

Obsah

Předmluva	3
1. Definice a charakteristika disciplíny	5
2. Vývoj chemických léčiv	6
3. Názvosloví léčiv	11
4. Zdroje nových chemických léčiv	15
4.1 Nahodilý screening	15
4.2 Objevování ztraceného	15
4.3 Obměňování struktur stávajících léčiv	16
4.4 Kombinatoriální chemie	16
4.5 Využití poznatku příbuzných oborů	17
5. Strukturální faktory ovlivňující účinek léčiv	20
5.1 Uhlíková složka	21
5.2 Dusíkaté funkční skupiny	24
5.3 Kyslíkaté funkční skupiny	29
5.4. Sírné sloučeniny	39
5.5 Halogenderiváty	42
6. Modifikace struktury	47
6.1 Izomerie	47
6.1.1 Strukturmi izomerie	47
6.1.2 Stereoizomerie	49
6.2 Homologie	60
6.3 Analogie	62
6.3.1 Hydrogenace a dehydrogenace	63
6.3.2 Analogie alkylová	65
6.3.4 Izosterie	69
6.3.5 Analogie funkčních skupin	73
6.3.6 Analogie kruhu	75
6.3.7 Modely	78
6.3.8 Zdvojení molekul	79
6.4 Prekurzory léčiv	82
6.4.1 Prekurzory se zvýšenou rozpustností ve vodě	83
6.4.2 Prekurzory se zlepšeným vstřebáváním	84
6.4.3 Prekurzory se specifitější distribucí	86
6.4.4 Prekurzory se sníženou toxicitou a redukovanými vedlejšími účinky	88
6.4.5 Prekurzory s protražovaným účinkem	90
6.4.6 Prekurzory se zvýšenou stabilitou	92
7 Fyzikálně-chemické vlastnosti	94
7.1 Rozpustnost	94
7.1.1 Zvýšení rozpustnosti ve vodě	96
7.1.2 Snížení rozpustnosti ve vodě	100
7.1.3 Zvýšení rozpustnosti v lipidech	101
7.2 Bazicit a kyselost	101
7.3 Adsorpce na rozhraní fázi	103
7.4 Kvantitativní vztahy mezi chemickou strukturou a biologickou aktivitou	104
Literatura	106