



ОСНОВНЫЕ ЭТАПЫ И НАПРАВЛЕНИЯ СОЗДАНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ.

Сарвар Абдиманнонович Изатуллаев

Самаркандский государственный медицинский университет,

Самарканд, Узбекистан

**e-mail : sarvarbek020295@gmail.com*

Основные этапы создания лекарственных средств.

Принципиальная схема разработки нового лекарственного вещества включает несколько стадий.

На первой стадии проводится предварительный отбор химических соединений и выбор базовой потенциально активной структуры. На этой стадии возникает замысел создания необходимого лекарственного средства. Проводится анализ информации о наличии разнородных элементов, групп атомов, функциональных группировок, о типах связей между ними, электронном строении, пространственном расположении. На второй стадии осуществляется синтез предварительно отобранных соединений и их химический скрининг, т.е. отсеивание по устойчивости, простоте получения, выходу, растворимости и технико-экономическим показателям.

На третьей стадии проводится фармакологический скрининг и доклинические испытания - главное сито, на котором отбраковывается основная масса неактивных и малоактивных синтезированных соединений и остаются для продолжения углубленных испытаний наиболее перспективные вещества, обладающие высокой физиологической активностью и не проявляющие при этом токсичности и других побочных эффектов.

На четвертой стадии разрабатываются наиболее рациональные лекарственные формы фармакологически активного вещества,



характеризующиеся высокой фармацевтической и биологической доступностью (высвобождение фармакологически активного вещества из лекарственной формы), стабильностью при хранении.

На пятой стадии проводятся клинические испытания фармакологически активного вещества в виде лекарственной формы на людях, в ходе которых выявляется терапевтическая эффективность и степень безопасности (наличие или отсутствие побочных эффектов) при лечении больных.

На шестой стадии идет освоение промышленного производства лекарственного средства, отрабатываются все стадии его получения в заводских условиях. ства серебра нитрата.

Эмпирический метод приемлем и для получения биологически активных соединений из природных источников.

Несмотря на широкое использование эмпирического метода в прошлом, на сегодняшний день он вытеснен направленным способом поиска биологически активных веществ.

Совершенствуются методы скрининга - используются не только физические, физико-химические, биохимические, но и математические методы.

Например, метод расчетного скрининга позволяет осуществить не только отсев малоэффективных соединений из огромного потока синтезированных веществ, но и на основании математического расчета зависимости биологической активности от химической структуры дать рекомендации для направленного синтеза.

Следует выделить следующие основные пути направленного поиска новых лекарственных веществ. ства серебра нитрата. Эмпирический метод приемлем и для получения биологически активных соединений из природных источников.

Несмотря на широкое использование эмпирического метода в прошлом, на сегодняшний день он вытеснен направленным способом поиска биологически активных веществ.



Совершенствуются методы скрининга - используются не только физические, физико-химические, биохимические, но и математические методы.

Например, метод расчетного скрининга позволяет осуществить не только отсев малоэффективных соединений из огромного потока синтезированных веществ, но и на основании математического расчета зависимости биологической активности от химической структуры дать рекомендации для направленного синтеза.

Следует выделить следующие основные пути направленного поиска новых лекарственных веществ. ства серебра нитрата.

Эмпирический метод приемлем и для получения биологически активных соединений из природных источников. Несмотря на широкое использование эмпирического метода в прошлом, на сегодняшний день он вытеснен направленным способом поиска биологически активных веществ.

Совершенствуются методы скрининга - используются не только физические, физико-химические, биохимические, но и математические методы.

Например, метод расчетного скрининга позволяет осуществить не только отсев малоэффективных соединений из огромного потока синтезированных веществ, но и на основании математического расчета зависимости биологической активности от химической структуры дать рекомендации для направленного синтеза. Следует выделить следующие основные пути направленного поиска новых лекарственных веществ. Основные направления создания новых лекарственных средств.

Основными направлениями создания лекарственных средств являются эмпирический и направленный поиск. Эмпирический метод поиска лекарственных средств осуществляется методом проб и ошибок. На основании эмпирически установленных закономерностей о влиянии отдельных функциональных групп на биологическую активность, синтезируют ряд



соединений, которые проходят фармакологический скрининг и отбор наиболее активных веществ.

Эмпирический метод приемлем и для получения биологически активных соединений из природных источников.

Несмотря на широкое использование эмпирического метода в прошлом, на сегодняшний день он вытеснен направленным способом поиска биологически активных веществ.

Совершенствуются методы скрининга - используются не только физические, физико-химические, биохимические, но и математические методы. Например, метод расчетного скрининга позволяет осуществить не только отсев малоэффективных соединений из огромного потока синтезированных веществ, но и на основании математического расчета зависимости биологической активности от химической структуры дать рекомендации для направленного синтеза.

Следует выделить следующие основные пути направленного поиска новых лекарственных веществ.

Выделение и изучение биологически активных веществ из природных источников. Этим методом были получены многочисленные лекарственные средства из растительного сырья: морфин, эфедрин, кокаин, атропин, сердечные гликозиды, платифиллин, физостигмин, гормоны, рутин, кверцетин и др.

Химическое модифицирование структуры известных синтетических и природных лекарственных веществ проводится путем введения в молекулу известного вещества структурного элемента или фрагмента молекулы, с помощью которого достигается желаемый эффект: усиление специфической активности, снижение токсичности, пролонгирование действия, расширение спектра действия, изменения направленности фармакологического эффекта и др.

Введение фармакофорной группы известного лекарственного вещества в молекулу нового вещества. Фармакофорным называют такой структурный элемент или фрагмент молекулы, который обеспечивает фармакологическую



активность. Например, на основе азотистого иприта были получены противоопухолевые средства путем введения в молекулу различных веществ

N,N - дихлорэтиламинного или азиридинового фрагмента (сарколизин и др.). Структурный фрагмент кокаина, обеспечивающий его анестезирующее действие - эфир бензойной кислоты и акиламиноэтанола, взят за основу ряда

синтетических местных анестетиков - производных п-аминобензойной кислоты (новокаин, анестезин, дикаин и др). Принцип молекулярного моделирования. Этот подход в сочетании с рентгеноструктурным анализом позволяет установить стереохимические особенности молекулы лекарственного вещества и биорецептора, конфигурацию их хиральных центров, измерить расстояния между отдельными

атомами, группами атомов или между зарядами в случае цвиттер-ионных структур лекарства и биорецепторного участка его захвата.

Принцип создания лекарственных веществ на основе естественных метаболитов. Лекарственное средство при поступлении в организм под действием ксенобиотиков (ферменты, защищающие организм от чужеродных веществ) превращаются в метаболиты. Часто лечебный эффект оказывают активные метаболиты, а не сами препараты. В этом случае лекарственный препарат называют пролекарством, которое само по себе не обладает лечебным эффектом, но имеет такие структурные элементы, которые позволяют ему легко преодолевать в организме защитные барьеры и точно доставляться в больной орган. При попадании в биомишень это пролекарство метаболизируется и превращается в истинное лекарство.

ЛИТЕРАТУРА

1. Изатуллаев, С. А., & Ёрбекова, С. Ё. К. (2024). НОВЫЕ МЕТОДЫ СИНТЕЗА ГИДРАЗИДОВ ФОСФОРИЛИРОВАННЫХ МУРАВЬИНЫХ КИСЛОТ ТРЕТИЧНОГО ФОСФИНОКСИДНОГО СТРОЕНИЯ. *Research Focus*, 3(3), 11-15.



2. Иззатуллаев, С. А., Эшмаматова, З. Г., & Эшкобилова, М. Э. (2024). СИНТЕЗ НОВЫХ АНАЛОГОВ КАПАХА. *Research Focus*, 3(2), 260-265.
3. Nizomiddinovich, Toshboyev Feruz, Izatullayev Sarvar Abdimannonovich, and Akhmadov Javokhir Zoirovich. "Of organic substances by thin layer chromatographic method." *Ta'lim innovatsiyasi va integratsiyasi* 14.1 (2024): 70-72.
4. Тошбоев, Феруз Низомиддинович, Тахир Откирович Анваров, and Сарвар Абдиманнонович Иззатуллаев. "ОПРЕДЕЛЕНИЕ pH СРЕДЫ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ ПОТЕНЦИОМЕТРИЧЕСКИМ МЕТОДОМ." *World of Scientific news in Science* 1.1 (2023): 166-169.
5. Дониёрова, С. О., Байкулов, А. К., Советов, К. Т., & Ташанов, О. С. (2023). ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНОЕ ОБОСНОВАНИЕ СОСТАВА ГРАНУЛ НА ОСНОВЕ СУХОГО ЭКСТРАКТА СОЛОДКИ. *PEDAGOGS*, 46(1), 140-142.
6. 2. Ташанов, О. С., & Советов, К. Т. (2023). ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РАСТЕНИЯ, ИСПОЛЬЗУЕМЫЕ В КАЧЕСТВЕ СРЕДСТВ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ СЛИЗИСТОЙ ОБОЛОЧКИ РТА. *Research and Publications*, 1(1), 42-45.
7. 3. Begmamat o'g'li, Odilov Javohir, Erkinov Feruzbek Asqarjon o'g'li, and Tashanov Odilboy Safarovich. "DORI VOSITALARINING ZAMONAVIY TAHLIL USULLARI." *Journal of new century innovations* 49.1 (2024): 75-77.
8. 4. Safarovich, Tashanov Odilboy. "DORI VOSITALARINI TAHLIL QILISHNING ZAMONAVIY USULLARI." *Proceedings of International Conference on Educational Discoveries and Humanities*. Vol. 3. No. 5. 2024.
9. Арзамасцев А.П. Фармацевтическая химия: учебное пособие, 3-е изд., испр.-М.:ГЭОТАР-Медиа, 2006,- 640 с.
10. Арыстанова Т.А. Общая фармацевтическая химия:учебное пособие, Алматы: изд-во «Эверо», 2013.- 291с.
11. Беликов В.Г. Фармацевтическая химия. В 2-х ч: учебное пособие, 4-е изд., перераб. и доп.-М.: МЕДпресс-информ., 2008. - 616 с.
12. Ташанов, О. С. (2024). СТОМАТОЛОГИЧЕСКИЕ ГЕЛИ. *Лучшие интеллектуальные исследования*, 31(1), 67-70.
13. SHomurodov, SH SH, and O. S. Tashanov. "ZAHARLI METALL KATIONLARINI MINERALIZATDAN ANIQLASH. QO'RG'OSHIN KATIONINI TAHLILI." *ОБРАЗОВАНИЕ НАУКА И ИННОВАЦИОННЫЕ ИДЕИ В МИРЕ* 55.4 (2024): 17-20.
14. Musayev, S. M., & Tashanov, O. S. (2024). BIOLOGIK OB'EKTNI MINERALIZASIYALAB AJRATIB OLINADIGAN ZAHARLI MODDALAR



GURUH. *ОБРАЗОВАНИЕ НАУКА И ИННОВАЦИОННЫЕ ИДЕИ В МИРЕ*, 55(4), 21-24.

15. SHomurodov, S. S., & Tashanov, O. S. (2024). ZAHARLI METALL KATIONLARINI MINERALIZATDAN ANIQLASH. QO'RG'OSHIN KATIONINI TAHLILI. *ОБРАЗОВАНИЕ НАУКА И ИННОВАЦИОННЫЕ ИДЕИ В МИРЕ*, 55(4), 17-20.

16. Safarovich, T. O., Nayimovna, A. S., Ergashboyevna, A. Z., & Ergashboyevna, E. M. (2024). LIPIDLAR ASOSIDA SIRT FOAL MODDALARINI OLIISH. *Ta'limda raqamli texnologiyalarni tadbiq etishning zamonaviy tendensiyalari va rivojlanish omillari*, 31(2), 122-125.

17. Zarxol, B., Mamirzayev, M. A., & Tashanov, O. S. (2024). VITAMINLAR ISHLAB CHIQRISH VITAMINLARNING BIOLOGIK AHAMIYATI MODDALAR ALMASHINUVI. *Лучшие интеллектуальные исследования*, 21(5), 154-159.

18. Begmamat o'g'li, O. J., Asqarjon o'g'li, E. F., & Safarovich, T. O. (2024). DORI VOSITALARINING ZAMONAVIY TAHLIL USULLARI. *Journal of new century innovations*, 49(1), 75-77.

19. Ziyadullayev, A. O., Eshtemirova, M. Z., & Tashanov, O. S. (2024, April). GIDROKSIL GURUHINI HIMOYALASH USULLARI. In *Proceedings of International Conference on Educational Discoveries and Humanities* (Vol. 3, No. 5, pp. 33-38).

20. Husanov, A. D., and O. S. Tashanov. "DENITRATSIYALASHNI GIDROLIZ USULI." *ОБРАЗОВАНИЕ НАУКА И ИННОВАЦИОННЫЕ ИДЕИ В МИРЕ* 55.4 (2024): 25-27. Safarovich, Tashanov Odilboy. "DORI VOSITALARINI TAHLIL QILISHNING ZAMONAVIY USULLARI." *Proceedings of International Conference on Educational Discoveries and Humanities*. Vol. 3. No. 5. 2024.