

**MUNI**  
**PHARM**

# **PSYCHODYSLEPTIKA**

**Drogová závislost** je podle WHO **nutkání (bažení - Nešpor)** k příjmu **psychotropně aktivní látky** (drogy) pro příjemný pocit, který vyvolává. Při nedostatku vznikají abstinenční příznaky. Tendence ke zvyšování dávek.

Může být:

tělová (somatická)

duševní (psychická)

kombinace obou předchozích

Objevuje se u lidí, konzumujících drogy kontinuálně či periodicky

**Návyk** vzniká při opakované aplikaci některých **léků** a vyvolává **touhu** (ne nutkání) na jeho opakované použití.

nevznikají abstinenční příznaky

není tendence (nebo jen malá) zvyšovat dávky

projev určité psychické, nikoliv somatické závislosti

# ALKALOIDY ODVOZENÉ OD TRYPTOFANU „INDOLOVÉ ALKALOIDY“

BOHATÝM A FARMACETICKY VÝZNAMNÝM ZDROJEM JSOU ZÁSTUPCI  
ČELEDÍ:

APOCYNACEAE (*Rauwolfia, Catharanthus, Aspidosperma*)

RUBIACEAE (*Cinchona*)

LOGANIACEAE (*Strychnos*)

CLAVICIPITACEAE (*Claviceps*)

SPOLUÚČAST HEMITERPENICKÉ NEBO MONOTERPENICKÉ JEDNOTKY

**Psychotomimetika – vyvolávají změny psychiky a emocionality od euforie až k depresi a děsu**

**Halucinogeny vyvolávají halucinace, snové obrazy a depersonalizaci**

**Fantasmagorika- „psychonauti“ (řada psychiatrů – Stanislav Grof, Pavel Bém)**

**Téměř bez terapeutického významu – zatím, (adjuvans psycho- terapie)**

**Význam toxikologický, zneužití jako omamné látky**

**Podléhají ustanovení o omamných látkách**

**Vyvolávají příjemné počáteční halucinace**

**Vyvolávají závislost a provokace latentních psychos**

**Zneužívání se nebezpečně rozrůstá**

**DERIVÁTY INDOLU (psilocybin, bufotenin, ergin, semisynt. LSD)**

**DERIVÁTY FENYLETHYLAMINU (mezkalin)**

**OBSAHOVÉ LÁTKY *CANNABIS* (tetrahydrokannabinol – THC, marihuana, hašiš)**

**DERIVÁTY ISOXAZOLU (muscimol, kyselina ibotenová)**

**DITERPENY NEOKLERODANOVÉ (salvinoriny)**

**ANTICHOLINERGNÍ LÁTKY (skopolamin, atropin)**

# PSILOCYBIN

Zdroj: houby r. *Psilocybe*, *Conocybe*, *Stropharia* (Agaricaceae). Střední a Jižní Amerika „TEONANACATL“ – boží maso

První v přírodě popsany fosforylovaný derivát indolu N,N-dimethyltryptamin-4-fosfát

Účinná dávka = 4-8 mg

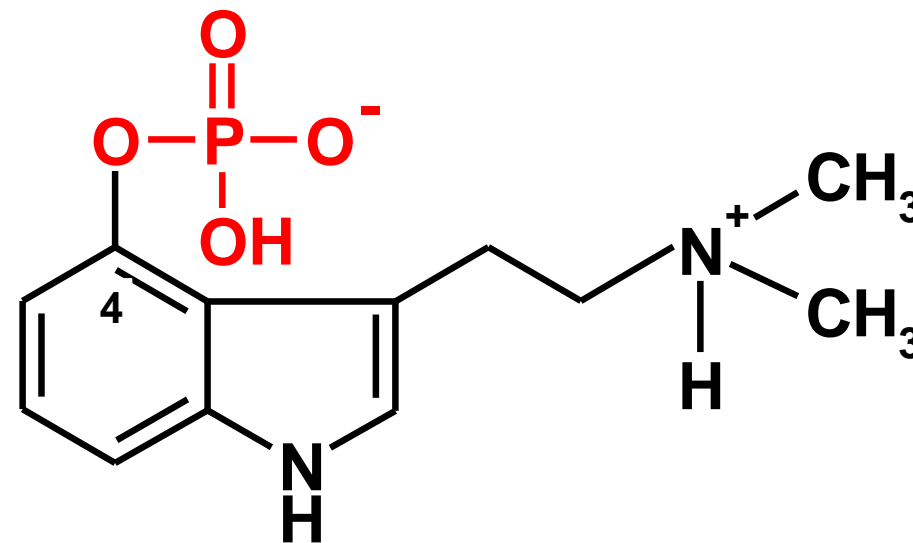
Účinek nastupuje za 30-60 min.

Změny vnímání a myšlení, reálný svět se jeví jako proměnný v čase i prostoru

Optické a sluchové halucinace

Typické představy o schopnosti létat

Psilocin je neúčinný





**Evropa:**

***Psilocybe semilanceata* –  
Lysohlávka kopinatá,  
*P. cyanescens* – L. modrající**

**Obsah psilocybinu 0,01-2,5 % /  
hmotnost sušiny, průměrně lze  
předpokládat 1 %**

**Účinná dávka v cca 0,5-1 g  
suchých plodnic; = asi 5-10 g  
čerstvých hub, = cca 6-12  
plodnic**



# MUNI PHARM

## BUFOTENIN

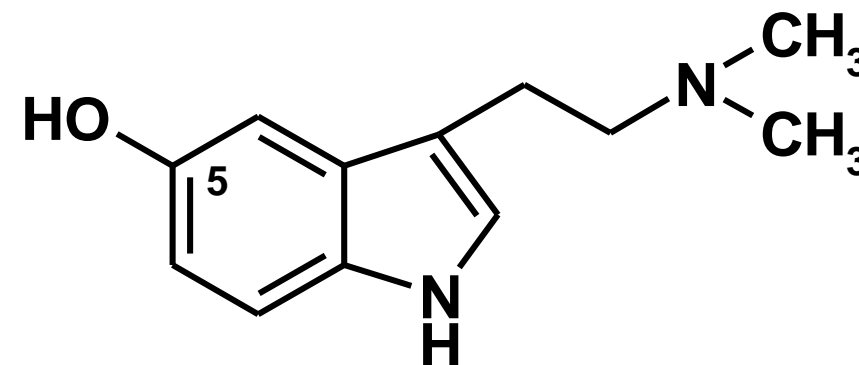
Zdroj:

*Bufo marinus*

*Piptadenia peregrina* (šňupací prášek ze semen)

*Amanita citrina*, *A. porphyria*  
(muchomůrky)

Účinná dávka 10-15 mg  
krátkodobé halucinace, neklid  
poruchy vnímání prostoru, času  
depersonalizace  
makropsie



**N,N-dimethyl-5-hydroxytryptamin**



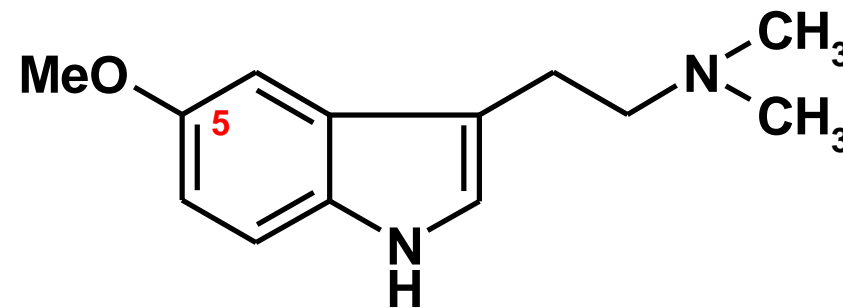
## *Bufo alvarius* – ropucha koloradská

*Bufo alvarius* – ropucha koloradská  
Žije v Sonorské poušti – hranice mezi USA  
a Mexikem

Stírá se produkt kožních žláz

Aplikace inhalací

Údajně při léčbě závislostí (vyhánění  
d'ábla belzebubem)



N,N,-dimethyl- 5-methoxytryptamin

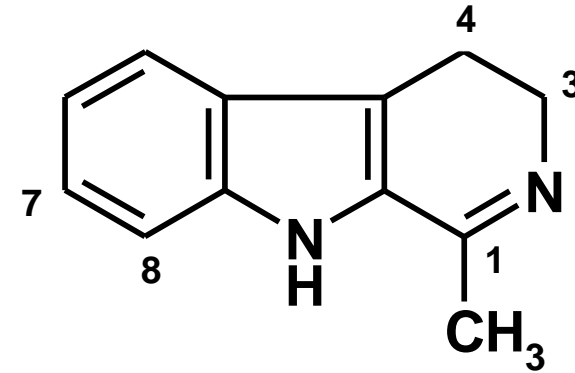


# INHIBITORY MAO

*Banisteriopsis caapi* - Cortex  
(Malpighiaceae)

tropická liana – obsahuje v kůře  
 $\beta$ -karbolinový alkaloid harmalin,  
silný reversibilní inhibitor MAO-A  
Zvyšuje obsah noradrenalinu a  
serotoninu v mozku

Ayahuasca – entheogen  
Indiáni v Amazonii

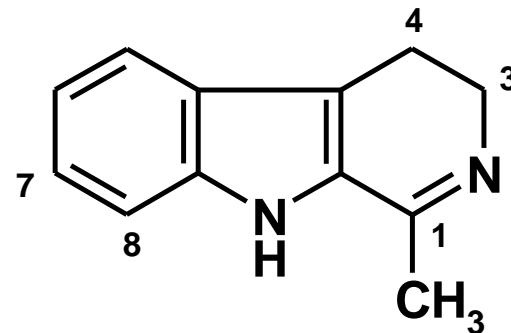


Harmalin

$\beta$ -karbolinový alkaloid

*Banisteriopsis caapi* (Malpighiaceae)

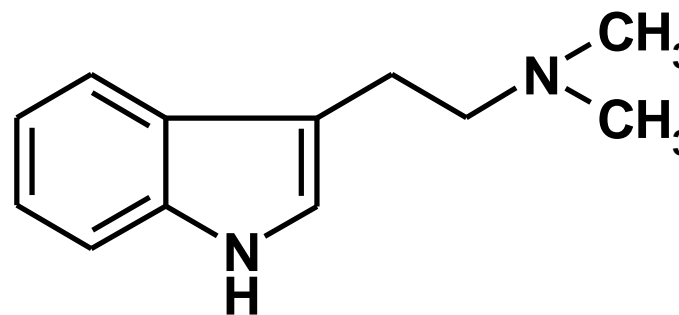
# *Banisteriopsis caapi* – Ayahuasca (liána života, mrtvých)



harmalin

β-karbolinový alkaloid

*Banisteriopsis caapi* (Malpighiaceae)



N,N,-dimethyltryptamin

# ERGIN (amid kyseliny lysergové)

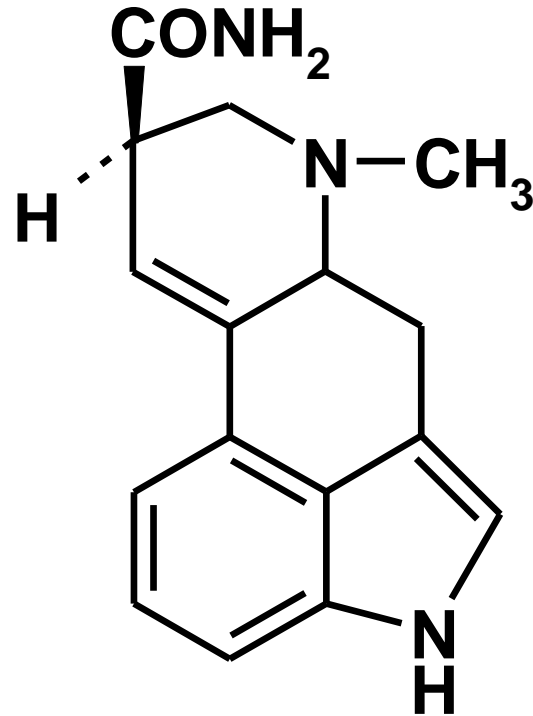
Zdroj:

Semena *Ipomoea violacea* – povijnice  
trojbarevná (Convolvulaceae)

*Rivea corymbosa*

2-10 mg – depersonalizace

Používána Aztéky – (OLOLIUQUI) při  
náboženských obřadech



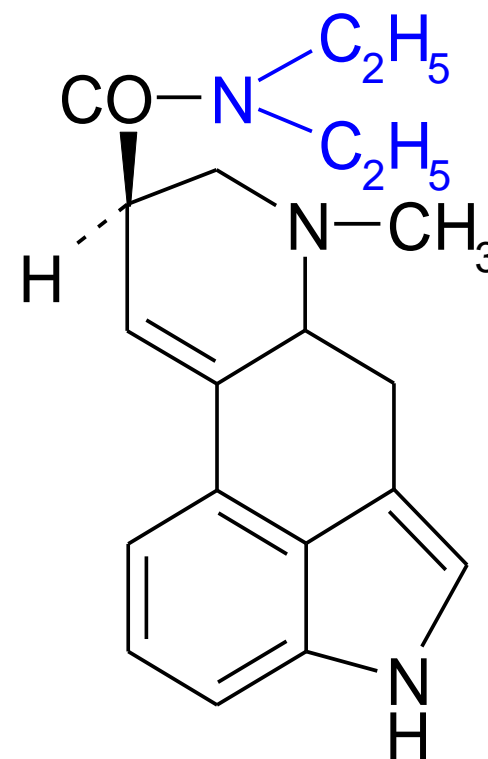
# LSD (diethylamid kyseliny lysergové)

Polosyntetický derivát (1938), původně  
uterotonikum; účinek objeven náhodně r.  
1943 A. Hofmannem (SANDOZ)

Zneužívaný halucinogen, účinná dávka 20-25  $\mu\text{g}$  (0,000020 až  
0,000025 g)

Vyvolává aberace chromosomů  
Od r. 1943 fenomén extáze,  
Hippies 60. léta (euforie, smích, iluze, zrakové  
halucinace)

Prof. Timothy Leary – Harvard Univ.  
psychedelický kult, manifestace duše  
1966 – zákaz LSD v USA





M U N I

PSYCHODYSLEPTIKA

P H A R M

MEZKALIN

Synonymum: Peyotl, Mescal buttons (ke kouření)

Zdroj:

*Echinocactus williamsii* = *Lopophora Lewinii*, *Trichocereus*

Příčně nařezané plátky – sušením – mezkalové „knoflíky“

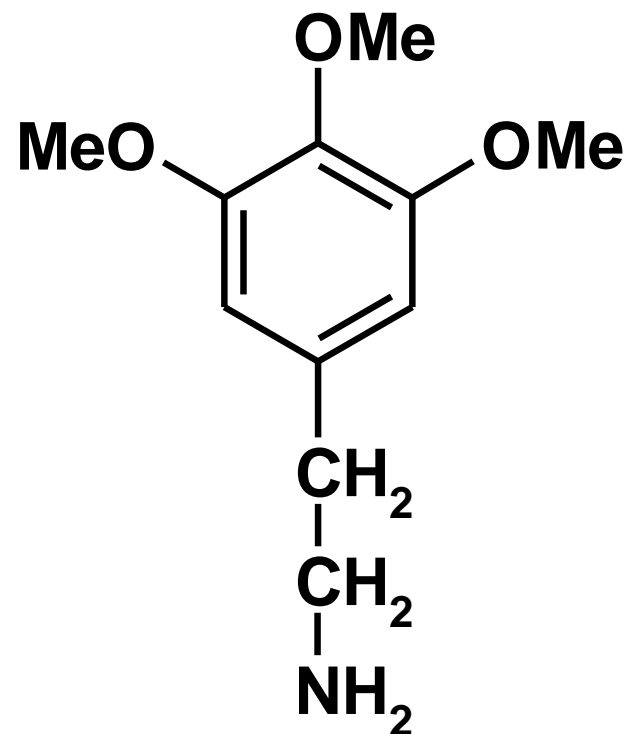


Účinná látka:

3,4,5-trimethoxy- $\beta$ -fenylethyl-  
amin

V kaktusech 5-7 %

0,2-0,6 g vyvolává halucinace





# M U N I P H A R M

## SYMPATOMIMETIKA NEPŘÍMÁ KAT – HABEŠSKÝ ČAJ

Zdroj: *Catha edulis* – Kata jedlá (Celastraceae).  
Vždyzelený keř domácí Jemenu, Etiopii a Somálsku.  
Domorodci žvýkají čerstvé výhonky = KAT.

Droga: usušené kožovité listy = Habešský čaj

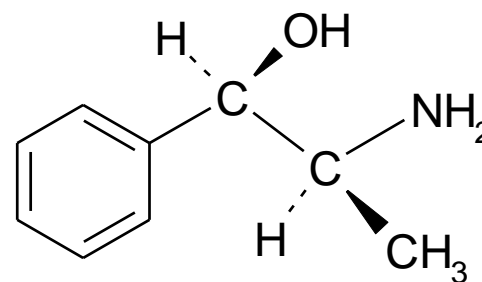
OL: norpseudoefedrin = katin, katinon (nepřímé sympatomimetikum), flavonoidy

Účinky: euforizující, po opakovaném užívání vzniká závislost, v CNS zvyšuje uvolňování dopaminu a serotoninu, na periférii noradrenalinu

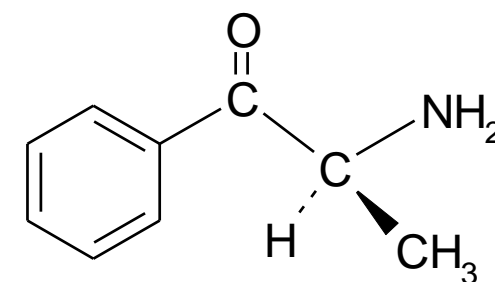
ztráta chuti k jídlu

zvýšení TK, tepové frekvence

katin – předloha syntetických anobesik



katin



katinon

Zdroj:

*Amanita pantherina* –  
muchomůrka tygrovaná

*Amanita muscaria* –  
muchomůrka červená  
dužnina čistě bílá a jedovatá

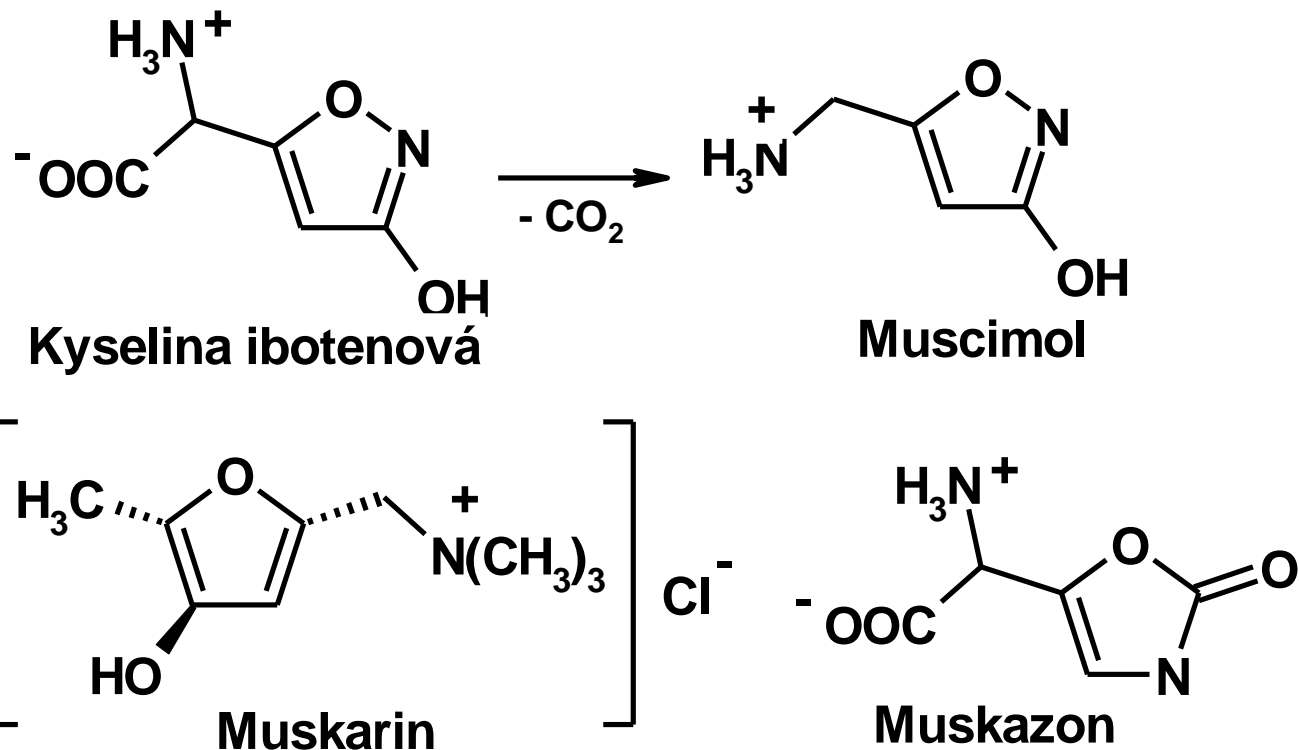


Obsahují směs isoxazolových alkaloidů

Spolu s muskarinem působí na parasimpatikus. M. zvyšuje sekreci slin, potu, žluče, pankreatické šťávy, vyvolává psychické exaltace, opojení rozjaření.

Vyvolávají stav podobný alkoholovému opojení, mráкотy, halucinace, zuřivost

Zneužívány k navození válečného nadšení





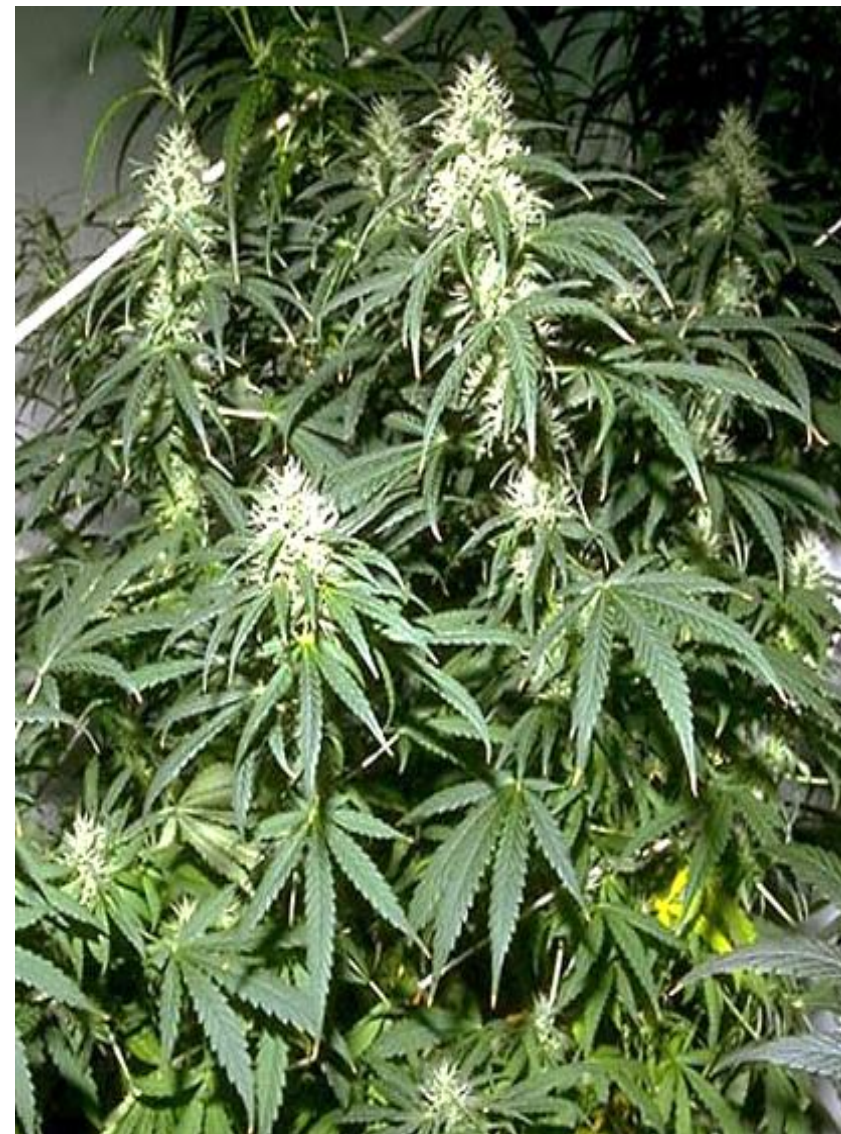
Zdroj: *Cannabis indica* – konopí indické  
(Cannabaceae)

Kvetoucí stopky samičích rostlin

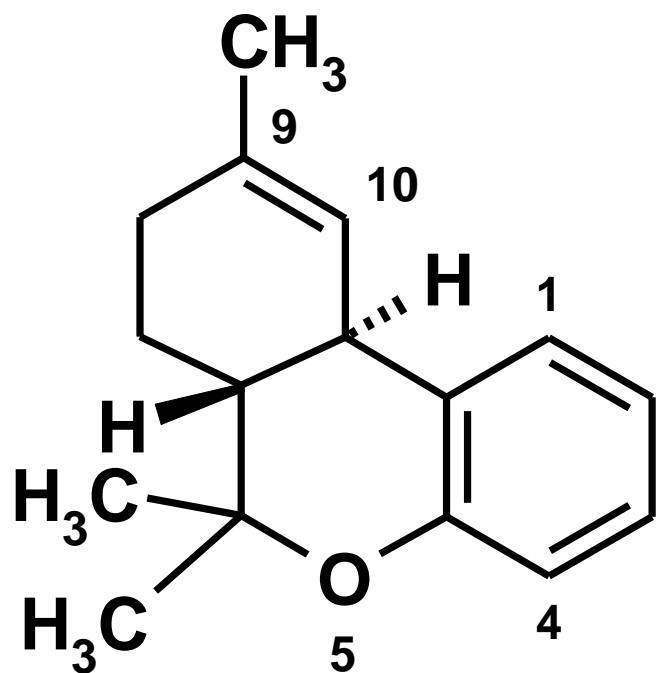
THC se vstřebává sliznicí HCD  
Nejčastější užití ve formě cigaret

Hašiš – pryskyřice setřená z listů a stopek

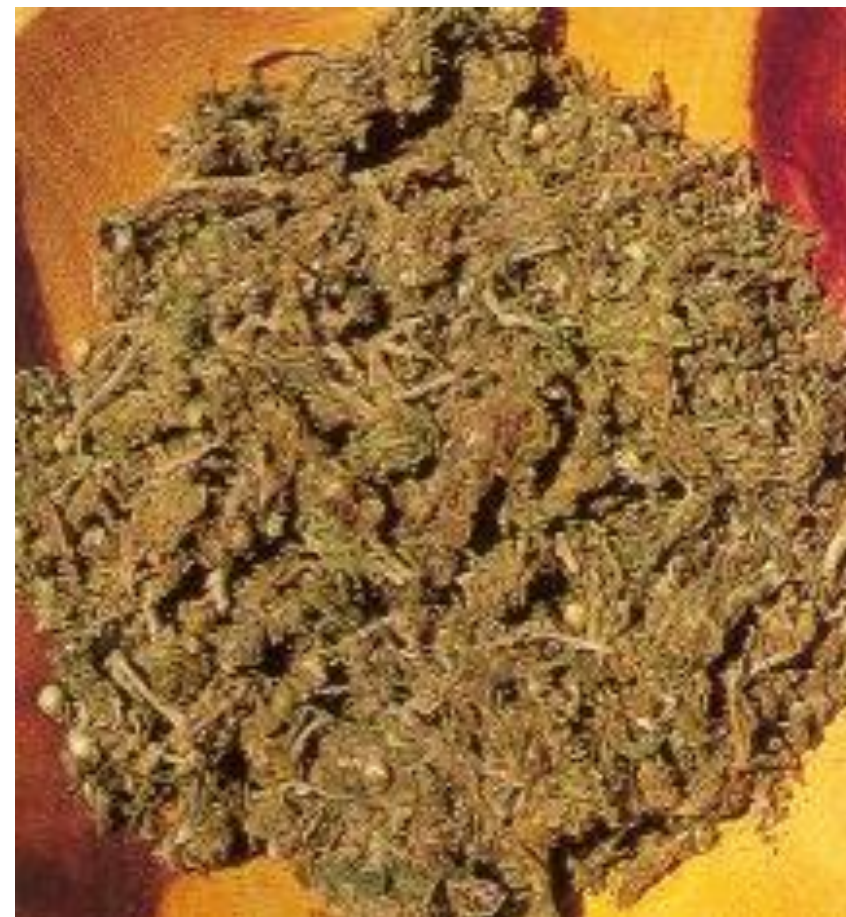
Obsahuje kanabinoidy, účinný THC



# MUNI PHARM MARIHUANA, HAŠIŠ, THC



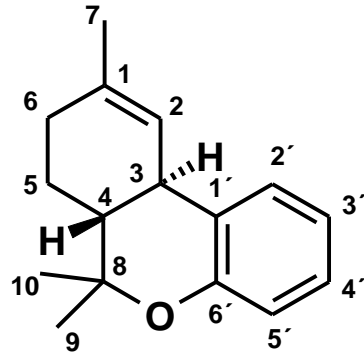
$\Delta^9$ -Tetrahydrocannabinol



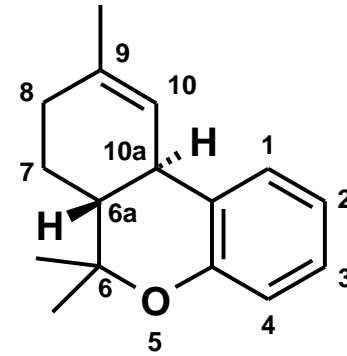
# Účinky některých pryskyřičných látek konopí

látka	účinek			
	antibiotický	sedativní	analgetický	omamný
Kanabidiol	+	+	+	-
Kanabidiolová kys.	+	+	-	-
Kanabinol	-	+	-	-
Kanabigerol	+	-	-	-
Kanabigerolová kys.	+	-	-	-
Kanabichromen	-	+	-	-
THC	-	-	-	+++

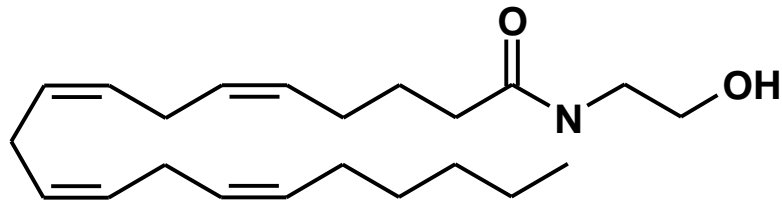
# Kannabinoidy



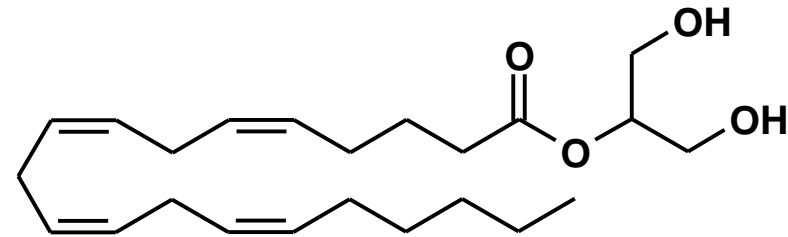
číslování "biosyntetické"



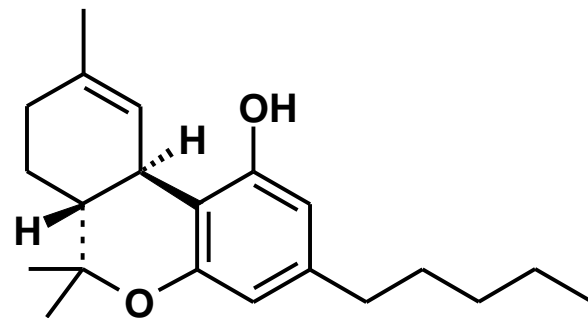
číslování systematické



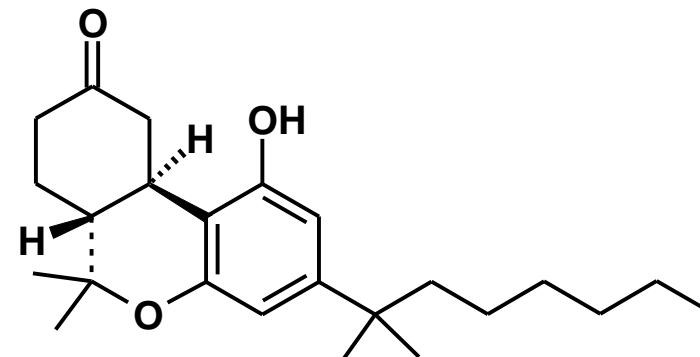
Anandamid (ethanolamid kys. arachidonové)



2-arachidonoylglycerol



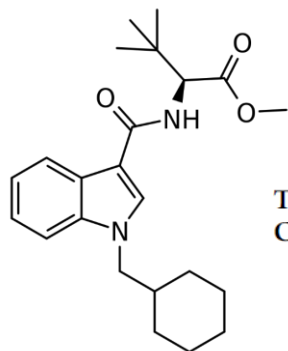
THC



NABILON



# Syntetické kanabinoidy



MDMA-  
CHMICA

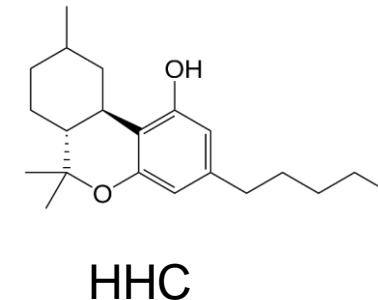
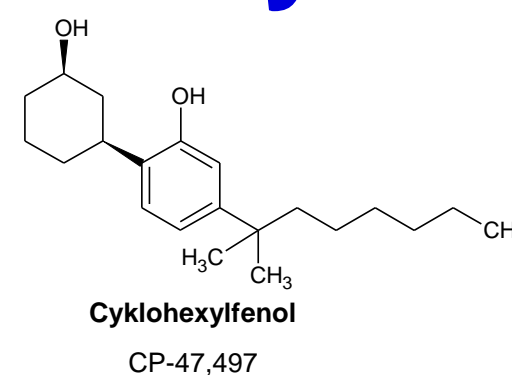
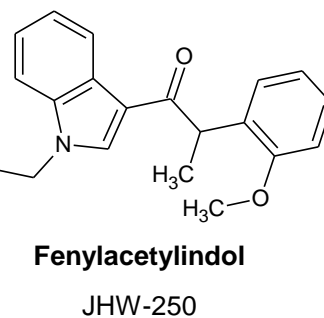
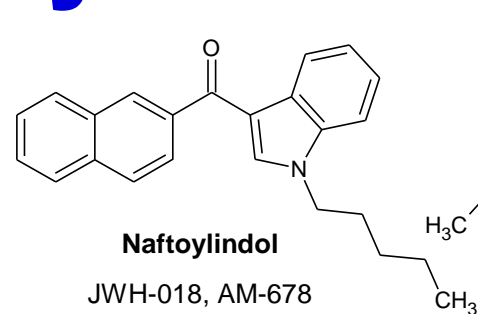


Table 1. Adverse Effects Associated with Synthetic Cannabinoid Intoxication

- acute kidney injury
- agitation
- bleeding<sup>a</sup>
- cardiotoxicity
- chronic cough
- confusion
- hypokalemia
- hyperthermia
- liver failure
- nausea
- nystagmus
- pneumothorax
- psychosis
- pulmonary infiltrates
- rhabdomyolysis
- seizure
- serotonin syndrome
- stroke
- suicidal ideation
- tachycardia
- vomiting

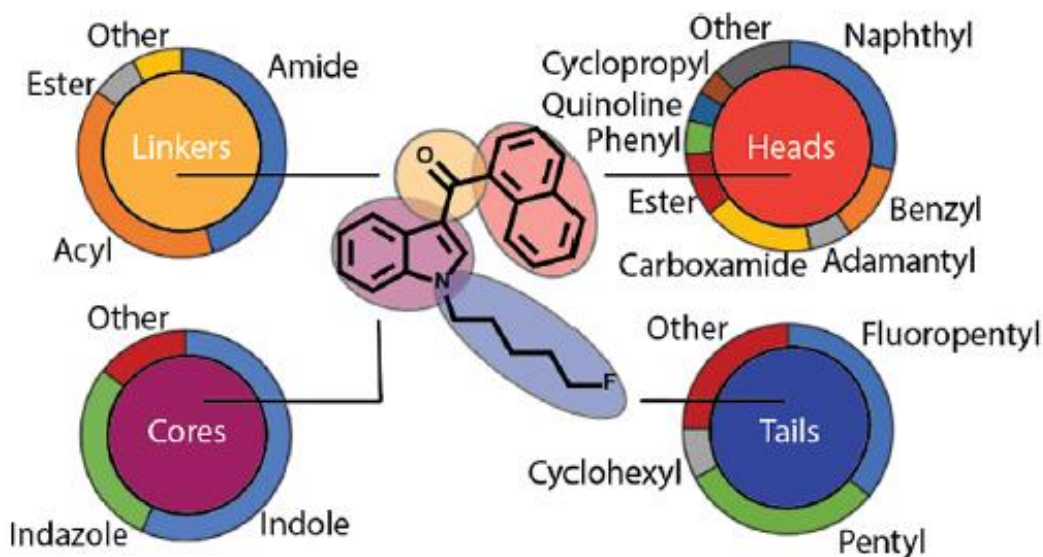


Figure 2. Prevalence of individual structural elements among synthetic cannabinoids that have been identified in seized materials.

# MUNI PHARM

MARINOL® – dronabinol – antiemetikum u  
onkologických pacientů – THC v *Oleum sesami*

BEDROCAN – *Cannabis flos*

léčivý přípravek s obsahem konopí pro léčebné účely  
výhradně elektronický recept s omezením

předepisovat může pouze lékař se specializovanou způsobilostí podle vyhl. č 221/2013  
Sb, pacientům nad 18 let věku

Unguenta s obsahem konopí – dermatologikum  
(ekzémy, lupénka, akné)

Lokální analgetikum – rheuma, záněty kloubů

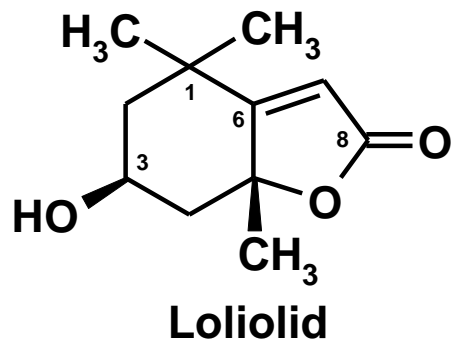
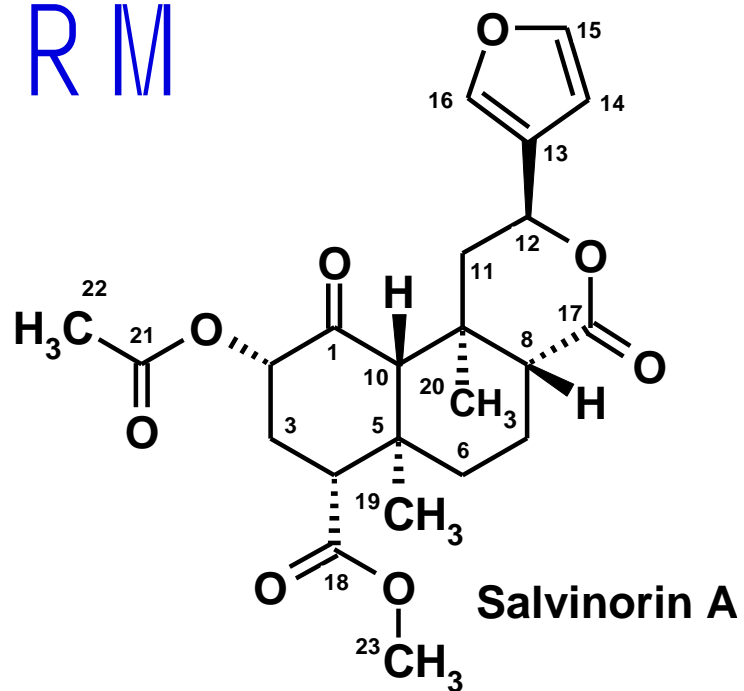
# M U N I *Salviae divinorae folium*

## P H A R M

*Salvia divinorum* – šalvěj božská (Lamiaceae) mexická bylina dorůstající výše přes 1 m, listy jsou 12 – 15 cm dlouhé, ke konci zašpičatělé.  
droga - čerstvé listy, halucinogenní účinek se projevuje jako vize „tančících barev v komplikovaných geometrických obrazcích“.  
obsahují salvinorin A a salvinorin B, diterpeny neoklerodanového typu. V čerstvých listech jsou v kolísavém množství = 10 až 200 ppm. V listech je přítomný v množství cca 5 ppm repelent na mravence liliolid.



*Salviae divinorae folium*



**MUNI**  
PHARM

# **KOROVÁ, PODKOROVÁ A MÍŠNÍ STIMULANCIA** **(CENTRÁLNÍ ANALEPTIKA)**

## **Analeptika stimulují**

- 1. dýchání (význam poklesl zavedením řízeného dýchání s přívodem kyslíku)**
- 2. oběh (porucha cirkulace – v současnosti periferní vasokonstriční látky)**
- 3. částečně bdělost**
- 4. určité oblasti CNS, aniž by významněji ovlivňovala psychické funkce**

**Vyšší dávky – křeče centrálního původu**

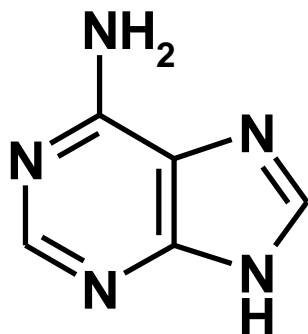
**Terapeutický význam relativně malý, antidota při otravě barbituráty a morfinany**

**Terapeutické využití mají především methylderiváty xanthinu (purinové base – kofein a theofylin)**

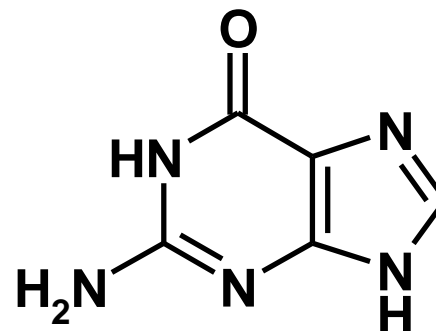
**Ostatní (nespecifická analeptika) se užívají omezeně, protože po fázi stimulační dochází k fázi útlumové**

**Chemicky skupina velmi heterogenní**

# Purinové báze

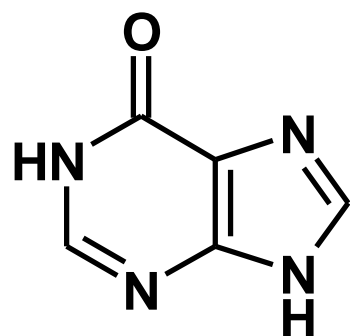


adenin

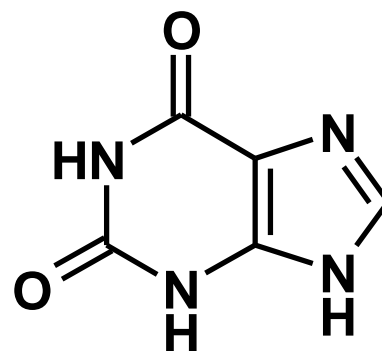


guanin

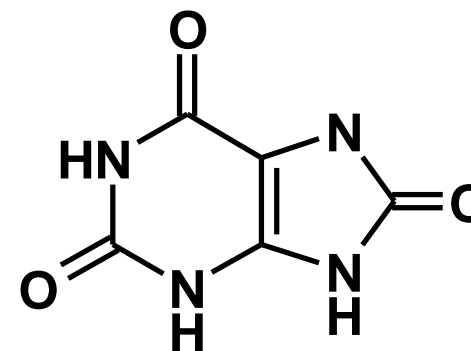
složky nukleových kyselin



hypoxanthin



xanthin



kyselina močová

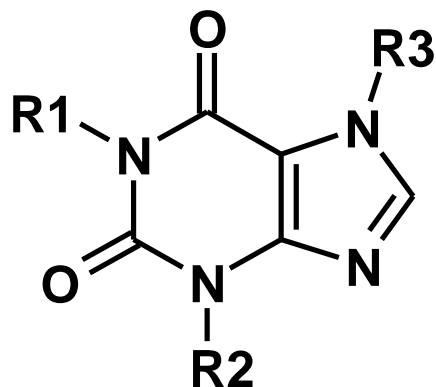


MUNI

METHYLDERIVÁTY XANTHINU –

PHARM

PURINOVÉ BÁZE



xanthin                     $R1 = R2 = R3 = H$

kofein                     $R1 = R2 = R3 = CH_3$

**Coffeinum - Kofein (ČL 2017)**

theofylin                     $R1 = R2 = CH_3, R3 = H$

**Theophyllum - Theofylin (ČL 2017)**

theobromin                 $R1 = H, R2 = R3 = CH_3$

**Theobrominum - Theobromin (ČL 2017)**

## RELATIVNÍ FARMAKOLOGICKÝ ÚČINEK DERIVÁTŮ XANTHINU

Účinek	kofein	theobromin	theofylin
Stimulace CNS (kůra i podkoří)	+++	±	+
Stimulace kosterních svalů	++	±	+
Stimulace srdečního svalu	+	++	+++
Dilatace koronárních cév	±	+	++
Relaxace bronchiálních svalů	+	++	+++
Stimulace žaludeční sekrece	++	±	±
Diuretický účinek	+	++	+++

stimuluje dechové a vasomotor. centrum a zvyšuje míšní aktivitu

**M U N I**

**Oficinální purinové base**

**P H A R M**

**COFFEINUM ČL 2017**

**COFFEINUM MONOHYDRICUM ČL 2017**

bílý, snadno sublimující krystalický prášek

mírně rozpustný ve vodě, snadno rozpustný ve vroucí vodě

rozpouští se v koncentrovaných roztocích alkalických benzoanů a salicylanů

**THEOBROMINUM ČL 2017**

rozpouští se v ve zředěných roztocích alkalických hydroxidů a v minerálních kyselinách

**THEOPHYLLINUM ČL 2017**

**THEOPHYLLINUM MONOHYDRICUM ČL 2017**

rozpouští se v ve zředěných roztocích alkalických hydroxidů, v amoniaku a minerálních kyselinách

# MUNI THEOPHYLLINUM PHARM

Indikací je prevence a léčba reversibilního bronchiálního spasmu při léčbě asthma bronchiale nebo chronické obstrukční plicní nemoci

Je vhodné upozornit pacienty na předpokládané NÚ: GI nevolnost, nespavost, třes, palpitace, kožní projevy alergie

Pacient léčený theofylinem by měl omezit konzumaci kávy a produktů obsahujících kofein

## Používané sloučeniny purinových basí

Pro špatnou rozpustnost se purinové báze používají v terapii

v kombinaci se solemi organických kyselin

*(Coffeinum cum natrio benzoico)*

jako podvojně soli

*(Aminophyllum = theofylin s ethylendiaminem)*

směsi solí se solemi organických kyselin

*(Natrium theobromino-salicylicum)*

# MUNI THEOFYLIN PHARM

HVLP: Euphyllin, Afonilum, Theoplus

Doporučován jako lék 2. či 3. volby CHOPN nebo sthma kvůli systémovému účinku. Lékaři jej i tak předepisují jako lék 1. volby, je velmi oblíbený.

Předepisován v dávce 100 mg u akutního nachlazení, kašle a z toho plynoucích potíží s dýcháním

***Coffae semen*** – semeno kávovníku

***Theae folium*** – list čajovníku

***Colae semen*** – kolové semeno (ČL 2017)

***Cacao semen*** – kakaové semeno

***Maté folium*** – list maté

***Guarana (Pasta guarana)*** - guarana



## *Coffae semen* – Semeno kávovníku

**Zdroj:** *Coffea arabica* – Kávovník arabský, *C. liberica* – K. liberijský, *C. canephora var. robusta* – K. mohutný a jiné druhy (Rubiaceae - mořenovité); Vždyzelené keře nebo malé stromy (původem z Etiopie a Súdánu)

Plod vejčitá dvoupouzdrá peckovice o průměru asi 1,5 cm

**Producenti:** Brazílie, Kolumbie, Mexiko, Guatemala, Pobřeží slonoviny, Etiopie, Indonésie, Indie, státy Arabského poloostrova



# MUNI ZPRACOVÁNÍ KÁVY

## PHARM

Suché zpracování - nasbírané plody se suší po dobu čtyř týdnů. Pravidelně se prohrabávají, aby se zabránilo kvašení a fermentaci. Působením vzduchu a slunce oplodí vyschne, zhnědne, je křehké a odstraní se s osemením. Zrna nesmějí přeschnout ani zůstat nedoschlá. Získají se méně jakostní zrna.

Mokrý zpracování → „vypraná káva“. Po sklizni se do 24 h odstraňuje oplodí pomocí loupacího stroje. Za pomoci vody se oddělují nekvalitní semena od zralých a těžkých semen. U těch probíhá v kvasných nádržích až 36hodinový proces fermentace, při kterém se uvolní zbývající lepkavá část osemení. Suší se.

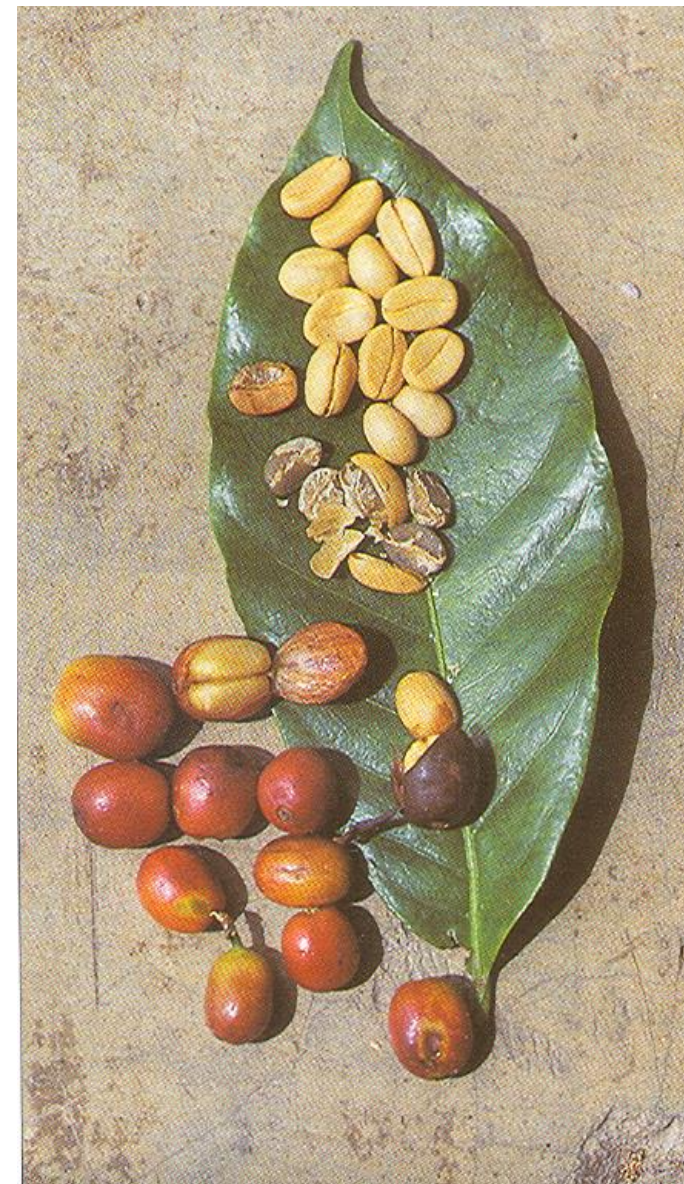
# M U N I    *Coffae semen* – Semeno kávovníku

## P H A R M

**Droga:** semena zbavená oplodí a osemení, praží se při 200-250 °C

**OL:** 0,4-2,5 % kofeinu, stopy teobrominu a teofylinu, 2-5 % kyseliny chlorogenové. Pražením vznikají další nepřírodní látky (fenoly, pyrazin, pyrrol, furfural, thiazol, thiofen, merkaptan).

**Použití:** K izolaci kofeinu, horečnaté stavy u infekčních onemocnění, při otravě alkoholem. Pochutina.  
Ondráček: „Nejušlechtilejší a nejnevinnější toxikomanie“.





# MUNI *THEAE FOLIUM* – LIST ČAJOVNÍKU

## PHARM

**Droga:** usušené listy **fermentované**  
**OL:** 1,5 až 4,5 % kofeinu (více v černém čaji); 0,04 % teobrominu a teofylinu; 10-25 % katechinových tříslovin; 0,5-1 % silice (250 komponent) hlavně z monoterpenických aldehydů a alkoholů, flavonoidy

**Použití:** Čajový odvar – mírné antidiarrhoikum, koncentrovaný odvar – antidotum při otravách alkaloidy a těžkými kovy; pochutina

Čajový odpad k izolaci kofeinu



# MUNI ZPRACOVÁNÍ ČAJE

## PHARM

Čaj zelený – nefermentovaný (Čína, Japonsko),  
Čaj černý – fermentovaný + oxidace (Indie, Ceylon)

Klasická metoda: zavadnutí (10-20 h.) → svinování (1 h.) → fermentace (2 a více h.) → sušení → třídění

CTC technologie (crushing-tearing-curling): drcení → trhání → svinování → fermentace → sušení

Fermentace a oxidace

Fermentace je anaerobní proces – enzymy

Oxidace za přístupu vzduchu

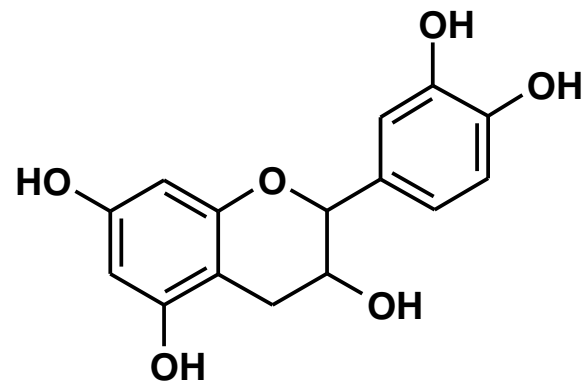
# M U N I     *Camelia sinensis*

## P H A R M

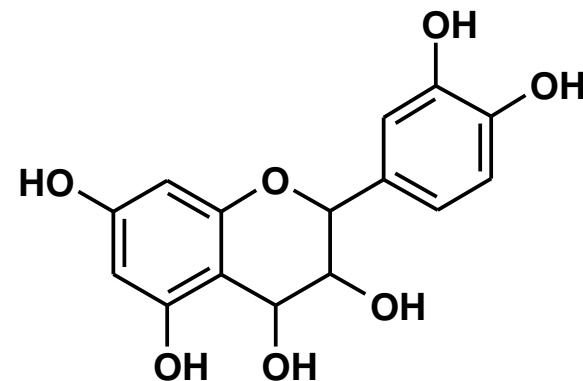
2 až 15 m vysoký keř nebo strom  
listy střídavé, kopinaté, tmavě zelené, s pilovitým okrajem  
korunní lístky velkých květů bílé  
plod hladká kožovitá hnědá tobolka  
semena hnědá kulovitá  
v kultuře se provádí druhým rokem tvarovací řez  
první sběr ve třetím roce  
kultura se využívá 30 až 100 let, klesá kvalita  
z jednoho keře až 250 g čerstvých listů



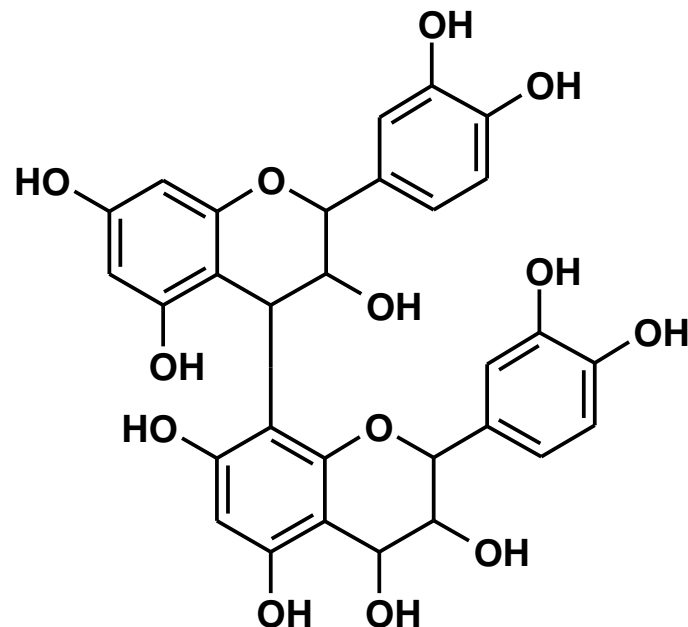
# KATECHINY



Katechin (3-flavanol)



Leukoanthocyanidin (3,4-flavandiол)



Dimerní kondenzační produkt  
jako první stupeň tvorby tríslovin  
z flavandiолu a katechinu

## COLAE SEMEN – KOLOVÉ SEMENO (ČL 2017)

Zdroj: *Cola nitida* – Kola lesklá, *C. acuminata* – K. zašpičatělá  
(Sterculiaceae - lejnicovité)

Stromy domácí v tropické Africe, pěstované v Brazílii, na Jamajce, Jávě,  
Madagaskaru, v Kamerunu a Togu

Plodem je tobolka obsahující 3-6 semen

Droga: ze zralých plodů vyjmutý a na slunci usušený semenný klíček

OL: 1-3 % kofeinu, 0,1-0,2 % teobrominu, částečně vázané s  
tříslovinami na tzv. kolateiny; 3-5 % katechinových tříslovin, které se  
tvoří při sušení; škrob, tuk

Použití: galenické přípravky s psychostimulačními a diuretickými účinky  
Osvěžující nápoje.

Coca-Cola obsahuje cca 20 mg kofeinu ve 100 ml

Coca-Cola – 1886 PhMr. John Pemberton a laborant Asa Chandler  
(Atlanta)

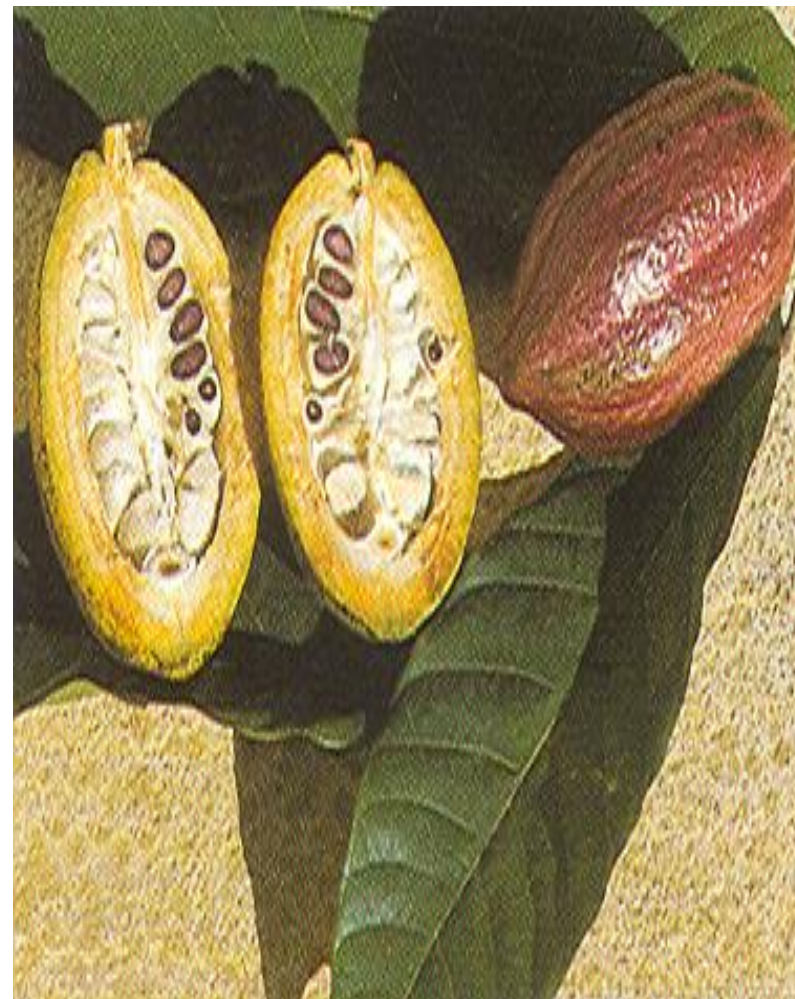


Zdroj: *Theobroma cacao* – kakaovník pravý  
(Sterculiaceae - lejnicovité)

Kauliflorní strom tropické Střední a Jižní Ameriky;  
významná součást tropického zemědělství (Brazílie,  
Ghana, Nigerie)

Plodem jsou tobolky, obsahující 25-30 semen v pěti  
řadách

Semena se nechají na slunci zapařit a fermentovat -  
rozštěpí se hořčiny, vytvoří se vonné látky a semena  
ztmavnou. Potom se praží při 100-140 °C, získají typickou  
vůni a chuť.



# MUNI PHARM

Droga: fermentovaný a upražený klíček, resp. jeho dělohy.

OL: 1-2 % teobrominu, 0,05-0,2 % kofeinu, cca 50 % tuku, cca 5 % tříslovin a škrob.

Mletí mezi horkými válci – kakaová hmota, hydraulickým lisováním – *Oleum cacao*, zbytek kakaový prášek

Použití: osemení k izolaci teobrominu; kakaový prášek – pochutina; *Oleum cacao* – pomocná látka, výroba čokolády.

Belgie – produkce čokolády – 350.000 tun/rok.



MUNI

## MATÉ FOLIUM – LIST MATÉ

PHARM

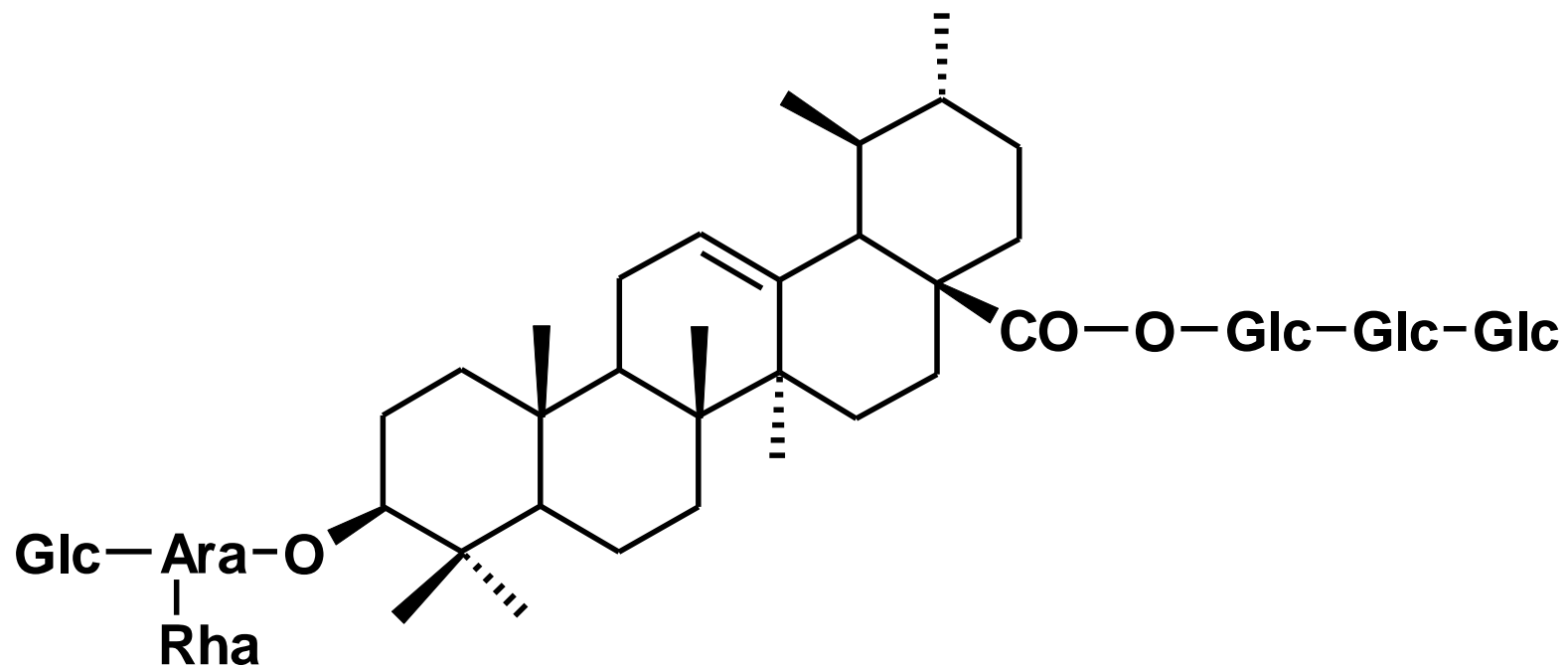
Zdroj: *Ilex paraguariensis* – cesmína paraguajská (Aquifoliaceae- cezmínovité). Strom domácí v Jižní Americe, pěstuje se. Hlavní producent Argentina

Droga: světlezelené kožovité lesklé listy. Inaktivace enzymů - větve se protahují bezkouřovým plamenem, čím získají zvláštní vůni. Sušení v sušárnách.

OL: 1-1,5 % kofeinu, 0,05-0,3 % teobrominu; cca 12 % kyseliny chlorogenové, silice, flavonoidy

Použití: Příprava nápoje s psychostimulačními účinky. Pro Evropany příliš trpký a pach po kouři.





Matésaponin, bidesmosid ursolové kyseliny  
(podílí se na diuretickém účinku)



## GUARANA – PASTA GUARANA

Zdroj: *Paullinia cupana* – Paulinie nápojná (Sapindaceae - mýdelníkovité). Popínavá liana brazilských a venezuelských pralesů. Pěstuje se. Plodem je tobolka. Semeno se po vyjmutí suší a praží.

Droga: upražená rozdrčená semena zformovaná (voda + škrob) do tyčinek

OL: kofein cca 5 %, katechinové třísloviny až 25 %, škrob a tuk

Použití: Stimulans a přísada k analgetickým směsím. V Evropě zřídka, na americkém kontinentě k přípravě osvěžujících nápojů (Aqua branca).



**M U N I**

**CAMPHORA D – D-KAFR (ČL 2017)**

**P H A R M**

**CAMPHORA NATURALIS – PŘÍRODNÍ KAFR**

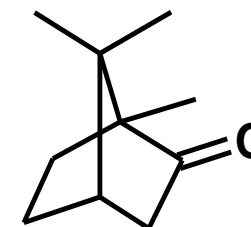
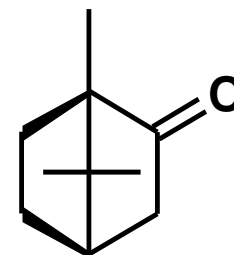
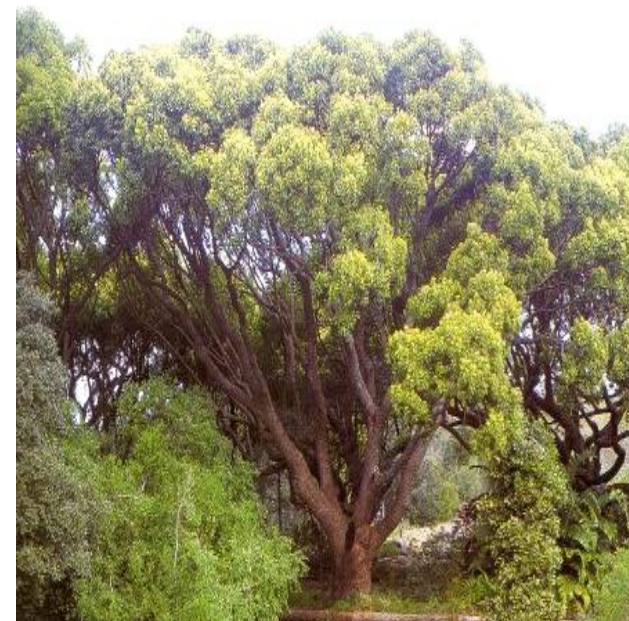
Zdroj: *Cinnamomum camphora* – skořicovník kafrový  
(Lauraceae - vavřínovité)

Statný, vždyzelený strom, domácí ve východoasijském pobřežním území. Pěstovaný v tropických a subtropických zemích (USA Florida, východní Afrika aj.). K výrobě kafru se užívá dřeva nejméně 50 let starých kafrovníků; kafr se získává destilací vodní parou.

Použití: Centrální analeptikum ve formě i.m. injekcí  
(obsoletní)

Zevně derivans, antipruriginosum

Výroba celuloidu a bezdýmného prachu



Zdroj: *Anamirta cocculus* – Chebule latnatá (Menispermaceae – chebulovité); popínavý keř domácí v Indii a v Malajsii.

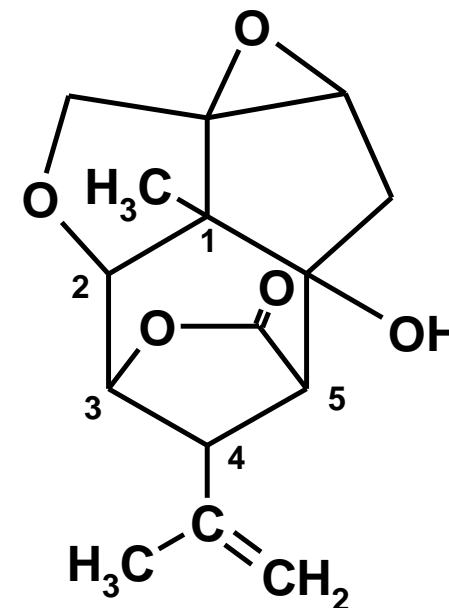
Droga: plody – peckovice o  $\varnothing$  1 cm

OL: až 1,5 % pikrotoxinu

Účinek: Silné centrální analeptikum, pro malou terapeutickou šíři se nepoužívá.

Při terapii periferně podmíněných forem závratí včetně Meniérova syndromu (v minulosti využíván námořníky proti kinetózám)

U ryb vyvolává křečovitě polykání vzduchu  
- vodní pytláctví

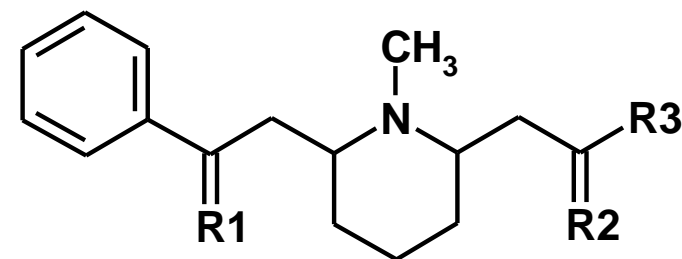


Zdroj: *Lobelia inflata* – lobelka nadmutá (Lobeliaceae). Až dvouletá bylina, doma v Sev. Americe. V Evropě pěstovaná.

Droga: V době květu řezaná a usušená nať.

OL: 0,2-1 % piperidinových alkaloidů; významný lobelin a isolobinin.

Použití: Stimulans dechového centra; součást antiasthmatických přípravků (isolobinin reflektoricky vyvolává sekreci bronchiální sliznice a umožňuje tak expektoraci).



lobelin,

R1=O,

R2=H,OH,

R3=C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>

isolobinin,

R1=O,

R2=H,OH,

R3=C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>



# MUNI STRYCHNIN

## PHARM

Zdroj: *Strychnos nux vomica* – kulčiba dávivá (Loganiaceae - kulčibovité); strom nebo keř domácí v tropické části Indie, na Ceylonu a v sev. Austrálii; pěstuje se v Kamerunu, Kambodži. Plod = bobule velikosti jablka, v něm 4-5 semen.

Droga: semeno ploché, po obvodě ztlustlé o  $\varnothing$  15-25 mm, bohatě oděné trichomy.

OL: 2,5-4 % indolových alkaloidů, 90 % strychninu a brucinu. Mastný olej, loganin.

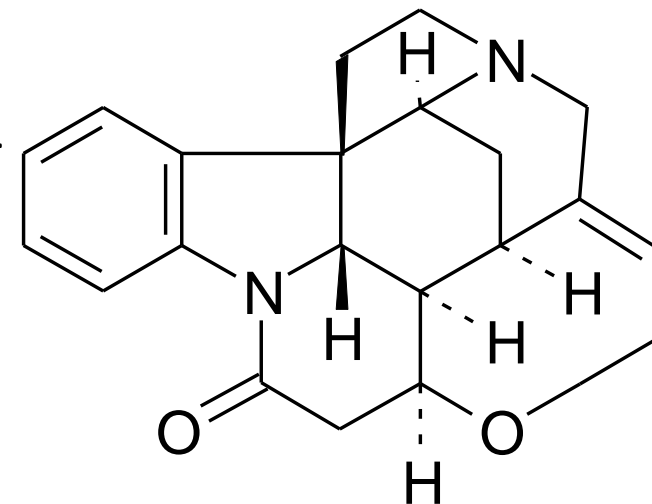
Použití: K izolaci strychninu a brucinu a k přípravě *Strychni tinctura* – syn. *Nucis vomicae tct.*

při percepčních poruchách (nedostatečné smyslové vnímání)

myopatická insuficience hlasivek

atonie trávicího ústrojí

amarum (pro hořkou chuť)



**MUNI**  
PHARM



LOKÁLNÍ ANESTETIKA

vyvolávají místní znecitlivění v důsledku reversibilní blokády vedení vzruchu sensitivním neuronem

- kokain
- menthol
- eugenol

PERIFERNÍ MYORELAXANCIA

specificky brzdí neuromuskulární přenosy dráždění; snižují tonus kosterního svalstva a vyvolávají až jeho úplné ochabnutí a neschopnost kontrakce

- kurare Menispermaceae a Loganiaceae
- šíповý jed Apocynaceae

M U N I

# COCAINI HYDROCHLORIDUM – KOKAIN-HYDROCHLORID

P H A R M

(ČL 2017)

Zdroj: *Erythroxylum coca* – koka pravá (Erythroxylaceae); vždyzelený keř (až 5 m); planě se nevyskytuje; pěstuje se jako nízký keř - Bolívie, Peru, Kolumbie, Jáva (600-1000 m n.m., konstantní teplota a vlhko).

Droga: usušené listy

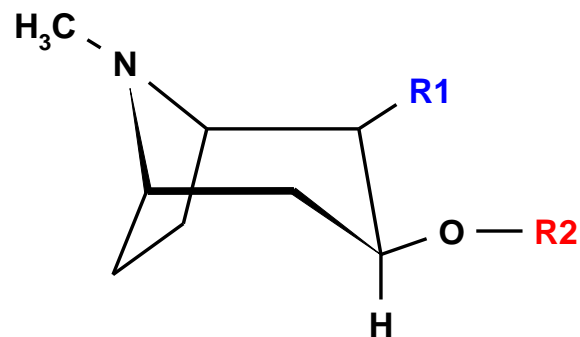
Huanuco - z Bolívie – velké, temně zelené, kožovité listy

Truxillo - z Peru a Kolumbie – tenké, menší, světlezelené listy

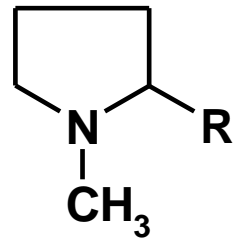
OL: 0,7-2,5 % alkaloidů odvozených od pseudotropinu, ekgoninu, hygrinu; třísloviny, silice



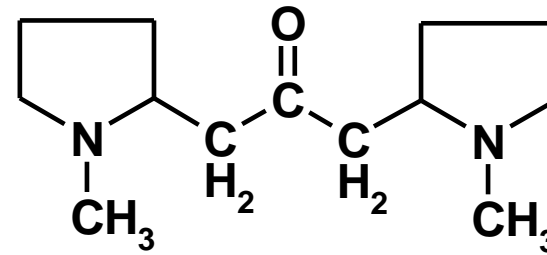
# ALKALOIDY PŘÍTOMNÉ V LISTECH *ERYTHROXYLUM COCA*



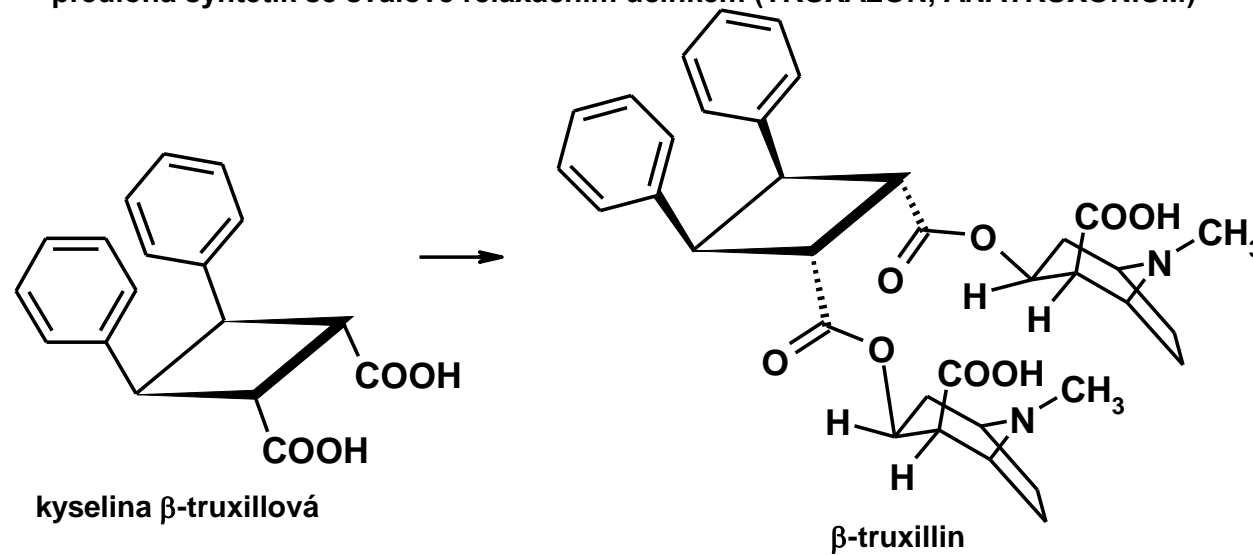
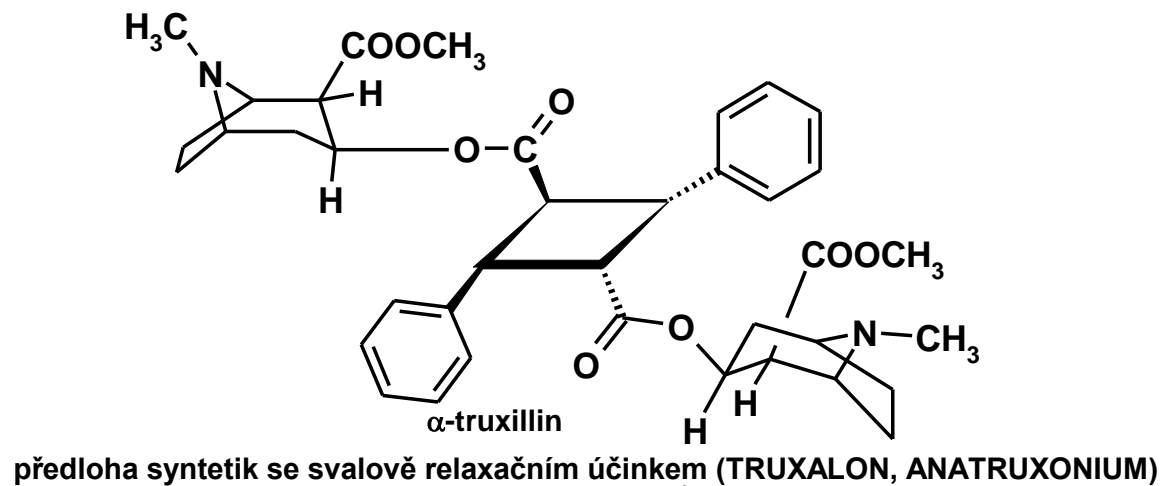
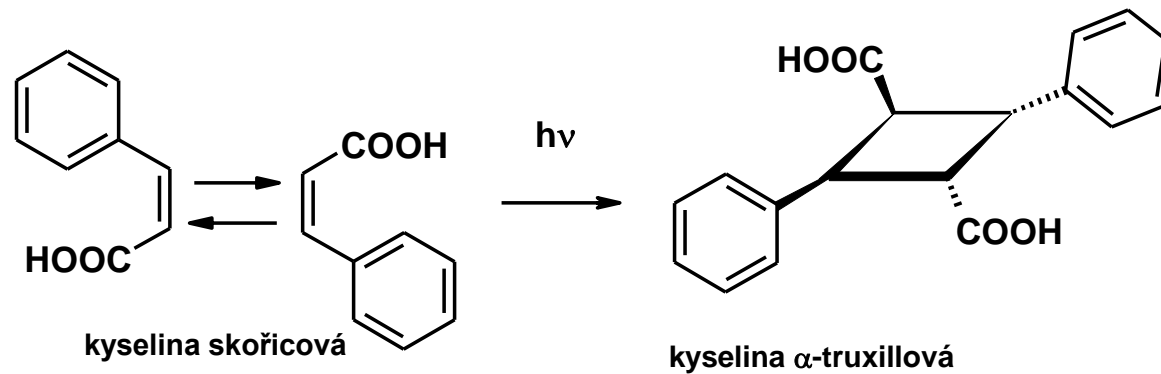
	R1	R2
kokain	COOCH <sub>3</sub>	OC-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
ekgonin	COOH	H
benzoylekgonin	COOH	OC-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
cinnamoylkokain	COOCH <sub>3</sub>	OC-CH=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
methylekgonin	COOCH <sub>3</sub>	H
tropakokain	H	OC-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
α-truxillin	COOCH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_5 - \text{C} - \text{C} - \text{COOH} \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{H} \\ \text{--- CO} - \text{C} - \text{C} - \text{C}_6\text{H}_5 \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{H} \end{array}$
β-truxillin	COOCH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_5 - \text{C} - \text{C} - \text{COOH} \\   \quad   \\ \text{C}_6\text{H}_5 - \text{C} - \text{C} - \text{CO} \cdot \\   \quad   \\ \text{H} \quad \text{H} \end{array}$



hygrin, R=CH<sub>2</sub>COCH<sub>3</sub>  
hygrolin, R=CH<sub>2</sub>CH(OH)CH<sub>3</sub>



kuskohygrin



# M U N I

## MENTHOLUM RACEMICUM – RACEMICKÝ MENTHOL

### P H A R M (ČL 2017)

Menthol vyvolává na kůži pocit chladu specifickým podrážděním nervových zakončení pro vnímání chladu.

Snižuje sekreci sliznic.

Působí antisepticky a antiflogisticky.

Alergen

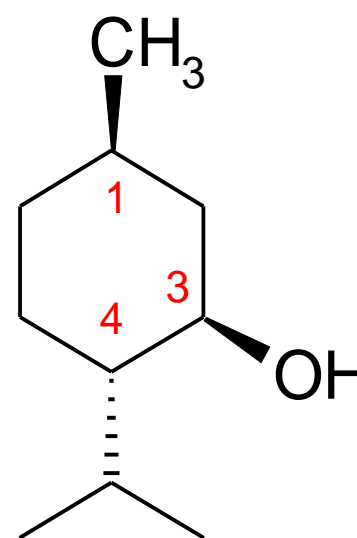
Použití:

slabé anestetikum

antipruriginosum

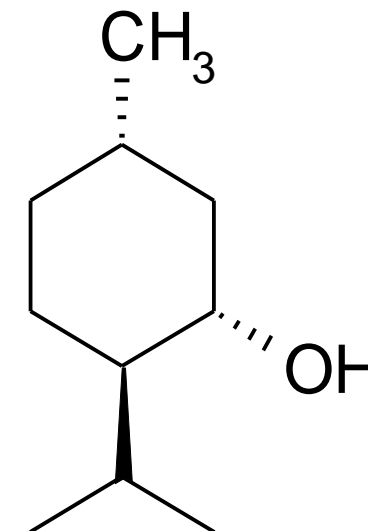
*Menthae piperitae folium* (ČL 2017)

*Menthae piperitae etheroleum* (ČL 2017)



(1R,3R,4S)-3-p-menthanol

přírodní



(1S,3S,4R)-



**CARYOPHYLLI FLOS – Hřebíčkovcový květ (ČL 2017)**

**CARYOPHYLLI ETHEROLEUM – Hřebíčková silice (ČL 2017)**

**EUGENOL**

Zdroj: *Syzygium aromaticum* – Hřebíčkovcový květ (Myrtaceae); strom pěstovaný v tropech

Droga: celé poupě sušené tak dlouho, dokud nezíská červeno- hnědou barvu. Obsahuje nejméně 150 ml silice / 1kg drogy. Získává se destilací s vodní parou.

OL: silice obsahující 70-85 % eugenolu, 10 %  $\beta$ -karyofylenu, alifatické a aromatické terpenoidy



# MUNI PHARM

Použití:

topické přípravky pro ošetření malých poranění  
infekce dutiny ústní (ústní hygiena)

koření

Indonésie – cigarety „KRETEK“

kosmetika – Old Spice

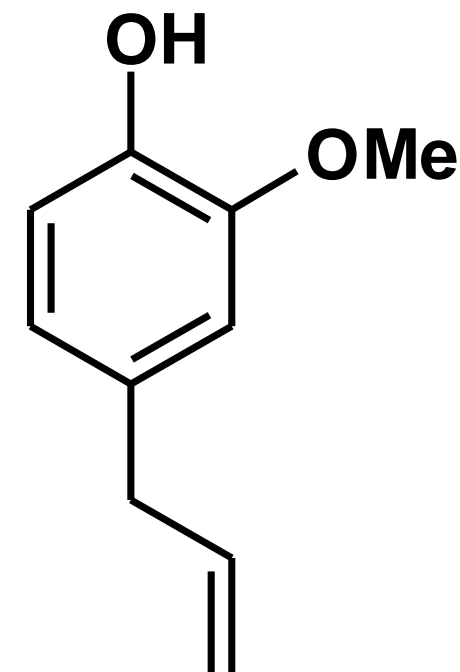
EUGENOL

CARYOPHYLLI ETHEROLEUM

Ve stomatologii:

lokální anestetikum

desinficiens



eugenol

4-allyl-2-methoxyfenol

# M U N I      A C E T Y L C H O L I N O V É   R E C E P T O R Y

## P H A R M

1. Receptory nikotinové
  - neuronální ( $N_N$  receptory) ganglia CNS, senzoričká nervová zakončení
  - muskulární ( $N_M$  receptory) **nervosvalová ploténka**
2. Receptory muskarinové
  - neuronální ( $M_1$  receptory) CNS, periferní neurony, parietální buňky žaludku
  - kardiální ( $M_2$  receptory) srdce a neuronální tkáně, včetně hladkých svalů
  - žlázy/hladké svaly ( $M_3$  receptory) exokrinní žlázy (zvýšení sekrece slinných, bronchiálních a jiných žláz), hladké svaly vnitřních orgánů (kontrakce)

Jsou kompetitivními antagonisty acetylcholinu na  $N_M$  receptorech. Obsazují postsynaptické nikotinové receptory na nervosvalovém spojení a zabraňují tak účinku acetylcholinu.

Specificky brzdí neuromuskulární přenosy dráždění. Z CNS se impulsy nepřenášejí na příčně pruhované svalstvo. Váže se na receptor, ale tím, že není degra-dován ACHE a neotevívá iontové kanály jako acetyl-cholin, způsobuje dramatický pokles ploténkového potenciálu.

Na hladké svaly bronchů, trávicího ústrojí a dělohy nepůsobí.  
Struktura podobná acetylcholinu.

Skupinové označení „kurareformní látky“, „kurarimi-metika“.

Prof. Edward Babák, 1. rektor VFU: Užití kurare jako blokátoru nervově svalového přenosu (1919)

# M U N I P H A R M

## PERIFERNÍ MYORELAXANCIA KURARE

Kurare – indiánský šípový jed s myorelaxačním účinkem. Toxický pouze při parenterální aplikaci. Per os neúčinné.

Specificky brzdí neuromuskulární přenosy dráždění. Z CNS se impulsy nepřenášejí na příčně pruhované svalstvo.

Užívaný indiány v ústí Amazonky a Orinoka k lovu zvěře, zřídka jako bojový prostředek

Zahuštěný vodní extrakt z částí rostlin rodu *Chondrodendron*, *Telitoxicum*, *Anomospermum* a *Strychnos*

dříve klasifikace podle typu obalů (charakteristické pro určité oblasti): tubokurare – v bambusových rourách, potkurare – v hliněných nádobách, kalebasové kurare – v plodech lahvovníku aj.

V současnosti: dělení kurare podle botanického původu a chemické konstituce obsahových látek

Zdroj: *Chondrodendron tomentosum* – *Ch. plstnatý*  
(Menispermaceae). Keře tropických pralesů Amazonie, Peru,  
Kolumbie

Droga: do pevné konzistence zahuštěný  
vodní extrakt kořenů, kůry a listů

OL: směs alkaloidů s převahou tubokura-  
rinu. Získá se izolací z  
vodného roztoku jako pikrát, pro aplikaci se užívá chlorid.

Další zdroje: rostliny rodu *Anomospermum*, *Telitoxicum*





**TUBOCURARINII CHLORIDUM – TUBOKURARINIUM-CHLORID**

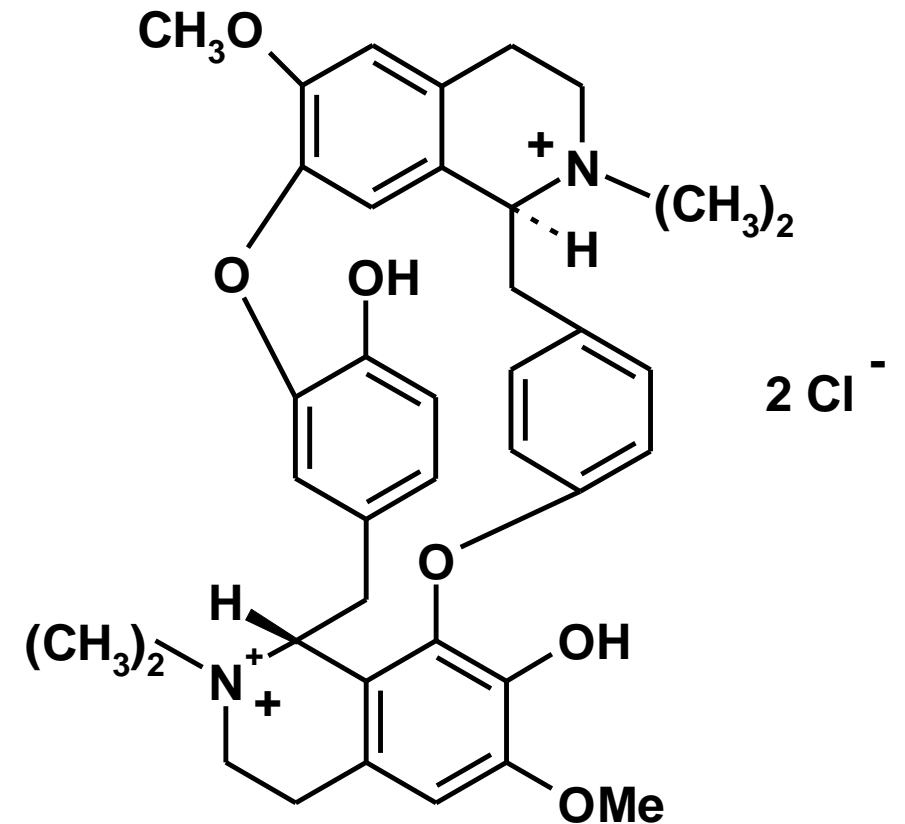
Použití:

Svalové relaxans v hrudní a břišní chirurgii při celkové anestézi

K uvolnění spasticity svalů

K uvolnění tetanických křečí

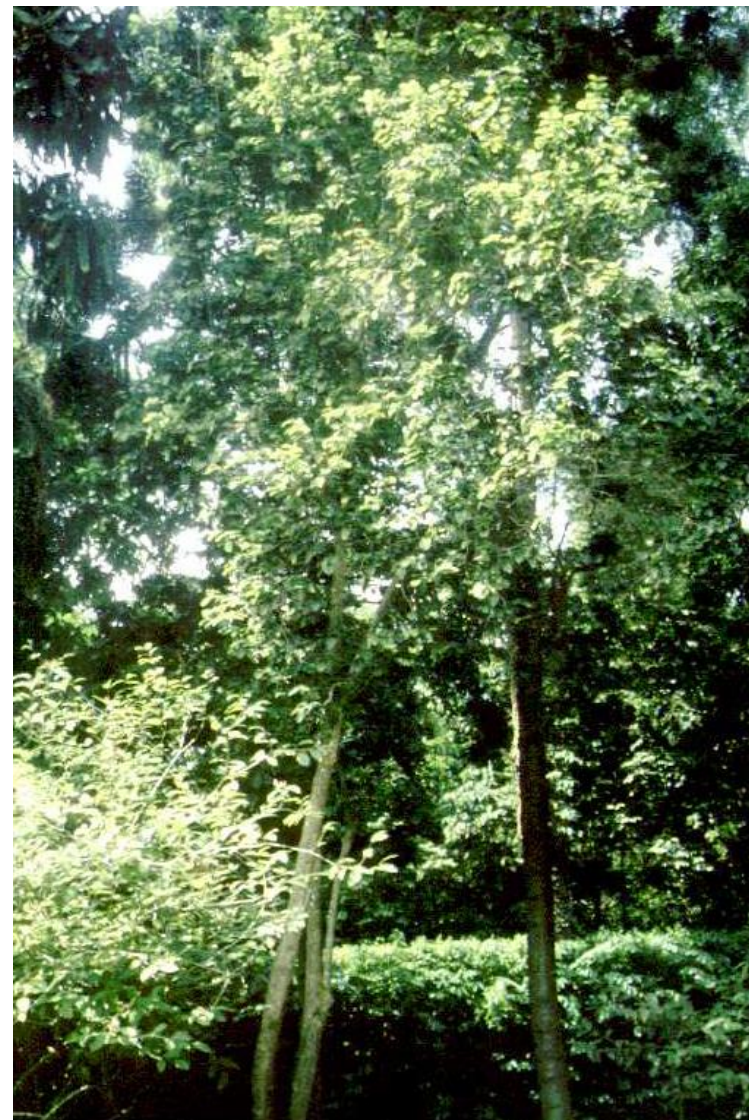
Diagnostikum *myasthenia gravis* = autoimunitní onemocnění, jehož příčinou je porucha přenosu vzruchu mezi nervem a svalem v oblasti nervosvalové ploténky  
TUBARINE inj.



Zdroj: *Strychnos toxifera*, *S. castelnaei*, *S. crevauxii* – kulčiba jedovatá (Loganiaceae); stromy Amazonie, Peru, Kolumbie

Droga: do pevné konzistence zahuštěný vodní extrakt kůry a listů

OL: deriváty bisindolových alkaloidů typu strychninu: C-toxiferin,  
C-kurarin



**M U N I**

**C-TOXIFERIN**

**P H A R M**

**ALCURONII CHLORIDUM – ALKURONIUMCHLORID (ČL 2017)**

Použití:

pro přípravu polosyntetického  
ALKURONIUMCHLORIDU

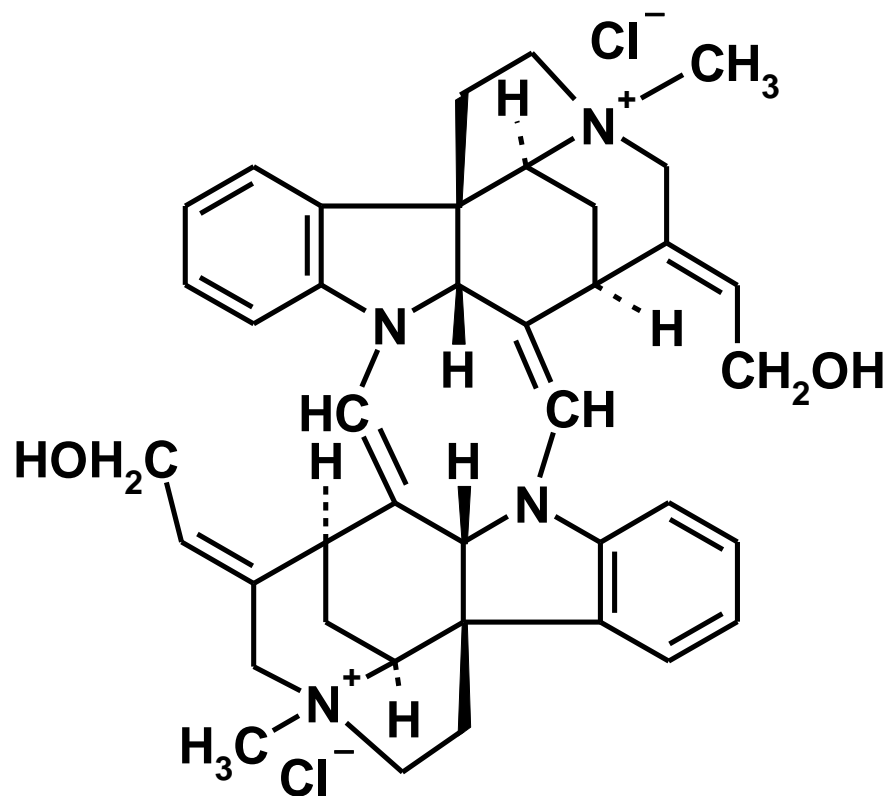
(methyly kvarternizující dusíky jsou nahrazeny  
allylem)

Svalové relaxans v hrudní a břišní chirurgii při celkové  
anestézi

K uvolnění spasticity svalů

K uvolnění tetanických křečí

ALLOFERIN inj.



# M U N I

## Periferní myorelaxans steroidního typu

# P H A R M

## MALOUETIN

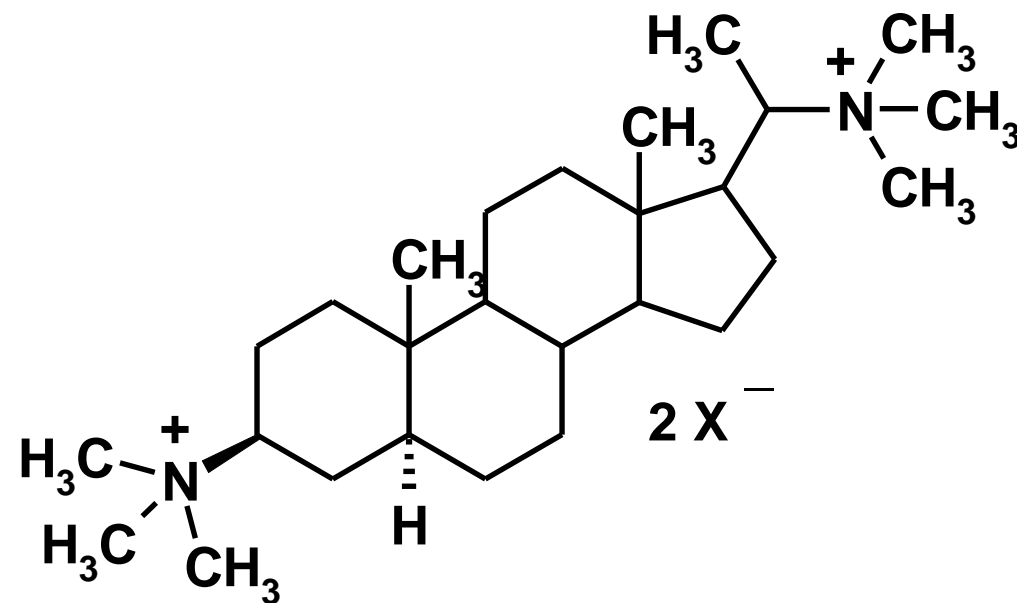
*Malouetia bequaertiana* Woodson (Apocynaceae)

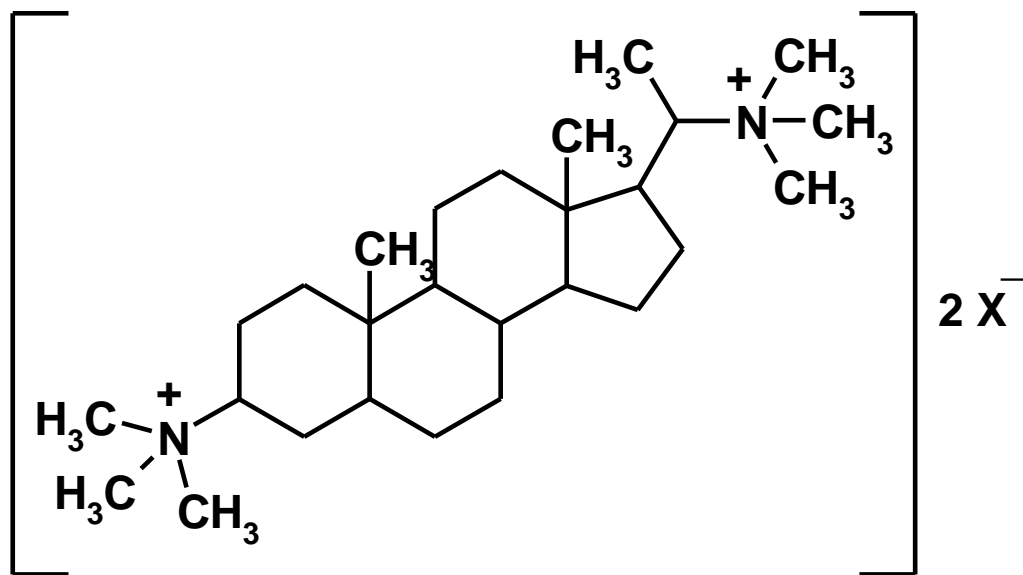
Keř nebo nízký strom tropů a subtropů Asie a Jižní Ameriky.

Používán jako součást šípových jedů.

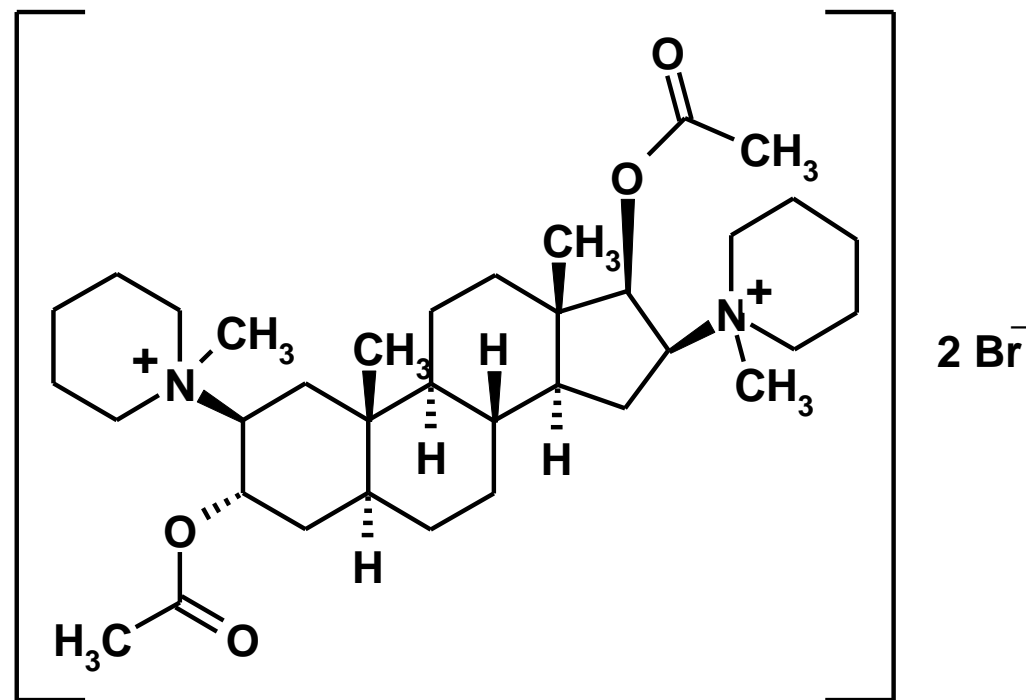
Předloha pro syntézu.

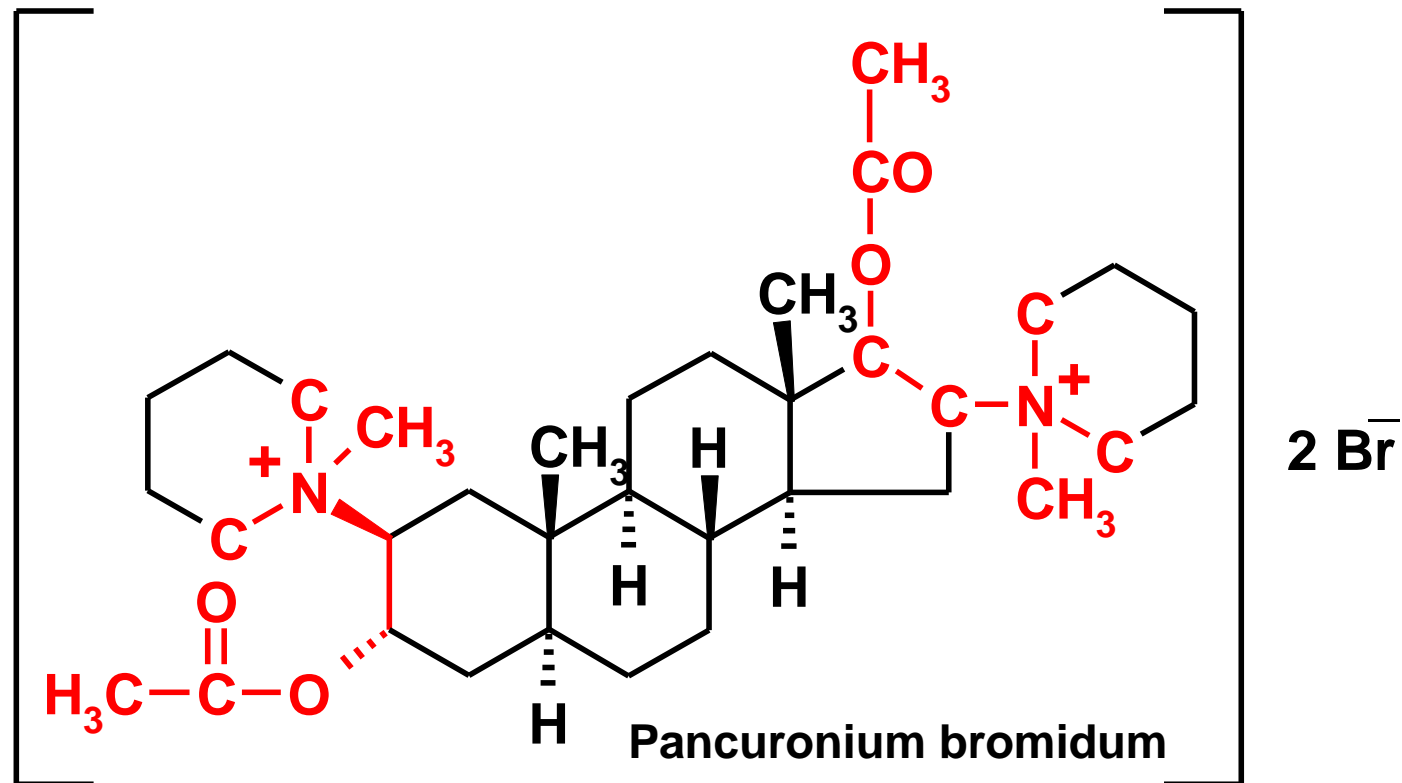
Pregnan-3,20-diamminium,  
N,N,N,N',N',N'-hexamethyl-  
dijodid (3-β,5-α,20S)



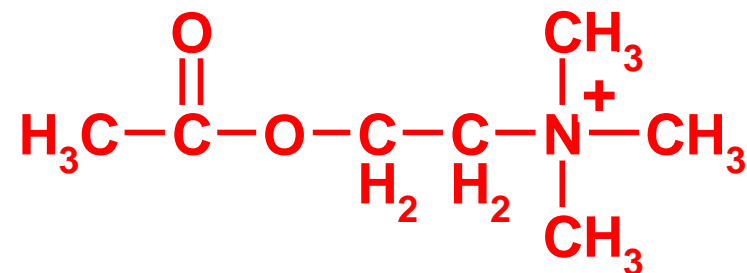


Ammonium 5  $\alpha$ -pregnan-3- $\beta$ ,20 $\alpha$ -ylenebis(trimethyl)dijodid





Vyvolá dramatický pokles ploténkového potenciálu



acetylcholin