

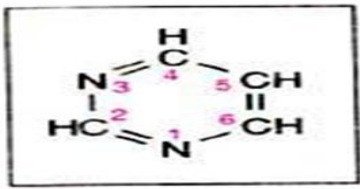
Дәрілік препараттардың синтезі мен олардың классификациясы.

Соңберген І. А.

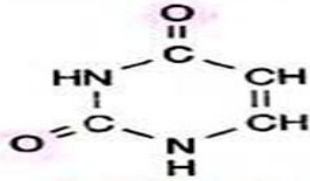
ОЗХТ-14-11

- ▶ Заттың химиялық және кеңістіктік құрылысы онда биобелсенділіктің болуын анықтайды. Дәрілік заттардың көбі суда жақсы еруі керек. Дәрілік заттарды сәйкес жүйесінде дұрыс тасымалдануын қамтамасыз ету үшін гидрофильді (суда еритін) және липофильді (майда еритін) фрагменттері болуы керек.

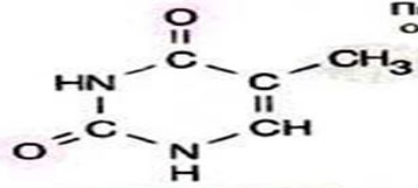
- ▶ Спиртті немесе карбоксильді топтары олардың күрделі немесе жай эфирлері түрінде болатын биобелсенді бөліктері бар дәрілік заттарды қолдану молекула полярлығын өзгертеді. Бензол сақинасын пиридинді, фуранды-пиррольді немесе тиофендіге алмастыру тиімді биоәсерге ықпал етпейді.



пиримидин

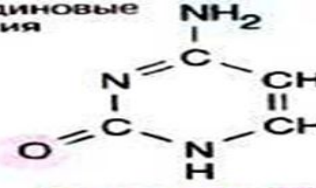


урацил (Ura)

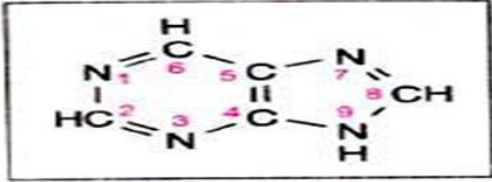


тимин (Thy)

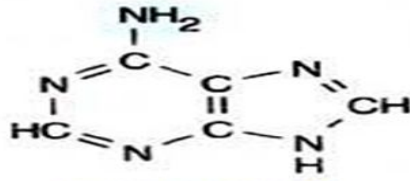
Пиримидиновые основания



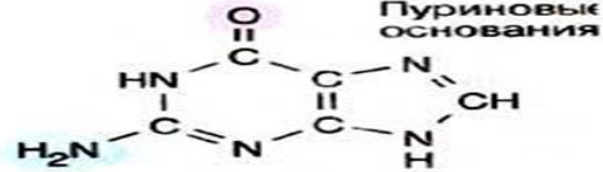
цитозин (Cyt)



пурин



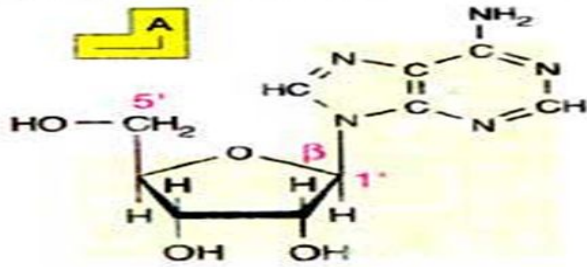
аденин (Ade)



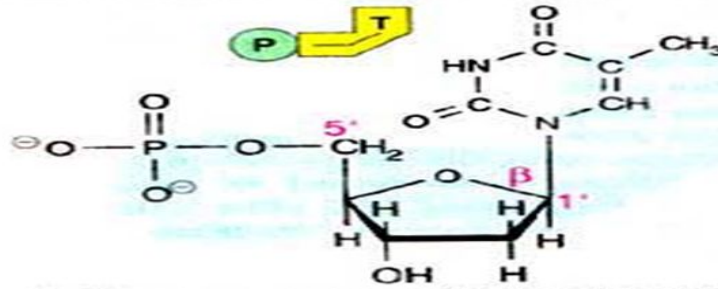
гуанин (Gua)

Пуриновые основания

A. Азотистые основания

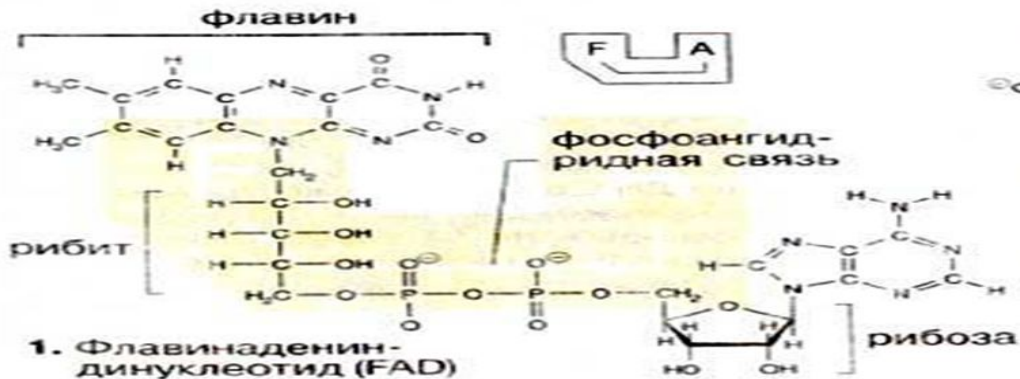


1. Аденозин (A)

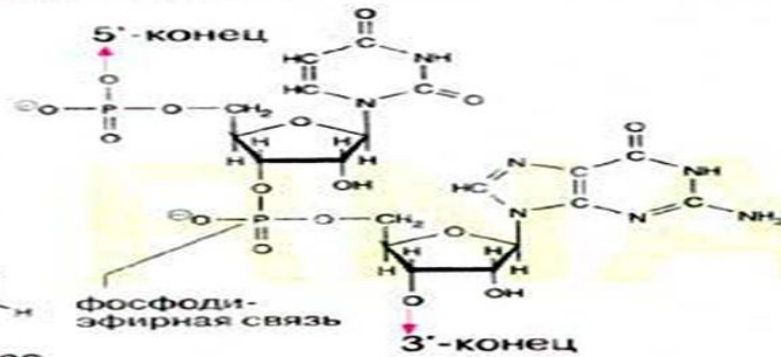


2. Дезокситимидин-5-фосфат (dTMP)

Б. Нуклеозиды, нуклеотиды



1. Флавинадениндинуклеотид (FAD)



2. RNA (фрагмент)

В. Олигонуклеотиды, полинуклеотиды

- ▶ Қорытындысында дәрілердің әсерін пролонгирлеу (ұзарту) бойынша қазіргі қолданылатын дәрілік формаларға ұнтақтар, таблеткалар, капсулалар, жақпа майлар, ерітінділер жатады.



- ▶ Жаңа тиімді бағыттардың бірінде дәрілік зат қосылатын (жалғанатын) биосәйкес полимерлі материалдар қолданылады. Дәрілік затты полимер-тасымалдағышпен енгізу оның әсерін ұзартып және енгізу орнындағы диффузияның баяулауының әсерінен ағзаға берілуін бақылауға мүмкіндік бере отырып, препараттың фармакокинетикалық және фармакодинамикалық қасиеттерін жақсартады.



Дәрілік заттарды дайындау принципі

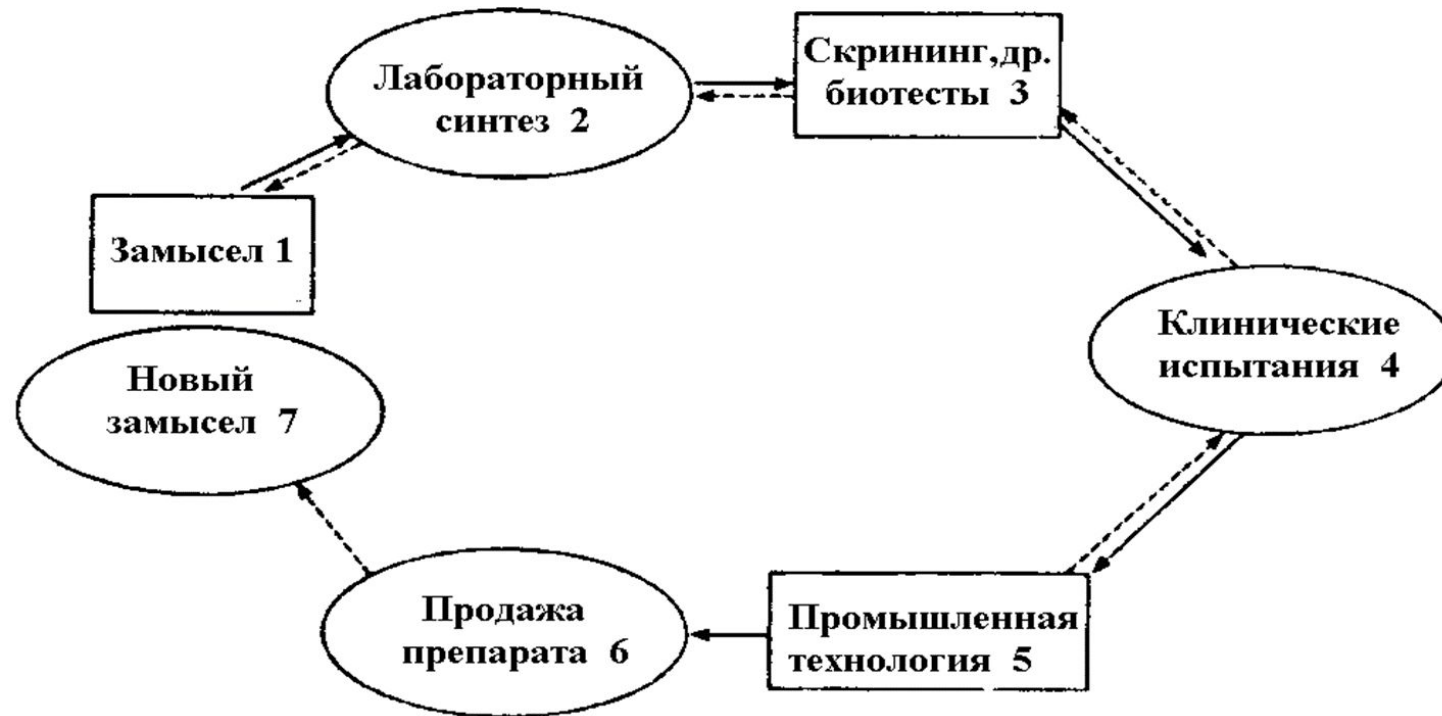
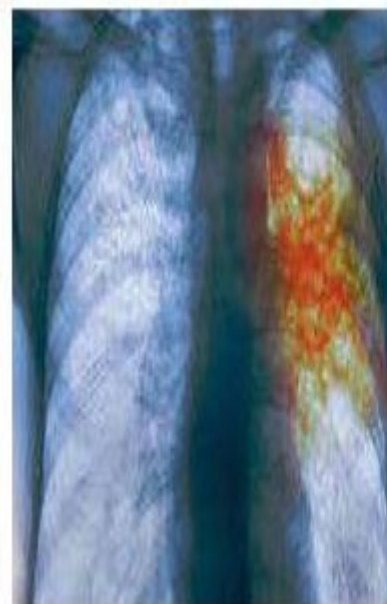


Рис.1 Общая схема разработки лекарственного вещества

- ▶ Бірінші сатыда синтезделетін зат туралы ой пайда болады.
- ▶ Екінші саты дәрілік затты синтездеу әдістерін зертханалық зерттеуден, алудың қарапайымдылығы, шығымы, ерігіштігі және техникo-экономикалық көрсеткіштері бойынша таңдаудан тұрады.
- ▶ Биотестілеу белсенсіз синтетикалық қосылыстардың негізгі бөлігінің жарамсыздығын дәлелдеп, физиологиялық белсенділігі жоғары, улылығы және кері әсерлері жоқ тиімді заттарды анықтайды.
- ▶ Төртінші сатыда адамдарға клиникалық зерттеу жүргізіледі, оның барысында дәрілік заттың жоғары емдік эффективтілігі расталып, аурулардв емдеу кезінде жағымсыз кері әсерлерінің болу-болмауы анықталады.
- ▶ Клиникалық зерттеулер оң нәтиже көрсетсе, бесінші сатыда дәрілік зат өндірістік синтездің технологиясын дайындауға жіберіледі, бұл ең қымбат және еңбекті көп қажет ететін саты болып табылады.
- ▶ Зауыттық өндірістен дәрілік зат сатуға жіберіледі (алтыншы саты).

- ▶ Химиотерапевтикалыққа паразиттік ағзаларға әсер ететін инфекцияға қарсы дәрілік заттар: антивирустық, антимикробтық (антибиотиктер, антисептиктер), туберкулезге қарсы, малярияға қарсы, фунгицидтік, ісікке қарсы препараттар жатады.



- ▶ Алу көздері бойынша дәрілік заттар синтетикалық (барлық дәрілік заттардың 70%-ын құрайды), жартылай синтетикалық (табиғи заттардан оларды химиялық модификациялау жолымен алынады, мысалы, пенициллин қатарының антибиотиктері) және табиғи (мысалы, алкалоидтар, антибиотиктер, гормондар, дәрумендер, гормондық заттар және т.б.) болып бөлінеді.



- ▶ Химиялық құрылысы бойынша дәрілік заттар бейорганикалық (тұздар, оксидтер, кешенді қосылыстар), алифатты, алициклды, ароматты және гетероциклды қатарлардың органикалық синтетикалық туындылары (әр қатардың ішінде дәрілік заттарды функционалды топтар мен орынбасарлардың болуына байланысты бөледі), органикалық табиғи қосылыстар (алкалоидтар, антибиотиктер, гормондар, дәрумендер, гликозидтер және т.б.) болып бөлінеді.



Антибиотик - средство уничтожающее бактерии или сдерживающее их рост



- Жалпы саны бойынша дүние жүзінде пневмония мен гриппке қарсы дәрілік заттар (10%), жүрек-қантамырға арналған заттар (8%), ревматизмге қарсы (4%) және анальгетиктер (2%) сатылды. Дәрілік заттардың жеке топтарының ішінде сатылуы бойынша бірінші орынды пенициллиндік және цефалоспориндік антибиотиктер (8%) алады.



- ▶ Химико-фармацевтикалық өнеркәсіптің өндіретін препараттар саны бойынша бірінші орынды жүрек-қантамыр ауруларын емдейтін дәрілік заттар алады. Екінші орында антибактериалды заттар тұр. Алдыңғы топқа, сондай-ақ, ауруды басатын және ісікке қарсы дәрілік заттар кіреді.

