

Дәрілік формалардың технологиясы

Дәріс №1

**Тақырып: Дәрілік формалар технологиясының
қысқаша тарихы**

Дәріс 1

Дәрілік формалар технологиясының қысқаша тарихы

Жоспары:

1. Ежелгі өркениеттердің медицинасы мен фармацевциясы
2. Орта ғасырлардағы Таяу Шығыс пен Батыс Еуропаның медицинасы мен фармацевциясы
3. Қазіргі замандағы дәрілік заттарды өндіру

КІРІСПЕ

Фармацевтикалық препараттар - бұл өндірістің нақты өнімі, оның сапасын тұтынушы өз бетінше бағалай алмайды, сондықтан препараттардың сапасына, тиімділігіне және қауіпсіздігіне кепілдік мемлекеттің халықтың денсаулығын қорғаудағы негізгі міндеттерінің бірі болып табылады.

Әлемдік тәжірибеде GMP тұжырымдамасының дамуы нәтижесінде тезис қалыптасты: сапаны фармацевтикалық препаратқа сынақтар арқылы қосу мүмкін емес, оны өндіріс үрдісіне енгізу керек.

GMP стандарттары фармацевтикалық препараттардың сапасын қамтамасыз ету бойынша барлық жұмыстарды жүйелейді, бұл ретте шикізат сапасынан бастап дайын өнімге дейінгі барлық үрдістерді бақылауды құжаттамалық рәсімдеуге тиісті көңіл бөлінеді.

"Дәрілік заттардың технологиясы" курсының мақсаты студенттердің білімі мен практикалық дағдыларын қалыптастыру, өңдеу, бастапқы материалдарды, жартылай өнімдерді, дайын өнімдерді алу және олардың сапасын бақылау болып табылады.

Сондықтан, осы оқу құралында авторлар фармацевтикалық препараттарды өндіру саласындағы кейбір негіздерге, ұғымдарға және негізгі терминологияға арнаған.

Экстракция негіздері, экстракция үрдісін күшейту. Экстракция кезеңдері және олардың сипаттамалары. Экстракцияның толықтығы мен жылдамдығына әсер ететін факторлар. Еріткіштерге қойылатын талаптар. Экстракт алудағы қажетті параметрлер және оларды қалай қарастыру керек. Жіктеу және сапаны бақылау. Сұйық сығындылар өндірісі. Өсімдік шикізатынан сығындыларды алуды күшейту әдістері. Қою және құрғақ сығындылар өндірісі. Булану және кептіру үрдісінің негіздері, жабдықтар және оның жұмыс принципі Жұмсақ дәрілік формаларды, шырындарды өндіру, оларға қосылатын қосымшалар. МФ сәйкес сапаны бақылау.

Суппозиторийлер, жіктеу және оларға қойылатын талаптар. Негіздер мен қосалқы заттардың сипаттамасы. Өндіріс әдістері. МФ сәйкес сапаны бақылау. Фармацевтикалық препараттар өндірісі.

Дәрілік түрі ретінде жақпа. Жақпаға қойылатын талаптар, жақпа негіздерінің жіктелуі және оларға қойылатын жалпы талаптар. Таблетка өндірісіндегі көмекші заттар.

Капсула түрлері және олардың мақсаты. Капсула өндірісіндегі көмекші заттар. Жұмсақ және қатты желатинді капсулаларды өндіру әдістері, оларды дәрілік заттармен толтыру.

Валидация жайлы жалпы түсінік. Материалдық балансты сәтті игеру үшін есептер мен шешімдері берілген, олар студенттердің алған ақпараттарына және бағдарлау қабілетін дамытуға ықпал етеді.

ДӘРІЛІК ЗАТТАР ТЕХНОЛОГИЯСЫ, ОНЫҢ ӨЗЕКТІЛІГІ

Қазіргі уақытта қоғам өмірін дәрі - дәрмексіз елестету мүмкін емес. Академик И. П. Павлов дәрі-дәрмектің дәрігердің әмбебап қаруы екенін және хирургиялық, акушерлік немесе басқа да медицинадағы араласулар дәрі-дәрмектерді қолданбай жасалмайтынын атап өтті. Көне заманда науқасты емдеу халық медицинасына сүйенген. 100 жылдан астам уақыт бұрын Н.И. Пирогов: «Болашақ, медициналық дәрі-дәрмектерге жататынын» атап өтті. Шынында да, қазіргі уақытта дәрігердің барлық тағайындауларының 90% - ы дәрі-дәрмектерді қолдануға әкеледі. Дәрі-дәрмектер операциядан кейінгі асқынуларды емдеу үшін, ағзалар мен тіндерді трансплантациялау, жүрек-тамыр, онкологиялық, эндокриндік, вирустық ауруларды, сондай-ақ жүйке жүйесінің ауруларын емдеу үшін кеңінен қолданылады. Осылайша, дәрі-дәрмекпен қамтамасыз ету қазіргі қоғамның тіршілік әрекетінің негізі болып табылады. Адамның ыңғайлы және ұзақ өмір сүруіне мүмкіндік беретін дәрі-дәрмекпен қамтамасыз етуді ұйымдастыру **өзекті** мәселе.

Дәрілік түрлерге қойылатын талаптар. Тиімді дәрілік препаратты алу мақсатында бірде-бір дәрілік затты (фармацевтикалық субстанцияны) қайта өңдеусіз пайдалануға болмайды. Шынында да, науқасқа 0,0005 г нитроглицеринді қалай қолдануға болады? Ол үшін қолдануға ыңғайлы дәрілік түр дайындалуы тиіс немесе құрамында 1 қабылдауға арналған дәрілік заттың осы дозасы бар қатты (таблетка) немесе сұйық (ерітінді) болады. Бұл ретте дәрілік нысан дәрілік препараттың барынша ықтимал тиімділігін, сақтау кезіндегі оның тұрақтылығын қамтамасыз ету тұрғысынан ұтымды болуға тиіс. Сонымен, нитроглицерин асқазан қышқылында ыдырайды, бірақ ауыз қуысының шырышты қабығымен жақсы сіңеді. Сондықтан сублингвальды сіңіруге арналған таблетка немесе спрей түріндегі дәрілік форма оңтайлы болып табылады.

Нитроглицерин - ұшпа сұйықтық, сондықтан нитроглицериннің таблеткадан аз булануын қамтамасыз ету керек, яғни, таблетканың кеуектілігін төмендететін қосымша заттарды енгізу керек (біздің жағдайда бұл полиэтиленгликоль және поливинилпирролидон полимерлері), ал олардың мөлшері нитроглицериннің таблеткадан шығарылу жылдамдығын және шырышты қабық арқылы сіңуін нашарлатпауы керек. Препарат сақталу кезінде тұрақты болуы тиіс, яғни жарамдылық мерзімі ішінде қаптамада көрсетілген дәрілік заттың дозасы болуы тиіс.

Жоғарыда айтылғандар мынаны көрсетеді: тиімді және қауіпсіз дәрілік затты (препаратты) жасау үшін ғылым мен технологияның барлық соңғы жетістіктерін пайдалану қажет. Дәрілік заттардың айналысы туралы заңда "дәрілік зат" терминінің кеңейтілген түсіндірмесі белгіленген.

Бұл фармацевтикалық заттар (тікелей байланысқа түсетін және адам ағзасының мүшелері мен тіндеріне енетін заттар) және дәрі-дәрмектер. Сондықтан дәрілік

нысандар технологиясының мақсаты: тиімді және қауіпсіз дәрілік препараттарды жасау болып табылатын ғылым мен техника жетістіктеріне негізделген ғылыми білімнің жеке саласы.

ДӘРІЛІК ЗАТТАР ТЕХНОЛОГИЯСЫНДА ҚОЛДАНЫЛАТЫН НЕГІЗГІ ТЕРМИНДЕР

Фармацевтикалық ғылым (фармация) - дәрілік заттар мен препараттарды іздестіру, қасиеттері, жасау, өндіру, талдау туралы, сондай-ақ фармацевтикалық қызмет пен маркетингті ұйымдастыру туралы ғылыми білім жүйесі. Дәрілік заттардың алуан түрінің технологиясы фармацевтика ғылымының құрамдас бөлігі болып табылады.

Дәрілік заттар технологиясы - белгілі бір дәрілік форманы беру арқылы дәрілік заттар мен қосымша заттарды дәрілік препараттарға өңдеудің теориялық негіздері мен өндірістік үрдістері туралы ғылым.

Дәрілік заттар технологиясының міндеті - дәрілік нысандарды дайындаудың теориялық және технологиялық үрдістерін зерттеу және белгіленген физикалық, химиялық, механикалық және басқа заңдылықтар негізінде ең тиімді және үнемді өндірістік үрдістерді практикаға енгізу.

Дәрілік заттар технологиясының негізгі бағыттары.

- дәрілік нысандарды дайындаудың қолданыстағы әдістерінің теориялық негіздемелерін әзірлеу;
- жаңа дәрілік заттарды - формаларды жасау, онда емдік әсері, ең аз жанама әсері барынша аз және науқастар пайдаланған кезде ыңғайлы болуы керек;
- дәрілік заттарды - формаларды дайындаудың белгілі тәсілдерін жетілдіру және сабақтас ғылымдардың қазіргі заманғы жетістіктерін пайдалану негізінде жаңаларын жасау.
- тиімді және қауіпсіз дәрілік препараттарды дайындау үшін медицина, химия және биохимия білімін қолдану қажет;
- дәрілік түрлерді дайындау үшін заманауи жабдықтарды пайдалану керек;
- дәріханалар жағдайында дәрілік түрлерді дайындауға арналған қосымша заттардың, концентраттар мен жартылай фабрикаттардың ассортиментін кеңейту қажет;
- дәрілік нысандардың сапасын бағалаудың физика - химиялық әдістерін қолдану керек;
- заманауи қаптама материалдарын пайдалану керек.

Кейбір терминологиялар және талаптар

- **Аборальды** – ауыз қусына қарама қайшылық. Дәріні енгізу тәсілі - ректальді сөзінің синонимі.
- **Аддитивтік синергизм** – (лат. addition – қосу; син.: дәрілік заттардың аддитивтік әсері) дәрілік заттарды қосып қолданғанда ақырғы әсері әрбір заттың бөлек қолданған кезде әсерлерінің қосындысына тең болатын синергизмнің түрі.

- **Агрегация** - қанның арнаулы элементтерінің жабысуы (эритроцит, тромбоцит және т.б.) сондай-ақ дәрілік заттардың дұрыс сақталмауы (таблетка, драже, түйіршік т.б.). Бұған кері үрдіс дезагрегация (жоғалу немесе еріп ету) деп аталады.
- **Адьюванттар** – (лат. Adiuvars - көмекші) шығу тегі және химиялық табиғаты түрлі, ағзаға антигенмен бірге енгізілген иммуногенезді спецификалық емес (беймарал) ынталандыратын заттар тобы. Алюминий гидратының тотығы, хлорлы кальций, желатин, минералды, өсімдік және жануарлар майы, эфир майларының және алты атомды спирттің эфирлері секілді адьюванттардың әсер ету механизмі ағзада антигендер «депосын» құрумен сипатталады.
- **Антиангиналды дәрілер** – (**анти+ angina pectoris**)- жүрекке оттегі жеткізілуін жақсартатын немесе жүректің оттегіне қажеттілігін төмендететін стенокардия ұстамасының алдын алу немесе оны басу үшін қолданатын дәрілер (нитроглицерин, пропранолол т.б.).
- **Антибластомды дәрілер** – қатерлі ісікке қарсы дәрілер.
- **Термин** (лат. terminus-шек, шекара) - ғылымның, техниканың және т.б. қандай да бір арнайы саласының белгілі бір ұғымдарын көрсететін сөз немесе сөзжасам.
- Дәрілік нысандар технологиясының терминологиясы мынадай терминдерді қамтиды: дәрілік заттар - формалар технологиясының терминдері;
- Халықаралық химиялық терминдер; арнайы фармацевтикалық ғылымдар терминдері (фармацевтикалық химия, фармакогнозия, фармацевцияны ұйымдастыру және экономикасын қадағалау және т. б.);
- техникалық терминдер (аппараттар, үрдістер, материалдар).
- Дәрілік формалар технологиясында қолданылатын барлық терминдер бір-бірімен байланысты, яғни, дәрі-дәрмектің өмірлік циклінің жеке кезеңдерін анықтайды, бірақ ұғымдар мен анықтамалардың байланысқан тізбегіне біріктірілген.
- Дәріхана ұйымы (дәріхана, медициналық ұйымның дәріханасы, дәріхана пункті, дәріхана дүкені, дәріхана дүңгіршегі) - осы республикалық заңның талаптарына сәйкес дәрілік заттарды сақтауды, дәрі-дәрмектерді бөлшектеп сатуды, дәрі-дәрмектерді өндіруді және сатуды жүзеге асыратын заңды тұлға немесе жеке кәсіпкер.
- **Дәрілік заттардың қауіпсіздігі** - дәрілік заттардың тиімділігін салыстырмалы талдауға және денсаулыққа зиян келтіру қаупін бағалауға негізделген сипаттама.
- **Қайта өндірілген дәрілік препарат** - құрамында дәл сондай әсер етуші зат немесе әсер етуші заттардың комбинациясы бар, бірегей дәрілік препаратқа ұқсас және бірегей дәрілік препаратқа биоэквивалентті дәрілік препарат болуы тиіс.
- **Қосымша заттар** - бұл қажетті физика-химиялық қасиеттерді беру үшін дәрілік заттардың дәрілік түрлерін өндіру және өндіру үрдісінде қолданылатын органикалық немесе бейорганикалық заттар.
- **Мемлекеттік фармакопея** - фармакопеялық мақалалар жинағы.
- **Дәрілік заттың сапасы** - дәрілік заттың фармакопеялық баптардың талаптарына немесе олар болмаған жағдайда нормативтік құжаттамаға сәйкестігімен түсіндіріледі.

- **Дәрі-дәрмектің химиялық эквиваленті** – дәрі құрлымының химиялық және физикалық құрамы мемлекеттік стандартқа сәйкес келетінін білдіреді.
- **Контрафактілік дәрілік заттар** - айналымы азаматтық заңнаманы бұза отырып жүзеге асырылатын дәрілік заттар.
- **Дәрілік түр** - дәрілік препаратқа берілетін, оны енгізу жолдары мен қолдану тәсіліне сәйкес келетін және қажетті емдік әсерге қол жеткізуді қамтамасыз ететін күйі.
- **Дәрілік препараттар** - аурудың алдын алу, диагностикалау, емдеу, жүктілікті сақтау, болдырмау немесе ұзу үшін қолданылатын дәрілік нысандар түріндегі дозаланған дәрілік заттар.
- **Дәрілерді тіркеу** – оны қолдану, сапасын, әсерлігін, қауіпсіздігін анықтайтын тиянақты қатты бағалау Фармакологиялық, фармакопоялық және Ұлттық ведомствалармен келісімі бойынша жүргізіледі.
- **Дәрілік заттар** - тікелей байланысқа түсетін және адам ағзасының ағзалары мен тіндеріне әсер енетін, профилактика, диагностика (адам немесе жануар ағзасымен жанаспайтындарды қоспағанда), ауруды емдеу, жүктілікті сақтау, алдын алу немесе ұзу үшін қолданылатын, қаннан, қан плазмасынан, сондай-ақ адамның немесе жануардың ағзаларынан, тіндерінен, өсімдіктерден, минералдардан, синтез әдістерімен немесе биологиялық технологияларды қолдана отырып, алынған заттар немесе олардың комбинациялары:
 - Дәрілік заттарға оның ішінде фармацевтикалық субстанциялар мен дәрілік препараттар жатады.
 - Дәрілік заттың халықаралық патенттелмеген атауы - Дүниежүзілік денсаулық сақтау ұйымы ұсынған дәрілік заттың атауы.
 - Есірткі құралдары -1961 жылғы бірыңғай конвенцияға сәйкес жасалған және жаңартылатын, бақылауға жататын есірткі, психотроптық заттар мен олардың прекурсорларының тізбесіне енгізілген дәрілік заттар.

Дәрілердің әсер ету механизмі – көптеген дәрілер ферменттер, жасушалық мембрана немесе басқа арнайы функционалды компоненттермен әсер етеді.

Сапасыз дәрілік зат - фармакопоялық баптың немесе нормативтік құжаттаманың талаптарына сәйкес келмейтін дәрілік зат.

Нормативтік құжаттама - нақты өндіруші ұйымның дәрілік затына белгіленетін дәрілік заттың сапа көрсеткіштерінің және сапасын бақылау әдістерінің тізбесі.

Дәрілік заттардың айналымы - Дәрілік заттар айналымы саласындағы жұмыстар: дәрі-дәрмектерді әзірлеу, зерттеу, мемлекеттік сараптама, мемлекеттік тіркеу, стандарттау және сапаны бақылау, өндіру, дайындау, сақтау, буып-түю, дәрілік затты кедендік аумаққа әкелу, республиканың кедендік аумағынан әкету, тасымалдау, сату, жарнама, дәрі-дәрмектерді қолдану, дәрілік заттарды кәдеге жарату, жою және басқа да әрекеттерді қамтитын қызметтің жалпыланған тұжырымдамасы.

Дәрілердің Мемлекеттік Реестрі – қолдануға және өндіруге рұқсат етілген дәрілер туралы мәліметтерден тұратын мемлекеттік құжат.

Дәрілердің сапалық стандарттары – дәрілердің өнімнен, субстанциядан бастап дайын дәрілік түрге дейінгі тиімділігіне, қауіпсіздігіне және сапалығына қойылатын халықаралық талаптар. Клиникаға дейінгі, лабораториялық эксперименттердің әдістеріне, шарттарына, тазалығына және сапалығына (GLP), дәрілердің клиникалық зерттеулері (GCF) мен өнеркәсіптік өндірілуіне (GMP) қойылатын талаптар. Олардың негізгін ұлттық және халықаралық стандарттау мен сертификаттау құрайды.

Дәрілердің фармакодинамикалық әрекеттестігі – жасушалардың, гормоналді, медиаторлы рецепторлары арқылы, сонымен қатар, тіндердің, мүшелердің, функционалды жүйенің қызметінің өзгеруі арқылы жүруін көрсетеді.

Дәрілердің мутагендік әсері – дәрілердің ұрық жасушаларының генетикалық аппаратын тұрақты зақымдап, ауытқыған гендердің тұқым қуалауына әкелетін қасиеті.

Бірегей дәрілік препарат - қауіпсіздігі клиникаға дейінгі және клиникалық зерттеулердің нәтижелерімен расталған, бұрын тіркелген барлық дәрілік препараттардан әсер етуші затпен немесе әсер етуші заттардың құрамасымен ерекшеленетін дәрілік препарат.

Дәрі-дәрмектердің көтерме саудасын ұйымдастыру - осы мемлекеттік Заңның талаптарына сәйкес дәрі-дәрмектерді сақтауды және дәрі-дәрмектердің көтерме саудасын жүзеге асыратын заңды тұлға немесе жеке кәсіпкер.

Психотроптық дәрілік заттар - мемлекетте бақылауға жататын, 1961 жылғы Психотроптық заттар туралы конвенцияға және заңнамаға сәйкес жасалған және жаңартылатын есірткі, психотроптық заттар мен олардың прекурсорларының тізбесіне енгізілген дәрілік заттар.

Тіркеу нөмірі - мемлекеттік тіркеу кезінде дәрілік затқа (препаратқа) берілетін кодтық белгі.

Сапа сертификаты - дәрілік зат (препарат) сапасының мемлекеттік сапа стандартына сәйкестігін растайтын құжат.

Дәрілік препараттың саудалық атауы - әзірлеуші ұйым дәрілік препаратты мемлекеттік тіркеу үшін мәлімдейтін атауы.

Фармакопеялық бап - Дәрілік заттың (препараттың) сапасын бақылау көрсеткіштері мен әдістерінің тізбесін қамтитын дәрілік заттың (препараттың) Мемлекеттік стандарты.

Фармацевтикалық қызмет - дәрілік заттарды сақтауды, дәрілік заттардың көтерме саудасын және дәрілік препараттардың бөлшек саудасын, дәрілік заттардың көтерме сауда ұйымдары мен дәріхана ұйымдары жүзеге асыратын дәрілік препараттарды дайындауды және босатуды қамтитын дәрілік заттар айналымы саласындағы қызмет.

Фармацевтикалық субстанциялар (әсер етуші заттар) - фармакологиялық белсенділігі бар, дәрілік препараттарды өндіруге және дайындауға арналған және

олардың тиімділігін айқындайтын өсімдіктерден, жануарлардан алынатын, биотехнологиялық немесе синтетикалық заттар.

Дәрілік препараттың тиімділігі - дәрілік препараттың аурудың ағымына, ұзақтығына немесе алдын алуға, жүктілікті сақтауға, алдын алуға немесе тоқтатуға оң әсер ету дәрежесінің сипаттамасы.

Синергизм (грек тілінен. συνεργία Synergos - (syn)бірге (ergos) әрекет ету,) - бұл екі немесе одан да көп факторлардың өзара әрекеттесуі, олардың әрекеті қарапайым қосынды түрінде әрбір жеке компоненттің әсерінен едәуір асып түсетіндігімен сипатталады.

Дәрінің фармакокинетикалық үрдісі – дәрілік заттарды жұту – асқазан-ішек жолдарында дәрілік заттардың молекуласын сіңіру және енгізген жерде (тері астына, бұлшық етке, субарахноидальды, эндолюмбальды және т.б.) диффузия үрдісі және молекулалардың белсенді тасымалдануы;

Дәрілік заттардың таралуы – қан плазмасынан дәрілік заттарды басқа биологиялық сұйықтыққа тасымалдау (тіндер арасындағы сұйықтық, сілекей т.б.);

Дәрілік заттардың метаболизмі – дәрілік заттардың биотрансформация молекуласының синтетикалық және синтетикалық емес реакциясы;

Дәрілік заттардың элиминациясы – фильтрация, диффузия және секреция жолымен бүйректің проксимальді тубулярлы жүйесімен ақырғы зәрмен сілтенуі.

Проксимальді - орталыққа жақын немесе дененің ортаңғы сызығына жақын орналасқан.

Хронофармакодинамика – тәуліктің әртүрлі уақытында ағзаның сезімталдығына тәуелді дәрілердің әсерін зерттеуші фармакологияның бір бөлімі, мысалы, морфин (күннің екінші жартысында белсендірек), нитроглицерин.

Хронофармакокинетика – фармакокинетикалық сипаттамалардың тәуліктік биоырғаққа тәуелділігін қарастыратын фармакологияның бөлімі, мысалы, литий препараттары ішке енгізілген кезде, күндізгіге қарағанда түнде аз мөлшерде бөлінеді.



Биологиялық белсенді заттардың құрлысы мен белсенділігі арасындағы байланыс.

Биологиялық белсенді заттар неге керек, әрине олар тірі ағзадағы кейбір өзгерістерді жою немесе дұрыстау үшін қажет.

Фармацияны дамытуға үлес қосқан адамдардың бірі Бутлеров А.М. хинин молекуласындағы хинолинді ашқан, уротропин алған, оның оқушысы Вышнеградский хинолин туындысын синтездеген, физико-химиялық қасиетінің биологиялық белсенділікпен байланысын зерттеген.

Бұл зерттеу оған безгек ауруына қарсы және қызуды басатын зат алуға көмектескен. Фармхимияда көбіне арматты заттар қатардың туындыларын пайдаланады – бензол, толуол, нафталин, фенантрен, фенол, гетероциклды туындарлар т.б.

Құрлыс дегеніміз зерттелетін заттың физикалық және химиялық қасиеті. Қанықпаған органикалық қосылыстар қаныққанға қарағанда активтілігі жоғары болады, ал бензолдың улылығы циклогексаннан жоғары.

Бензолдың буы орталық нерв жүйесіне тиіп адамды өлтіреді, ал егер алкил радикалын тізбекке енгізсек, онда заттың улылығы жоғарлайды, егер алкил радикалдың ұзындығы үлкен болса улылықта өседі.

Егер алкил радикал орто- немесе пара- жағдайда жатса оның улылығы төмендейді. Карбоксил топ бензолдың физиологиялық активтілігін өсіреді.

Бензальдегидтің улылығы бензолдан жоғары.

Бензой қышқылының натрий тұзы дәрі.

Бензол сақинасында амин тобы болса, ол заттың улылығы жоғарлайды да, орталық нерв жүйесіне зақым келтіреді, температураны түсіреді. Күшті анальгетик.

Егер анилинге гидроксил топты енгізсек анилиннің улылығы төмендейді. П-аминофенолдың улылығы анилиннен төмен.

Егер анилинге қышқыл қалдығы енсе улылық төмендейді. О-, п-амино бензой қышқылының улылығы жоқ деуге болады.

Қышқыл қалдығы көлемді орынбасар болғандықтан амин тобын бүркейді. Ацетанилид көп уақыт ыстық түсіруде пайдаланылған.

Галоген атомын ароматты сақинаға енгізсек улылық өседі. Хлор және бром туындылары наркотикалық әсерді көтеріп, қан қысымын түсіреді. Иодтың активтілігі төмен, ол антисептикалық әсер көрсетеді.

Оттек атомының әсері оның кіретін функционалды тобына байлынысты. Үшіншілік спирттің активтілігі жоғары. Егер ОН-топты ароматты сақинаға енгізсек, онда ароматты сақинаның улылығы жоғарлайды. ОН-тобы бар қосылыс биологиялық субстратқа оттек атомының бөлінбеген жұп электрондарымен әрекеттеседі. Егер ОН-топ саны көбейсе антисептикалық қасиет өседі.

Молекулаға альдегид немесе кетон топты енгізу, сол молекуланың фармакологиялық активтілігін өсіреді.

Молекуланы ацилдеу үрдісі аминдердің, спирттердің, фенолдардың фармакологиялық активтігіне қатты әсер етеді. Азоты бар функционалды топтар тірі ағзаның нерв жүйесіне әсер ететін дәрілік заттардың әсерін өсіреді. Нитротобы бар молекула миға әсер етеді. Азот қышқылының алифатты күрделі эфирлері және нитротуындылар сосудтарды кеңейтеді.

Фенил топтарды молекулаға енгізу активтілікті өсіреді.

Тиол топтар ауыр металдармен кешен түзуі, қос байланысы бар заттармен реакцияласуы, жеңіл тотығуы - бұл қосылысты антидот есебінде пайдалануға ұсынады.

Алкалоидтар - биологиялық белсенділігі бар, көбіне өсімдік шикізатында кездесетін, құрамына азот атомы кіретін органикалық қосылыстар (морфин, атропин, пилокарпин, никотин т.б.) Өсімдікте олар әдетте тұздар түрінде кездеседі. Глицерофосфат – глицерин және фосфор қышқылының эфирі, май және көмірсу алмасуының аралық өнімі болып келеді. Кальций глицерофосфаты – дәрілік зат.

Оптикалық активтілік. Солға айналатын заттардың активтілігі оңға айналатынан жоғары. Адреналин (-) 17 есе, никотин (-) 2 есе.

Тізбектің тармақталуы активтілікті өзгертеді.

Никотин және изоникотин қышқылын салыстырсақ, изоникотин қышқылының гидразиді туберкулезға қарсы әсер етеді.

ОН-топ май қатарындағы қосылыстарда наркотикалық әсерді көтереді.

Амил спиртінің наркотикалық әсері этил спиртінен жоғары.

Суда жақсы еритін заттар ағзада жақсы таралады, суда ерімейтіндер қиын енеді, қиын шығады.

