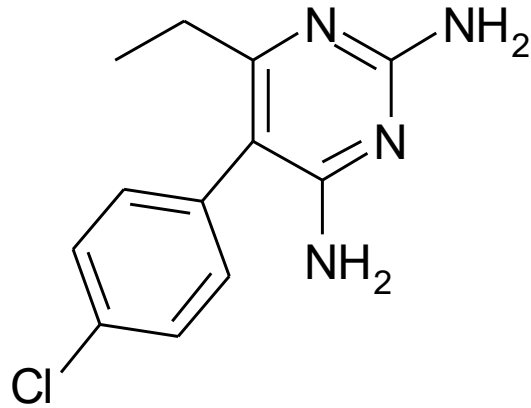
simatachin



tebuchin

Antimalarika

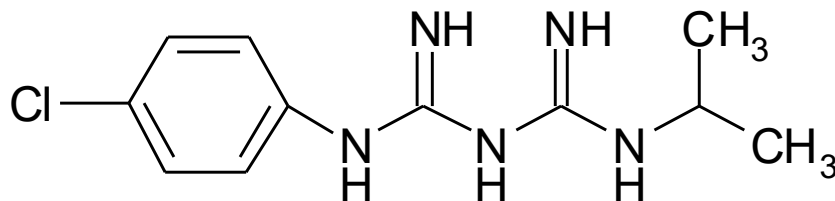
Deriváty pyrimidinu



pyrimethamin
Daraprim®

Antimalarika

Deriváty biguanidu



proguanil

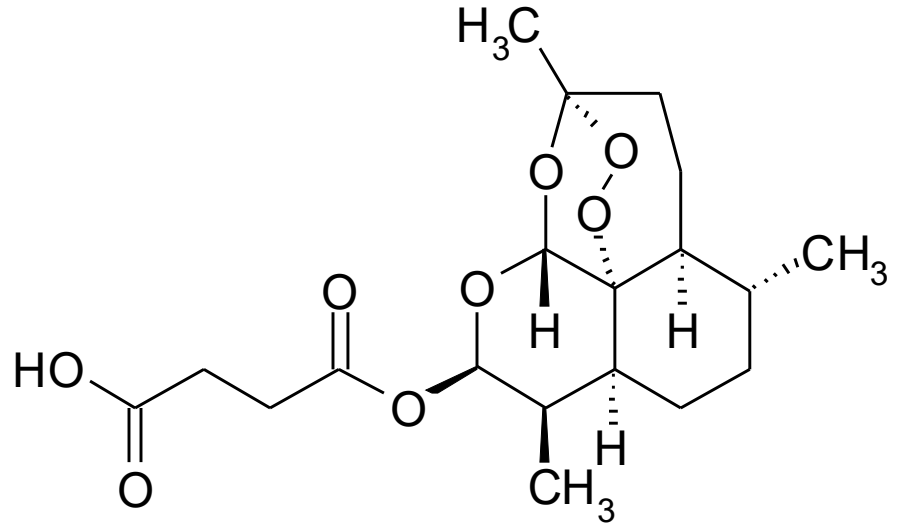
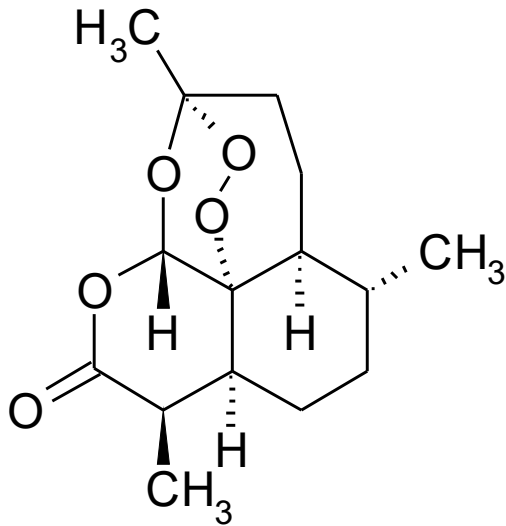
Paludrine®

- 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



artesanát

- používán jako sodná sůl pro i.m. podání

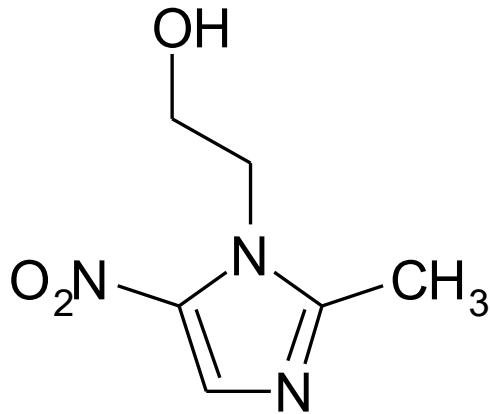
artemisinin

izolován z *Artemisia annua*

špatná biol. dostupnost

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

Antiprotozoika
Deriváty 5-nitroimidazolu

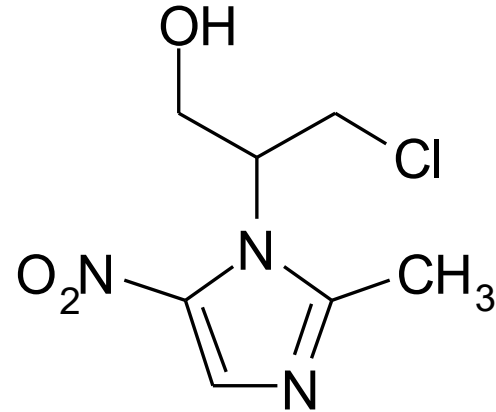


metronidazol

Entizol[®] tbl., tbl. vag.

•spektrum: *Trichomonas vaginalis*, *Entamoeba histolytica*, anaerobní mikroby

•mechanismus: narušení metabolismu



ornidazol

Avrazor[®] inj.

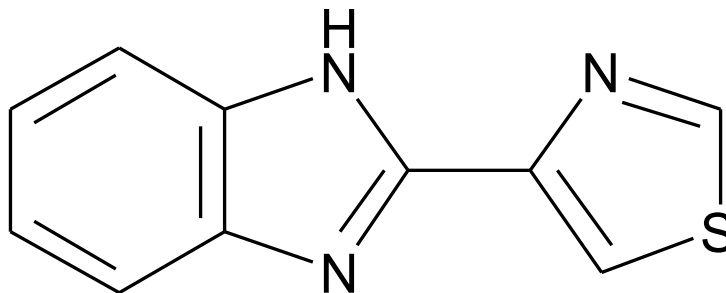
•spektrum: *Trichomonas vaginalis*, *Entamoeba histolytica*, *Giardia intestinalis*, *Bacteroides*, anaerobní mikroby

•mechanismus: narušení metabolismu

Anthelmintika

= látky působící proti cizopasným červům

Deriváty benzimidazolu



thiabendazol

Mintezol® tbl.

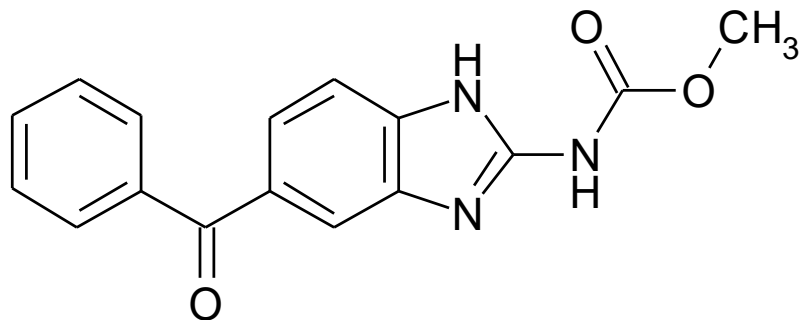
•též fungicidní účinky

Anthelmintika

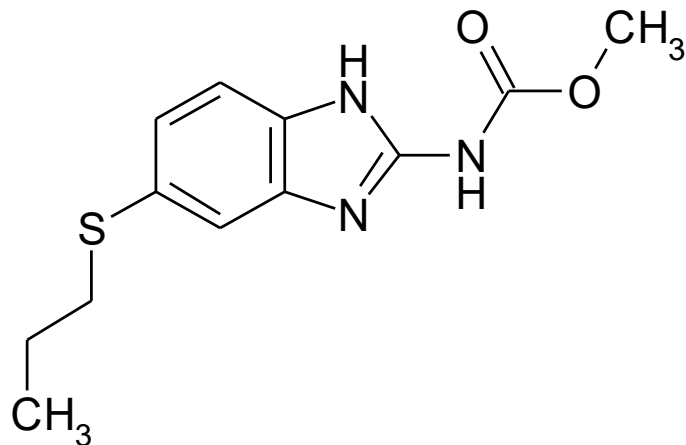
Deriváty benzimidazolu

Methyl-1H-benzimidazol-2-karbamátý

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



mebendazol
Vermox[®] tbl.

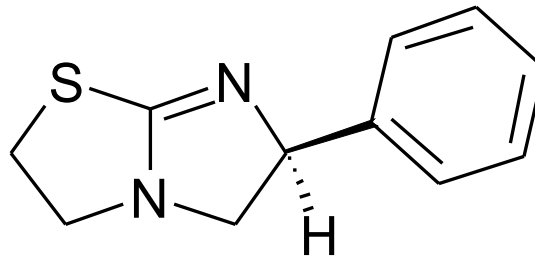


albendazol
Zentel[®] por. sus.

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

Anthelmintika

Deriváty imidazothiazolu

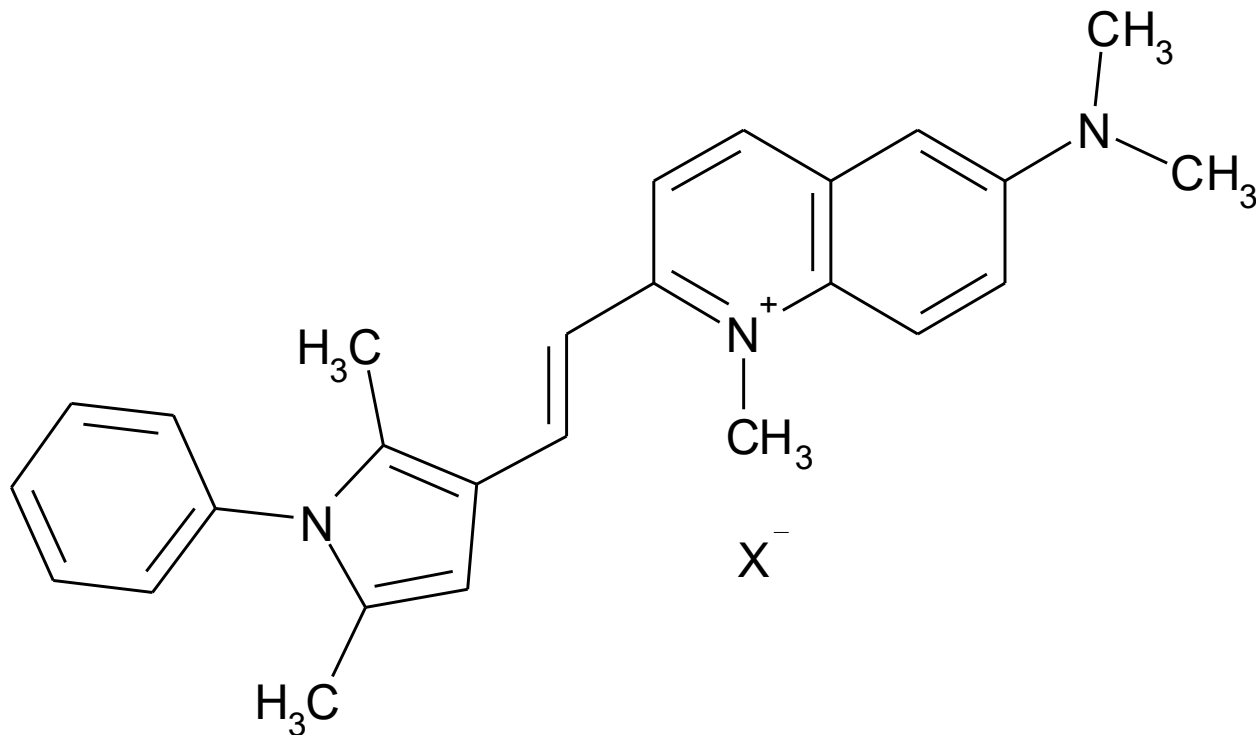


levamizol

Decaris[®] tbl.

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

Anthelmintika
Deriváty chinolinu

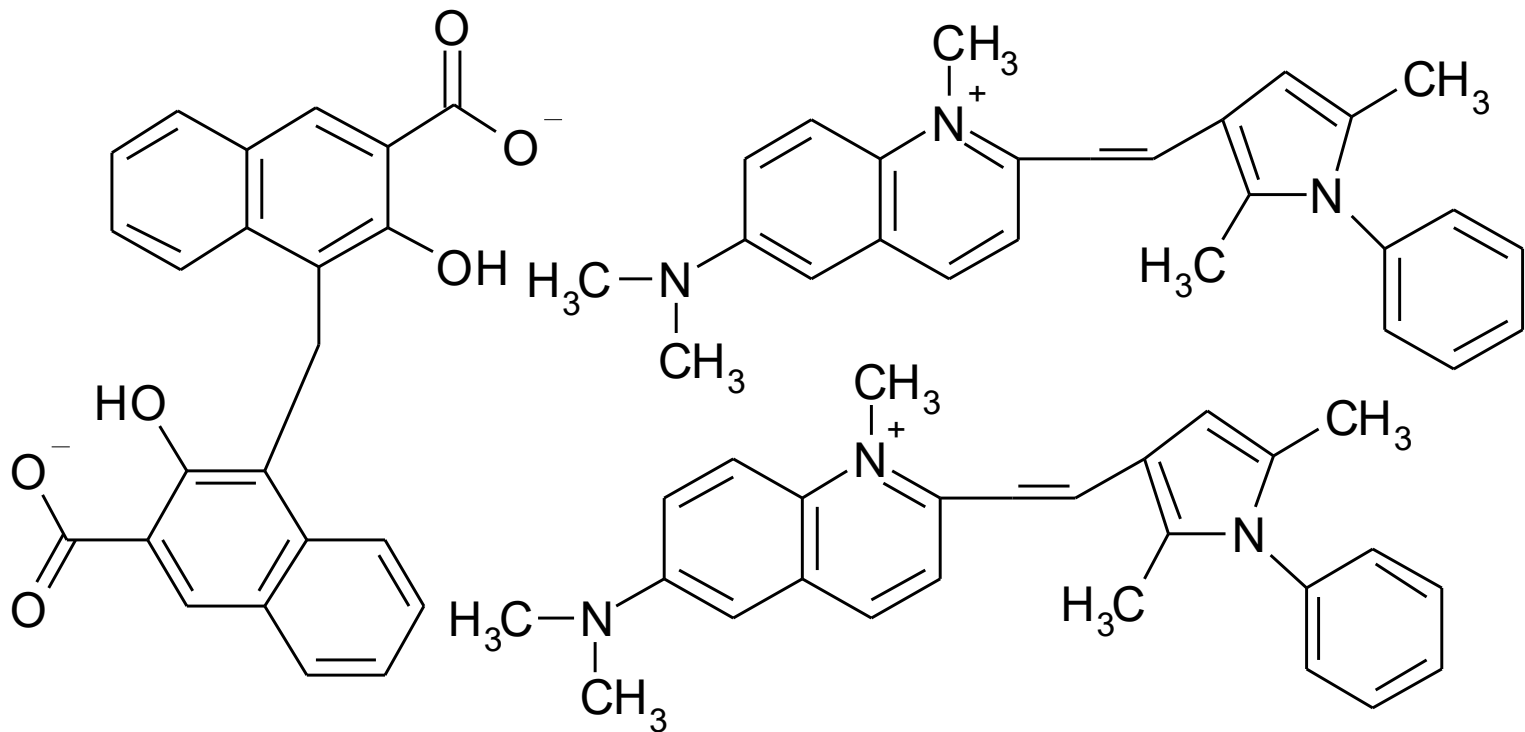


pyrvinium

Pyrvinium[®] susp. (jako embonát, tj. sůl s 4,4-methylenbis(3-hydroxynaftalen-2-karboxylovou) kyselinou)

•*Enterobius vermicularis*

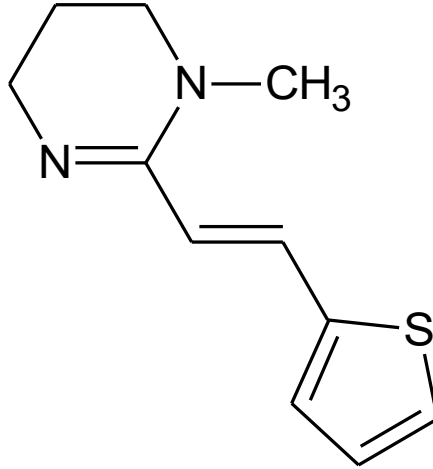
Pyrvinium embonát



·pyrvinium embonát (syn. pamoát)

Anthelmintika

Deriváty tetrahydropyrimidinu



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

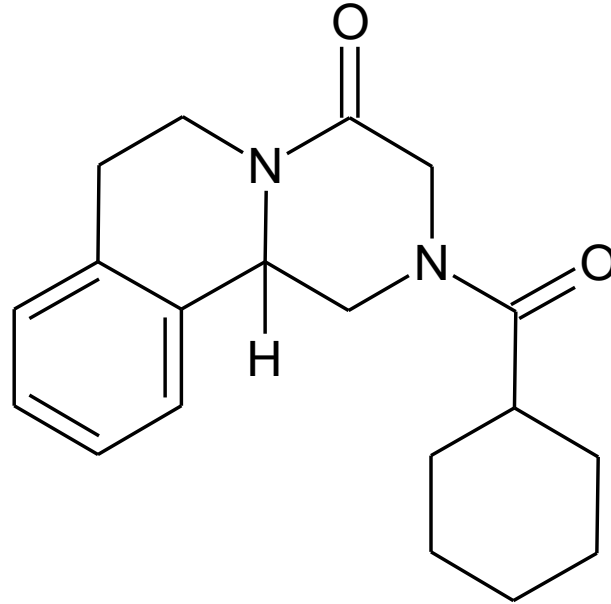
pyrantel

- 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

Deriváty

pyrazinisochinolinu



2-(cyclohexylcarbonyl)-1,2,3,6,7,11b-hexahydro-4*H*-pyrazino[2,1-*a*]isoquinolin-4-one

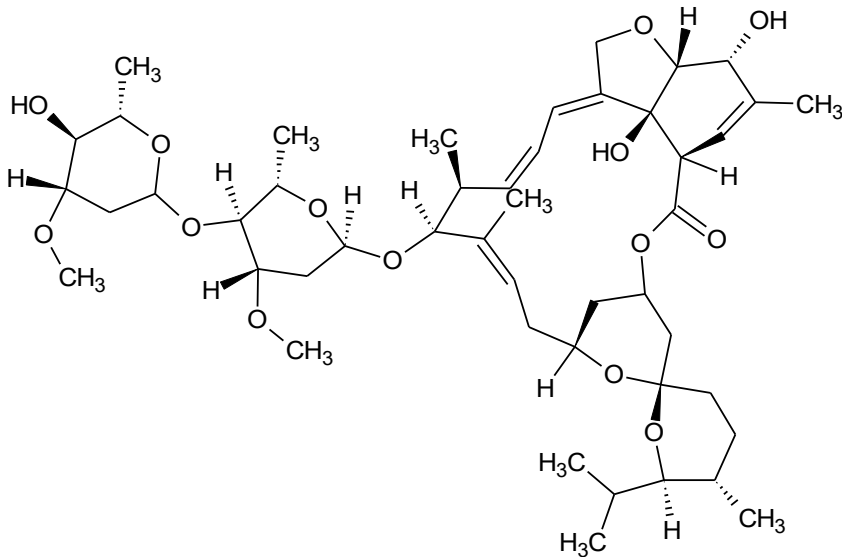
praziquantel

▪treatment of schistosomiasis (blood-flukes or bilharzia or *Schistosoma* infection)

Anthelmintika

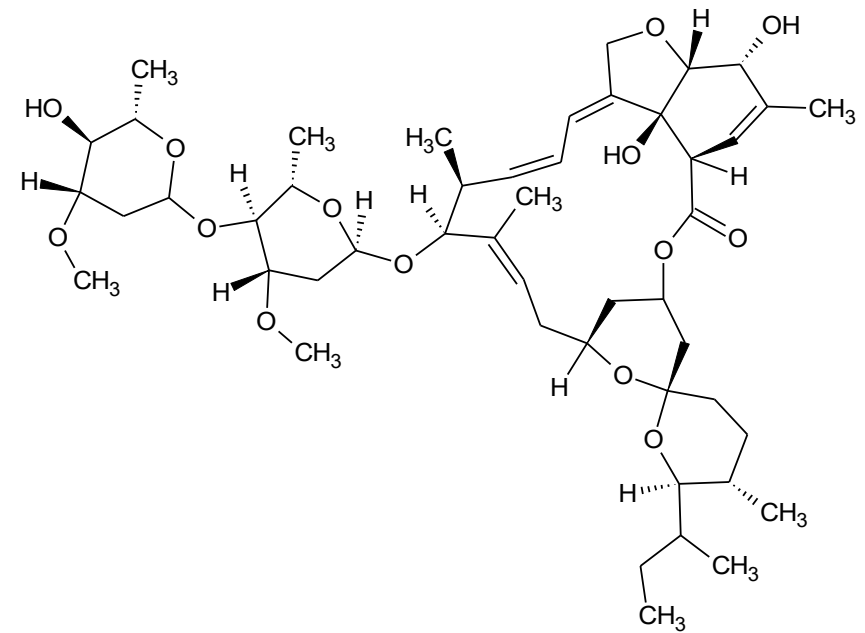
Makrolidy

Ivermektin



avermektin H2B1a

- většina

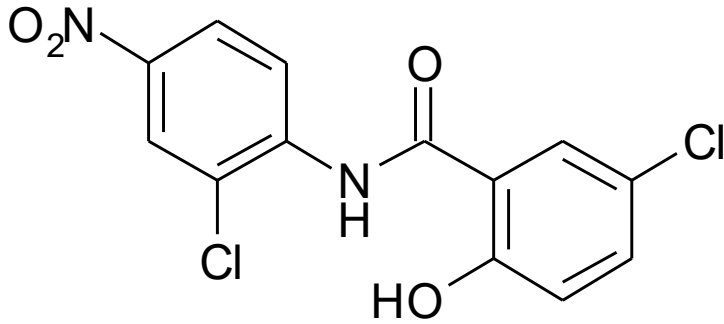


avermektin H2B1b

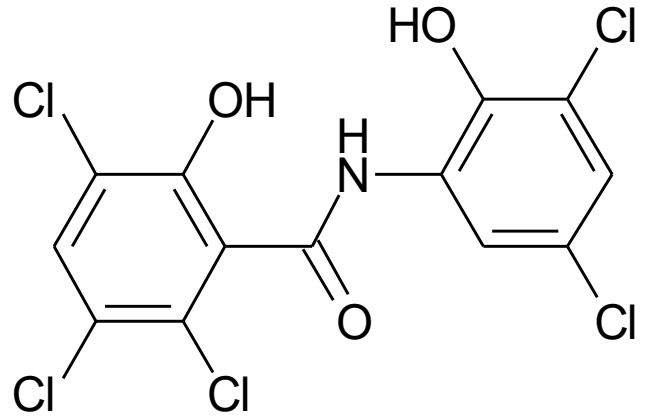
- příměs

- 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⁻ kanál ⇒ ↑permeabilita + hyperpolarizace nervových a svalových bb.; interaguje i s dalšími Cl⁻ kanály

Anthelmintika
Halogenované salicylanilidy

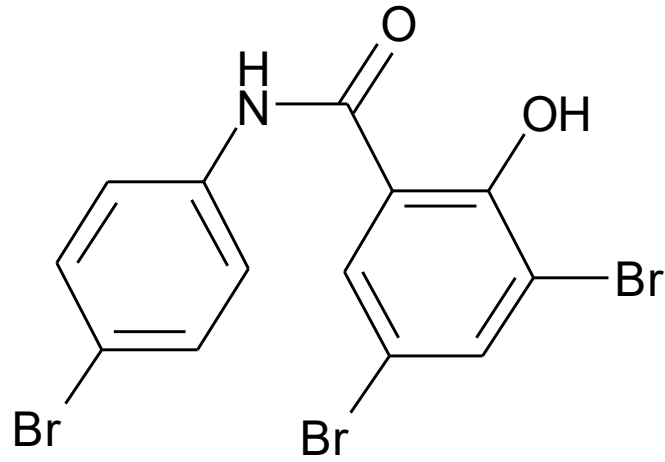


niklosamid



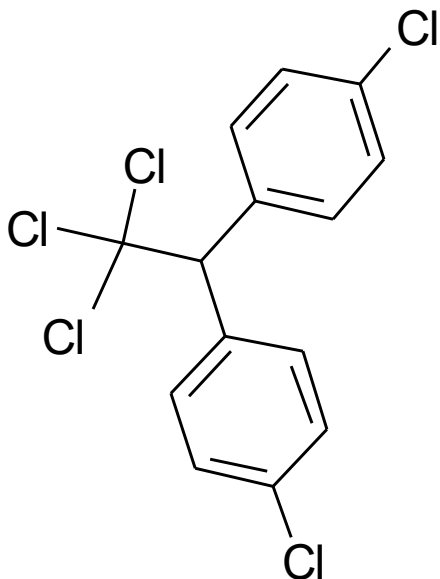
oxyklozanid

Anthelmintika
Halogenované salicylanilidy



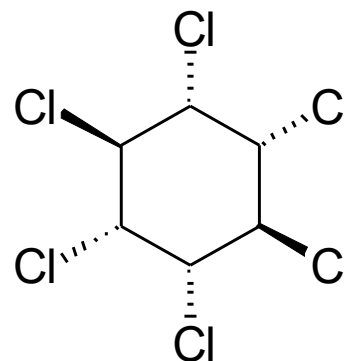
tribromsalan

Insekticida Chlorované sloučeniny



DDT

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



γ -hexachlorcyklohexan

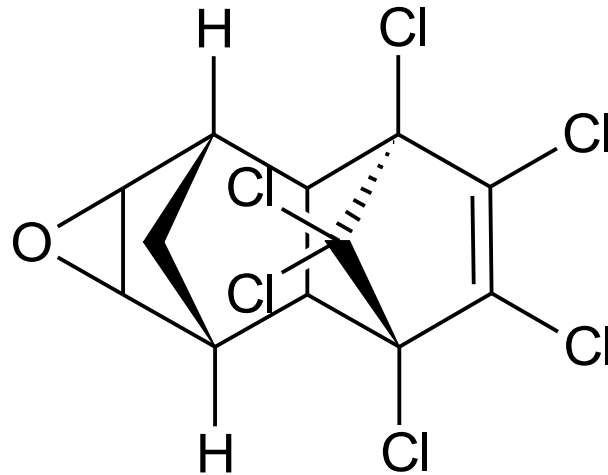
lindan

Skabacid® drm. eml.

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

•kontaktní, alimentární a inhalační nervové jedy pro hmyz

Insekticida
Chlorované sloučeniny



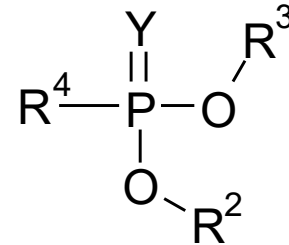
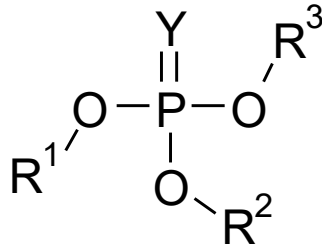
dieldrin

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

Insekticida

Organické sloučeniny fosforu

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



Y= O, S

R¹- R⁴ = alkyl, aryl

**organofosfáty,
organothiofosfáty**

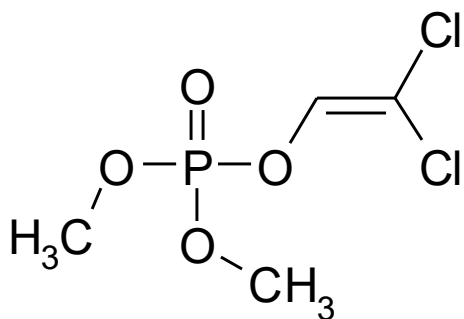
**organofosfonáty,
organothiofosfoáty**

·irreverzibilní inhibitory cholinesterasy

Insekticida

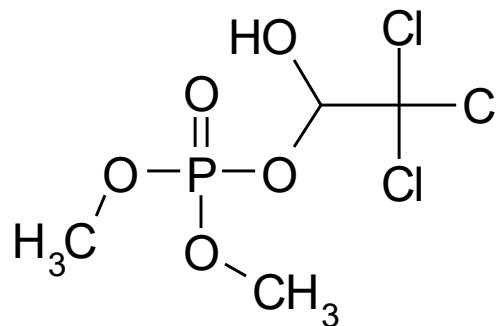
Organické sloučeniny fosforu

Estery kyseliny fosforečné a kyselin fosfonových



dichlorvos

Nuvan Top® spray a.u.v.



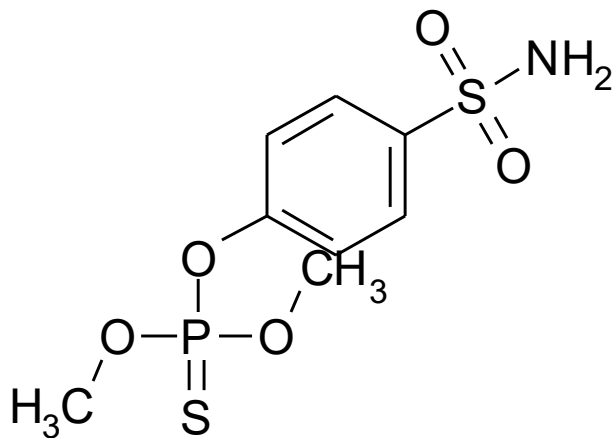
metrifonát

Arpalit® spray a.u.v.

Insekticida

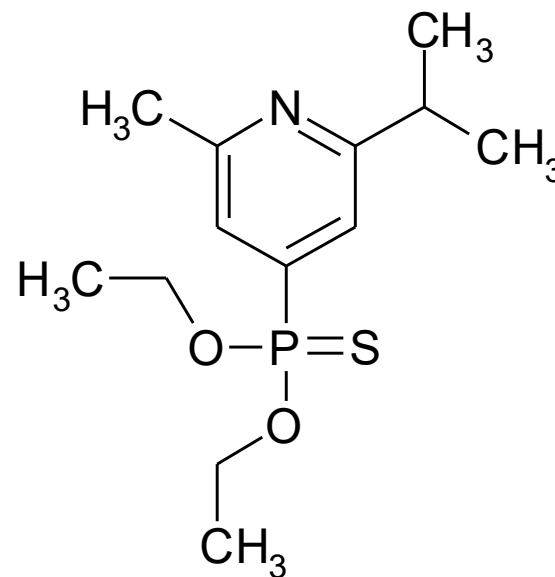
Organické sloučeniny fosforu

Estery kyseliny thiofosforečné a kyselin thiofosfonových



cythiotát

Cyflée® sol. a.u.v.

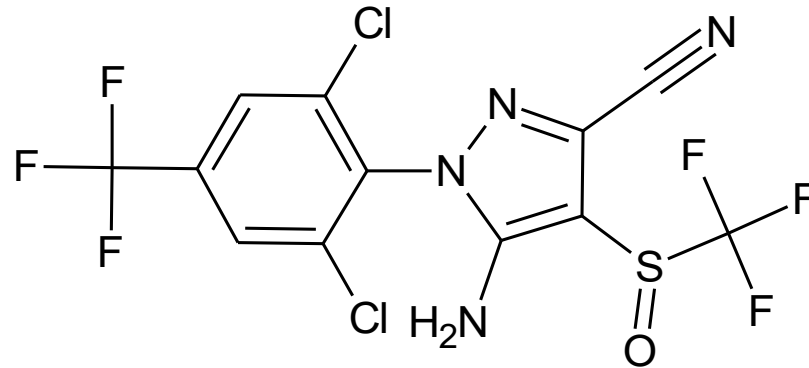


dimpylát

Droplix® a.u.v.

·absorbuje se transkutánně, hubí parazity na celém těle

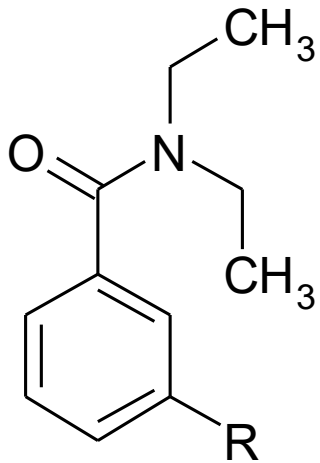
Insekticida
Selektivní inhibitory GABA-receptorů



fipronil

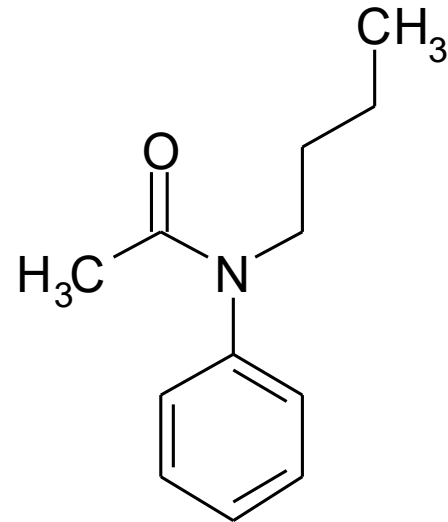
- blokuje hmyzí GABA-receptory, které se zásadně strukturou i funkcí liší od savčích
- vysoká selektivní toxicita pro hmyz

Repelenty



R = H
N,N-diethylbenzamid

R = CH₃
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 %