

**Vaqif Həsənov, Ədilə Mahmudova,
Rəfiqə Məmmədova**

**DƏRMAN MADDƏLƏRİNİN
KİMYASI**

Ə. MAHMUDOVA - DƏRMAN MADDƏLƏRİNİN KİMYASI

Bakı – 2015

**Azərbaycan Respublikası Təhsil Nazirliyi
Azərbaycan Dövlət Pedaqoji Universiteti**

V.S. Həsənov, Ə.Ə. Mahmudova, R.K. Məmmədova

**DƏRMAN MADDƏLƏRİNİN
KİMYASI**

Dərs vəsaiti

Azərbaycan Respublikası Təhsil Nazirliyinin
04.11.2014-cü il tarixli 1130 sayılı əmrinə
əsasən çap edilir

Bakı - 2015

Redaktor: prof. M.Ə. Allahverdiyev

Texniki redaktor: Z.Z. Ağamalıyev

Rəyçilər: prof. P.Ş. Məmmədova
prof. F.M. Çıraqov
dos. N.T. Mehmandarova

V.S. Həsənov, Ə.Ə. Mahmudova, R.K. Məmmədova

Dərman maddələrinin kimyası. Dərs vəsaiti.

Bakı, 2014, 332 səh.

Ön söz

“Dərman maddələrinin kimyası” fənni üzvi kimya nəyi öyrənir və nə üçün lazımdır suallarına cavab olaraq üzvi kimyanın əsas kursundan sonra tədris edilir. “Dərman maddələrinin kimyası” fənni bir sıra elmlərlə sıx əlaqədədir. Hər bir dərman maddəsinin alınmasında üzvi kimya, əczaçılıq kimyası, bioüzvi kimya, bioloji kimya, kimya texnologiyası və biotexnologiyanın nailiyyətlərindən istifadə edilir.

Tibbdə geniş istifadə olunan və üzvi maddələrin müəyyən sinfinə mənsub olan dərman maddələrinin kimyəvi tərkibi, quruluşu, sintezi, fiziki-kimyəvi xassələri və onların quruluşu ilə bioloji təsiri arasında əlaqənin öyrənilməsi “Dərman maddələrinin kimyası” kursunda əsas diqqət yetirilən məsələlərdəndir.

Üzvi kimyanın iki əsrlik tarixi müddətində 10 milyondan artıq üzvi maddə sintez edilmişdir. Hər il kimyacılar tərəfindən minlərlə yeni maddələr sintez edilməkdədir. Fundamental məsələlərin həlli yeni maddələrin sintezi, kimyəvi xassələri, reaksiya qabiliyyəti və quruluşu ilə farmakoloji təsiri arasında əlaqənin öyrənilməsini tələb edir.

Üzvi birləşmələrin kimyəvi quruluşu ilə bioloji aktivliyi arasında əlaqənin olması ideyası alimlər tərəfindən ilk dəfə olaraq hələ 16-cı əsrdə irəli sürülmüşdür. Bioloji aktivlik dedikdə maddə ilə orqanizm arasında qarşılıqlı əlaqə və buna orqanizmin reaksiyası, məsələn, temperaturun aşağı düşməsi, sakitləşdirici təsir, keyləşdirici təsir və s. nəzərdə tutulur. Üzvi maddələrin ayrı-ayrı siniflərinə mənsub olan dərman maddələrinin sintez üsulları, fiziki-kimyəvi xassələri, quruluşu ilə farmakoloji təsiri arasında əlaqə və onların tətbiqi haqqında geniş məlumat verməklə “Dərman maddələrinin kimyası” adlı dərs vəsaiti ali təhsil müəssisələrinin kimya müəllimliyi, kimya və biologiya müəllimliyi ixtisaslarında təhsil alan tələbələr üçün nəzərdə tutulsada, bu dərs vəsaiti digər ali məktəblərin kimya ixtisasını öyrənən tələbələr, müəllimlər, magistrantlar, kimya təmayüllü liseylərin yuxarı sinif şagirdləri üçün də əhəmiyyətli ola bilər.

Müəlliflər dərs vəsaitinin ərsəyə gəlməsində xidmətləri olanlara öz təşəkkürlərini bildirir və tənqidi fikirlərini söyləyənlərə də əvvəlcədən minnətdarlıq edirlər.

Müəlliflər

GİRİŞ

Dərman maddələri xəstəliklərin müalicəsində, diaqnostikasında və profilaktikasında qanunvericiliyə uyğun olaraq tətbiq edilən bioloji fəal maddələrdir. Hələ qədim zamanlarda bir sıra xəstəliklərin təbii mənşəli dərman maddələri ilə müalicə edilməsi məlum idi. Dərman maddəsi kimi bitkilərdən, qurudulmuş həşəratlardan və sürünən heyvanların bəzi orqanlarından istifadə edilirdi. Bitkilər və heyvanlardan alınan dərmanları sistem halına salan və onların təmizlənməsi haqqında ilk üsul verən isə bizim eramızın II əsrində yaşamış K.Qalen olmuşdur. Dünyada ilk aptek 754-cü ildə Bağdad şəhərində açılmışdır. Əczaçılıq kimyasının banisi isə Avropada Razes adı ilə məşhurlaşmış ərəb alimi Əbu Bəkir Ər-Razi (865-925) olmuşdur.

Ər-Razidən sonra dərman maddələri sahəsində, türk aləminin dühası, həkim, filosof və kimyagər İbn-Sinanın (980-1037) böyük əməyi olmuşdur. Onun “Tibb elminin qanunları” əsərinin ikinci cildi mineral, bitki, heyvan mənşəli dərman maddələrinə həsr olunmuşdur.

Hələ XVI əsrdə yatrokimyanın banisi Paracelsus yazmışdır ki, “hazırda kimyanın əsas məqsədi qızılın alınmasında deyil, dərman maddələrinin hazırlanmasındadır”.

Rusiyada əczaçılıq kimyasının inkişafı M.V. Lomonosovun adı ilə bağlıdır. İlk dəfə 1706-cı ildə Moskvada əczaçılıq kursları açılmış və orada “Əczaçılıq kimyası” tədris edilmişdir. Orada bir çox rus kimyaçıları təhsil almışdır.

17-ci əsrin ikinci yarısı əczaçılığın inkişafında yeni istiqamətin başlanması ilə xarakterizə olunur. Burada əsas yeri flaqiston (“floqistos” – yunanca alışqan, yanar) nəzəriyyəsi tutur.

Bu nəzəriyyənin nümayəndələri olan Yohan Beker (1635-

1682) və Georq Ştal (1660-1734) flaqiston nəzəriyyəsindən istifadə edərək yanma və oksidləşmənin əmələ gəlməsini izah etməyə çalışırdılar. Onlar belə hesab edirdilər ki, yanma – parçalanmadır və buna görə də yalnız mürəkkəb cisimlər yana bilirlər. O, hesab edirdi ki, yanma zamanı flaqiston ətraf mühitə yayılır, cismin digər tərkib hissəsi isə dəyişməz qalır. Flaqiston nəzəriyyəsi o zamankı kimyaçı alimlər arasında geniş yayılmış və kimyanın sonrakı inkişafına müəyyən dərəcədə təsir etmişdi. Ancaq mütərəqqi əhəmiyyətə baxmayaraq, bu nəzəriyyənin bir çox yanlış tərəfləri var idi.

Böyük rus alimi Mixail Vasilyevich Lomonosov (1711-1765) flaqiston nəzəriyyəsini təkzib etmiş və sübut etmişdir ki, yanma və oksidləşmə prosesində əsas rol hava oynayır. Lomonosov təcrübi olaraq müəyyən etmişdir ki, yanma flaqistonun ayrılması ilə gedən parçalanma reaksiyası deyil, əksinə, yanar maddələrin havadakı oksigenlə birləşmə reaksiyasıdır. Bir qədər sonra dahi fransız kimyaçısı Antuan Loran Lavuazye (1743-1794) də anoloji nəticəyə gəlmişdir.

Həmin dövrün alimləri arasında kimya sahəsində bir sıra böyük kəşflər etmiş əczaçı kimyaçıları da qeyd etmək lazımdır. Belə ki, isveç əczaçısı E.Şeele (1742-1786) çaxır daşından çaxır turşusunu ayırmış, ilk dəfə limon, alma, süd, turşəng kimi bir sıra üzvi turşuları kəşf etmişdir.

18-ci əsrin ikinci yarısı üzvi kimyanın böyük müvəffəqiyyət və qeyri adi inkişafı ilə yadda qalmışdır ki, bu da kimyanın elm kimi sonrakı inkişafına təsir göstərmişdir. Həmin dövrün əczaçı kimyaçıları bir sıra böyük kəşflər etmişlər. Belə ki, Parisdəki əczaçılıq məktəbinin ilk direktoru Nikola Vokelen (1763-1829) xrom, berilium, palladium və osmium elementlərini kəşf etmişdir. Paris Hərbi hospitalının Fransız əczaçısı Bernar Kurtua (1777-1838) dəniz bitkilərinin külündən mineral duzlar alaraq yodu kəşf

etmişdir. Fransız əczaçısı Seqen 1807-ci ildə ilk dəfə opiumdan morfini ayırmış, bir qədər sonra isə əczaçı Sertyürner (1783-1841) kristal şəkildə morfin almış, onun əsas xüsusiyyətini və turşularla reaksiya zamanı duza çevrilmə qabiliyyətini müəyyən etmişdir. Fransız əczaçılar Jözef Pelye (1788-1842) və Beneme Kavantu (1795-1877) təbii bitki mənbələrindən strixnin (1818), brusin (1819), xinin (1820) və s. alkaloidlərini almışlar. İstedadlı rus əczaçısı, misilsiz qeyri-üzvi kimyaçı Karl (Ernst) Karloviç Klaus (1796-1864) ruteniumun kəşfi ilə şöhrət qazanmışdır. Tanınmış alman kimyaçı və əczaçısı Karl Fredrix Mor (1806-1879) dərman analizi sahəsində çox iş görmüşdür. O ilk dəfə analiz zamanı byüret və pipetkaları tətbiq etmiş, hazırda onun adını daşıyan tərəziləri yaratmışdır. Məşhur “Mor duzu”nun müəllifi də odur.

Beləliklə, əczaçılar kimyanın bir elm kimi yaranmasında və inkişafında böyük rol oynamışdır.

Qeyd etmək lazımdır ki, 16-18-ci əsrlərin digər məşhur avropalı kimyaçıları da, əslində kimyəvi elmi tədqiqat laboratoriyaları olan apteklərdə işləmişlər.

18-ci əsrin ortalarında Rusiyada kimya elmi kifayət qədər yüksək səviyyədə idi. Onun inkişafı rus və dünya elminə əvəzsiz töhvələr verən və haqlı olaraq ensiklopediyaçı alim adlandırılan rus alimi Mixail Vasilyeviç Lomonosovun adı ilə bağlıdır. Bu alimin fəaliyyəti həmçinin ənənəvi kimya, fizika, təbabət və əczaçılığın inkişafı ilə də bağlıdır.

Tibbin və əczaçılığın inkişafı ilə paralel olaraq 1806-cı ildə Kazan universitetində ilk kimyəvi laboratoriyanın əsası qoyuldu. Nəticədə böyük kimyaçı və irsən əczaçı olan tanınmış Karl Karloviç Klausla yanaşı, rektor N.İ.Lobaçevskinin təkidi ilə, universitetin fizika-riyaziyyat fakültəsinin təbiət elmləri bölməsini 1933-cü ildə bitirmiş, istedadlı məzun-riyaziyyatçı Nikolay Nikolayeviç Zinin də

kimya dərslərinə cəlb olundu. Yeni kimyəvi laboratoriya üçün ayrıca bina tikilməsinin ilk onilliyində (1834-1844-cü illər) burada, 1842-ci ildə N.N.Zinin tərəfindən anilinin sintezi və 1844-cü ildə K.K.Klaus tərəfindən ruteniumun kəşfi kimi iki dünya miqyaslı kəşf edildi.

Bu alimlər Kazan kimyaçılıq məktəbinin banisi hesab olunurlar.

1901-ci ildə Petroqradda Əczaçılar cəmiyyətinin yığıncağında əczaçı magistr L.Y.Vilpyan Kazan əczaçılarından, xüsusilə də F.Qraxin fəaliyyətinə yüksək qiymət verərək demişdir: “Klausdan başqa Kazan laboratoriyası unudulmaz A.M.Butlerovun yaxın silahdaşı olan F.Qrax kimi bir sıra istedadlı əczaçı kimyaçılar yetirmişdir”.

Butlerov yeni dərman preparatlarının işlənməsi və mineral suların istehsalında F.Qraxa böyük kömək göstərmişdir.

Bitkilərdən ilk fərdi təbii birləşmələr yalnız 19-cu əsrdə alınmağa başlanmışdır. Belə ki, 1816-cı ildə Zetyürner opiumdan morfin aldı. Sonra çay, qəhvə, kakao və kola fındığının tərkibində eyni alkaloidin-kofenin olduğu müəyyən edildi. Analoji inkişaf mərhələlərini, bir çoxları hələ qədim zamanlardan məlum olan malyariya əleyhinə vasitələrin tarixindəki xinin maddəsini 1820-ci ildə Pelletye və Kaventu ayırmazdan əvvəl Perunun yerli əhalisinə məlum idi və əsrlər boyu onun ticarəti ilə məşğul olmuşdular.

Farmakoloji təsiri olan sintetik maddələr də həmçinin, 19-cu əsrdə - müasir üzvi kimyanın yaranmasına və inkişafa başlamasına paralel olaraq meydana gəlmişdir.

Anestetik kükürd efiri 1846-cı ildən, antiseptik fenol (karbol turşusu) 1867-ci ildən istifadə olunmağa başlamışdır. Bu istiqamətin inkişafında mühüm dövrlər, iki onillik – antipirin (Knorr, 1883) və aspirinin (Drezer, 1899) praktikaya daxil olduğu 1880-1900-cü illər

olmuşdur. Bununla yanaşı 1888-ci ildə təsadüfən yuxugətirici vasitə olan sulfanol kəşf olundu. 1904-cü ildə Merinq və Fişer dietilbarbitur turşusunu (veronal) kəşf etdilər. 1904-cü ildə Ştolts ilk sintetik hormon olan adrenalini sintez etdi.

20-ci əsrin əvvəllərində birinci dünya müharibəsi dövründə yaraların dezinfeksiyası üçün antiseptik vasitə kimi müvəffəqiyyətlə tətbiq olunan bir sıra sintetik kation boyaların antibakterial təsiri aşkar edildi.

1908-ci ildə ilk sulfanilamidlər sintez olundu, yalnız 24 il sonra onların terapevtik aktivliyi müəyyən edildi.

1932-ci ildə sintetik boya olan prontosilin antimikrob xüsusiyyətinin kəşfi (4-sulfamid-2,4-diaminoazobenzol, onun hidroxloridi isə “qırmızı streptosid”), ilk dəfə laboratoriyalarda alınan sintetik bioloji aktiv maddələrə tədqiqatçıların diqqətini cəlb etdi və artıq 30-cu illərin sonunda antimikrob təsirli ilk sulfanilamid preparatı (“ağ streptosid” və s.) sintez olundu ki, bu da sənaye əczaçılıq sintezinin əsasını qoydu.

Prontosilin antimikrob təsirinin kəşfinə görə 1939-cu ildə macar alimi Herhard Domaqk (1895-1964) fiziologiya və təbabət üzrə Nobel mükafatı aldı. İndiyə qədər streptosidin on minlərlə törəməsi sintez olunmuş və bunlardan 30-dan çox dərman maddəsi hazırlanaraq praktikaya daxil olmuşdur.

İkinci dünya müharibəsi illərində kinə ağacından alınan və malyariya əleyhinə təbii alkaloid olan xinin maddəsinin əyazləyicisinin sintezi işlərinə başlandı.

Bundan bir qədər əvvəl 1929-cu ildə ingilis mikrobioloqu Aleksandr Fleming ilk dəfə kif göbələyindən (az miqdarda) antibakterial maddə olan penisillin aldı.

Fransız bioloqu Ernst Düşen 1897-ci ildə “Mikroorqanizmlərin həyat mübarizəsi” mövzusunda dissertasiya

müdafiə etmiş, sonralar antibiotiklərin yaradıcıları ona istinad etmişlər.

A.Fleminq öz kəşfini lazımınca qiymətləndirə bilməmişdir. O, bu preparata şübhə ilə yanaşmış, sabit ekstrakt əldə edə bilmədiyini üçün “bununla məşğul olmağa dəyməz” deyərək bildirmişdir.

1940-cı ildə Hovard Uolter Flori, Ernst Boris Çeyn və onların asistentləri xeyli miqdarda penisilin almağa müvəffəq oldular və onu “Penisillin G” adlandırdılar. 1945-ci ildə isə Nobel mükafatının təqdimat mərasimində jüri qeyd etmişdi ki, laureatlar Fleminq, Çeyn və Flori “faşizm üzərində qələbə üçün 25 diviziyanın etdiyindən daha artıq iş görüblər”.

SSRİ-də penisillinin dərman preparatı kimi işlənməsi və geniş yayılması Z.V.Yermolyeva və T.İ.Balezinin işləri ilə bağlıdır (1942-1944). Artıq 1949-cu ildə kifayət qədər penisillin preparatı klinik tətbiq olunurdu.

Kecən əsrin ortaları eksperimental üzvi və əczaçılıq kimyasının sürətli inkişafı ilə xarakterizə olunurdu. Bu illərdə steroid hormonlar, sintetik antibiotiklər, əsəb və ürək-damar sistemi xəstəliklərinin müalicəsi üçün vasitələr alınmışdı. 1950-1960-cı illərdə 500-ə yaxın preparat alınmışdı. Sonrakı 20 ildə daha 750 preparat əldə edildi, 1980-1990-cı illərdən isə klinik praktikaya 500 yeni dərman maddəsi daxil oldu. Son 20 ildə tibbi praktikaya 1000-dən yuxarı preparat daxil olmuşdur.

1.1 Dərman maddələrinin xammal mənbələri

Qeyri-üzvi dərman maddələrinin alınması mənbələrinə mineral xammallar aid edilir. Mineral xammal kimi ya mineralın özündən, ya da ayrı-ayrı elementlərindən istifadə edirlər. Xammal kimi göl və dənizlərin suyu, qazlar, kimya sənayesinin məhsulları istifadə edilir.

Sintetik üzvi dərman maddələrini almaq üçün isə ağac, daş kömürün, yanacağın quru distilləsi, həmçinin neftin müxtəlif distilləsindən istifadə olunur. Bu növ xammalın emalı ilə koks kimyası, meşə kimyası və neft emalı sənayesi məşğul olur. Emal məhsullarından xalq təsərrüfatının müxtəlif sahələrində, həmçinin tibb sənayesində istifadə olunur.

Daş kömür qətranı 400-dən artıq müxtəlif aromatik və heterotsiklik birləşmələrin qarışığını özündə birləşdirən mürəkkəb qarışıqdır. Rektifikasiya kolonunun köməyi ilə daş kömür qətranını fraksiyalara ayırırlar. Hər fraksiya üçün mövcud olan temperatur intervalı və əsas məhsul cədvəl 1.1-də göstərilmişdir.

Cədvəl 1.1. Daş kömür qətranının fraksiyaları

Fraksiyalar	Temperatur, °C	Əsas məhsullar
Yüngül yağlar	170°C-yə qədər	Benzol, toluol, ksilol, tiofen, karbon sulfid, piridin və s.
Fenollar	170-210°C	Fenol, krezollar, naftalin, kükürlü və azotlu birləşmələr
Naftalin	210-230°C	Naftalin, metil naftalin tionaften, indol
Uducu	230-270°C	Naftalinin törəmələri, asetonaften, flüoren, indol və s.
Antrasenlər	270-360°C	Antrasen, fenantren, karbazol və onların analogları və parafinlər
Daş kömürün qalığı	360°C-dən yuxarı	Parafinlər, piren, xrizen və s.

Sonra hər fraksiyanı kiçik temperatur intervalında qovub, müvafiq maddələr alırlar. Onların təmizlənməsi üçün adsorbsiya, sulfat turşusu (sulfolaşma), qələvi ilə (fenolyatların ayrılması) işləməklə və s. istifadə edilir. Ayrılan maddələr müxtəlif üzvi maddələrin, o cümlədən dərman maddələrinin alınmasında ilkin məhsul kimi istifadə edilir.

Analoji olaraq oduncaq da emal edilir: quru distillədə ağac kömürü və iki maye fraksiya əmələ gəlir. Onlardan birinin tərkibində metil spirti, aseton və sirkə turşusu, digərində isə fenol və digər üzvi maddələr olur. Oduncaq həm də furfrolun alınmasında istifadə olunur.

Tərkibində müxtəlif karbohidrogen növləri saxlayan neftin emalı məhsullarından ilkin məhsul kimi dərman maddələrinin istehsalında bir qədər məhdud istifadə edilir. Tibbdə və dərman maddələrinin istehsalında yalnız neftin emalından alınan müəyyən maye və bərk karbohidrogenlərdən istifadə olunur.

Bitki xammalı kimi bitkilərin yarpağı, çiçəyi, toxumu, qabığı, meyvələri və köklərindən istifadə olunur. Bundan başqa bu xammaldan efir və yağlar, zülallar, karbohidratlar və qətranlar ayrılır ki, onlar birbaşa dərman maddələri kimi, ya da dərman maddələrinin alınmasında ilkin xammal kimi istifadə edilir. Bitki xammalı təbii bioloji aktiv maddələrin: alkaloidlərin, terpenlərin, qlükozidlər və vitaminlərin alınmasının mənbəyidir.

Heyvan mənşəli xammaldan xüsusi maddələr hormonal preparatlar alınır. Xammalın bu növünə orqanlar, toxumalar, iribuynuzlu heyvanların vəziləri aiddir. Mikroorqanizmlər qiymətli dərman preparatlarının antibiotiklərin alınması üçün əsas mənbəyə çevrilmişdir.

Dərman maddələrinin alınmasında hidrobiontların (dəniz orqanizmləri) istifadəsi böyük perspektivə malikdir. Yosunların

bəzi növləri, treskanın qaraciyərinin piyi yodun, bromun, vitaminlərin mənbəyi kimi istifadə olunur. Lakin yalnız XX əsrin 50-ci illərində dəniz orqanizmlərindən bioloji aktiv maddələrin alınması mümkünlüyünün sistematik tədqiqi başlandı.

1.2 Dərman maddələrinin metabolizmi

Orqanizmə daxil olan bütün maddələr, eləcə də dərman maddələri orqanizmə daxil olma yollarından asılı olmayaraq metabolizmə məruz qalırlar. Çevrilmə məhsulları **metabolitlər** adlanır. Dərman maddələrinin metabolitləri toksiki, farmakoloji aktiv, həmçinin farmakoloji qeyri-aktiv ola bilərlər. Metabolizmin öyrənilməsi dərman maddələrinin təsir mexanizmini, farmakoloji aktivliyini və ya metabolitlərin toksikliyi, yığılma sürəti və ya orqanizmə daxil olma yollarını və başqa biotransformasiya yollarını öyrənməyə kömək edir.

Dərman maddələri orqanizmə xas və ona yad olmaqla iki qrupa bölünür. Hormonlar, vitaminlər, aminturşular, şəkərlər, yağ turşuları, nukleozidlər, polinukleotidlər kimi üzvi maddələr orqanizmin funksiyalarını təmin edir. Əksər üzvi və qeyri-üzvi sintetik birləşmələr, o cümlədən bitki mənşəli maddələr orqanizmə yad maddə olub, ksenobiotiklər adlanır. Onlar əsasən hüceyrə mikrosomlarında müxtəlif qeyri-spesifik fermentlərin iştirakı ilə metabolizmə uğrayır. Lipidlərdə həll olan ksenobiotiklər gec metabolizm edirlər, orqanizmdən gec xaric olurlar və ona görə orqanizmdə toplanırlar. Metallar (Hg, As, Pb, Ag) orqanizmdə zülallarla davamlı kovalent rabitə əmələ gətirir və orqanizmdə toplanırlar.

Peroral qəbul edilmiş ksenobiotiklər ardıcıl əvvəlcə mədə-

bağırsaq sisteminin selikli qişasından sorulduqdan sonra qaraciyərdə metabolizmə uğrayırlar. Müxtəlif toxuma hüceyrələrində metabolizm nisbətən az aktiv olur. Parenteral yolla dərman maddələrinin qəbulu zamanı qaraciyərdə dərman maddələrinin miqdarı az olduğundan maddələr mübadiləsi zəif olur. Parenteral yolla qəbul edilmiş dərman maddələrinin qanda uzun müddət dövrünü da bununla izah edilir.

Bağırsaq florasının, həmçinin qan hüceyrələrindəki müxtəlif fermentlərin təsirindən qaraciyərdə və toxumalarda dərman maddələrinin dehidroksilləşmə, dekarboksilləşmə, dezalkilləşməsi baş verir. Dehalogenləşmə, aromatikləşmə, nitro qrupun amin qrupa çevrilməsi, ikiqat rabitənin hidrogenlə doydurulması, sulfoksidlərin və azot oksidlərinin müvafiq olaraq sulfidlərə və üçlü aminə qədər reduksiyası, heterotsikllərin qırılması kimi kimyəvi çevrilmələr baş verir. Metabolizm əsasən oksid və amin törəmələrin asetilləşməsi prosesi ilə müşayiət olunur.

Beləliklə, orqanizmdə sintezlə yanaşı həm də dərman maddələri molekullarının parçalanması (deqradasiyası) prosesi də gedir. Sintez nəticəsində yeni daha mürəkkəb quruluşlu, orqanizm üçün az toksik, daha polyar və bununla da suda yaxşı həll olan, orqanizmdən asan xaric ola bilən birləşmələr əmələ gəlir. Bu proses **konyuqasiya**, sintez məhsulları isə **konyuqatlar** adlanır. Məsələn: üzvi turşular qaraciyərdə qlükuron turşusu ilə konyuqatlar əmələ gətirib, daha sonra orqanizmdən xaric olurlar. Çox az hallarda metabolizm nəticəsində orqanizm üçün toksik maddələr əmələ gəlir. Məsələn: orqanizmdə CH_3OH -ın toksikliyi onun formaldehidə reduksiyası və qarışıq turşusuna qədər oksidləşməsi ilə bağlıdır.

Metabolizm həm də dərman maddələrinin molekullarının deqradasiyası ilə müşayiət olunur. Nəticədə oksidləşmə, reduksiya, hidroliz, birləşmə, radikalın molekuldan ayrılması və ya

əvəzlənməsi, tsikllərin qırılması və s. kimi kimyəvi çevrilmələr gedir. Əmələ gəlmiş metabolitlər dərman maddələrinə nisbətən az aktivliyə malik olur, ya da tamamilə aktivliklərini itirirlər. Onlar orqanizmdən ya qismən dəyişilməklə, ya da konyuqatlar əmələ gətirməklə xaric olur. Məsələn: asetilsalisil turşusu qaraciyərdə salisil turşusuna qədər hidroliz edir, sonuncu da qlükuron və sulfat turşusu ilə konyuqasiya edir.

Beləliklə, dərman maddələrinin orqanizmə daxil olması ilə gedən kimyəvi proseslər, onların təsir mexanizmi, lokallaşma, aktiv metabolitlərə çevrilmə, inaktivasiya və nəhayət orqanizmdən xaric olması ilə xarakterizə olunur.

1.3 Dərman maddələrinin saxlanması zamanı baş verən fiziki-kimyəvi proseslər

Dərman maddələrinin saxlanması zamanı baş verən proseslər onların kimyəvi tərkibinin və fiziki xassələrinin (çöküntü əmələ gəlməsinə, rənginin, aqreqat halının) dəyişməsinə səbəb olur. Bu proses maddələrin fizioloji aktivliyinin tədricən itməsinə gətirib çıxarır. Fiziki faktorlardan daha çox temperatur, işıq və rütubət dərman maddələrinə təsir edir.

Temperaturun dərman maddələrinə təsirini xüsusi qeyd etmək lazımdır. Belə ki, temperaturun artması nəticəsində kimyəvi reaksiyaların sürəti daha çox artır. Hətta əgər temperatur əmsalını 2 qəbul etsək, temperaturun 20°C-dən 100°C-ə qədər qalxması reaksiya sürətini 256 dəfə artırır. Bu nöqteyi nəzərdən bu və ya digər dərman maddələrinin saxlanması üçün optimal temperatur şərtləri olmalıdır. Temperaturun aşağı düşməsi də dərman maddələrinə müxtəlif cür təsir edir. Ampulalarda olan 0,1%-li

adrenalin-hidroxlörüd; 25-40%-li qlükoza; 25%-li maqnezium sulfat; 10%-li kalsium xlorid; 5%-li efedrin-hidroxlörüd; 2%-li novakain məhlulları hətta -43°C -də öz keyfiyyətini saxlayırlar. Bununla belə elə dərman maddələri var ki, aşağı temperaturda davamsızdır. Məsələn: antibiotiklər $6-20^{\circ}\text{C}$ arasında belə öz keyfiyyətini itirirlər.

İşıq da dərman maddələrinə müxtəlif cür təsir edir. Adətən işığın təsiri parçalanmanı sürətləndirir. Quru, kristallik maddələr məhlullara nisbətən işığa qarşı daha davamlıdır. İşığın təsiri bu reaksiyaların aktivləşməsinə səbəb olan katalizatorların iştirakı ilə sürətlənir. Kristallik maddələrin üst qatında yalnız fotokatalitik proseslər baş verir.

Havanın rütubətliliyi dərman maddələrinin sabilliyini pozan aktiv faktorlardan biridir. Rütubətin aşağı düşməsi adətən temperaturun yuxarı qalxması ilə müşahidə olunur. Bu da dərman maddələrində suyun azalması və preparatın qatılığının artmasına, eləcə də fiziki xassələrinin, kristallarının formalarının dəyişməsinə səbəb olur. Rütubətin yuxarı olması isə hiqroskopik dərman maddələrində hidroliz kimi kimyəvi prosesləri sürətləndirir. Nəticədə dərman maddələrinin xarici görünüşü, rəngi, qatılığı dəyişə bilər. Bu proseslər nəticəsində parçalanma məhsulları alınır və dərman maddələrinin fizioloji təsirini aşağı salır.

Dərman maddələrinin saxlanması zamanı baş verən kimyəvi proseslər mürəkkəb və müxtəlif istiqamətlidir. Bu fiziki faktorların təsiri ilə sıx əlaqədardır. Bu proseslərin mexanizmi və sürəti haqqındakı biliklər bu reaksiyaların qarşısını almağa və ya onları ləngitməyə imkan verir. Bununla dərman maddələrinin sabilliyi artmış olur. Hidroliz, oksidləşmə-reduksiya reaksiyaları, dekarboksilləşmə, fotokimyəvi destruksiya, izomerləşmə və s. dərman maddələrinin saxlanması zamanı baş verə bilən kimyəvi

proseslərdir. Bəzi dərman maddələri yuxarı temperaturda və rütubətli havada hətta kristal şəklində də hidrolizə uğrayırlar. Hidroliz xüsusən Cu, Zn, Fe və digər metalların duzları olan birləşmələrdə daha aktiv gedir.

Hidroliz sürətinə təsir edən amillərdən biri də dərman maddələrinin həllediciləri və mühitin pH-dır.

Adətən həlledici kimi su götürülür. Dərman maddələrinin məhlulları hazırlanarkən, əgər preparat suda həll olmur, bitki yağlarından istifadə olunur. Həlledici kimi həmçinin propilenqlikol, dimetilsulfoksid, polietilenoksid-400, benzilbenzoat da götürülə bilər. Bu həlledicilərdən istifadə zamanı hidrolizin sürət sabiti olduqca aşağı düşür. Hidroliz proseslərinin sürətini aşağı salmaq üçün dərman maddələrinə HCl, bufer məhlulları ilə təsir edirlər. Stabilizatorun seçimi dərman maddələrinin kimyəvi tərkibindən asılıdır.

Hidrolizin sürət sabiti məhlulun pH-dan asılıdır. Bundan başqa sabit həmçinin məhlulun ion qüvvəsindən, dielektrik nüfuzluğundan da asılıdır. Buna görə də stabilizator kimi daha çox NaCl və digər duzlar tətbiq edilir. Reaksiyanın sürət sabiti üçün optimal pH-ın və digər parametrlərin seçilməsi dərman maddələrinin saxlanılma müddətinin uzadılmasında mühüm rol oynayır. Dərman maddələrində katalizator rolunu hidrogen ionları və ya hidroksil qrupu, həmçinin pH mühiti də oynaya bilər, ona görə də dərman maddələri üçün optimal mühitin pH-ı eksperimental yolla seçilir.

Hidroliz prosesinə ləngidici təsir göstərən amillərdən biri də dərman maddələrinə səthi aktiv maddələrin əlavə edilməsidir. Bu maddələr hidrolitik davamlılığı 10-20 dəfə artırır.

Oksidləşmə dərman maddələrinin parçalanmasına təsir edən faktorlardan biridir. Onlardan bəziləri hətta kristallik formada belə

oksidləşirlər. Lakin oksidləşmə prosesi məhlulda daha fəal gedir. Xüsusən deaktiv reduksiyaedici xassəyə malik olan aldehidlər, hidrazidlər və s. maddələr daha tez oksidləşir. Oksidləşməyə səbəb olan əsas amillərdən biri havadakı oksigendir.

Oksidləşmə prosesi yuxarı temperaturda, rütubətdə və ultrabənövşəyi sahədə nəzərə çarpacaq dərəcədə aktivləşir. Həmçinin ağır metallar, dəmir, mis, nikel və s. oksidləşməyə katalitik təsir göstərir.

Adətən oksidləşmə prosesinə hidroliz təkan verir, bəzən də əksinə oksidləşmə prosesi hidroliz üçün başlanğıc olur.

Dərman maddələrində oksidləşməyə qarşı aparılan tədbirlər-hava oksigeninin təsirini azaltmaq və oksidləşməyə katalitik təsir göstərən maddələri aradan çıxartmaqdan ibarətdir. Bu tədbirlərə həmçinin dərman maddələrinin qablaşdırılması və saxlanması şərtləri də daxildir.

Optimal saxlanılma şəraitini eksperimental yolla müəyyən edirlər. Oksidləşdiricilərdən istifadə etməklə oksidləşmə prosesini modelləşdirmək olar. Sonra alınmış standart nəticələrlə dərman maddələrinin parçalanmasından alınan maddələrlə müqayisə etdikdə oksidləşmə prosesinin mexanizmi haqqında fikir söyləmək olar. Bu stabiləşmə yollarının axtarılıb tapılmasında mühüm rol oynayır. Reduksiya qabiliyyətindən asılı olaraq dərman maddələrini ampulalarda, adi və tıxaclı flakonlarda, parafinlə izolə olunmuş qablarda saxlayırlar. Dərman maddələrinin saxlanması zamanı izomerləşmə hadisəsi də baş verə bilər. Xüsusən də optik izomerlərin əmələ gəlməsi və ya rasemikləşməsi (autorasemikləşmə) dərman maddələrinin farmakoloji təsirini xeyli aşağı salır.

1.4. Dərman maddələrinin təsnifatı və sintezinin əsas prinsipləri

Hal-hazırda dərman maddələrinin təsnifatı 3 tipə əsaslanır:

1. Farmakoloji aktivliyə əsaslanan tibbi təsnifat (psixotrop, ürək-damar, hormonal, antibakterial, xərçəng əleyhinə və.s.);
2. Dərman maddələrinin kimyəvi təbiətinə və quruluşuna əsaslanan kimyəvi təsnifat;
3. Alınma mənbələrinə əsaslanan təsnifat.

Tibbi təsnifata görə dərman maddələri özləri də 3 böyük qrupa ayırd edilir: kimyəvi-terapevtik, neyrofarmakoloji və biotənzimləyici mexanizmlərə təsir edən preparatlar (metabolik, hormonal, immunoloji). 1-ci qrup maddələrə virus, bakteriya, göbələklər, xərçəng hüceyrələrinə qarşı istifadə edilən preparatlar; 2-ci qrup maddələrə reseptorlarla bilavasitə və ya qeyri-spesifik mexanizmlərlə qarşılıqlı təsirdə olaraq mərkəzi və ya periferik sinir sisteminə təsir göstərən maddələr; məsələn, yerli və ümumi anestetiklər, 3-cü qrup maddələrə isə fermentativ və immun sisteminə təsir edən maddələr, həmcinin, hormonal və antihormonal maddələr aid edilir.

Alınma mənbələrinə görə dərman maddələri sintetik (bütün dərman maddələrinin 75%-ni təşkil edir); yarım sintetik (təbii maddələrin modifikasiyası nəticəsində alınır, məsələn, sefalosporin və pensillin sırası antibiotikləri); və təbii dərman maddələri (məsələn, vitaminlər, hormonlar, alkaloidlər).

Yalnız bir təsnifata əsaslanaraq dərman maddələrinin öyrənilməsi çətinlik yaradır, ona görə bəzən hər üç təsnifata istinad edilir.

Tibb təcrübəsində tətbiq olunan dərman maddələrinin böyük əksəriyyətini üzvi birləşmələr təşkil edir. Kimya və tibbin ayrılmaz əlaqəsi dərman maddələrinin sintezi və tətbiqində daha aydın

təzahür edir.

Əgər 19-cu əsrə qədər üzvi maddələr ancaq bitki və heyvan mənşəli məhsullardan alınırıdsə, 19-cu əsrin əvvəllərindən dərman maddələrinin quruluşları haqqında təsəvvürlər yarandı və ilk dərman maddələri sintez edildi. Hazırda müasir təbabət geniş çeşidli dərman maddələrinə malikdir ki, bunların da böyük əksəriyyətini sintetik maddələr təşkil edir.

Dərman preparatlarının sayının çox olmasına baxmayaraq, yeni yüksək keyfiyyətli dərman vasitələrinin axtarışı zərif üzvi sintez, bəuəvi kimya, biotexnologiya və əəzaçılıq kimyasının qarşısında duran kompleks problemdir. «Quruluş-xassə» probleminin öyrənilməsi effektiv dərman maddələrinin məqsədyönlü sintezi üçün elmi baza təşkil edir. İlk vaxtlarda ancaq təbii mənbələrdən alınan dərman maddələri hazırda sənaye miqyasında sintez və ya yarımşintez üsulla alınır, bununla yanaşı bitkilərdən, heyvanların ayrı-ayrı üzvlərindən, zülallardan, mikroorqanizmlərdən alınan preparatlar da geniş tətbiq edilir.

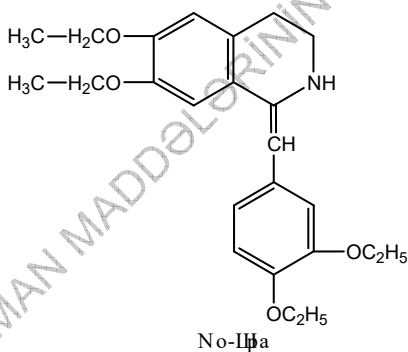
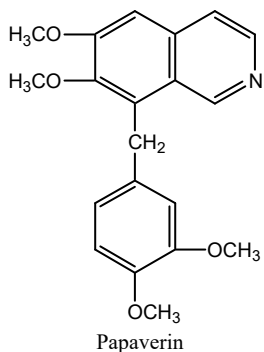
Yeni dərman preparatlarının yaradılması sahəsində çalışan kimyaçı, biokimyaçı, əəzaçı və fiziklərin çoxsaylı tədqiqatlarına baxmayaraq, birgə məqsədlər üçün ənənəvi sərhədləri pozaraq molekulyar səviyyədə tədqiqatları düşünən həqiqi mütəxəssislər o qədər də çox deyil.

İndiki zamanda ümumi təyinatlı bir yeni preparatın yaradılmasına 7-10 il vaxt və 100-500 milyon dollar sərf olunur. Belə bir preparatın alınması üçün adətən 10000-ə yaxın maddəni sınaqdan keçirmək lazım gəlir. Sonuncu faktorla əlaqədar 1990-cı illərdə kombinator kimya meydana gəlmişdir.

Yeni səmərəli dərman maddələrinin axtarışı müxtəlif yollarla həyata keçirilir. Onlardan biri təbii bioloji fəal maddələrin kimyəvi quruluşunun öyrənilməsinə əsaslanır. Bioloji fəal maddələrin

kimyəvi təbiəti öyrənildikdən sonra təbii maddənin quruluşu modelləşdirilir və onlara bənzər bir sıra maddələr sintez olunur. Modelləşdirilmə zamanı məlum qanunauyğunluqlar nəzərə alınır. Nəticədə təbii maddəyə oxşar və əlverişli üsullarla alınan sintetik maddələr yaranır.

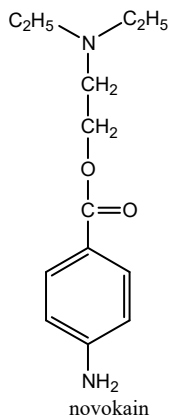
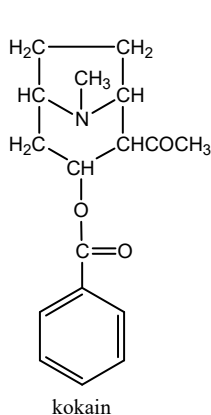
Təbii dərman maddəsi olan papaverinə oxşar sintetik preparatın - No-şpanın yaradılması və tibbdə geniş tətbiqi deyilənlərə sübutdur:



No-şpa öz spazmolitik təsirinə görə papaverindən daha güclüdür.

Bir çox hallarda təbii dərman maddələrinin analoqları olan sintetik birləşmələr öz quruluşuna görə daha sadə olur.

Yerli anesteziyaedici təsiri olan kokainə bənzər maddələrin sintezi bunu təsdiq edir:



Yeni dərman preparatları sintez olunduqdan sonra onların farmakoloji təsiri yoxlanır və kliniki sınaqlar üçün müəyyən birləşmələr seçilir. Bəzən bir sıraya aid yüzlərlə, minlərlə birləşmələrdən kliniki sınaq üçün ancaq bir-iki birləşmə seçilib götürülür. Belə seçmə prosesi farmakoloji skrining (skrining ingiliscə ələkləmə deməkdir) adlanır.

Seçilmiş maddələr öz analoqlarından üstün cəhətlərinə görə fərqlənməlidir. Belə ki, onlar yüksək fizioloji fəallığa malik olmaqla yanaşı, orqanizmə zərərli təsir göstərməməlidir və ya belə təsiri cüzi dərəcədə olmalıdır. Məsələn, malyariya əleyhinə olan sintetik maddələrin tədqiqi nəticəsində 12000-dən artıq birləşmə sintez olunmuşdur. Lakin onlardan yalnız ikisi lazımi dərəcədə fəal olmuş və tibb təcrübəsinə daxil edilmişdir (akrixin və plazmosid). Minlərlə sulfanilamid törəməsi olan birləşmələr sintez olunmasına baxmayaraq, bunların yalnız bir qismi yüksək antimikrob təsirli olmaqla bərabər, orqanizmə zərərli təsir göstərmədikləri üçün tibb təcrübəsində tətbiq edilir.

1.5 Üzvi maddələrin quruluşunun onların farmakoloji fəallığına təsiri

Üzvi maddələrin quruluşları ilə bioloji fəallığı arasında əlaqənin olması haqqında təsəvvürlər hələ 19-cu əsrin əvvəllərində mövcud idi. Lakin keçən bir əsrdən çox müddət ərzində yalnız bəzi qanunauyğunluqlar müəyyən edilmişdir. Bu əlaqənin müəyyən edilməsi yeni effektiv dərman maddələrinin sintezi üçün çox mühümdür.

Alifatik karbohidrogenlərin molekuluna halogen atomlarının daxil edilməsi onların farmakoloji təsirini gücləndirir. Məsələn, metan narkotik təsiri deyil, onun xlorlu törəmələri isə narkotik təsirlidir, xlor atomlarının sayı artdıqca bu təsir və toksiklik güclənir:



Xlor və brom törəmələri orqanizmə narkotik təsir göstərir, Lakin yod törəmələri antiseptik xassəyə malikdir.

Son illərdə tərkibində flüor atomu olan dərman preparatları tibbdə geniş tətbiq olunur və bunlar güclü farmakoloji təsirə malikdir.

Alifatik birləşmələrə hidroksil qrupları daxil etdikdə, həmin qrupların sayına müvafiq olaraq, fizioloji təsir zəifləyir. Spirtlərin molekulunda hidroksil qruplarının sayı artdıqca onların narkotik və toksiki təsirləri itir. Məsələn, etil spirti, qliserin, mannit, monosaxaridlər. Hidroksil qrupunun molekulda hansı vəziyyətdə olmasının əhəmiyyəti böyükdür. Məsələn, birli spirtlər müvafiq ikili spirtlərdən, onların isə üçlü spirtlərdən fəallığına görə zəif maddələrdir.

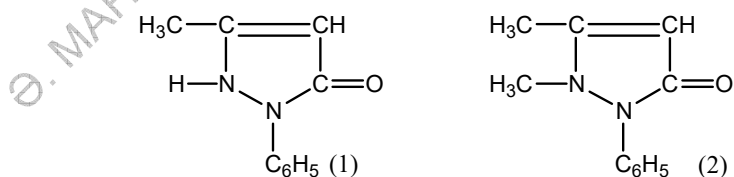
Aromatik birləşmələrə hidroksil qrupu daxil etdikdə onların

fəallığı və toksikliyi artır. Məsələn, fenol benzola nisbətən daha toksikdir, bununla yanaşı antiseptik təsirə malikdir. Benzoy turşusundan salisil turşusuna keçdikdə onun antiseptik təsiri güclənir, revmatizmə qarşı fəallıq yaranır.

Molekula aldehid və keton qrupunu daxil etdikdə onların bioloji fəallığı artır. Aldehidlər spirlərə nisbətən daha toksiki maddələrdir. Aldehid qrupunun olması maddələrin narkotik və dezinfeksiyaedici təsirinə səbəb olur, karbonil qrupu ($>C=O$) isə maddəyə yuxugətirici xassə verir. Aldehidlərin fəallığı, həmçinin, alkil radikalının təbiətindən də asılıdır. Belə ki, radikalda ikiqat rabitənin və halogenlərin olması onların toksikliyinə və fəallığına təsir göstərir.

Sulfhidril (SH) qrupu saxlayan birləşmələr yüksək reaksiyaya girmə qabiliyyətinə malikdir. Onlar ağır metallarla reaksiyaya daxil olaraq zərərsiz kompleks birləşmə əmələ gətirirlər. Qliserinin kükürdlü törəmələri olan unitiol və dikaptol arsen, stibium, bismut, cıvə və digər ağır metallarla zəhərlənmələrdə antidotlar (əks-zəhər) kimi tətbiq olunur.

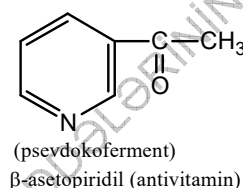
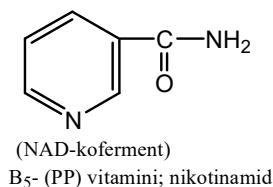
Molekula alifatik radikalın daxil edilməsi onların fəallığını artırır. Məsələn, 1-fenil-3-metilpirazon-5-in farmakoloji təsiri yoxdur, 1-fenil-2,3-dimetilpirazon-5 (antipirin) (2) isə hərarəti aşağı salmaq qabiliyyətinə malikdir:



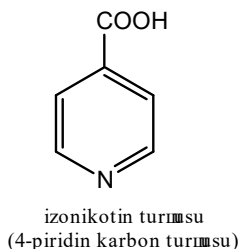
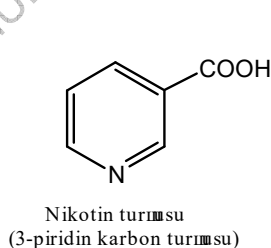
Molekulda $>N-CH_3$ qrupunun olması analgetik təsiri artırır. Molekula turşu qrupları: sulfo- və karboksil qrupları daxil etdikdə

onların fizioloji təsiri və toksikliyi zəifləyir.

Bioloji fəal maddələrin quruluşundakı cüzi dəyişikliklər, onun fəallığının zəifləməsinə və ya itməsinə, bəzən isə əks təsirli maddələrə çevrilməsinə səbəb olur. Buna misal olaraq bəzi vitamin və antivitaminləri göstərmək olar. Belə ki, nikotin turşusunun amidi – nikotinamid bioloji fəal maddə olub B₅ (PP) vitaminidir. Onda olan amin qrupunu metil qrupu ilə əvəz etdikdə isə əks təsirli maddə – antivitamin alınır.



Bir funksional qrupun yerdəyişməsi farmakoloji effektin zəifləməsinə, hətta bütünlüklə yox olmasına gətirib çıxarır. Məsələn, nikotin turşusundan fərqli olaraq izonikotin turşusu heç bir farmakoloji fəallığa malik deyil, lakin izonikotin turşusunun hidrazidi vərəm əleyhinə aktivlik göstərir, nikotin turşusunun hidrazidində bu xassə müşahidə edilmir.



Üzvi birləşmələrin farmakoloji fəallığı optik fəallıqla əlaqədar stereo izomerlikdən, həmçinin atomlararası məsafədən çox asılı

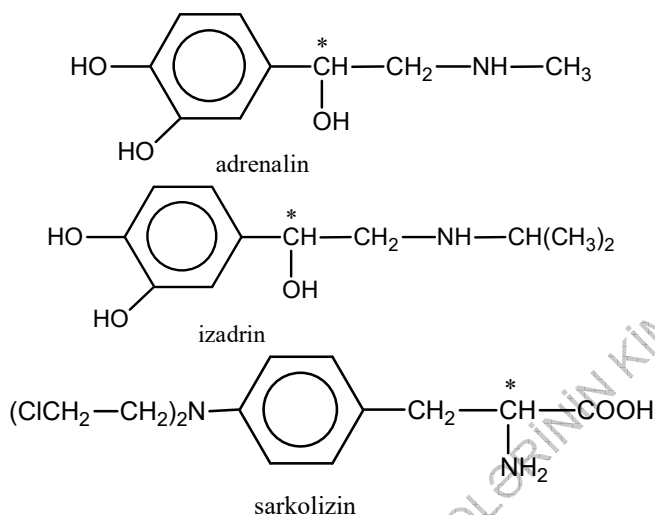
olur. Maddələrin fəza quruluşu onların fizioloji xassələrinə böyük təsir göstərir.

1.6 Dərman maddələrinin fəza quruluşu ilə farmakoloji təsiri arasında əlaqə

Müəyyən edilmişdir ki, optiki aktivliyə malik olan dərman maddələrində enantiomerlərdən yalnız biri farmakoloji təsirə malik olur. Bu da onunla izah edilir ki, biokimyəvi reaksiya (farmakoloji effekt) yalnız dərman molekulunun müvafiq aktiv mərkəzi ilə reseptor arasında əlaqə yarandığı halda mümkün olur.

Yəni dərman maddələrinin aktivliyi onların reseptorlarla qarşılıqlı təsirindən asılıdır. Dərman maddəsi o halda daha effektiv olur ki, o reseptorla daha sıx əlaqə yarada bilsin. Enantiomerin antipoduna dəyişməsi, onun reseptorla əlaqəsinin zəifləməsinə və hətta qırılmasına səbəb olur və dərman maddəsinin farmakoloji təsirini azaldır. Məsələn, hormonal təsirə malik olan adrenalinin ən böyük fizioloji aktivliyə malik olan enantiomeri D(–) adrenalindir. L(+) adrenalində OH-qrupu əks istiqamətdə yerləşdiyindən o, reseptorla qarşılıqlı təsirdə olmur və nəticədə bu enantiomerin farmakoloji təsiri azalacaq.

Analoji hadisə bir sıra dərman maddələri üçün xarakterikdir. İzadrin adlanan (+)-1-izopropilnoradrenalinin bronxları genişləndirmək xassəsi, onun sola fırladan enantiomerinə nisbətən 800 dəfə güclüdür. Şiş əleyhinə dərman vasitəsi olan sarkolizin-sola fırladan enantiomerdir: (+)-sarkolizin isə fizioloji aktiv deyil:

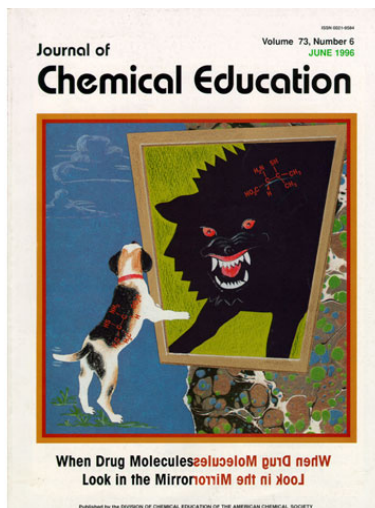


Oxşar nümunələr digər qrup dərman maddələri arasında da çoxdur. Məsələn, ibuprofen preparatının iki enantiomerindən yalnız S-izomer bioloji aktivdir, iltihab əleyhinə və hərərəti aşağı salmaq xassəsinə malikdir.

Analoji olaraq metildofa preparatının yalnız S-izomeri kəllədaxili təzyiqi aşağı salmaq qabiliyyətinə malikdir.

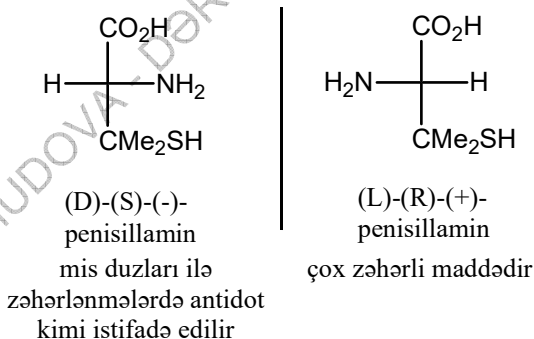
Xroniki artiritin müalicəsində istifadə edilən penisillamin yalnız S-izomer formada effektivdir. R-enantiomer farmokoloji effektdə malik deyil, toksiki maddədir.

Üzvi maddələrin fəza quruluşu ilə bioloji fəallığı arasında əlaqəyə dair Amerikada nəşr olunan J. Chem. Education (1996, vol.73, p. 481) jurnalında “Molekul güzgüyə baxdıqda” adlı məqalə dərc edilmişdir. Jurnalın üz qabığında belində pensillaminin formulu əks edilmiş güzgüyə baxan köpək rəsmi verilmişdir. Güzgüdən isə ona əcaib heyvan baxır ki, bunun belində isə pensillaminin güzgü əksi olan izomerinin quruluş formulu əks edilmişdir:

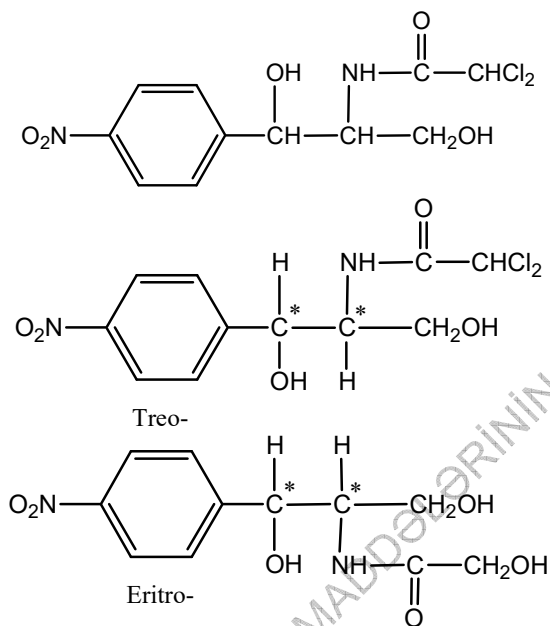


Şəkil 1.6-1. Belində penisillaminin formulu əks edilmiş güzgüyə baxan köpək

S-penisillamin effektiv dərman maddəsi olduğu halda, R-penisillamin toksiki maddədir:



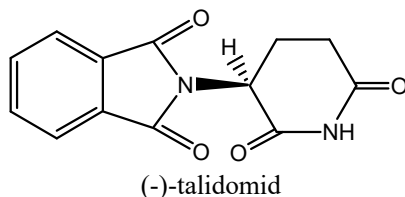
Levomisetin kimyəvi quruluşuna görə p-nitrofenil-2-dixlorasetilaminopropandiol-1,3-dür. İki assimetrik karbon atomuna və 4 fəza izomerinə: D-treo, L-treo, D-eritro, L-eritro izomerlərə malikdir:



Levomisetin D(-)-treo-izomeri fəaldır, onun L(+)-treo izomeri qeyri-fəaldır. D(-) və L(+)-eritro formalar toksik maddələrdir.

Beləliklə, biotənzimləyicilərin: hormonlar, vitaminlər, antibiotiklər və s. dərman maddələrinin farmakoloji təsiri onların fəza quruluşu ilə əlaqədardır.

Dərman maddələrinin optik təmizlik dərəcəsinin əhəmiyyətindən danışarkən 1950-60-cı illərdə Avropada geniş istifadə edilən talidomid preparatı ilə bağlı kədərli faktı qeyd etmək lazımdır. Talidomid *Chemie Grünenthal* alman əczaçılıq şirkəti tərəfindən istehsal edilmiş və o dövrdə Almaniyada ən çox satılan sedativ və yuxugətirici təsirə malik dərman preparatı olmuşdur:

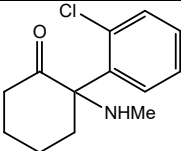
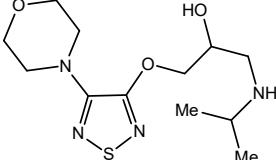
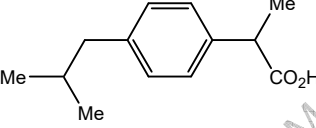
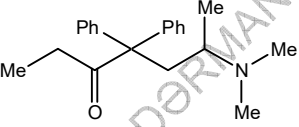
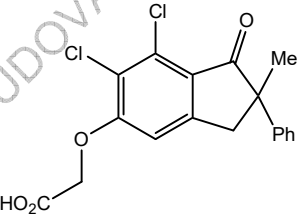
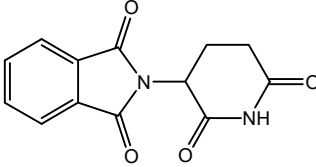


1961-ci ildə onun qəbulu ilə bağlı ciddi problemlər haqqında ilk məlumatlar yayılmağa başladı. Almaniya, İngiltərədə hamiləlik dövründə talidomid preparatı qəbul etmiş qadınlar tərəfindən doğulan körpələrdə anadangəlmə eybəcərliklər xüsusi ilə, ətrafların mutasiyası halları (8000 hadisə) müşahidə edilmişdir.

1979-cu ildə alman kimyacıları tərəfindən talidomid enantiomerlərinə ayrıldı və müəyyən edildi ki, teratogen təsirə S(-) enantiomer cavab verir. 1984-cü ildə isə müəyyən edildi ki, təmiz R(+) enantiomerin də istifadə edilməsi vəziyyəti dəyişə bilməz, beləki hər iki enantiomer pH-ın fizioloji mühitə uyğun qiymətlərində qarşılıqlı çevrilməyə məruz qalırlar. Buna görə müasir dövrdə əczaçılıq şirkətləri xiral dərman maddələrini rasemat şəklində deyil, individual enantiomerlər şəklində istehsal edirlər.

Cədvəl 1.6.1-də optiki aktivliyə malik bir sıra dərman maddələrinin xassələri verilmişdir.

Cədvəl 1.6.1. Optiki aktivliyə malik bir sıra dərman maddələrinin xassələri

Preparatın adı	Quruluşu	İstifadə edilən enantiomer	Antipod
Ketamin		S-(+) enantiomer 4 dəfə güclü anestetikdir.	R-(-) əlavə təsirləri vardır.
Timolol		S-(-) enantiomer yüksək qan təzyiqi zamanı istifadə edilir.	R-(+) enantiomer qlaukomada istifadə edilir.
İbuprofen		Yalnız S-(+) enantiomer analgetik təsirə malikdir.	
Metadon		R-(-) enantiomer rasemata nisbətən 3 dəfə güclü narkotik təsirə malikdir.	
İndakrinon		R-(-) diuretik təsirə malikdir.	S-(+) sidik turşusunun ayrılmasını stimulaşdırır.
Talidomid		R-(+) enantiomer sedativ və yuxugətirici təsirə malikdir.	S-(-) enantiomer güclü teratogen təsirlərə malikdir.

2. ALİFATİK KARBOHİDROGENLƏRİN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

2.1 Alkanlar

C_nH_{2n+2} ümumi formuluna malik bu birləşmələr təbii qazın, neftin tərkibinə daxildir.

Doymuş karbohidrogenlərin fiziki xassəsi onların molekulunda olan karbonun sayından asılıdır. Bunlardan metan, etan, propan, butan – qaz, C_5 – C_{12} -dən $C_{17}H_{36}$ -ya qədər maye, qalanları isə bərkdir. Maye halda olanlar benzin iylidir, bərk halda olanlar isə iysizdir. Doymuş karbohidrogenlər suda praktik olaraq həll olmurlar, üzvi həlledicilərdə isə yaxşı həll olurlar. Həlledicinin karbon zənciri uzandıqca həllolma qabiliyyəti yaxşılaşır.

Sənaye əhəmiyyətli doymuş karbohidrogenlərin əsas alınma mənbəyi neft hesab olunur. Neftin tərkibi çıxarılma mənbəyindən asılı olaraq dəyişir.

Neftin ilkin distilləsindən alınan əsas fraksiyalar cədvəl 2.1.1-də göstərilmişdir:

Cədvəl 2.1.1. Neftin ilkin distilləsindən alınan əsas fraksiyalar

Fraksiyalar	$T_{qay.}, ^\circ C$	Sıxlıq, q/m^3
Yüngül məhsullar (petrolein efiri,benzin)	150-dək	0,760
Kerosinlər	50-250	0,865
Sürtgü yağları	250-350	0,87-0,95
Neft qalıqları	350-dən yuxarı	0,95-dən çox

Tibbi praktikada əsasən maye və bərk halda olan doymuş karbohidrogenlərin nümayəndələrindən istifadə olunur. Bu qrupun onlarla preparatlarından yalnız üçünə nəzərdən keçirəcəyik: vazelin yağı, vazelin, bərk parafin. Onların alınma mənbələri əsasən tərkibində sürtgü yağları olan neft fraksiyaları hesab olunur. Vazelin yağı almaq üçün yalnız maye halda, vazelin və parafin almaq üçün isə parafin kütləsi adlanan 300°C-dən yuxarı temperaturda qaynayan bərk halda olan fraksiyalardan istifadə olunur. Bu üç preparatın kimyəvi tərkibi və xassələri cədvəl 2.1.2-də göstərilmişdir.

Cədvəl 2.1.2. Üç preparatın kimyəvi tərkibi və xassələri

Preparat	Kimyəvi tərkib	Xassələri	T _{er.} , °C	Sıxlıq, q/sm ³
Vazelin yağı	C ₁₀ H ₂₂ –C ₁₅ H ₃₂	Rəngsiz, yağabənzər mayedir	- 5	0,875-0,890
Vazelin	C ₁₂ H ₂₆ –C ₂₅ H ₅₂	Ağ və ya sarımtıl rəngli eynicinsli maz	37-50	0,855-0,880
Bərk parafin	C ₁₉ H ₄₀ –C ₃₆ H ₇₄	Ağ rəngli yarımşəffaf kütlə	50-57	0,881-0,905

Preparatları tibbi praktikada tətbiq etməzdən əvvəl onları təmizləyirlər. Qatı H₂SO₄ ilə təsir etməklə kükürlü, azotlu birləşmələrdən, doymamış və aromatik karbohidrogenlərdən təmizlənir. Daha sonra qələvilərlə təsir etməklə həm reaksiyaların turşu məhsullarını, o cümlədən naften turşularını neytrallaşdırmaq olur. Sonrakı təmizləmələri adsorbent vasitəsilə aparırlar.

Preparatların xassələri onların tərkibindəki karbon atomlarının sayından asılıdır. Doymuş karbohidrogenlərin preparatları iysiz və

dadsız olur. Onlar suda həll olmur. Lakin efirdə, xloroformda, benzində həll olurlar. Yağlarla istənilən nisbətdə qarışırlar.

Təmizliyin tam başa çatmasını preparatların tərkibində digər maddələrin olmaması ilə təyin edirlər. Digər maddələr olan zaman sulfat turşusunun əlavə edilməsi rəng dəyişikliyinə səbəb olur. Vazelin yağında suyu və bərk parafinləri 0°C -dək soyutma zamanı əmələ gələn dəyişikliyə görə təyin edirlər. Neftin aşağı temperaturda qaynayan fraksiyalarını isə həmin temperaturda qovulma ilə təyin edirlər. Reduksiyaedici maddələri KMnO_4 məhlulu ilə təsir etməklə rəngin dəyişməsi ilə müəyyən edirlər.

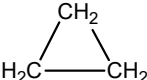
Vazelin yağını işıq düşməyən yerdə yaxşı bağlanmış bankalarda saxlayırlar. Parafini isə sərin yerdə saxlayırlar. Heyvan yağlarından fərqli olaraq bunlar turşuya, oda, qələvilərə qarşı davamlıdır.

Maye karbohidrogenlər dərinin sinir uclarına qıcıqlandırıcı təsir göstərir. Daha yüksəkmolekullu birləşmələri yüngül, zəif effekt verirlər. Aşağı temperaturda qaynayan doymuş karbohidrogenləri xaricə tətbiq etdikdə antiseptik xassə göstərir.

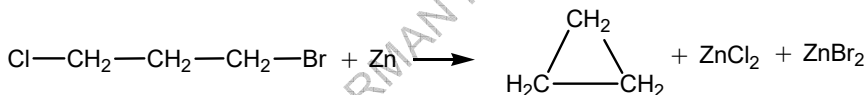
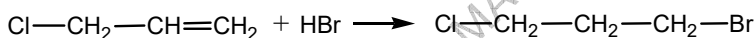
Vazelin yağı, vazelin və parafin bərk halda müxtəlif dərman maddələrinin hazırlanmasında indefferent əsas kimi istifadə olunur.

verir.

Bir həcm tsiklopropan 2,85 həcm suda həll olur. Spirtdə, petrolein efirində, maye yağlarda asan həll olur.

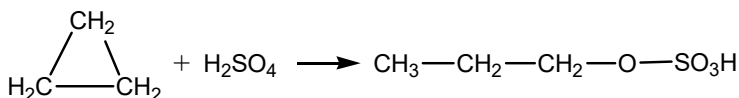
Preparat	Kimyəvi quruluşu	Fiziki xassələri
Tsiklopropan		Rəngsiz, xarakter iyli, yanıcı qazdır, iyinə görə petrolein efirini xatırladır, 34,5 ⁰ C-də qaynayır.

Sənaye miqyasında tsiklopropanı allilxloriddən alırlar. Əvvəlcə allilxlorid hidrogenbromidlə reaksiyaya daxil olur. 1-xlor-3-brompropan əmələ gəlir, daha sonra isə alınan məhsula Zn tozu ilə təsir edirlər.



Tsiklopropan digər qazlardan xüsusi iyinə və dadına görə fərqlənir. Tsiklopropan tərkibində qarışıqların – turşular, qələvilər, karbon dioksid, spirtlər, su, doymamış birləşmələr, halogenlər və s. qarışıqların varlığı xüsusi metodika ilə müəyyən edilir.

Tsiklopropanın miqdar təyini Qempel aparatında (oksigenin təyini də bu aparatda aparılır) aparılır. Uducu məhlul kimi sulfat turşusu götürülür. Tsiklopropan sulfat turşusu ilə çox enerjili sürətdə reaksiyaya daxil olur.

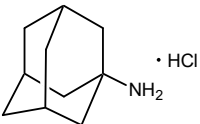
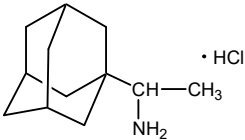


Sulfat turşusu tərəfindən udulan qazın həcminə görə tsiklopropanın həcmi təyin edirlər. Tədqiqatı yerinə yetirməkdən əvvəl təmizliyini və miqdarı təyin etmək üçün tsiklopropan balonu 25°C temperaturda 6 saat saxlanılmalıdır.

Tsiklopropan narıncı rəngli, ağzı kip bağlanmış polad balonlarda və soyuq yerdə saxlanılır. Balonun üzərinə də **“Ehtiyatlı ol - təhlükəlidir”** yazılmalıdır. Tsiklopropandan yalnız xüsusi təlim keçmiş tibb işçilərinə istifadə etməyə icazə verirlər. Ondan istifadə edərkən, nəzərə almaq lazımdır ki, tsiklopropan hava, oksigen və azot oksidləri ilə qarışıq əmələ gətirir ki, bu da zəif alovun, elektrik qılgıcımının təsirindən partlayır. Ona görə tsiklopropanı oddan, elektrik qılgıcımından və digər yanıcı maddələrdən qorumaq lazımdır. Bu qarışıqlar havada 2,4-10%, oksigendə 2,4-60%, azot oksidlərində 1,6-30% tsiklopropan olduqda yüksək təzyiqdə də partlayış verə bilər.

3.2 Adamantanın törəmələri

1-Aminoadamantan törəmələrindən viruslara qarşı istifadəsi haqqında məlumatlar ilk dəfə 1964-cü ildə nəşr edilmişdir. Çoxsaylı tədqiqatlar nəticəsində məlum olmuşdur ki, adamantanın törəmələri geniş spektrli bioloji fəal maddələrdir. Onlar nəinki virus əleyhinə, həm də antibakterial maddə kimi, qıcalmaya qarşı, belğəm gətirici, damargenişləndirici təsirə malik birləşmələrdir. Tibb praktikasında adamantanın törəmələrindən midantan və remantadin tətbiq edilir.

Preparat	Kimyəvi quruluşu	Fiziki xassələri
Midantanium- midantan	 1-aminoadamantan hidroxlorid	Acı dadlı, zəif iyli, ağ kristallik toz, suda, xloroformda, spirtdə, efirdə həll olur
Remantadi- midantan- remantadin	 α -metil-1-adamantilmetilamin hidroxlorid	Acı dadlı, iysiz, ağ rəngli kristallik maddədir, suda pis həll olur, xloroformda və spirtdə yaxşı həll olur

Midantanın həqiqiliyi natrium hidrokسيد məhlulunda qızdırdıqda parçalanması və ammoniyak ayrılmasına əsaslanır. Bu proses qırmızı lakmus kağızının rənginin dəyişməsi ilə müşahidə edilir.

Preparat əsasının – 1-aminoadamantanın 2-nitroindandion-1,3-lə qarşılıqlı təsiri zamanı sarı rəngli çöküntü verməsi ilə müəyyən edilir.

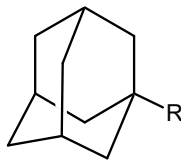
Remantadin isə natrium ilə nitroprussid aseton və natrium karbonat iştirakı ilə qarşılıqlı təsiri zamanı bənövşəyi rəng əmələ gətirir. Hər iki preparat xlorid ionu ilə müsbət reaksiya verir.

Midantan və remantadinin miqdarı təyini buzlu sirkə turşusu mühitində susuz titrləmə ilə müəyyən edilir. Digər üzvi əsasi hidroxloridlərlə olduğu kimi titrləmə civə (II) asetat mühitində aparılır. Titrant kimi 0,1 N xlorid turşusu məhlulundan istifadə edilir.

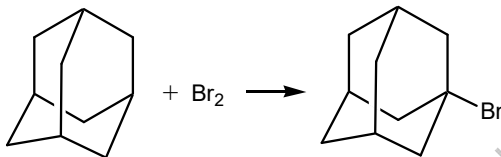
Midantan parkinsonizmi müalicə etmək üçün həb şəklində qəbul edilir (0,1q). Remantadin isə viruslara qarşı aktivlik göstərir. Ondan qripə qarşı müalicədə istifadə edilir.

Tibbi praktikada tətbiq edilən midantan və remantadin

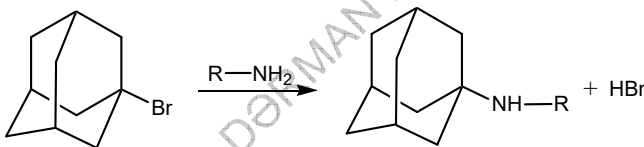
adamantanın törəmələrindən olub, ümumi formulu:



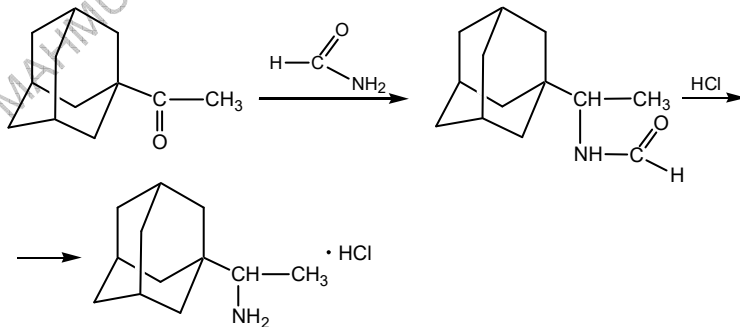
Bu birləşmələrin alınması üçün ilkin maddə 1-bromadamantan və ya 1-yodadamantan 100-150°C temperaturda adamantana Br_2 və ya J_2 ilə təsir etməklə alınır:



1-Bromadamantana alifatik aminlərlə R-NH_2 təsir etməklə adamantan-1-amin törəmələri alınır:



Remantadini almaq üçün adamantimetilketonun reduksiyaedici aminləşmə reaksiyasından istifadə edilir:



4. ALİFATİK SIRA HALOGENLİ TÖRƏMƏLƏRİNİN MÜHÜM DƏRMAN PREPARATLARI

4.1 Alkilhalogenidlər

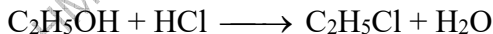
Alkilhalogenidlər alkanların özlərinə nisbətən daha fəal olur. Bu birləşmələrin fizioloji aktivliyi halogenin təbiətindən asılıdır.

Karbohidrogenlərin halogenli törəmələrinin fəallığı onların fiziki-kimyəvi xassələri ilə, əsasən də yağlarda, piylərdə həll olması ilə əlaqədardır.

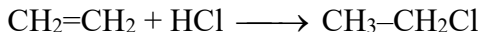
Onlar sinir toxumaları lipoidlərində fiziki və kolloidial dəyişiklik edərək keyləşdirici təsir göstərir. Alkilhalogenidlərdən etilxlorid, trixlorometan (xloroform), 1-xlor-1-brom-2,2,2-triflüoretan (ftorotan) inhalyasion narkoz kimi tətbiq edilir. Müəyyən edilmişdir ki, halogen atomlarının sayı artdıqca, həmçinin yodidlərdən bromidlərə, bromidlərdən xloridlərə doğru getdikcə onların narkotik təsiri artır.

Etilxlorid: C_2H_5Cl (xloretan) preparatı aşağıdakı üsullarla alınır:

1. Mütləq spirt içərisində $110-120^{\circ}C$ -ə qədər qızdırmaqla susuz hidrogenxlorid buraxılır və ya susuz $CaCl_2$ və qatı H_2SO_4 qarışığı ilə təsir edilir:



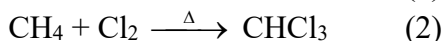
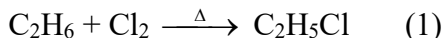
2. Etilenə hidrogen-xloridlə təsir etməklə:



Etilxlorid şəffaf, rəngsiz, asan buxarlanan mayedir. Özünəməxsus iylidir. Yaşıl alovla yanır. Suda çətin həll olur (1:50). Spirt və efirdə yaxşı həll olur. Qaynama temperaturu $12-13^{\circ}C$ -dir.

Preparat qısa müddətli cərrahi əməliyyatlarda narkoz üçün və toxumaları soyutmaqla yerli keyləşdirici kimi işlənir.

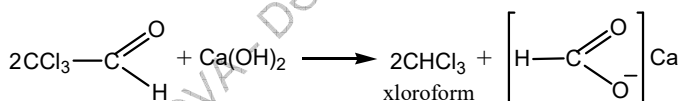
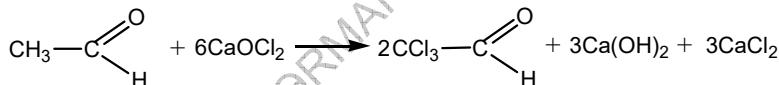
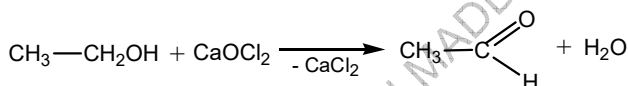
Sənayedə etilxlorid (1) və xloroform (2) həmçinin müvafiq olaraq etan və metanın yüksək temperaturda (400⁰C) xlorlaşdırmaqla alınır:



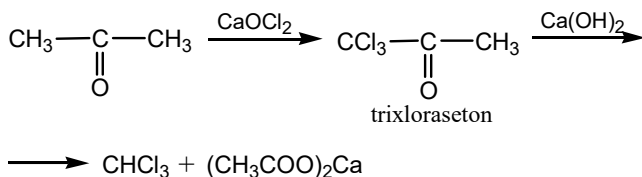
Xloroform: CHCl₃ (trixlorometan)

Xloroform aşağıdakı üsullarla alınır:

1. Etil spirtinə və ya asetona 55-60⁰C-də hipoxloritlərlə və ya xlorlu əhənglə təsir etməklə:

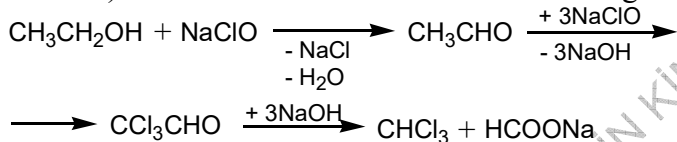


2. Daha təmiz xloroform asetona xlorlu əhənglə təsir etməklə alınır:



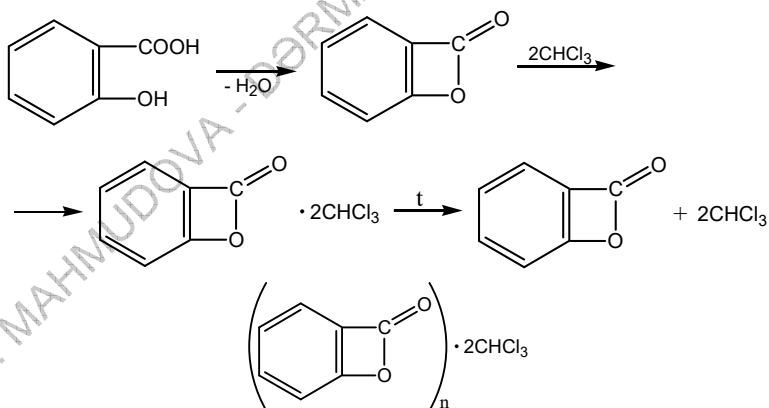
3. Sənayedə xloroformu almaq üçün iqtisadi cəhətdən əlverişli

olan elektroliz üsulundan istifadə edilir. Xammal kimi spirt və ya aseton götürülür, natrium və ya kalium-xlorid məhlulu ilə qarışdırılır. Qarışığı 60°C-ə qədər qızdırıb elektroliz edirlər. Katodda natrium (və ya kalium) qələvisi, anodda isə xlor alınır. Bunların qarşılıqlı təsirindən əmələ gələn NaOCl və ya KOCl spirtə (və ya asetonu) təsir edir və nəticədə xloroform əmələ gəlir:



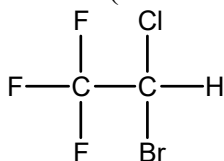
Narkoz üçün xloroform daha təmiz olmalıdır. Bundan ötrü xloroformu salisil turşusunun anhidridi ilə kristallik kompleks birləşməyə çevirirlər.

Bu üsul salisil turşusunun anhidridinin 2 molekul xloroformla kristal kompleks birləşmə əmələ gətirməsinə əsaslanır:



Sonra bu birləşməni qızdırdıqda ondan təmiz xloroform ayrılır. Narkoz üçün xloroform cərrahi əməliyyatlarda inhalyasion narkoz məqsədilə istifadə edilir.

Ftorotan – CF_3CHClBr (1-xlor-1-brom-2,2,2-trifluoretan)



1-xlor-1-brom-2,2,2-trifluor etan

Preparatın sənaye miqyasında sintezi müvafiq freonların yüksək temperaturda radikal xlorlaşdırılması və bromlaşdırılmasına əsaslanır:

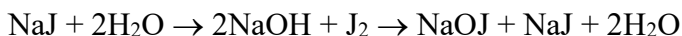
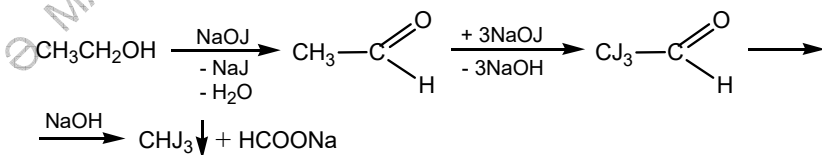


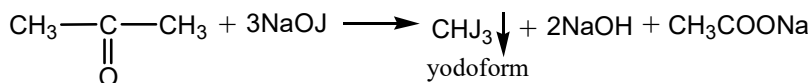
Ftorotan şəffaf, rəngsiz, ağır, alovlanmayan mayedir. İyi xloroforma oxşardır, şirin və qıcıqlandırıcı dadı malikdir. İnhalasyon narkoz üçün tətbiq olunur. Güclü narkotik təsiri vardır və tez bir zamanda narkoz törədir. Onun buxarları selikli qışaları qıcıqlandırır.

Ftorotan orqanizmdə dəyişmədən tənəffüslə xaric olur. Ftorotanla nəfəsalmanı dayandırdıqda 5-15 dəqiqə sonra narkoz keçir, xəstə oyanır və şüur bərpa olunur.

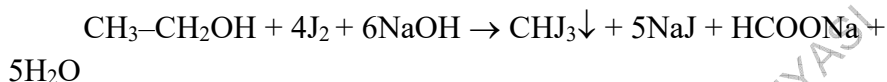
Triyodmetan: CHJ_3 yodoform

Preparatı almaq üçün etil spirti və ya asetonun iştirakı ilə natrium (və ya kalium) yodid məhlullarını elektroliz edirlər:





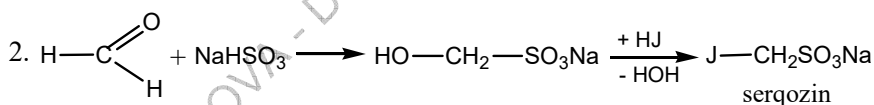
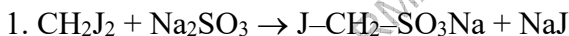
Laboratoriyada yodoformu almaq üçün etil spirti yod məhlulu ilə qələvi mühitdə qızdırılır.



Yodoform narın kristallik, limonu-sarı rəngli, özünəməxsus səciyyəvi iyə malik birləşmədir. Otaq temperaturunda tədricən uçucudur. Suda həll olmur, spirtə çətin həll olur. Efirə və xloroformda həll olur. 116-120⁰C-də əriyir. Preparat antiseptik maddə kimi irinli yaraların müalicəsində tətbiq olunur:

Serqozin: yodmetansulfonat-natrium - JCH₂-SO₃Na

Preparatı almaq üçün aşağıdakı reaksiyalardan istifadə edilir:



Serqozin iysiz, ağ kristallik maddədir, hiqroskopikdir. Suda həll olur (1:2).

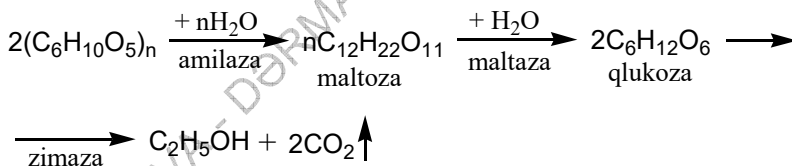
Serqozin rentgen-kontrast maddə kimi sidik yollarının, böyrəklərin, sidik kisəsinin müayinəsi zamanı (sisteielloqrafiyada) 10-40%-li məhlullar şəklində tətbiq edilir.

4.2 Alkanollar.

Alifatik spirtlərdən etanol tibbdə antiseptik maddə kimi, qıcıqlandırıcı kimi xaricə sürtmələr şəklində və eyni zamanda bəzi dərman maddələrinin, ekstraktların hazırlanmasında istifadə edilir

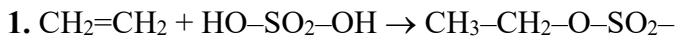
Etanol - etil spirti (95%-li): C_2H_5OH ; M.k.=46,07

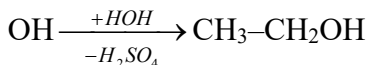
Sənayedə tibbi məqsədlər üçün etil spirtini tərkibində nişasta olan bitki xammalından: kartof, buğda, çovdar, arpa, düyü və s.-dən fermentativ üsulla alırlar. Xırdalanmış bitki xammalını $140-150^{\circ}C$ -də qızdırılmış buxarla işləyir, yapışqanlı qatı kütləyə çevirirlər. Sonra qarışığı soyudub üzərinə arpa səmənisi əlavə edirlər. Nişasta səmənində olan amilazanın təsirindən maltozaya, maltoza isə maya maltazasının təsirindən qlükozaya çevrilir. Qlükoza zimaza qrupu fermentləri təsirindən qıcqırmanın son məhsulları olan spirt və karbon qazına çevrilir.



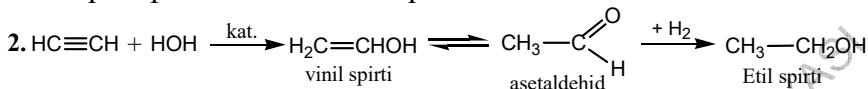
Karbon qazı qabarcıqlarının xaric olub qurtarması qıcqırmanın sona çatdığını göstərir, alınmış qarışığın tərkibində 14-18% spirt olur. Onu bir neçə dəfə qovmaq və aktivləşdirilmiş kömür üzərində təmizləməklə ayırırlar.

Sənayedə etil spirti etilenin buxar fazada (birbaşa) və maye fazada (aralıq etilsulfatın alınması mərhələsi ilə) hidratlaşması nəticəsində alınır:

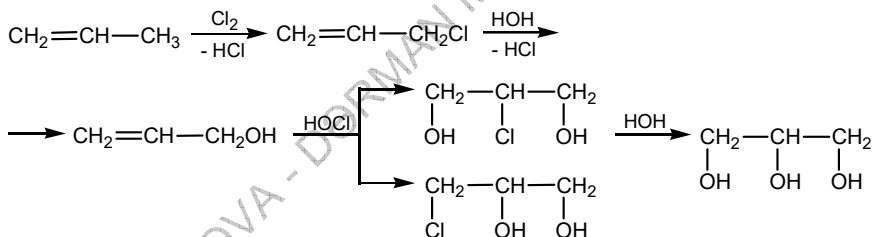




Etanol texniki məqsədlər üçün asetilenin hidratlaşması nəticəsində sintez vasitəsilə də alınır. Etilen və asetilen neftin krekinqi və pirolizindən alınan qazların tərkibində olur:

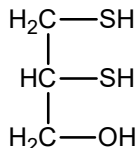


Qliserin: $\text{CH}_2\text{OH—CHOH—CH}_2\text{OH}$ - üçatomlu spirtir. Sənayedə qliserin müxtəlif üsullarla: yağların və piylərin sabunlaşması nəticəsində və ya sintez üsulu ilə propileni xlorlaşdırmaqla və s. alınır. Tibbdə 84-88%-li qliserindən istifadə edilir, çünki təmiz 100%-li qliserin dəriyə qıcıqlandırıcı və yandırıcı təsir göstərir. Güclü suçəkici maddədir. Tibbdə tətbiq olunan qliserin şirəyəbənzər, sudan ağır mayedir, zəif iyi və şirin dadı vardır.



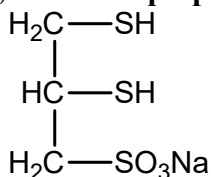
Qliserin dəriyə yumşaldıcı təsir göstərir. Bir sıra məlhəmlərin əsası və həlledicisi kimi işlənir.

2,3-dimerkaptopropanol; ditionqliserin:



Dikaptol 2,3-dimetikaptopropanolun benzilbenzoatda və zeytun yağında olan 10%-li məhluludur. Civə, gümüş, arsen və s. birləşmələrlə zəhərlənmələrdə əks zəhər kimi 1 ml. dozada əzələyə yeridilir.

Unitol - natrium-2,3-dimerkaptopropansulfanat

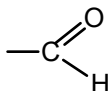


Preparat arsen, civə, bismut və ağır metal birləşmələri ilə (qurğuşundan başqa) zəhərlənmələrdə əks-zəhər kimi tətbiq olunur.

Təsir mexanizmi onunla əlaqədardır ki, molekulunda olan hidrosulfid (–SH) qrupları qanda, toxumalarda, ağır metal ionları ilə birləşərək zərərsiz və böyrəklərdən asan xaric olan kompleks birləşmələr əmələ gətirir.

5. ALDEHİDLƏR VƏ KARBON TURŞULARI

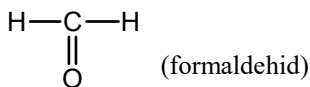
5.1 Aldehidlər



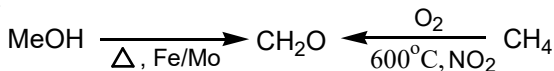
Aldehidlər spirtlərə nisbətən daha toksiki maddələrdir. Aldehid qrupunun olması maddələrin narkotik və dezinfeksiyaedici təsirinə səbəb olur.

Ümumiyyətlə, karbonil qrupu ($>\text{C}=\text{O}$) olan maddələr yuxugətirici xassəlidir. Aldehidlərin fəallığı, həmçinin, alkil radikalının təbiətindən də asılıdır. Belə ki, radikalda ikiqat rabitənin və halogenlərin olması onların toksikliyinə və fəallığına təsir göstərir.

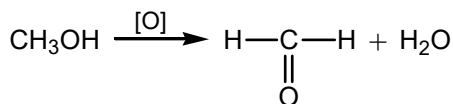
Metanal:



Sadə aldehid – metanal xaricə antiseptik kimi zəif sulu məhlullarından əllərin, dərinin və alətlərin dezinfeksiya edilməsində istifadə edilir. Sənayedə onu metanolun (350°C , katalizator-Fe/Mn oksidləri) və ya metanın (600°C , katalizator-azot dioksid) oksidləşməsindən alırlar.



Tibbdə formaldehidin 40%-li məhlulundan istifadə edilir. Preparatı almaq üçün metil spirtinin buxarları ilə doymuş hava cərəyanını közdərilmiş mis telləri üzərindən keçirib, alınmış formaldehidi soyutduqdan sonra su ilə udurlar. Suyu o vaxta qədər formaldehid qazı ilə doyduurlar ki, 38-40%-li məhlul alınsın.



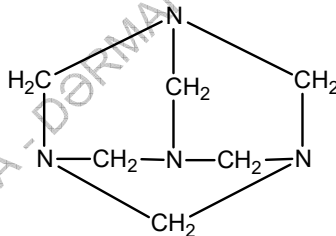
Formaldehid məhlulu şəffaf, rəngsiz, özünəməxsus kəskin iyli mayedir. Su və spirtdə bütün nisbətlərdə həll olur. Formaldehid asanlıqla polimerləşərək paraform – $(\text{CH}_2\text{O})_n$ əmələ gətirir.

Preparatı stabiləşdirmək üçün onun üzərinə 1,0%-ə qədər metil spirti əlavə edirlər. Metil spirti formaldehidin polimerləşməsinin qarşısını alır.

Formaldehid məhlulları saxlandıqda öz-özünə baş verən, aldehidin qismən oksidləşmə və qismən də reduksiya olunması nəticəsində qarışıq turşusu və metil spirti əmələ gələ bilər.

Heksametilentetramin – urotropin

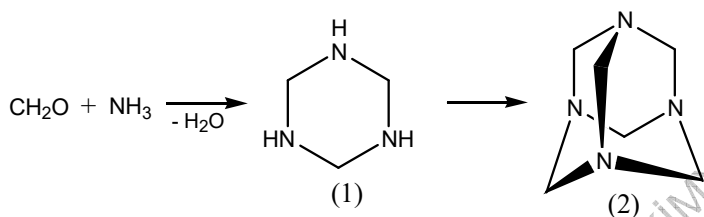
$(\text{CH}_2)_6\text{N}_4$; $M_r=140,19$



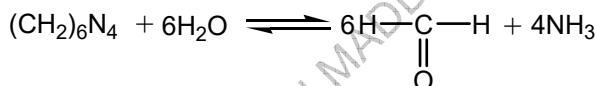
Preparat ilk dəfə A.M.Butlerov tərəfindən 1860-cı ildə formaldehid və ammoniyak məhlullarının qarşılıqlı təsiri nəticəsində alınmışdır.

1895-ci ildən tibbdə istifadə edilən heksametilentaaminin (urotropin, 2) antiseptik təsiri onun tədricən formaldehidə qədər parçalanmasına əsaslanır. Bu proses turş mühitdə sürətlənir. Buna görə də urotropini dərman əmələ gətirən hesab etmək olar. Tetraazaadamantani (2) asanlıqla metanal və ammoniyakın sulu

məhlullarının kondensləşməsindən alınır, bu zaman aralıq məhsul heksahidrotriazin (1) alınır.

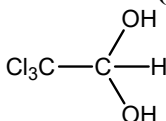


Preparat iysiz, rəngsiz kristallardır. Sulu məhlulu zəif əsasi reaksiyalıdır, hidroliz olunaraq formaldehidə və ammonyaka parçalanır. Turş mühitdə hidroliz asanlıqla gedir:



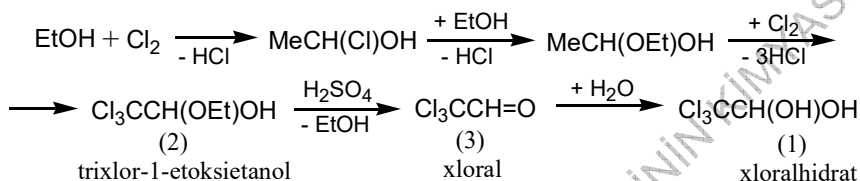
Fizioloji təsiri orqanizmdə tədricən parçalanaraq antiseptik təsirli formaldehid əmələ gətirməsinə əsaslanır. Qripə qarşı və sidik yollarının infeksiyasında istifadə edilir. Fosgenlə zəhərlənmənin qarşısını almaq üçün də işlənir, çünki fosgenlə urotropin zərərsiz birləşmə $(\text{CH}_2)_6\text{N}_4 \cdot \text{COCl}_2$ verir. Kalsium xloridlə də kompleks birləşmə $(\text{CH}_2)_6\text{N}_4 \cdot \text{CaCl}_2$ əmələ gətirir. Bu birləşmə «kalseks» dərmanı şəklində soyuqdəymələrdə işlənir.

1,1-dihidroksi-2,2,2-trixloretan (xloralhidrat):



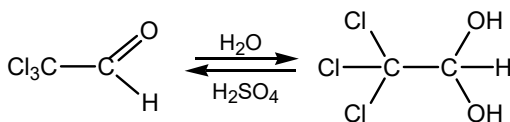
Xloralhidrat ilk dəfə 1832-ci ildə Libix tərəfindən spirti xlorlaşdırmaqla alınmışdır. Tibbi məqsədlər üçün 1896-cı ildən

işlənir. O yuxugətirici, sakitləşdirici, qıcolmaya qarşı istifadə edilir. Asetaldehyd zəif yuxugətirici təsirə malik olduğu halda, hidrogen atomlarının xlorla əvəz olunması nəticəsində alınan trixlorasetaldehyddə yuxugətirici təsir güclənir. Preparatın sintezi aşağıdakı sxem üzrə aparılır:



Xloralhidratın alınması ilkin olaraq etanolun xlor iştirakı ilə trixlor-1-etoksietanola (2) çevrilməsinə əsaslanır. Sonrakı mərhələdə sulfat turşunun iştirakı ilə bu yarımasetal etanol molekulu ayıraraq trixloretnal-xloral (3) əmələ gətirir ki, sonuncunun da hidratlaşması nəticəsində kristallik xloralhidrat əmələ gəlir.

Trixlorsirkə aldehidi elektromənfi trixlormetil qrupuna malik olması nəticəsində stabil kristalhidrat olan xloralhidratı əmələ gətirir ki, bu da yalnız qüvvətli su alıcı maddələrin təsiri ilə məsələn, H_2SO_4 təsiri ilə suyunu itirir.



Xloralhidratın aldehid qrupuna malik olması narkotik təsir verir. Halogen atomları onun bu xassəsini artırır, karbonil qrupunun hidratlaşması isə onun toksikliyi azaldır.

Xloralhidrat rəngsiz şəffaf kristallardır və ya xırda kristallik

tozdur, özünə məxsus kəskin iyliidir. Səciyyəvi acıtəhər dadı vardır. Nəmli havada hiqroskopikdir. Suda, spirtdə, efirdə çox asan həll olur, xloroformda da həll olur. Ərimə temperaturu 49-55⁰-dir.

Xloralhidrat yuxugətirici və qıcolmaya qarşı maddə kimi, kiçik dozalarda isə sakitləşdirici kimi işlənir.

5.2 Alifatik karbon turşuları

Tibb təcrübəsində əksər hallarda karbon turşularının duzları tətbiq edilir. Adətən, üzvi turşuların duzları asan hidrolizə uğrayır və əsasən məhlulları qələvi reaksiyalı olur:



Oksikarbon turşularının turşuluq xassəsi daha qüvvətlidir, bu xassə α-oksitürşularda özünü xüsusilə göstərir. Tibbdə oksikarbon turşuları da duzları (kalsium, dəmir, mis, natrium və s.) şəklində tətbiq edilir.

Kalium-asetat - CH₃COOK

Preparatı almaq üçün asetat turşusu və kalium-hidrokarbonat məhlullarını qarışdırıb buxarlandırırlar:



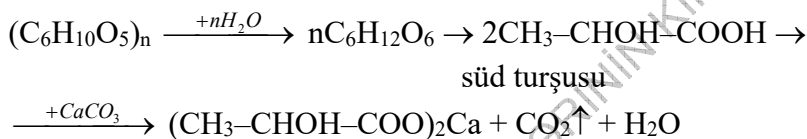
Kalium-asetat ağ tozdur, iysiz və ya zəif sirkə turşu iyliidir, azacıq şor dadlıdır. Hiqroskopikdir, havada mayələşir. Suda və spirtdə asan həll olur, məhlulları qələvi reaksiyalıdır.

Preparat kalium ionlarının mənbəyi kimi orqanizmdə kaliumun azlığında (hipokaliemiya) 10-15%-li məhlullar şəklində

daxilə qəbul olunur.

Kalsium-laktat: $(\text{CH}_3\text{—CHOH—COO})_2\text{Ca} \cdot 5\text{H}_2\text{O}$

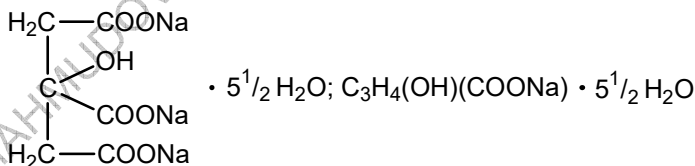
Sənayedə preparatı almaq üçün süd turşusunun qıcqırma prosesində istifadə edirlər. Şəkərli maddələr (nişasta, qlükoza) qıcqırma bakteriyaları təsirindən 50°C -ə qədər temperaturda süd turşusuna çevrilir, alınan turşu isə kalsium-karbonatla neytrallaşdırılır.



Preparat ağ narın tozdur. Havada kristallaşma suyunu tədricən itirir. Soyuq suda az, isti suda isə yaxşı həll olur. Spirtdə, efirdə, xloroformda çox az həll olur.

Preparat kalsium ionlarının mənbəyi və allergiyaya qarşı maddə kimi həblər və məhlullar şəklində tətbiq olunur. Kalsium-xloriddən fərqli olaraq, selikli qışalara qıcıqlandırıcı təsir göstərmir.

Natrium-sitrat (inyeksiya üçün)



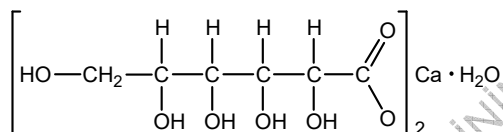
Preparat limon turşusunu natrium-karbonatla neytrallaşdırmaqla alınır. Sənayedə isə limon turşusu müxtəlif mənbələrdən, məsələn, pambıq bitkisi yarpaqlarından, limon və cır nar şirələrindən, mikrobioloji sintezlə alına bilər.

Preparat rəngsiz və ya ağ kristallik tozdur. Suda asan həll

olur.

Preparat qanın laxtalanmasının qarşısını alan maddə kimi (konservant), tibbi məqsədlər üçün, qan hazırlığında 4-5%-li məhlullar şəklində işlənir.

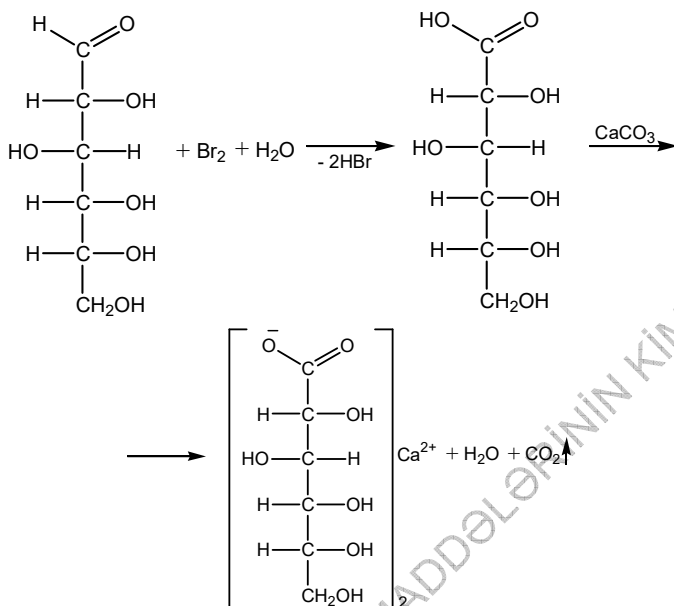
Kalsium-qlükonat



Preparatı almaq üçün qlükozanı qlükon turşusuna qədər oksidləşdirib, sonra onu kalsium-oksidi vasitəsilə kalsium duzuna çevirirlər.

Qlükozanı xlorun, bromun təsirindən mikrobioloji üsulla – penicillium luteum, penicillium citrinum və s. kif göbələklərinin köməyi ilə oksidləşdirmək olar.

Sənayedə bu proses elektrokimyəvi üsulla yerinə yetirilir. Bunun üçün tərbikində kalsium-karbonat və kalsium-bromid olan qlükoza məhlullarını elektroliz edirlər. Elektroliz zamanı kalsium-bromiddən sərbəst brom əmələ gəlir, o isə qlükozanı oksidləşdirib qlükon turşusuna çevirir, kalsium-karbonat isə onu neytrallaşdırır:



Kalsium-qlükonat ağ dənəvari və ya kristallik toz olub, iysiz və dadsızdır. 50 hissə soyuq suda, 5 hissə qaynar suda həll olur, spirtdə və efirdə praktiki həll olmur.

Preparat kalsium ionlarının mənbəyi kimi, allergiyaya qarşı maddə kimi tətbiq olunur.

Yerli qıcıqlandırıcı təsiri zəif olduğu üçün məhlulları əzələyə və venaya (bədənin temperaturuna qədər qızdırıldıqdan sonra) yeridilir.

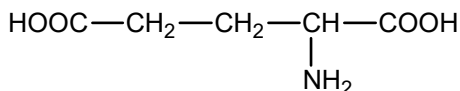
5.3 Alifatik aminturşular

Hal-hazırda dünya miqyasında α -aminturşuların ümumilikdə istehsalı ildə 0,5 mln. ton təşkil edir. Bu da onların geniş tətbiq sahələrinə (tibbdə, kənd təsərrüfatında, yeyinti sənayesində) malik

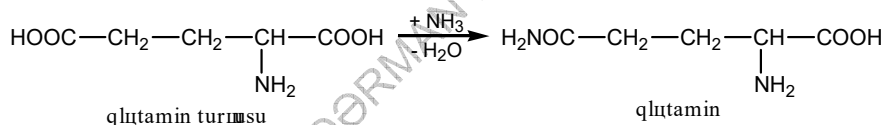
olması ilə əlaqədardır.

Aminturşuların tibbdə aşağıdakı preparatları tətbiq edilir:

5.3.1. 2-Amino-1,5-pentandikarbon turşusu (qlütamin turşusu):



Zülali maddələrin hidrolizi (miozin, kazein, buğda, zülali və s.) nəticəsində və sintez vasitəsilə alına bilər. Orqanizm üçün qlütamin turşusunun əhəmiyyəti böyükdür. O, azot mübadiləsində, ammoniyakın zərərsizləşdirilməsində iştirak edir. Belə ki, ammoniyakla birləşərək orqanizm üçün zərərsiz olan qlütamin əmələ gətirir.

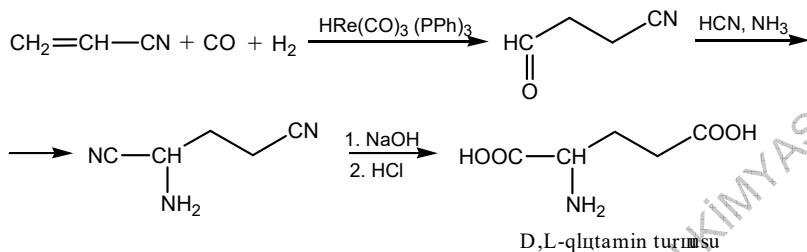


Bu prosesin mərkəzi sinir sisteminin normal fəaliyyəti üçün əhəmiyyəti böyükdür. Qlütamin turşusu zülal və şəkər mübadiləsində iştirak edir.

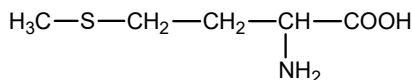
Mərkəzi sinir sistemi xəstəliklərində (epilepsiyada psixoz, uşaqlarda polimielit, əqli inkişafın zəifliyi) tətbiq edilir.

Qlütamin turşusunun sintezi akrilnitrilin katalizator iştirakı ilə (kobalt və ya renium triarilfosfinkarbonil) nitrilaldehydə çevrilməsinə əsaslanır. Sonuncu Ştrekker metodu ilə aminodinitril qlutar turşusuna çevrilir, sonra 100°C temperaturda qələvi ilə sabunlaşdırmaqla D,L-dinatrium qlutamat alınır. Rasematin enantiomerlərə ayrılması bu məhlulun L-qlütamin turşusunun

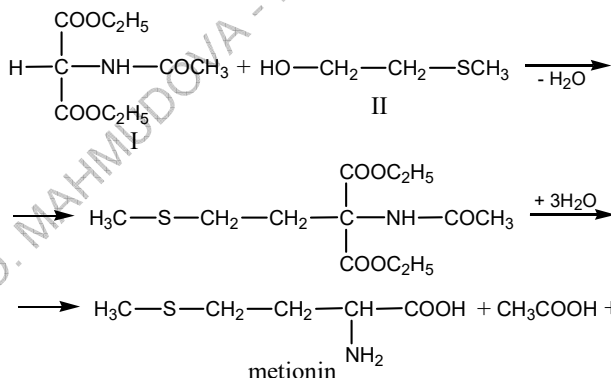
iştirakı ilə çökdürülməsinə əsaslanır (bu zaman L-Na qlutamat çökür):



5.3.2. 2-Amino-4-metiltiobutan turşusu (metionin)



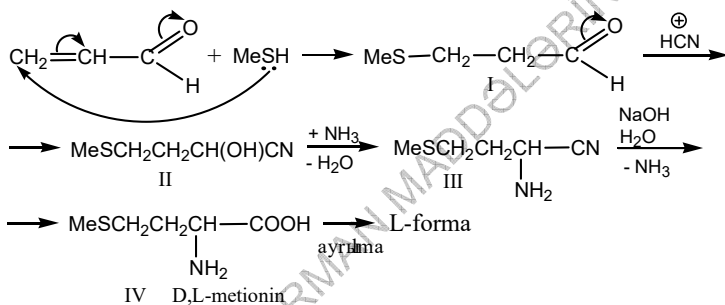
Zülalların hidrolizi nəticəsində alınır. Sintetik yolla asetilaminmalon turşusunun dietil efirinin (I) β-metiltioetanol (II) ilə kondensləşdirməklə sintez olunur:



Metionin (2-amino-4-metiltiobutan turşusu) tibbdə diabetin müalicəsi, qaraciyərin toksiki zədələnməsi hallarında profilaktika və

müalicə məqsədi ilə istifadə edilir.

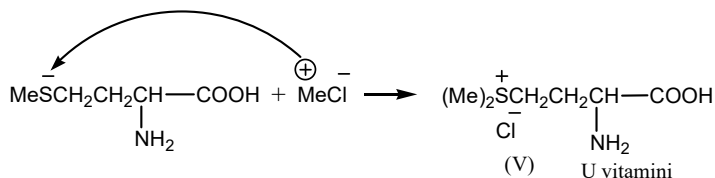
Metionin sintetik yolla akrolein və tiometanol əsasında alınır. Tiometanolun C=C rabitəsi vasitəsilə akroleinə birləşmə reaksiyası nəticəsində metiltiopropanal (I) alınır, sonuncu Ştrekker reaksiyası nəticəsində karbonil qrupunun siannitrilləşməsi nəticəsində sianhidrin (II) əmələ gətirir. Alınmış birləşməyə ammoniyakla təsir etdikdə OH- qrupu nukleofil əvəzlənmə reaksiyası nəticəsində amin qrupu ilə əvəz olunur. Alınmış heminal aminonitril (III) sonrakı mərhələdə qələvi mühitdə rasemik metioninə (IV) hidroliz olunur.



Aktiv L-forma fermentativ yolla və ya optiki aktiv birləşmələrlə kristalların ayrılması ilə alınır.

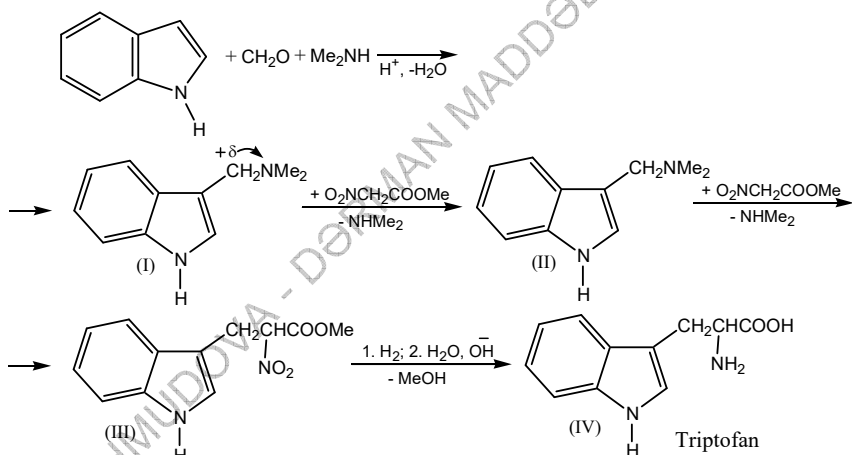
Təbii metilmetioninsulfoniumxlorid (V) U vitamini adlanır. U vitamini ilə kələm, pomidor, cəfəri daha zəngindir. U vitamini ilə mədə xəstəliklərinin müalicəsində məsləhət görülür. Bu vitamin bioloji proseslərdə metil qruplarının donoru rolunu oynayır.

• Sintetik yolla L-metioninin xlor metilləşdirməklə alınır.



Triptofan – heterotsiklik amin turşusu olub, müalicəvi qidalanma üçün istifadə edilir. Onun sintezinin birinci mərhələsində indol Mannix metodu ilə aminometilləşdirilir. Alınan 3-aminometilindol (I) sonrakı mərhələdə nitrosirkə turşusunun metil efiri ilə kondensləşdirilir. Reaksiyanın gedişində efirin metilen qrupundan proton ayrılır, alınmış karboanion indolda dimetilamin qrupunu asanlıqla sıxışdırıb çıxarır və nəticədə 3-indolilnitropropion turşusunun metil efiri alınır (II).

Daha sonra nitroqrupu amin qrupuna reduksiya etməklə, sonuncunun isə qələvi hidrolizindən triptofan və ya onun natrium duzu alınır (IV).



Metionin özünəməxsus iyli, ağ kristallik maddədir, «əvəzolunmaz» amin turşulardandır, orqanizmin fəaliyyəti üçün böyük əhəmiyyəti olan təkraramınlaşma prosesində iştirak edir. Metionin molekulunda olan metil qrupu çox fəaldır, bununla əlaqədar olaraq onun lipotrop, yəni qaraciyərdən piyin artığının uzaqlaşdırılması təsiri vardır, qaraciyərin toksiki zədələnməsi

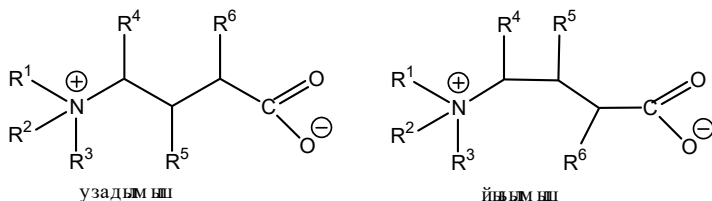
hallarında tətbiq edilir.

Metionin bir çox bioloji fəal maddələrin (adrenalin, kreatin və s.) sintezində iştirak edir.

5.3.3. γ -Aminyağ turşusu (QAYT)

γ -Aminyağ turşusu (QAYT) özü təbii maddə olub, 1950-ci ildə məməlilərin baş beyində aşkar olunub. İlk dəfə 1882-ci ildə sintez edilib. Müəyyən edilib ki, QAYT sinir impulslarının verilməsində tormozlayıcı rolunu oynayır. QAYT (aminolon, qammalon) sinir sistemi pozğunluqlarında, nitqin pozulması, yaddaşın zəifləməsi, beyin damarlarının ateroskleroza, uşaqlarda əqli inkişafın ləngiməsi hallarında istifadə olunur. O, nootrop təsir göstərərək, öyrənmək qabiliyyətini stimullaşdırır, əqli yaradıcılığı və yaddaşı yaxşılaşdırır. Son zamanlar məlum olmuşdur ki, QAYT təkcə sinir impulslarını tormozlamır, həmçinin beyində olan tormozlayıcı və oyadıcı neyronları qıcıqlandırır. QAYT neyronlarda qlutamatdan sintez olunur, sinaptik yarığa ifraz olunur və postsinaptik neyronun QAYT reseptoruna düşür (reseptorun aktiv olması üçün neyromediatorun 2-3 molekulu kifayətdir). QAYT kompleksi öz reseptorları ilə hüceyrə membranının protein fosfolipid kompleksində konformasiya dəyişikliyinə məcbur edir, nəticədə ölçüləri 3,7-6 Å olan məsələlər əmələ gətirir. Bu da xlor ionlarının keçməsinə kifayət edir ki, onlar da tormozlayıcı effekt yaradır. QAYT elastik svitter-ion molekulu olub, müxtəlif konformasiyalarda mövcud olur. Kvant-kimyəvi hesablamalarla, rentgenostruktur analiz vasitəsilə sintetik analoqların bioloji təsirini öyrənməklə məlum olmuşdur ki, tormozlayıcı effekt almaq üçün ən yaxşı vasitə QAYT-in uzadılmış konformasiyasıdır (bu zaman yüklənmiş N^+ və O^- arasındakı məsafə 5.4 ± 0.4 Å olur, yığılmış

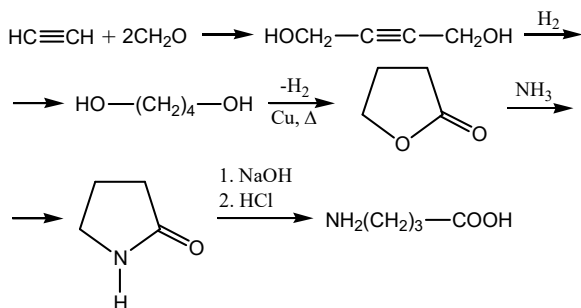
konformasiyada isə 4.2-4.2 Å):



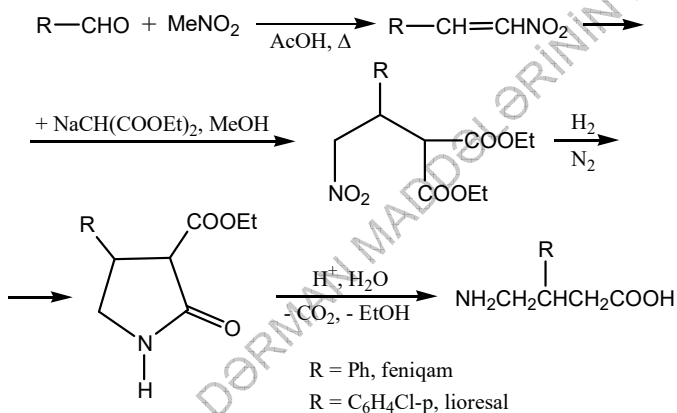
Hazırda QAYT və onun analoqlarının terapevtik effektə malik çox saylı törəmələri öyrənilmişdir. QAYT və onun analoqlarından dərman maddələri kimi istifadə etmək ideyası endogen birləşmələrə uyğun quruluşlu maddələrin axtarılması zamanı meydana gəldi. Bu da onların seçici mərkəzi təsirə və az toksiki olmasına şərait yaradır. Müxtəlif radikalların (R_1 - R_6) QAYT molekuluna daxil edilməsi alınmış birləşmələrin aktivliyinin kifayət qədər dəyişməsinə gətirib çıxarır. Xlor atomunun (Cl^-) və ya hidroksil qrupunun (OH^-) qrupunun ($R^6 = Cl, OH$) QAYT molekulunda C-2 vəziyyətində olması törəməyə sedativ və antikonvulsiv təsir verir. QAYT molekuluna aminqrup ($R^6 = NH_2$) daxil edildikdə isə bu təbii metabolitin aktivliyi azalır (bundan başqa o müəyyən qədər toksiklik əldə edir). QAYT molekuluna C-3 vəziyyətində hidroksil ($R^5 = OH$, həmçinin metabolit) qıcolma əleyhinə effektə malik olur. Bu preparat (hamibetal, buksamin) epilepsiya xəstəliyində istifadə olunur. QAYT-in $R^5 = Ph$ törəməsində sedativ təsir aşkar olunmuşdur (epilepsiya əleyhinə preparat funiqam), lakin $R^5 = C_6H_4Cl$ -p olduqda isə - antispazmatik dərman alınır (lioresal). Karboksil qrupunun eterifikasiyası motor aktivliyinin tormozlanmasını yaxşılaşdırır (QAYT efir şəklində hematoensafalik baryeri daha yaxşı keçir). Lakin bu zaman preparatın toksikliyi artır. Amin qrupunun metilləşdirilməsi (R^1 və $R^2 = Me$) və ya metil qrupunun

C-2 vəziyyətdə daxil edilməsi ($R^6 = \text{Me}$) QAYT-ın sinaptik təcrid etməsini azaldır. QAYT molekuluna γ -butirolaktam və C-2 vəziyyətdə fenil əvəzedicisi ($R^6 = \text{Ph}$) daxil etdikdə, QAYT-ın amid formasında bu effekt tamamilə itir. γ -vəziyyətdə QAYT molekuluna vinil qrupu daxil etdikdə epilepsiya əleyhinə təsir güclənir. Bu viqabatrın preparatı QAYT-transferaza fermentini tormozlayır. Epilepsiya əleyhinə dərman qrupuna qabapentin də daxil edilmişdir. Onun quruluşunda QAYT-ın β -karbon atomu tsikloheksan həlqəsinə daxil olur. Məlum olmuşdur ki, tsikloalkan fraqmenti preparatın hematoensefelik baryeri keçməsinə yaxşılaşdırır. Belə hesab olunur ki, qabapentin QAYT reseptorlarını stimullaşdırır. Ümumiyyətlə, belə hesab edirlər ki, dərman maddələrində QAYT-ın neyrotrop təsirini artırmaq üçün onun strukturunda amin və hidroksil qrupu olmalıdır. Bu da anion və kation yükləri (betain misalında) yaranması ilə əlaqələndirilir, bu da reseptorlarla qarşılıqlı təsir yaradır.

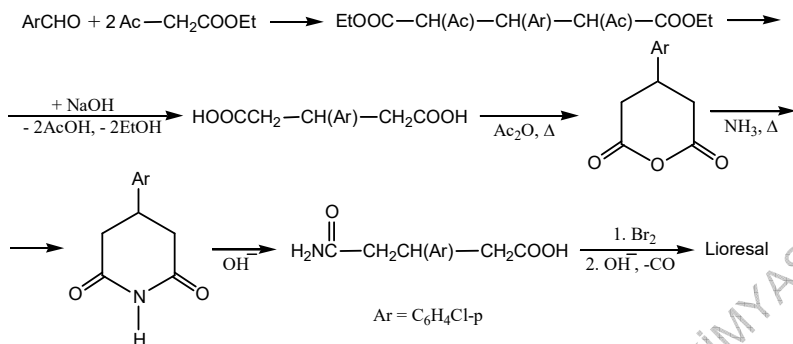
QAYT asetilen əsasında alınmış butirolaktamdan sintez edilir. Birinci mərhələdə asetilen formaldehidlə 1,4-butandiol qədər hidroksimetilləşdirilir, sonuncu mis (Cu) katalizatoru üzərində butirolaktama hidrogenləşdirilir. NH_3 -ün təzyiqi altında qızdırılmaqla α -pirrolidona çevirirlər. Sonda isə onu turşu və ya qələvi iştirakı ilə QAYT-a hidroliz edirlər:



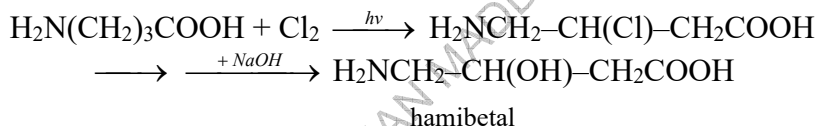
QAYT-ın 3-aril əvəzli törəmələri – feniqam və lioresal sənayedə aromatik aldehidlərin nitrometanla β-nitrostirola kondensləşməsindən alırlar. Bunun da dietilmalonatla birləşməsindən 2-karboetoksi-3-aril-4-nitrobutan turşusunun etilatı alınır. Bu nitrotörəmə sonradan Reney nikelinin iştirakı ilə hidrogenləşdirilməklə laktama qədər reduksiya olunur, sonra termiki dekarboksilləşdirməklə 20%-li HCl ilə hidroliz edilir, feniqam və ya lioresal alınır:



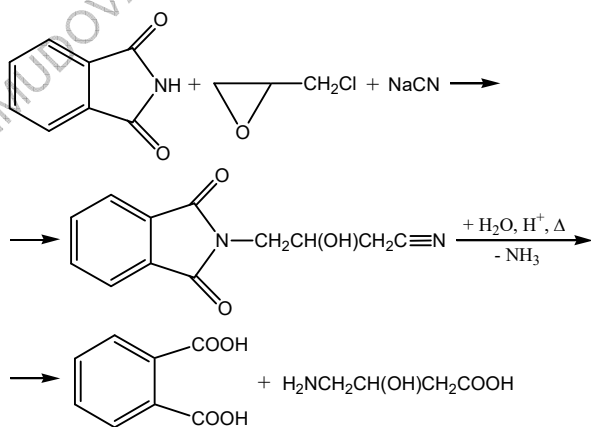
Lioresalın başqa sintez sxemi benzaldehidin asetosirkə efiri ilə kondensləşməsidir. Ardıcıl olaraq dikarbon turşusunun törəmələrini (qlutar), onun tsiklik anhidridini alırlar. İmidi qələvi ilə hidroliz edib 3-arilqlutar turşusunun monoamidinə çevirirlər, sonra ona qələvi iştirakı ilə bromla işləyib Hofman yenidənqruplaşmasına uğradırlar. Bu da aminturşunun (lioresal) əmələ gəlməsinə səbəb olur:



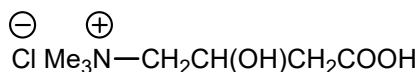
Hamibetalı QAYT-1 3-xlor törəməsinə fotokimyəvi xlorlaşdırmaqla sintez edirlər. Sonra qələvi təsiri ilə xlor atomunu hidroksil qrupu ilə nukleofil əvəz edirlər:



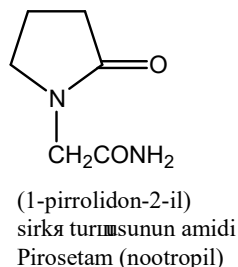
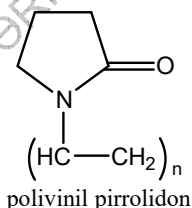
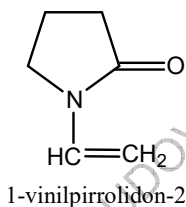
Hamibetalı xlormetil oksiranın NaCN və o-ftal turşusunun imidinin qarşılıqlı təsirindən də sintez etmək olur. Birinci mərhələdə 4-ftalamid-3-butironitrili asanlıqla hamibetala hidroliz edirlər:



Hamibetalın tam N-metilləşdirilməsindən 4-trimetilamin-3-hidroksibutan turşusunun xloridini alırlar (karnitin xloridi), bu da “boy vitamini” (B_T) adlandırılır:

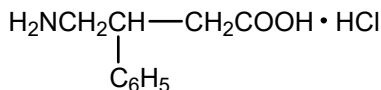


Ona bəzi bitkilərdə və heyvanların əzələ toxumalarında rast gəlinir. Vitamin B_T aktiv metabolit olub, zülalların biosintezini stimullaşdırır, anabolik təsir göstərərək zülal və yağ mübadiləsini yaxşılaşdırır, boyun və çəkinin artmasını təmin edir. Vitamin B_T pediatriyada, həmçinin böyüklərdə ürəyin işemik xəstəlikləri, sinir və fiziki gərginliklər zamanı, cərrahi əməliyyatlardan sonra və idman təbabətində geniş istifadə olunur. γ -Aminyağ turşusunun tsiklik forması olan laktamının törəmələri də xüsusi əhəmiyyət kəsb edir.

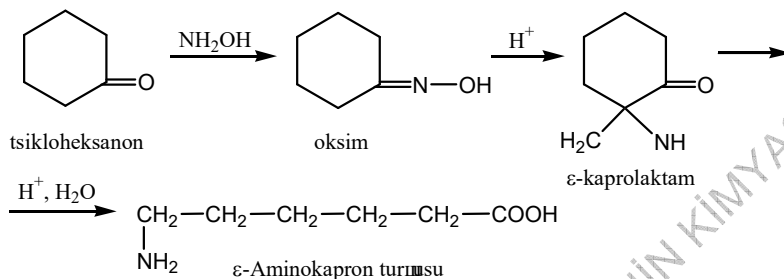


(1-Pirrolidon-2-il) sirkə turşusunun amidi ilk neyrotrop maddələrdəndir.

Fenibutin γ -amino- β -fenilyağ turşusunun hidroxloridi olub quruluşunun əsasını γ -aminyağ turşusu təşkil edir.



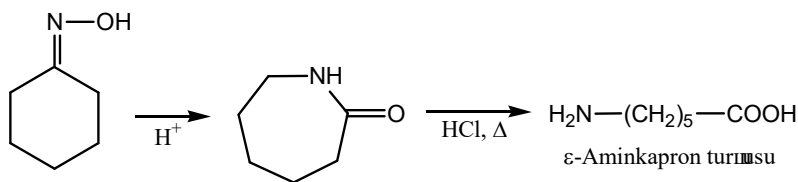
5.3.4. ϵ -Aminokapron turşusu tsikloheksanon əsasında alınır.



ϵ -Aminokapron turşusu müxtəlif səbəbdən olan qanaxmaların qarşısını almaq üçün tətbiq edilir.

5.3.5. ϵ -Aminheksan turşusu

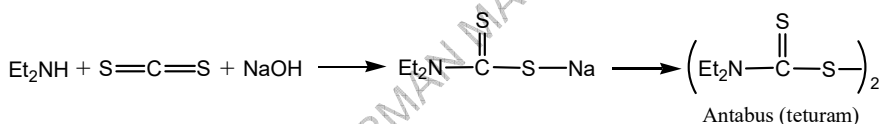
ϵ -Aminheksan turşusu (ϵ -aminkapron) tibbdə güclü qanaxmaların dayandırılmasında istifadə olunur, o qanın effektiv ləxəllənməsini təmin edir. Onun bəzi tsiklik analogları (məsələn, 4-aminometiltsikloheksan karbon turşusu) həmçinin qanın ləxəllənməsini sürətləndirir. ϵ -Aminkapron turşusunu tsikloheksan oxim mərhələsindən keçməklə sintez edirlər, bu da Bekman yenidən qruplaşmasına uğradılaraq kaprolaktama keçir, sonuncu isə HCl iştirakı ilə aminokapron turşuya hidroliz edilir:



Tibb təcrübəsində digər aminturşular və onların törəmələri də müalicəvi preparatlar kimi tətbiq edilir.

Histidin-hepatitlərdə, mədə və onikibarmaq bağırsağın yaralarında, sistein-göz xəstəliklərində, asetilsistein isə tənəffüs yollarının xəstəliklərində işlənir.

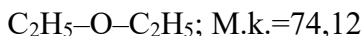
Aminturşular bölməsinin sonunda aminturşuların törəmələri olan dərman maddələrinə strukturunu ditiokarbamin turşusu təşkil edən – tetrametil tiuramdisulfidi (teturam, antabus) misal göstərmək olar. Onu alkoqol əleyhinə vasitə kimi istifadə edirlər. Antabusu NaOH iştirakilə dietilaminin karbondisulfidlə kondensləşməsi əsasında sintez edirlər. Birinci mərhələdə N,N-dietilditiokarbamin turşusunun natrium duzu alınır, sonra onu oksigenin, hidrogen peroksidin və ya xlorun təsiri ilə dimerləşdirirlər:



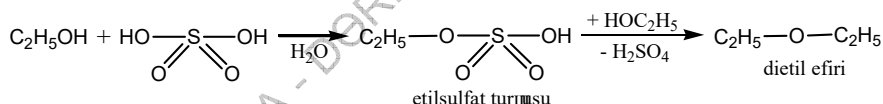
6. SADƏ VƏ MÜRƏKKƏB EFİRLƏR

Sadə efirlər $R-O-R$ ümumi formuluna malik üzvi birləşmələrdir. Aşağımolekullu alifatik efirlər – xarakterik iyli uçucu birləşmələrdir. Onların sıxlıqları və qaynama temperaturları eyni sayda karbon atomu saxlayan spirtlərdən aşağıdır. Tibbi praktikada dietil efirinin iki preparatından istifadə edilir: tibbi efir və narkoz üçün efir.

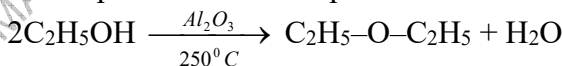
6.1. Tibbi efir - dietil efiri, narkoz üçün efir



Dietil efirini sənayedə almaq üçün, etil spirtinə $130-140^{\circ}C$ -də sulfat turşusu ilə təsir edirlər və əmələ gəlmiş efiri qovaraq, qarışıqdan ayırırlar:



Sənayedə tətbiq olunan üsullardan biri də etil spirtinin xüsusi şəraitdə dehidratlaşmasıdır. Katalizator olaraq alüminium-oksidi götürülür və proses $250^{\circ}C$ -də aparılır:

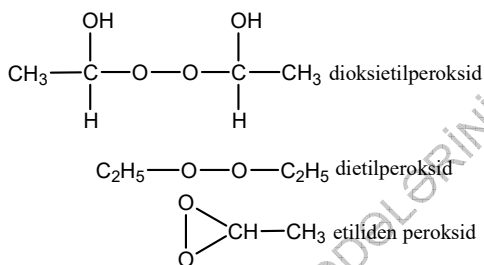


Hər iki üsulla alınmış efir sonradan təmizlənir, bunun üçün o əvvəlcə qovulur, sonra isə turşu qalığı su və spirtədən təmizlənir, belə təmizlənmiş efir əsasən narkoz üçün efir alınır.

Narkoz üçün efir yüksək dərəcədə təmiz olmalıdır. Odur ki, təmizlənmiş efir əlavə olaraq natrium hidrosulfat və kalium-

permanqanatla işlənilərək müxtəlif peroksid və aldehid qarışıqlarından təmizlənir, qovulur və 34-35⁰C temperaturda qovulan hissəsini toplayıb, narıncı rəngli xüsusi qablarda saxlayırlar.

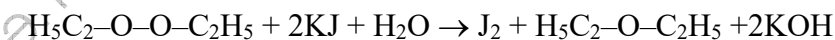
Etil efiri uzun müddət saxlanıldıqda oksidləşərək aşağıdakı peroksidləri əmlə gətirir:



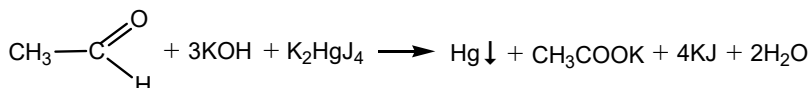
Distillədən əvvəl efiri oksidləşmə məhsullarından təmizləmək lazımdır. Bunun üçün əvvəlcə efir dəmir-2-sulfat məhlulu ilə, sonra isə su ilə yuyulmalı, susuz kalsium-xloridin köməyi ilə qurudulmalıdır.

Tibbi efir həlledici kimi ekstraktların hazırlanmasında istifadə olunur. Narkoz üçün efir çox nadir hallarda tətbiq edilir, bu məqsədlə əsasən daha az toksiki birləşmələrdən (azot oksidi, tsiklopropan, florotan və s.) istifadə edilir.

Efirdə peroksidlərin varlığı aşağıdakı reaksiya ilə müəyyən edilir:

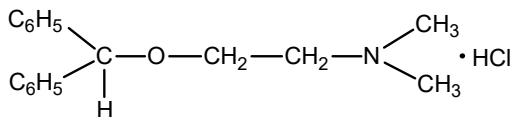


Aldehid qrupunun varlığı Nessler reaksiyası ilə təyin edilir.

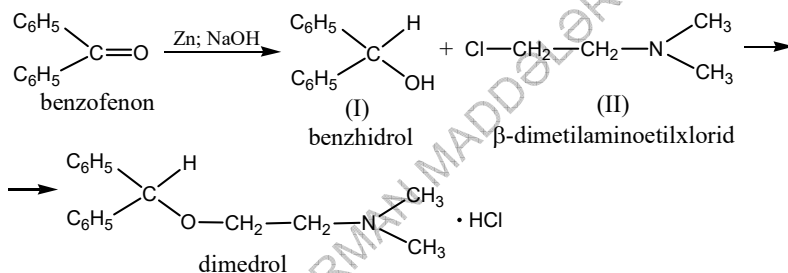


6.2. Sadə arilalifatik efirlər

Dimedrol



Kimyəvi təbiətinə görə benzhidrolun β-dimetilaminitil efirinin hidroxloridi olub, benzhidrol (I) və β-dimetilaminoetil-xloridhidroxlorid (II) əsasında sintez olunur:

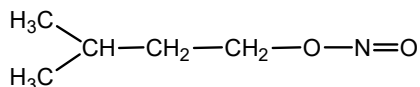


Dimedrol ağ narın tozdur, acı dadlıdır, dili keyləşdirir, hiqroskopikdir. Suda, spirtə, xloroformda asan, efirdə, benzolda çətin həll olur.

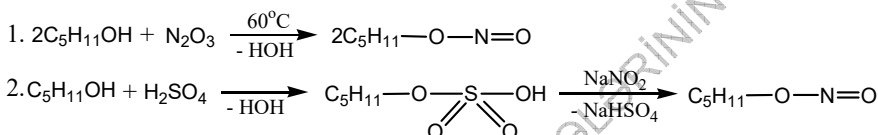
Dimedrol antihistamin maddə kimi allergiyaya qarşı, həmçinin zəif yuxugətirici kimi tətbiq olunur.

6.3 Nitrit turşusunun mürəkkəb efiri

Amilnitrit



İzoamil spirtinin ($\text{C}_5\text{H}_{11}\text{OH}$) nitrit turşusu ilə əmələ gətirdiyi mürəkkəb efirdir. Aşağıdakı reaksiyalara əsaslanan üsullarla alınır, sonra CaCl_2 -lə qurudulur və qovulmaqla təmizlənir:

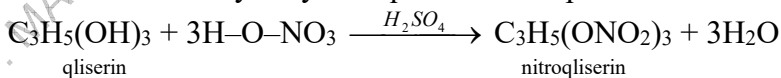


Amilnitrit şəffaf, sarımtıl, meyvə iyli mayedir, uçucudur və asan alovlanır. Suda çox az həll olur, bütün nisbətlərdə spirt, efir, xloroform və benzolda həll olur. Spazmolitik, ürəyin tac damarlarını genişləndirici təsirə malikdir. Təngənəfəslik tutmalarında işlədilir.

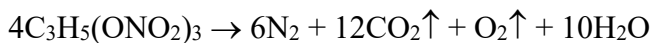
6.4 Nitrat turşusunun mürəkkəb efirləri

Nitroqliserin – $\text{C}_3\text{H}_5(\text{ONO}_2)_3$

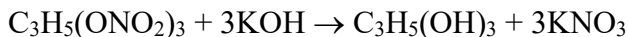
Susuz qliserinə qatı HNO_3 və H_2SO_4 -ın qarışığı ilə təsir etməklə alınır. Reaksiya soyutmaqla -15°C -də aparılır.



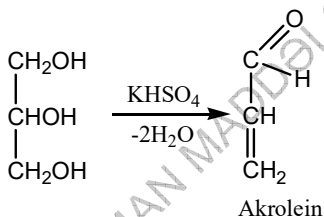
Nitroqliserin ağır yağabənzər mayedir ($p=1,6$), $8-10^\circ\text{C}$ -də donur, şirin dadlıdır, çox zəhərlidir, olduqca partlayıcıdır. Kiçik bir zərbə, istilik və çalxalanma nitroqliserin molekulunun böyük istilik xaric olmaqla parçalanmasına səbəb olur:



Odur ki, dağılmış nitroqliserinin üzərinə qələvi əlavə edilir, sabunlaşma reaksiyası gedir:



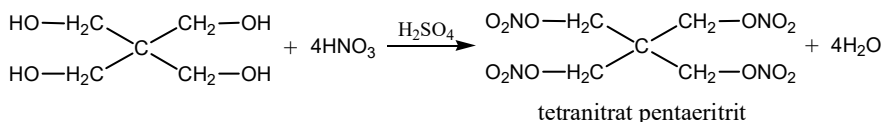
Preparatın spirt hissəsinin təyini natrium hidroksid məhlulu ilə sabunlaşmasından alınan qliserinin KHSO_4 -la reaksiyasına əsaslanır. Bu zaman xarakterik iyə malik akrolein alınır:



Nitroqliserin və onun məhlulları ilə təmasda olduqda ehtiyatlı olmaq lazımdır. Belə ki, az miqdarda belə selikli qışaya və dəriyə toxunduqda güclü baş ağrıları verir.

Nitroqliserin spazmolitik, damargenişləndirici təsirə malikdir. Preparat 1%-li spirt məhlulu kimi və ya 0,0005 qramlıq həb şəklində istifadə edilir.

Erinit – nitroqliserinə analoji olaraq pentaeritritə qatı sulfat və nitrat turşularının qarışığı ilə təsir etməklə alınır:

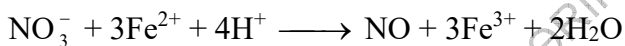
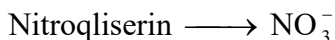


Erinit – kristallik maddədir, spirtdə və digər üzvi

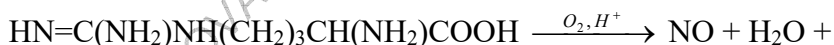
həllədicilərdə yaxşı, suda praktik olaraq həll olmur. Erinit də partlayıcı maddədir.

Farmakoloji təsiri nitroqliserinə analojidir. Hər iki preparat daxilə qəbul olunur, tədricən sorulur və uzun müddət təsir göstərir.

Müasir tədqiqatlar nəticəsində məlum olmuşdur ki, nitroefirlər dərman törədicilərdir. Onlar orqanizmdə asanlıqla nitrat anionuna çevrilir, sonuncu da, sonradan qanın hemoqlobini və dəmirtərkibli fermentləri ilə azot monooksidə reduksiya olunur.



Axırıncı maddə (NO) müalicəvi təsir göstərir. Damarların sayə əzələlərini zəiflədir, qan təzyiqini aşağı salır və ürəyin işemik ağrılarını azaldır. Axırıncı 10 il ərzində belə təsəvvürlər yarandı ki, NO hüceyrələr arasındakı qarşılıqlı təsirin siqnal funksiyalı endogen molekuludur. Bu siqnal molekulu orqanizmdə endogen yolla arginindən NO-sintetaza fermentinin təsiri ilə yaranır.



Arginin

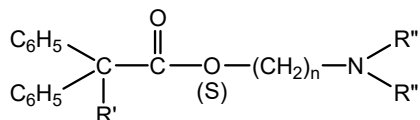


Sitrullin

Azot monooksid orqanizmdə neyromediator rolu oynayır. İmmun reaksiyaları gücləndirir və uzun müddətli yaddaş sisteminə iştirak edir. Bu kəşfə görə alimlər tibb sahəsində 1998-ci ildə Nobel mükafatı ilə təltif edilmişlər. Hal-hazırda NO-ə regenerasiya edə bilən yeni dərman maddələrinin sintezi və axtarışı üçün intensiv işlər görülür.

6.5 Arilalifatik turşuların mürəkkəb efirləri

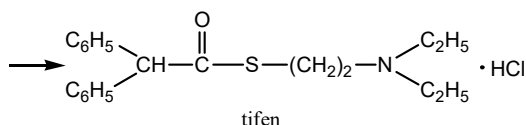
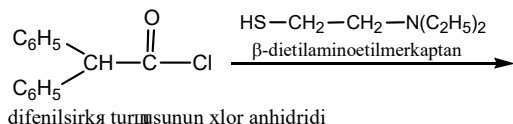
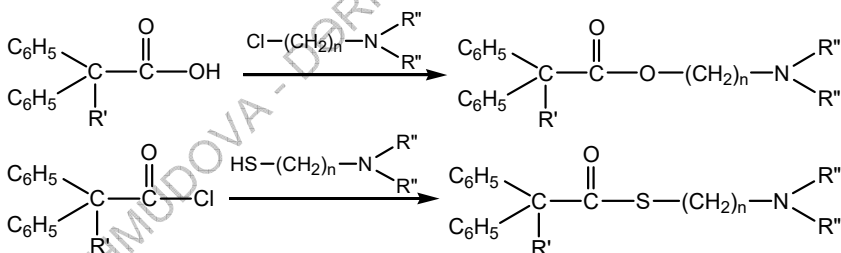
Tibbdə tətbiq edilən diarilalifatik turşular və dialkilaminoalkanollar əsasında sintez edilən mürəkkəb efirlərin ümumi formulu:



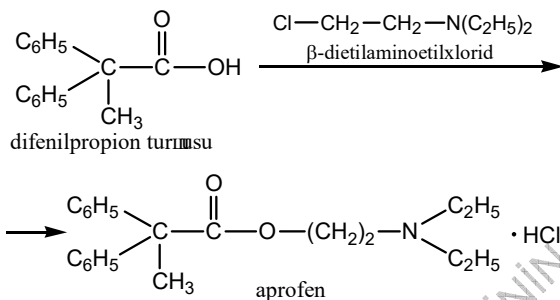
$\text{R}' = -\text{H}; -\text{CH}_3; -\text{OH};$

$\text{R}'' = -\text{CH}_3; -\text{C}_2\text{H}_5; -\text{C}_3\text{H}_7$

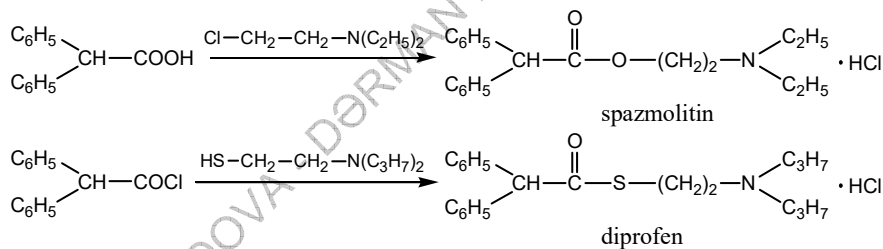
Bu dərman maddələri difenilsirkə, difenilpropion, difeniltiosirkə turşularının törəmələri olub, müvafiq turşuların dialkilaminolalkil xloridlər ilə və ya bu turşuların xloranhidridlərinin dialkilaminoalkilmerkaptanlarla qarşılıqlı təsiri nəticəsində sintez edilir:



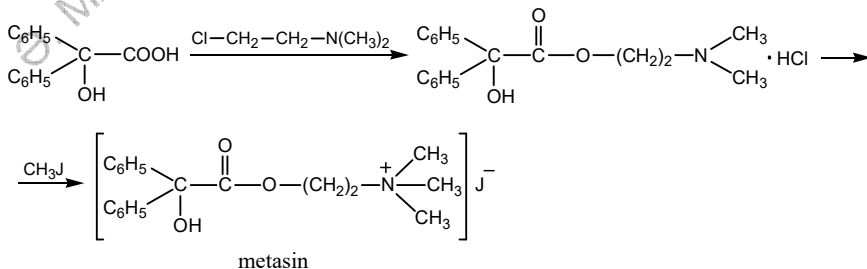
Bu qrupa daxil olan dərman maddələrinin sırasına aprofen, spazmolitin, tifen, diprofen və metasin aid edilir.



Analoji olaraq difenilsirkə turşusu və β-dietilaminoetilxloridin qarşılıqlı təsirindən spazmolitin, difenilsirkə turşusunun xloranhidridi ilə β-di-n-propilaminoetilmerkaptan əsasında diprofen sintez edilir:



Metasin difenilhidroksisirkə turşusunun və β-dimetilaminoetilxloridlə qarşılıqlı təsirindən alınır:



Aprofen, tifen, spazmolitin ağ kristallik maddələrdir, diprofen və metasin sarımtıl rəngə çalır. Tərkibində kükürd atomu saxlayan preparatlar xarakterik iyə malikdirlər.

Aprofen, tifen, spazmolitin və diprofen hidroxlorid, metasin isə yodmetilat şəkində tətbiq edilir. Xolinolitik, spazmolitik və damar genişləndirici təsirə malikdirlər.

Ə. MAHMUDOVA - DƏRMAN MADDƏLƏRİNİN KİMYASI

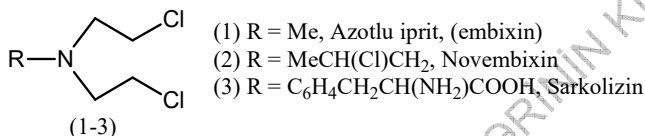
7. DİXLORDİETİLAMİN FARMAKOFOR QRUPLU XƏRÇƏNG ƏLEYHİNƏ DƏRMAN MADDƏLƏRİ

Hal-hazırda xərçəng xəstəliyi ölüm dərəcəsinə görə ürək-damar xəstəliklərindən sonra ikinci yeri tutur. Kansorogenezin əsasında qeyri-səmərəli qidalanmaq, siqaret çəkmək və əlverişsiz ekoloji faktorlar durur. Xərçəng hüceyrələrinin əmələ gəlməsinin səbəbləri kansorogen maddələr (benzol, pirenlər, aromatik aminlər), bəzi viruslar və radiasiya ola bilər. Xərçəng xəstəliklərinin müəyyən hissəsi (3%) genetik faktorlarla əlaqədardır. Normal molekulaların DNT-də protoonkogen və antionkogen saxlayan hissələr var, hansıların ki, aktivliyindən xərçəng hüceyrələrinin əmələ gəlməsi asılıdır. Belə hüceyrələrin yaranması zamanı həmin hissələrin əmələ gəlmə yerində bədxassəli şişlər əmələ gəlir. Bundan başqa, xərçəng hüceyrələri eyni toxumadan qoparaq və qan və ya limfa ilə daşınaraq orqanizmin başqa yerində şişlərin böyümə mərkəzini əmələ gətirir (metastaz hadisəsi). Xərçəng hüceyrəsi bütöv orqanizmdən sərbəst olması (ona tabe olmaması) və həyat dövrlərinin sonsuz artması ilə xarakterizə olunur. Normal hüceyrə orqanizmin nəzarəti altında olur və müəyyən dövrlərdən sonra apoptoza – proqramlaşdırılmış məhv olmaya məruz qalır. Bundan başqa xərçəng hüceyrələrinin bölünmə sürəti normal hüceyrələrin bölünmə sürətindən artıqdır.

Xərçəngin kimyaterapiyası böyük əhəmiyyətə malikdir, bədxassəli şişlərin böyüməsinin və yayılmasının qarşısını almaq üçün təyin edilir. Xərçəng əleyhinə dərman maddələrinin müasir beynəlxalq bazarında 40-dan artıq preparat var.

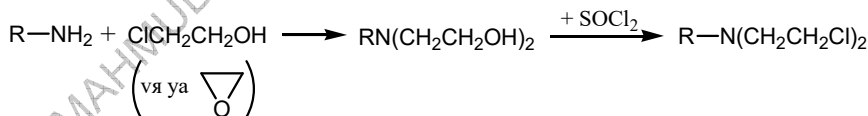
7.1 2,2'-Dixlordietilaminlərin törəmələri

Xərçəngin ilkin dövrlərdə müalicəsi alkilləşdirici agentlərə (sitostatiklər) əsaslanırdı. Bu maddələrə alifatik, aromatik və ya heteroaromatik əsası ilə birləşmiş 2,2'-dixlordietilamin fraqmentini farmokofor qrup kimi özündə saxlayan azotlu iprit (1) və ona analogi olan maddələr (2), (3) aiddir.

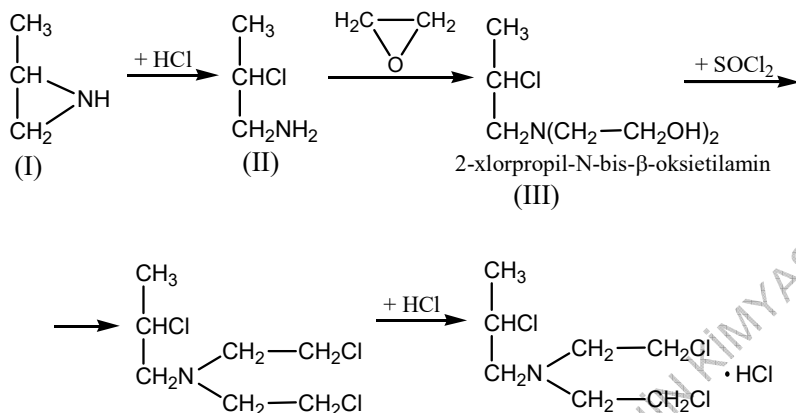


Güman edilir ki, bu agentlər şiş hüceyrələrinin DNT-nin imidazol hissəsinin qüanin əsasını alkilləşdirir. Nəticədə saxarofosfatların qopmasına səbəb olur və hüceyrələrin bölünməsinin qarşısını alır.

Bis-(2-xloretil) aminlərinin alınması birli aminlərin xlorethanol və ya oksiranla alkilləşdirilməsindən alınan dietanolaminə tionilxloridin təsiri ilə onun OH-qruplarının xlor atomları ilə nukleofil əvəzlənməsi ilə nəticələnir.



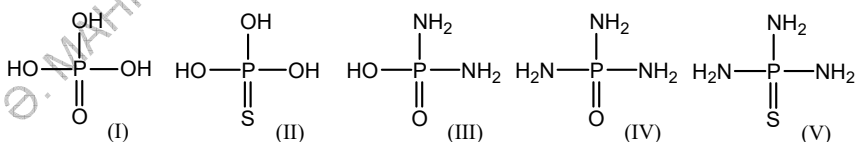
Novembixini almaq üçün propileniminə (I) HCl ilə təsir edirlər, bu zaman 2-xlorpropilamin (II) əmələ gəlir, sonra etilenoksidin təsirindən isə 2-xlorpropil-N, N-bis-β-oksietilamin alınır (III). Bu maddəni tionil-xloridlə işləməklə novembixin alınır.



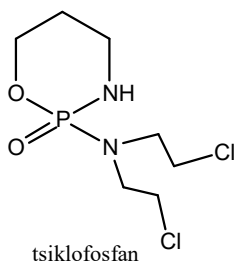
Novembixin ağ tozudur, suda və spirtdə həll olur, efirdə isə həll olmur. Preparat şişlərə qarşı sitostatik maddə kimi işlədilir. Şiş və limfoid liflərinin hüceyrələrinin nüvələri bis-(β-xloretil)-amin törəmələri çox həssasdır. Bu birləşmə şiş hüceyrələrinin parçalanması, artması prosesini tormozlayır.

7.2 Fosfat turşusu amidlərinin törəmələri

Bu qrupa aid olan preparatlar fosfat (I) və tiofosfat (II) turşuları di- və triamidlərinin (III-V) törəmələri olub, bədxassəli şişlərlə əlaqədar xəstəliklərdə tətbiq olunur:

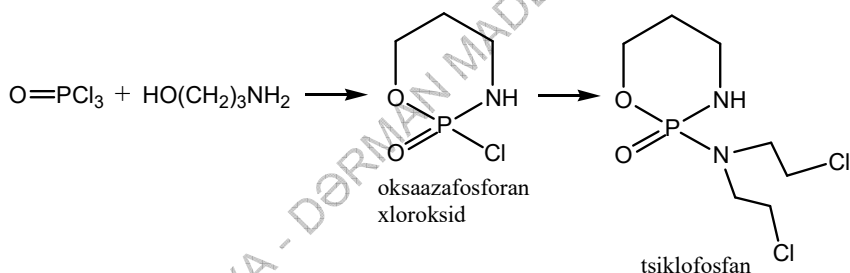


Tsiklofosfan:



Bu sinfə aid olan ən geniş yayılmış dərman maddəsi tsiklofosfandır. Ancaq şişlərin daha geniş sahəsində analoji aktivliyə malik olan daha təzə preparat tiofosfamiddir.

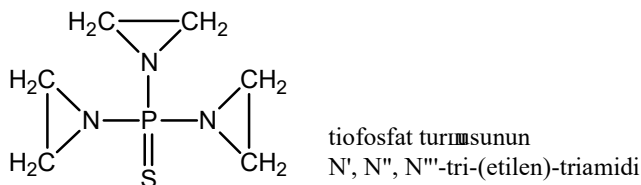
Tsiklofosfan fosfor oksixloridin (POCl_3) propanolamin ilə kondensləşməsindən alınır:



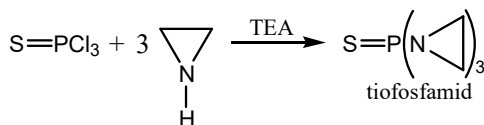
Tsiklofosfan iysiz, kristallik tozdu, suda, spirtə asan həll olur, efirdə, asetonə həll olur.

Preparat yumurtalıqların, süd vəzilərinin, ağciyər və digər üzvlərin xərçəngində daxilə qəbul olunur.

Tiofosfamid:



Tiofosfamid tiofosfat turşusunun xloranhidridindən (I) və etilenimindən (II) alınır:



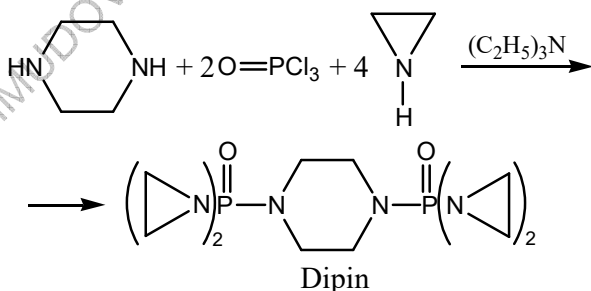
Preparat ağ kristallik tozdur, suda, spirtdə və digər üzvi həlledicilərdə asan həll olur.

Preparatın məhlulları şışlərin inkişafının tormozlayıcısı kimi tətbiq olunur.

Tiofosfamid yumurtalıqların süd vəzilərinin xərçənginin müalicəsində istifadə edilir.

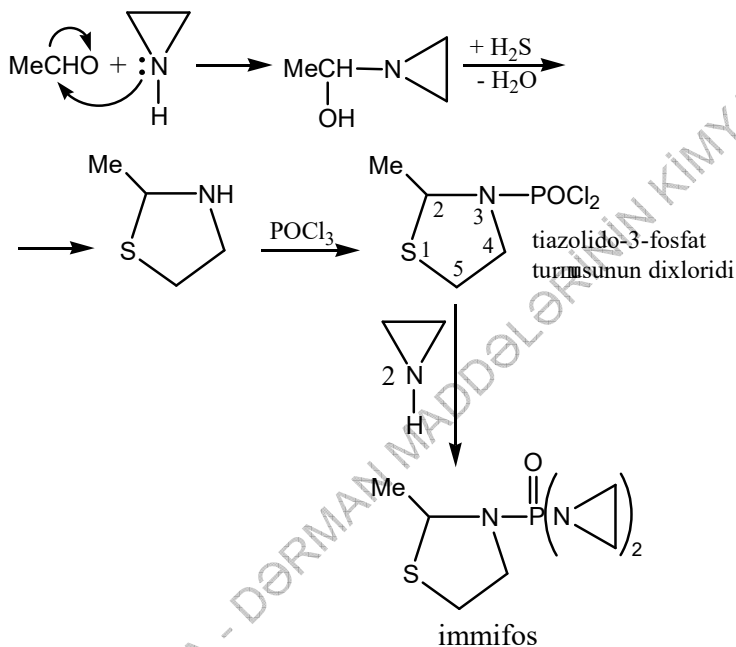
Aziridin və fosfat turşusunun törəmələri əsasında müxtəlif formalı xərçəng hallarında tətbiq edilən bir sıra dərman maddələri sintez edilmişdir. Məsələn, dipin limfaleykoz və qırtlağın xərçəngində tətbiq edilir.

Preparat aziridinə tiofosfat turşusunun trixloranhidridi ilə trietilamin mühitində təsir etməklə alınır.

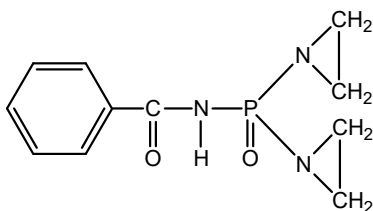


İmmifos analogi olaraq POCl_3 tiazolidinlə dixloramidə qədər monoamidləşdirilib, aziridinlə işləməklə alınır. Tiazolidin sintezi

aziridini etanolla elektrofili alkilləşdirərək hidroksietil aziridin, sonuncu isə hidrogen sulfidlə işlənir və suyun ayrılması və beşüzvlü tsiklik birləşmə əmələ gətirir.

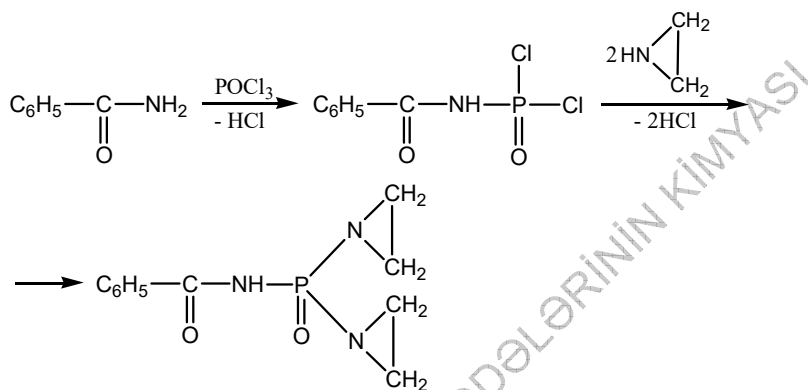


Benzotef. Fosfat turşusunun N-benzoil-N',N''-di(etilen)-triamidi.



Preparatın sintezi aşağıdakı sxem üzrə gedir: benzoamidə (I)

fosfor-3-xloridlə təsir edərək fosfat turşusu dixloranhidridinin benzoilamidi (II) alınır, sonuncunun etileniminlə qarşılıqlı təsirindən benzotef alınır.

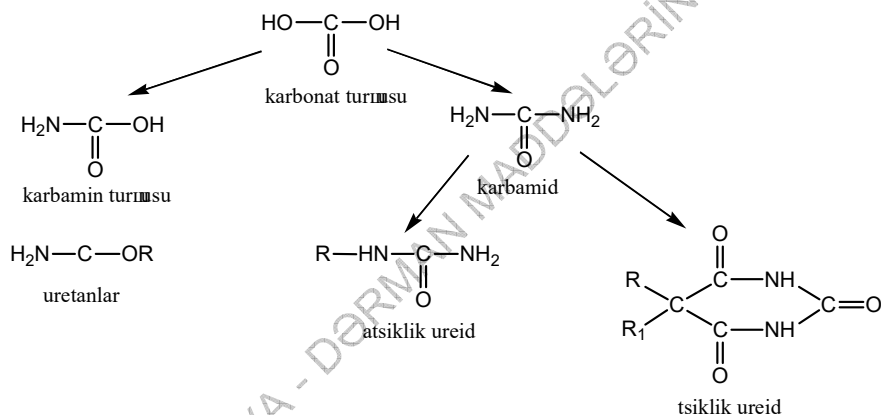


Benzotef farmakoloji təsirinə görə tiofosfamidə analogidir.

Tibbi təcrübədə benzotefə oxşar təsirli preparatlar flüorobenzotef və diyodbenzotef də tətbiq olunur.

8. KARBONAT TURŞUSUNUN AMİDLƏRİNİN TÖRƏMƏLƏRİ

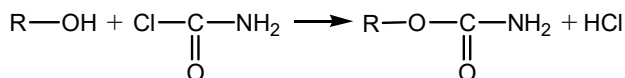
Karbonat turşusu iki tip amid əmələ gətirir: karbamin turşusu (natamam amid) və karbamid və ya sidik cövhəri (tam amid). Karbamin turşusunun mürəkkəb efirləri uretanlar adlanır. Karbamid turşularla iki tip birləşmələr əmələ gətirir: atsiklik ureidlər və tsiklik ureidlər (barbitur turşusunun törəmələri). Bu birləşmələrin kimyəvi strukturu aşağıdakı kimi göstərilə bilər:



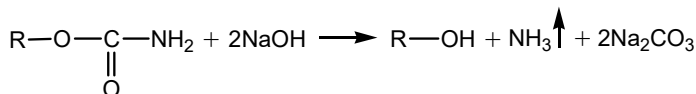
Karbonat turşusunun amidlərinin törəmələri sakitləşdirici və yuxugətirici xassəyə malikdirlər.

8.1. Uretanların törəmələri olan dərman maddələri

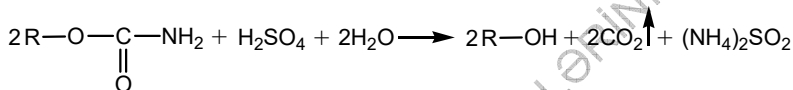
Uretanların ümumi alınma üsulu - spirtlərin karbamoilxloridlərlə qarşılıqlı təsir reaksiyasıdır:



Yeyici qələvilərin təsiri ilə uretanlar, spirtə, ammonyaka və karbonata parçalanırlar:

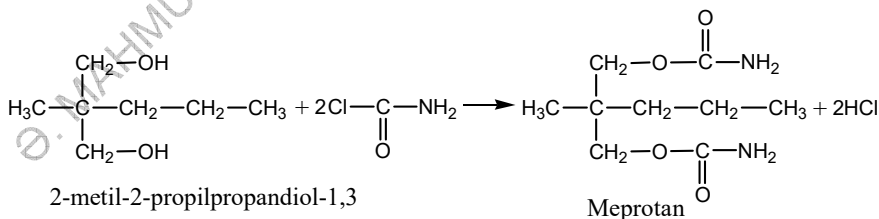
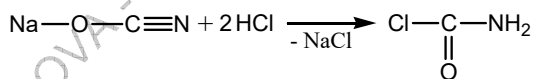


Uretanları duru turşularla qızdırdıqda spirt, ammonium duzu və karbon-4-oksüd əmələ gəlir:



Bu reaksiyalardan uretanların təyində istifadə olunur.

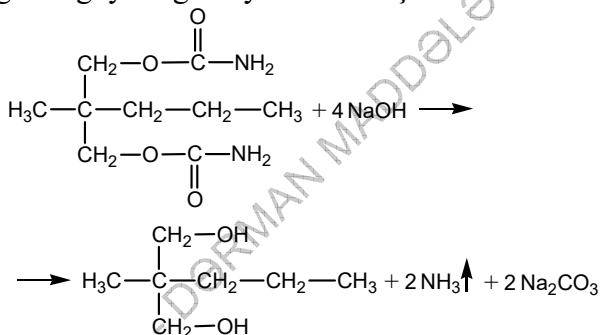
Tibbdə tərkibində diuretan saxlayan meprotran preparatından istifadə olunur. Meprotranı almaq üçün əvvəlcə 2-metil-2-propilpropandiol-1,3 sintez edilir. Sonra onun xloroformda məhlulu natrium sianatla qarışdırılır və qarışıq HCl ilə işlənir.



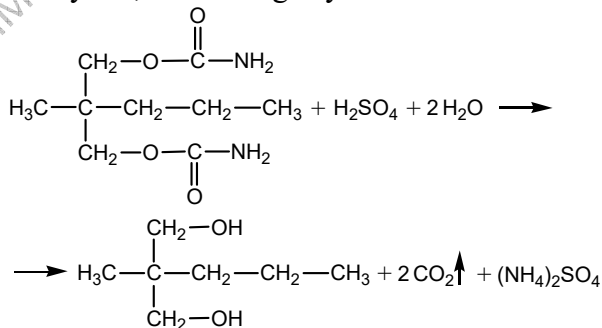
Meprotran-suda və efrdə az, spirtə və asetonda asan həll olan maddədir.

Preparat	Kimyəvi quruluşu	Xassələri
Meprotran	$ \begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}-\text{C}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_2-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \end{array} $ 2-metil-2-propilpropandiol-1,3-ün dikarbamin efiri	Ağ, kristallik tozdur, iysizdir, qaynama temperaturu 103-107°C-dir

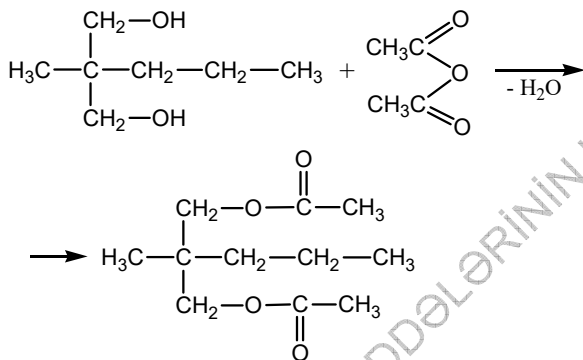
Bu preparatı təyin etmək üçün uretanların ümumi təyini reaksiyalarından istifadə olunur, meprotranı natrium hidroksidlə qaynatdıqda ammoniyak ayrılır. O, xarakterik iyi və ya qırmızı lakmus kağızını göy rəngə boyaması ilə aşkar olunur.



Preparatın duru sulfat turşusu ilə qarışığını qızdırdıqda karbondioksit ayrılır, o da əhəng suyunu bulandırır.



Molekulun spirt hissəsinin təyini üçün preparatın turş mühitdə (sirkə anhidridinin iştirakı ilə) hidrolizi təcrübəsindən istifadə olunur, nəticədə 2-metil-2-propilpropandiol-1,3-diasetat efiri əmələ gəlir.



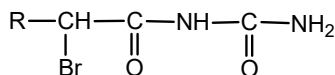
Alınmış efirdən ibarət çöküntü su ilə yuyulur, süzülür, qurudulur. Ərimə temperaturu 123-125⁰C-dir.

Meprotanın miqdarı təyini Keldal metodu ilə aparılır. Bu da molekulda azotun miqdarı təyininə əsaslanır. Preparatı hidrolizin baş verməməsi üçün yaxşı bağlanmış qabda saxlayırlar. Meprotandan əsəb xəstəliklərinin müalicəsində sakitləşdirici vasitə kimi istifadə olunur.

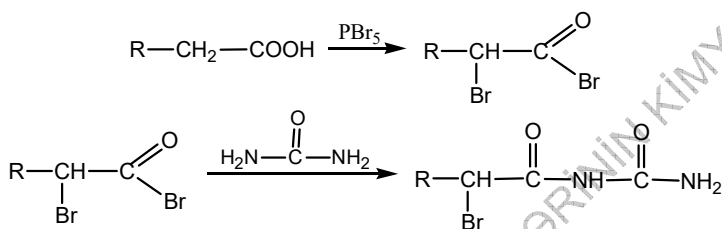
8.2. Atsiklik ureidlərin dərman təsirli törəmələri

Tibbi praktikada atsiklik ureidlərin α-bromtörəmələrindən istifadə edilir.

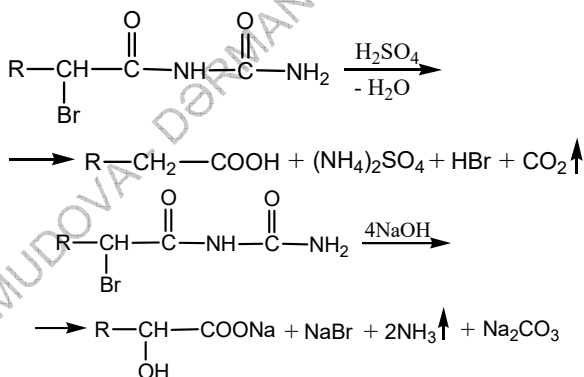
Ümumi formulu aşağıdakı kimidir:



Bu birləşmələrin sintezi ilkin olaraq alifatik turşuların α -brom törəmələrinin bromanhidridlərinin alınmasına əsaslanır. Bunun üçün N.D.Zelinski tərəfindən işlənmiş alifatik turşuların fosfor-5-bromidlə bromlaşdırılması üsulundan istifadə olunur. Sonra alınmış məhsul karbamidlə işlənir:



Brom preparatlarının tapılması və miqdarı təyini turşu və ya qələvinin qarşılıqlı təsiri ilə bromun ion halına keçməsi ilə bağlıdır:

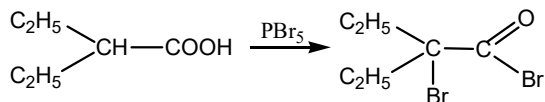


Brom ionları sərbəst bromla oksidləşdirilməklə təyin edilir, miqdarı isə argentometrik metodla təyin edilir.

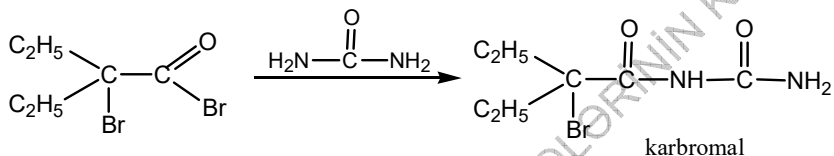
Dərman maddəsi kimi atsiklik ureidlərin törəmələrindən karbromal və bromizoval məlumdur.

Karbromalın sintezində Zelinski metodu ilə alınan reaksiya

məhsulundan istifadə edilir. Bunun üçün dietil sirkə turşusuna fosfor (V) - bromidlə təsir edilir.

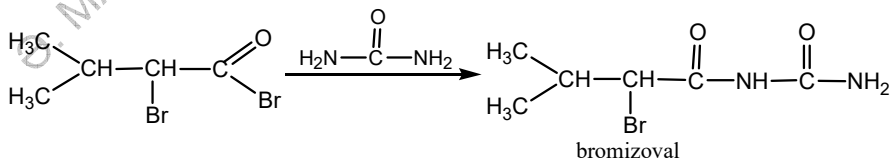
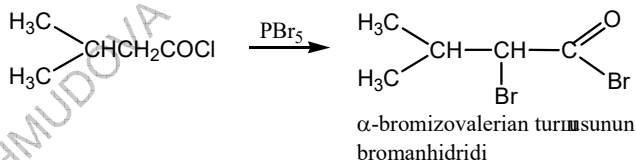


Daha sonra karbamidlə işlənir:



Karbromal və bromizovalın xassələri, tibbdə tətbiqi və alınması analogidir. Lakin 1982-ci ildən karbromal dərman maddəsi kimi ləğv edilmişdir.

Bromizoval analogi olaraq izovalerian turşusunun xloranhidridindən alınır:

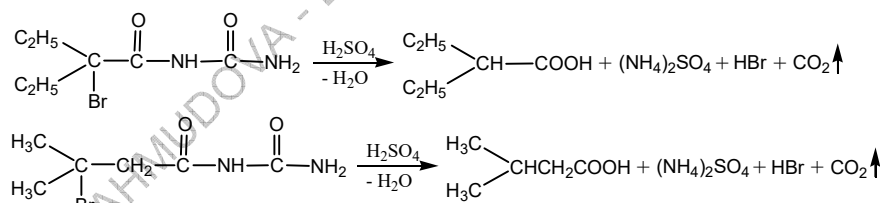


Preparatın adlandırılması və kimyəvi quruluşu	Xassəsi	Həll olması
Bromizoval $\begin{array}{c} \text{H}_3\text{C} \\ \diagup \\ \text{CH} \\ \diagdown \\ \text{H}_3\text{C} \end{array} - \underset{\text{Br}}{\text{CH}} - \text{C}(=\text{O}) - \text{NH} - \text{C}(=\text{O}) - \text{NH}_2$ N-(α-bromizovalerianil)-karbamid	Zəif iyə malik, acı dadlı ağ kristallik tozdur. Ərimə temperaturu 145-150 ⁰ C-dir.	Spirtdə və suda çox az həll olur.

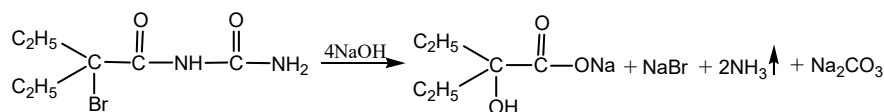
Karbmomal və bromizoval həm kimyəvi quruluşuna görə oxşardır, həm də fiziki xassələri praktiki olaraq oxşardır. Onlar çox zəif iyə malik olan ağ kristallik maddələrdir, suda və spirtə çox az həll olurlar. Onları bir-birindən yalnız ərimə temperaturlarına görə ayırmaq olar.

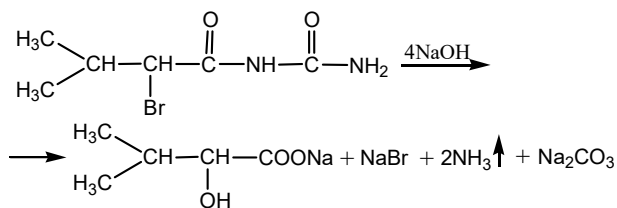
Preparatları sulfat turşusu və ya qatı qələvi məhlulunun qarşılıqlı təsiri ilə təyin edirlər.

Preparatları sulfat turşusunun təsiri ilə qızdırdıqda müvafiq olaraq kəskin iyə malik olan dietilsirkə turşusu və izovalerian turşusu alınır:

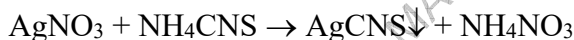
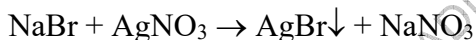


Qatı natrium-hidroksidlə təsir etdikdə ammoniyak ayrılır ki, bunu da iynə görə müəyyən edirlər.





Bromid ionları xloramin (və ya xlor) iştirakı ilə sərbəst bromla qədər oksidləşdirməklə təyin olunur, bu da xloroform təbəqəsini tünd sarı rəngə boyayır. Preparatları miqdarı təyin etmək üçün onların qatı qələvinin iştirakı ilə sabunlaşma reaksiyasından istifadə olunur. Ayrılan bromidlərin ekvivalent miqdarını əks argentometrik titrləmə yolu ilə təyin edirlər.

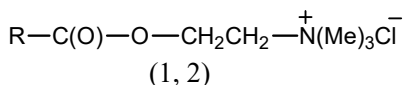


Havanın oksigeni və işıqla qarşılıqlı təsirdə olmaması üçün preparatı narıncı şüşə qablarda saxlayırlar.

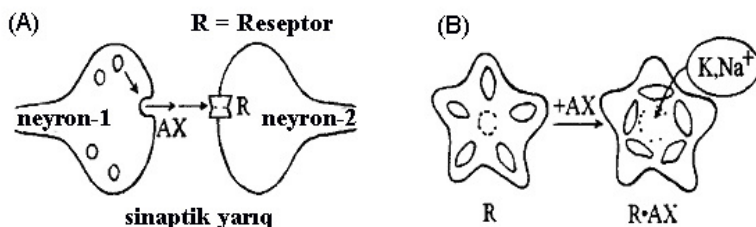
Preparat həm sakitləşdirici, həm də yuxugətirici təsirə malikdir. Sinir sisteminin xəstəliklərində yuxugətirici kimi təyin edilir. Onun təsiri mərkəzi sinir sisteminə “əzici” təsir edən brom və izovalerian qalığının birgə olması ilə əlaqədardır. Karbamid qalığının olması onun dərman təsirini yumşaldır.

9. AMİNSPİRTLƏR VƏ ONLARIN EFİRLƏRİNİN TÖRƏMƏLƏRİ

Bioloji vacib aminoalkanolları sinfinə 2-aminetanol (xolin) aiddir, bu da asetilxolinxlorid (1) şəklində biogen (orqanizmdə) sintez olunur və oyatma neyromediatoru olaraq sinir impulslarının ötürülməsində iştirak edir.



- (1) R = Me, asetilxolin (neyromediator)
(2) R = NH₂, karbaxolin (xolinomimetik)



**Şəkil 9.1 Sinaptik yarıqdan sinir impulslarının asetilxolin (AX) vasitəsilə
ötürülməsi. AX-nin təsirindən ionofor kanalın genişlənməsi**

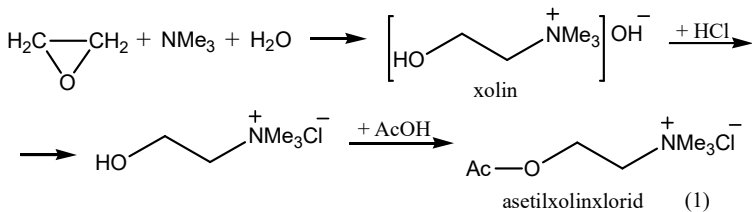
Məlumdur ki, sinir sisteminin hüceyrələri (neyronlar) bir-biri ilə bilavasitə əlaqəli olmurlar. Onlar sinaptik yarıqlar vasitəsi ilə ayrılıblar. Bu yarıqlardan siqnal (neyron membranında polyarlaşma-depolyarlaşma dalğasının qaçan şəkildə ötürülməsi) neyromediator (və ya neurotrans-mitter) adlanan müəyyən vasitəçi olmadan keçə bilmir. Sinir impulslarının bir neyrondan digərinə ötürülməsi aşağıda göstərilən qaydada baş verir (şəkil 9.1, sxem A). Sinir siqnalının həyəcanlanmış hüceyrənin sonuna çatması ilə (neyron 1) onun sinaptikdən əvvəlki sahəsində neurotransmitter (AX) sintez

olunur. Sonra AX sinaptik yarığa buraxılır və sürətlə öz reseptoruna (R)-sinaptikadən sonrakı hissəyə həyəcanlanmamış hüceyrənin (neyron 2) membranına diffuziya olunur.

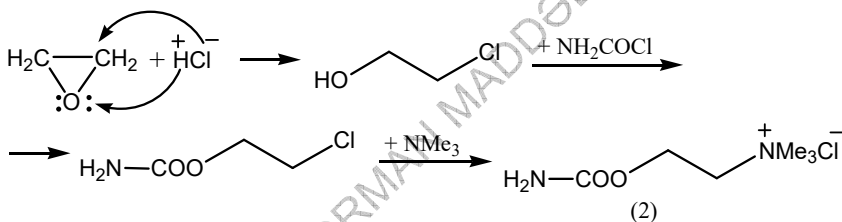
Asetilxolinin reseptorlarından biri özündə beş vahiddən ibarət olan zülal əks edir. O silindrik kanal əmələ gətirir, hansı ki bir tərəfdən 65 Å sinaptik yarığın üstünə düşür, digər tərəfdən isə membranın iki lipid qatından keçərək hüceyrənin 15 Å daxilinə keçir. Bu nazik kanal (və ya məsamə) neyromediatorun reseptora “enməsi” zamanı (kompleks RAX) zülal vahidlərinin fırlanma (konformasiya) hərəkətinin kəskin azalması hesabına 20 Å-ə qədər genişlənir. Kanalin ölçülərinin böyüməsi K^+ və Na^+ ionlarının membrandan elektrokimyəvi qradientə qarşı keçməsinə asanlaşdırır. Bu halda həyəcanlanmamış neyronun (2) membran potensialı dəyişir və onda sinir impulsu əmələ gəlir. Bundan sonra neyromediator asetilxolinesterazanın təsiri ilə təsirsiz xolinə qədər hidroliz olunur və ionofor kanalı bağlanır.

Asetil xolinin bioloji təsiri sinir impulslarının ötürülməsi ilə məhdudlanmır. O, həmçinin, ürək döyünmələrini yavaşladır, periferik qan damarlarını gücləndirir, arterial və gözdaxili təzyiqi aşağı salır. Tibbdə xolinin özünün əvəzinə xolinomimetik dərman maddələri sırasından istifadə olunur. Belə ki, bağırsaqların və sidik kisəsinin zəifliyində, hipertoniya və taxikardiya da karbxolin (2)- N-2-(2-karbamoiloksietil) trimetilammoniumxlorid işlədilir.

(1) və (2) dərman maddələri nukleofil agentlərin oksirana tsiklin açılması ilə asanlıqla birləşməsi əsasında sintez edilir. Asetil xolinin sintezi zamanı oksiran trimetilamin və su ilə işlənir. Nəticədə xolinhidroksid əmələ gəlir ki, sonuncu hidrogen xloridin və sirkə turşusunun təsiri ilə duza (1) çevrilir.



Karboxolini (2) 2-xlorethanoldan alırlar, bu da sonradan karbamin turşusunun xloranhidridi ilə qarşılıqlı təsirdən karbamoiloksietilxloridə çevrilir. Sonrakı mərhələdə xlor atomlarının trimetilamin qruplarına nukleofil əvəz olunması aparılır.



Karboxolin (2) asetilxolindən (1) çox aktivdir və uzunmüddətli təsir göstərir. Çünki, asetilxolinesterazanın təsirindən hidroliz olunmur. Karboxolin suda yaxşı, spirtə pis həll olur. Asetilxolin xlorid suda, spirtə və xloroformda həll olur, heç biri efirdə həll olmur.

Asetilxolin xlorid və karboxolin xolinomimetik (hipotenziv, miotik) dərman maddəsi kimi bağırsaq və sidik kisəsinin atoniyası hallarında, qlaukoma, hipertoniyanın ilkin formalarında, paraqsimal taxikardiya hallarında tətbiq edilir.

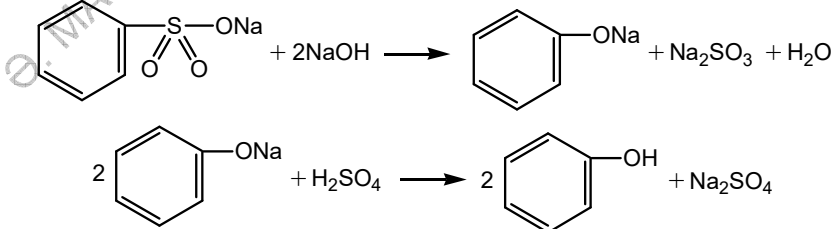
10. ARENLƏRİN DƏRMAN TƏSİRLİ MÜHÜM TÖRƏMƏLƏR

Struktur həlqəsini benzol nüvəsi təşkil edən dərman maddələri mühüm əhəmiyyət kəsb edir. Aromatik birləşmələri almaq üçün daş kömür qətranından, neftdən istifadə edilir. Eyni zamanda bu birləşmələri asetileni və onun homoloqlarını xüsusi şəraitdə polimerləşdirmək vasitəsilə də almaq olar. Benzolun monofunksional törəmələri əsasən toksik xassələrə malik olur. Əczaçılıq kimyası sənayesi üçün fenol, anilin, aromatik halogenli törəmələr əsasən başlanğıc maddə kimi geniş istifadə edilir.

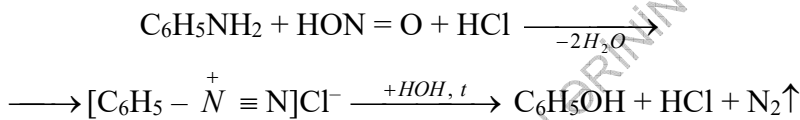
10.1 Fenollar və onların törəmələri

Fenol antiseptik maddə kimi ilk dəfə 1867-ci ildə cərrahiyyə əməliyyatlarında istifadə edilmişdir. Çox toksikliyini nəzərə alaraq yalnız tibbi alətlərin dezinfeksiyası üçün 3-5%-li zəif sulu məhlullarından istifadə edilir. Fenol kömürün kokslaşmasından, daş kömür qətranının qələvi turşu ilə işlənməsindən alınır. Fenolları almaq üçün aşağıdakı sintez üsullarından istifadə edilir:

1. Aromatik sulfoturşuların duzlarını qələvilərlə közərtməklə və sonra alınan fenolyata turşu ilə təsir etməklə:



3. Aromatik aminlərin diazolaşmasından alınan diazonium duzlarının qızdırıldıqda parçalanması nəticəsində:


$$\text{C}_6\text{H}_6 + \text{CH}_2=\text{CH}-\text{CH}_3 \longrightarrow \text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \xrightarrow{\text{O}_2, \text{ kat.}} \text{C}_6\text{H}_5-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{OOH} \xrightarrow{\text{H}_2\text{SO}_4} \text{C}_6\text{H}_5-\text{OH} + \text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$$

hidroperoksid fenol aseton

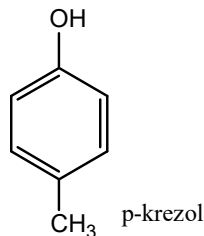
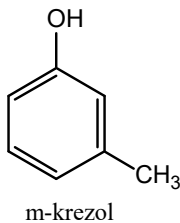
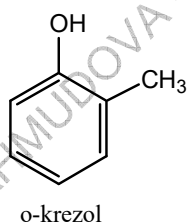
96

Fenolun zəif məhlulları dehidrogenaza fermentinin aktivliyini dayandırır və bununla bakteriostatik təsir göstərir.

Bu onunla izah olunur ki, fenol səthi fəal maddə olaraq mikrobların hüceyrə membranlarının keçiricilik qabiliyyətinə təsir göstərir. Fenolun qatı məhlulları mikrobların protoplazma zülallarının denaturatlaşmasına səbəb olur və bununla bakterisid təsir göstərir.

Fenolun zəif məhlulu dəriyə təsir edərək, sinir uclarına daxil olur və bir qədər keyləşdirici təsir göstərir. Buna görə də bəzən dəridə əmələ gələn qaşınma zamanı fenolun 0,5-1%-li məhlulundan istifadə edirlər. Toksik dozalarla fenol mərkəzi sinir sisteminin yüksək həyəcanlığına səbəb olur, iflicə gətirib çıxarır (dəriyə təsiri zamanı). Daxilə düşdükdə isə möhkəm zəhərlənmə əlamətləri: mədə ağrıları, ürək bulanma, mərkəzi sinir sisteminin funksiyasının aşağı düşməsi və s.

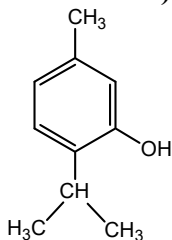
Fenolun törəməsi olan krezol da antimikrob xassəsinə malikdir. Krezolların üç izomeri vardır (o-, p- və m-krezol). Təbii preparatlar tərkiblərində izomerlərin hər üçünü saxlayır:



Krezolların zəhərli xassələri fenola oxşardır. Lakin antimikrob aktivliyi fenoldan üç dəfə yüksəkdir.

Krezollu preparatlar otaqların, mebelin, geyimlərin dezinfeksiyası üçün tətbiq olunur.

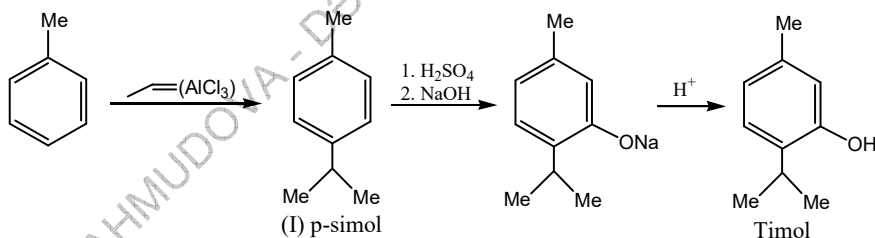
Timol- (2-izopropil-5-metilfenol)



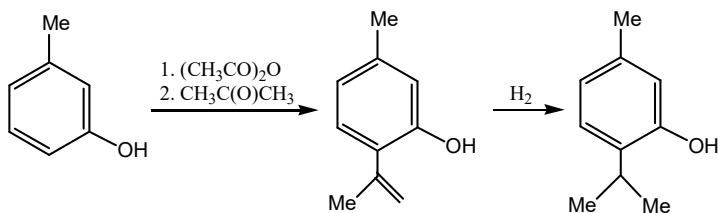
Timol fenola nisbətən az toksikdir, buna görə də nəinki xaricə, ağız boşluğunu silmək həmçinin mədə-bağırsaq traktı xəstəliklərində daxilə qəbul edilir.

Timol təbii mənbələrdən - kəklikotu bitkisinin efir yağından və sintez vasitəsilə alınır. Kəklikotunda efir yağının miqdarı 1-2,5%- ə qədərdir. Bu yağın 33-60%-ni fenollar, o cümlədən sərbəst halda və ya asetat efiri şəklində olan timol təşkil edir.

Timolu sintez etmək üçün p-simol (I) götürülür, sulfolaşma nəticəsində sulfoturşu alınır:

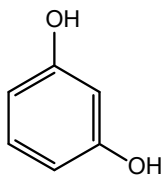


Alternativ metodla başlanğıc maddə olaraq m-krezol götürülür, əvvəlcə asilləşdirilir, sonra 300°C temperaturda asetonla kondensləşdirilir. Bu zaman əvəzli stirol alınır, sonuncunu hidrogenləşdirməklə timol alınır:

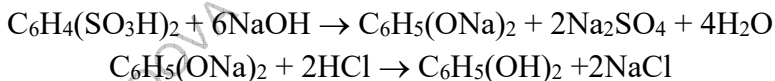


Timol – özünəməxsus iyli, rəngsiz kristallardır. Su buxarı ilə uçucudur. Suda çox az, spirtdə, xloroformda, efirdə, piyli yağlarda, qatı sirkə turşusunda asan həll olur. Ərimə temperaturu $49-51^{\circ}\text{C}$ -dir.

Rezorsin – (1,3-dihidroksibenzol)



Rezorsini sintez etmək üçün fenolların alınma üsullarının birindən istifadə edirlər. Məsələn, benzol-m-disulfoturşunu natrium hidroksidlə 270°C -də közərdirlər. Ərintini suda həll edib, xlorid turşusu ilə turşulaşdırdıqdan sonra rezorsini üzvi həlledicilərdə (benzol, efir) ekstraksiya edirlər.



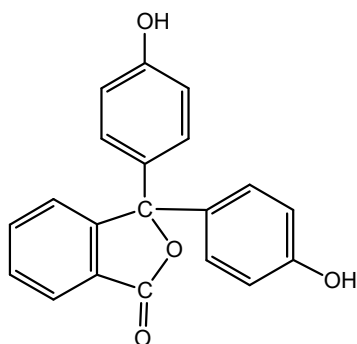
Rezorsin ağ və ya zəif sarımtıl kristallik maddədir, özünəməxsus zəif iylidir. Işıq və havanın təsirindən tədricən çəhrayı rəng alır. Suda, spirtə, efirdə asan həll olur. Ərimə temperaturu $109-112^{\circ}\text{C}$ -dir.

Rezorsin güclü antiseptik xassəyə malikdir. Dəri xəstəliklərində sulu və spirtli məhlullar (2-5%-li), həmçinin məlhəmlər (5-20%-li) şəklində işlənir.

Rezorsinin qatı məhlulları keratolitik təsirə malikdir

(epidermisi yumşaldır). Zəif məhlulları, əksinə keratoplastik təsirə malikdir (buynuz qıçasının əmələ gəlməsini sürətləndirir). Dəri xəstəliklərinin (ekzema, seboreya, dermatitləri, göbələk xəstəlikləri, dəmirov) müalicəsində tətbiq olunur.

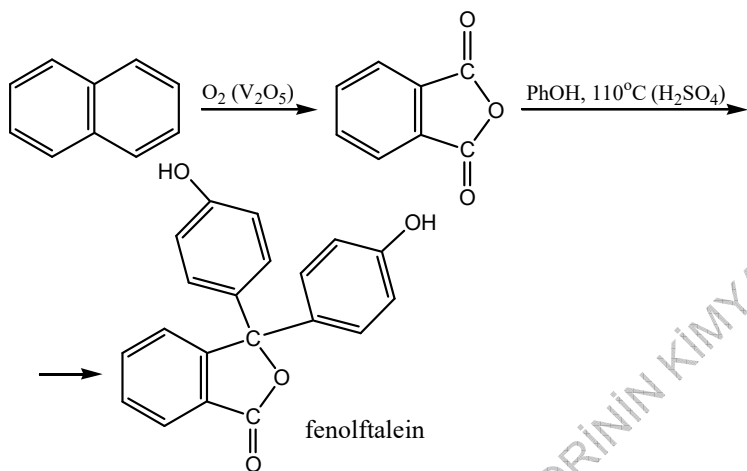
Fenolftalein (1,1-di-(4-oksifenil)benzodihidrofuran-3-on)



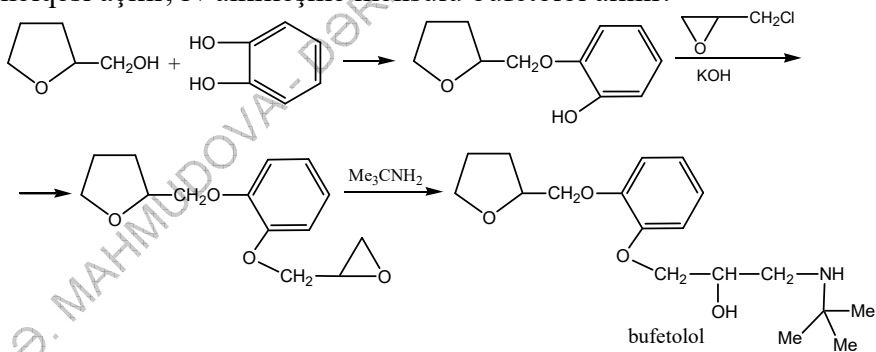
Fenolftalein fenol və ftal anhidridinin 115-120°C-də, suçəkici maddələrin (qatı sulfat turşusu, susuz sink-xlorid və s.) iştirakı ilə kondensləşməsi nəticəsində alınır.

Fenolftalein ağ və ya zəif sarımtıl rəngli, iysiz və dadsız narın kristallik maddədir. O zəif antiseptikdir, işlədici kimi xroniki qəbizlikdə daxilə qəbul edilir. Yoğun bağırsağa təsir edir. Fenolftaleinin orqanizmdə fəaliyyəti ondan ibarətdir ki, o, bağırsaqlardan qana sorularaq qismən öd ilə birlikdə hasil olur və yenidən bağırsağa düşür və yenidən sorulur. Bu proses fenolftaleinin daha uzun müddətli təsirini təmin edir. Orqanizmdən fenolftalein zəif ifraz olunur və beləliklə, kumulyativ (toplanma) xassə daşıyır. Nəticədə dəridə səpkilər və böyrəklərdə qıcıqlanma əmələ gətirir. Buna görə də fenolftaleini uzun müddət qəbul etmək məsləhət görülmür.

Fenolftalein naftalinin 450-500°C temperaturda V_2O_5 iştirakı ilə buxar fazada oksidləşməsindən alınan ftal anhidridinin 110°C temperaturda H_2SO_4 iştirakı ilə fenolla kondensləşməsindən alınır.

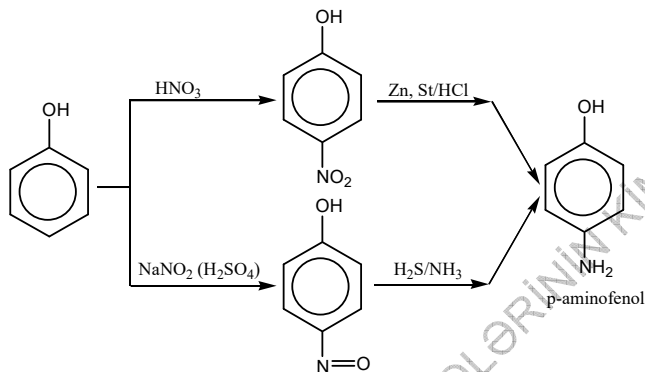


Digər, daha müasir antihipertenziv dərman maddəsi olan bufetolol (adobiol) pirokatekindən alınır. Əvvəlcə pirokatekin tetrahidrofurfuril spirti ilə monoefirə, sonra isə epixlorhidrinlə diefirə qədər O-alkilləşdirilir. Üçlü-butilaminin təsiri ilə oksiran həlqəsi açılır, N-alkilləşmə məhsulu bufetolol alınır:

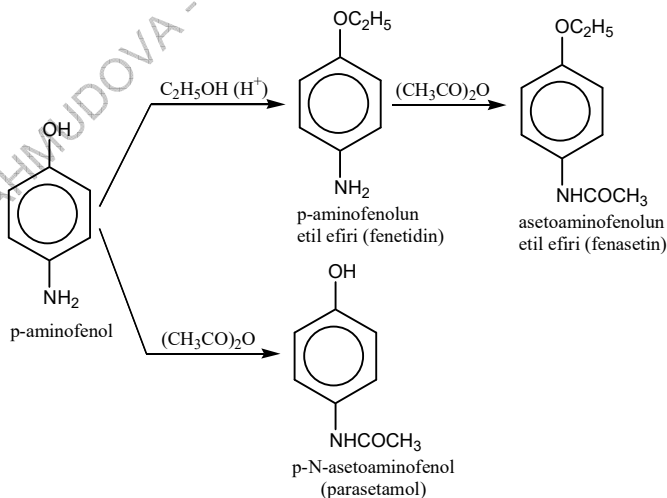


10.2 p-Aminofenol və onun törəmələrinin sintezi

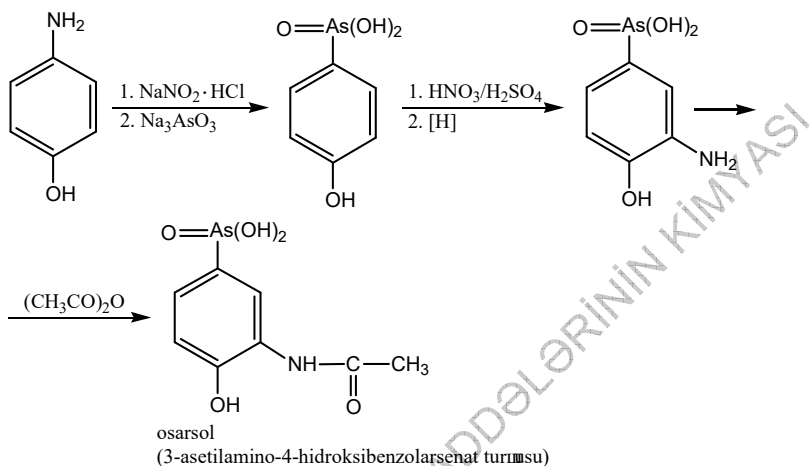
p-Aminofenol aşağıdakı çevrilmələrdən alınır:



p-Aminofenol bifunksional birləşmədir. O, həm ayrı-ayrı qruplar və həm də eyni zamanda hər iki funksional qrup hesabına müxtəlif törəmələr əmələ gətirir. Onun törəmələrindən tibbdə parasetamol (panadol) və fenasetin daha əhəmiyyətlidir. Onlar ağrı kəsici və hərarəti aşağı salmaq xassəsinə malikdir, nevrologiyada, baş ağrılarında, iltihab xəstəliklərində istifadə edilir.



p-Aminofenoldan həmçinin o-aminofenolların siflis əleyhinə təsirə malik arsen saxlayan törəmələri sintez edilir:



Osarsolu almaq üçün p-aminofenol əvvəlcə diazonium duzuna çevrilir, sonra hidroksil qrupuna nəzərən o-vəziyyətdə nitrolaşdırılır ki, bu da arsenat turşusu ilə işləndikdən sonra fenolarsenat turşusu əmələ gəlir. Sonuncu hidroksil qrupuna nəzərən o-vəziyyətdə nitrolaşdırıcı qarışıqla nitrolaşdırılır, amin qrupuna reduksiya olunur və sirkə anhidridi ilə asilləşdirilərək osarsol alınır.

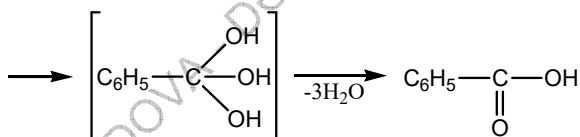
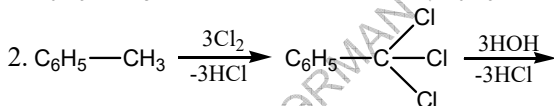
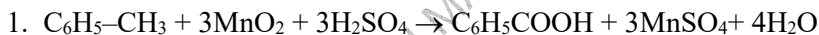
Siflis əleyhinə təsirə malik olmaqla yanaşı osarsol həmçinin trixomonasid və amobasid effektdə malikdir.

11. AROMATİK TURŞULARIN MÜHÜM TÖRƏMƏLƏRİ

11.1 Benzoy turşusu – C₆H₅COOH

Benzolun monofunksional qruplu törəmələrindən olan benzoy turşusu Na duzu şəklində tibbdə bəlgəmgətirici dərman kimi işlədilir. Bir sıra dərman maddələrinin alınmasında benzol nüvəsində müxtəlif funksional qruplara – hidroksi, karboksi-aminoqrupları olan heterofunksional törəmələrdən başlanğıc maddələr kimi istifadə edilir.

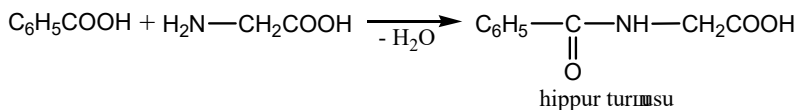
Benzoy turşusu – C₆H₅COOH toluolu müxtəlif üsullarla oksidləşdirməklə və xlorlaşdırmaqla sintez oluna bilər:



Birinci üsulla daha təmiz benzoy turşusu alınır.

Benzoy turşusu rəngsiz, iynəvari kristallar olub, qızdırıldıqda sublimasiya olunur. Ərimə temperaturu 122-124⁰C-dir. Benzoy turşusu spirtli məhlul məlhəmlər şəklində antimikrob maddələr kimi xəicə tətbiq edilir.

Benzoy turşusunun Na duzundan həmçinin qaraciyərin antitoksik funksiyasını müəyyən etmək üçün istifadə edilir. Bu da benzoy turşusunun orqanizmdə qlisinlə kondensləşərək hippur turşusu şəklində orqanizmdən xaric olunur.

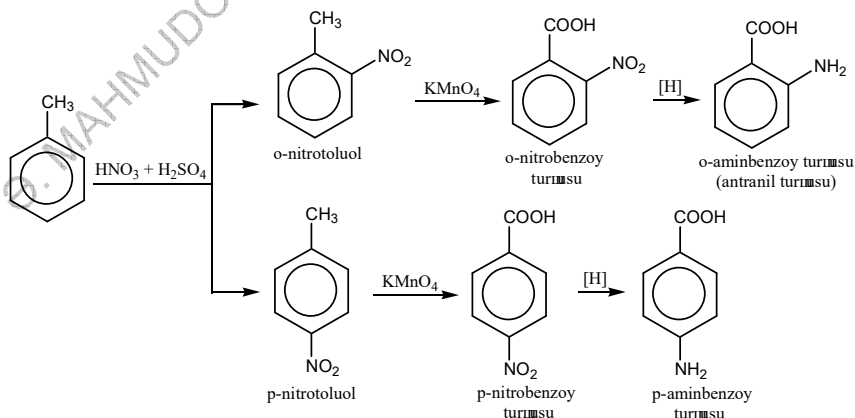


11.2 p-Aminobenzoy turşusu və onun törəmələri

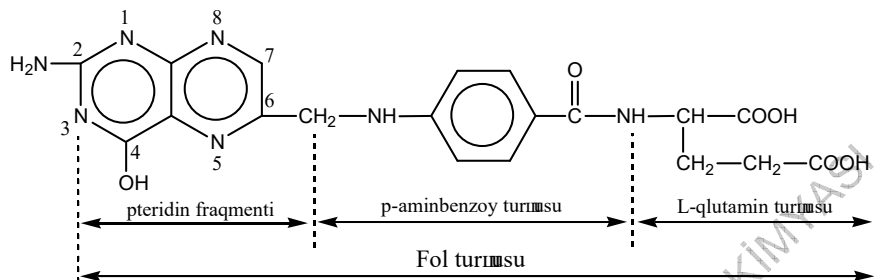
p-Aminobenzoy turşusunun bir neçə min törəmələri içərisində effektiv yerli anestetiklərə - sinir sonluqlarını keyləşdirən anestezin, novokain və dikain kimi dərman maddələrinə rast gəlinir ki, bunlar da tibbdə kokain alkaloidini müvəfəqiyyətlə əvəz edərək, bu zaman dərmandan asılılıq yaratmır.

p-Aminobenzoy turşusu toluola nitrat turşusu ilə təsir etdikdə alınan iki nitrotoluol izomerini əvvəl oksidləşdirib alınan nitrobenzoy turşusunun iki izomerinin reduksiyasından p-Aminobenzoy turşusunun iki izomeri alınır. p-Aminobenzoy turşusu PABT ilə işarə edilir. p-Aminobenzoy turşusu çatışmadıqda və heç olmadıqda mikroorqanizmlərin inkişafına təsir edir, fol turşusunun sintezində iştirak edir.

o-Aminobenzoy turşusu – antranil turşusu adlanır. Aminoboyaqların alınmasında istifadə edilir:

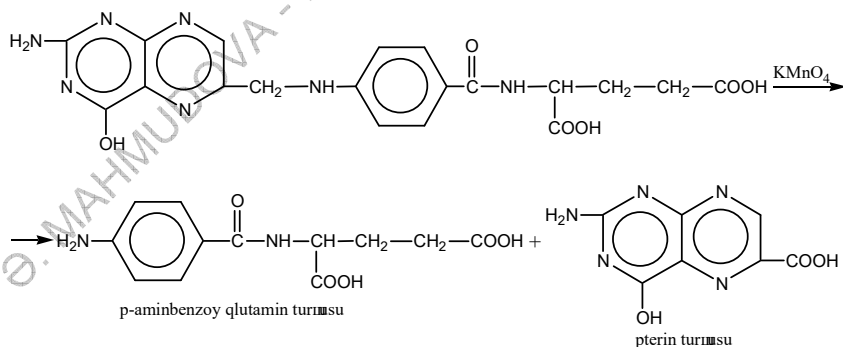


Fol turşusu (vitamin B_C) molekulu üç struktur fraqmentdən ibarətdir:



Bu turşu ispanaq yarpağından alındığı üçün adı latınca «folium»-yarpaq sözündən götürülmüşdür. Fol turşusu kök, kəhl və başqa tərəvəzlərdə olur, nuklein turşularının metabolizmində mühüm rol oynayır, insan orqanizmində sintez olunmur, yalnız qida ilə hazır şəkildə orqanizmə daxil olur və ya bağırsaqlarda mikroorqanizmlər tərəfindən sintez edilir.

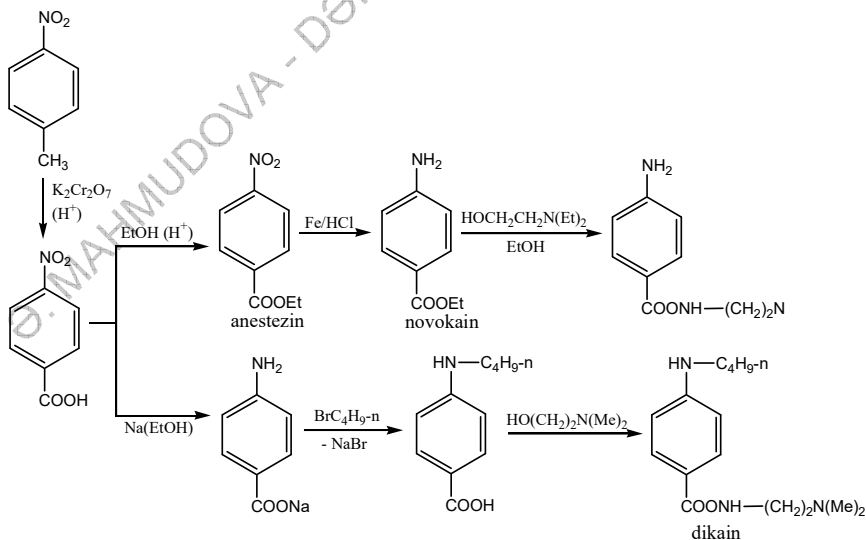
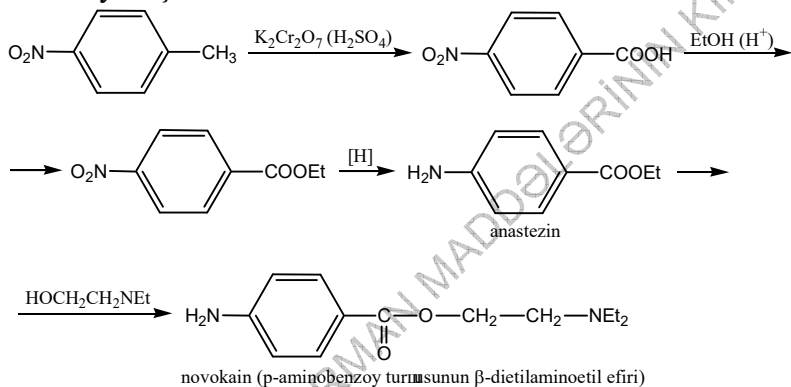
Fol turşusunun həqiqiliyi oksidləşərək p-aminobenzoyl qlütamin və pterin turşusuna parçalanması ilə müəyyən edilir:



Aromatik aminoturşuların efirləri ümumi xassəyə malik olub, onlar bu və ya digər dərəcədə yerli keyləşdirici təsirə malik olur. Bu keyfiyyət əsasən para-törəmələrdə daha qabarıq təzahür edir.

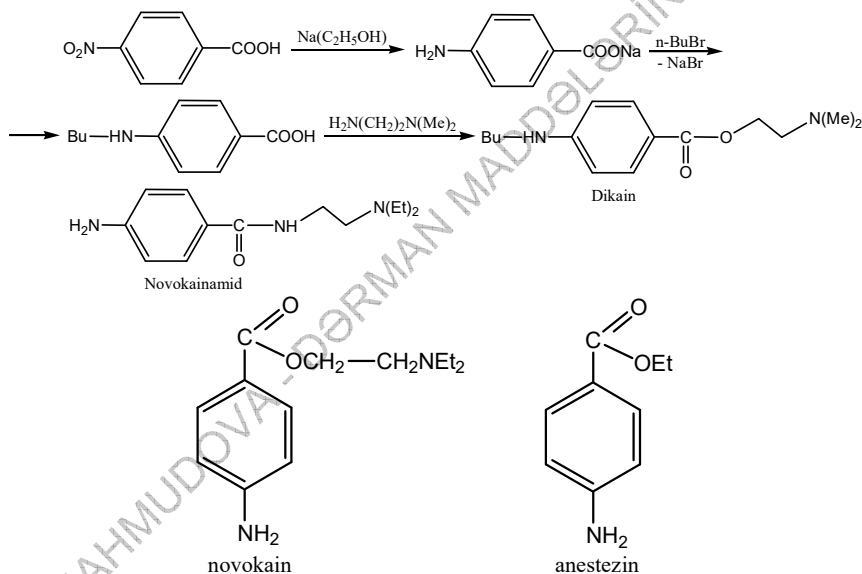
Tibbdə anestezin (p-aminobenzoy turşusunun etil efiri) və novokain (p-aminobenzoy turşusunun β-dietil aminoetil efiri) və dikaindən istifadə edilir. Hər iki birləşmə duzlar (hidroxlrid) şəklində istifadə edilir ki, bu da onların suda həll olmalarını artırmaq tələbindən irəli gəlir. Bundan başqa novokainamid və dikain preparatları da tətbiq edilir.

Başlanğıc maddə olaraq hər 4 preparat almaq üçün p-nitrobenzoy turşusundan istifadə edilir:



Hər 3 preparatın alınması üçün p-nitrotoluoldan istifadə edilir. Əvvəlcə onu p-nitrobenzoy turşusuna oksidləşdirib, sonuncunun efirləşmə və reduksiya reaksiyalarından anestezin və novokain alınır.

Dikaini almaq üçün başlanğıc maddə olaraq götürülmüş p-nitrotoluolun oksidləşməsindən alınan p-nitrobenzoy turşusuna Na metalı ilə C_2H_5OH iştirakı ilə təsir edilir, alınmış amin butilbromidlə alkilləşdirilir, sonrakı mərhələdə amin etanolla efirləşməsindən dikain alınır:

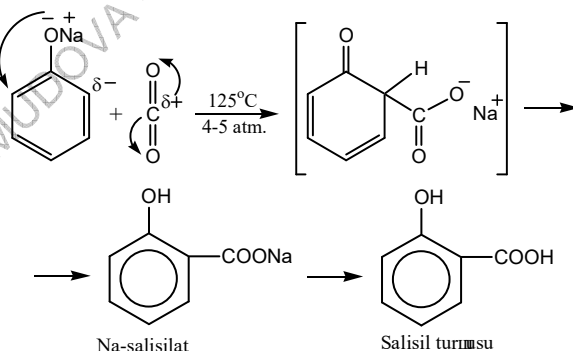


Anestezin və novokain keyləşdirici təsirə görə əvvəl tibbdə işlədilən kokaindən geri qalır. Lakin ən vacibi odur ki, kokainin çox istifadəsi zamanı bu dərmandan asılılıq («kokainizm») yaranır. Bu səbəbdən kokaindən praktikada istifadə olunmur. Novokain quruluşca kokainə oxşayır. Hər ikisinin orqanizmə təsiri belə təsəvvür yaradır ki, bu maddələrin tərkibindəki fraqmentlər

reseptorlar üzərində zəif kimyəvi rabitələr (Van-der-Vaals qüvvələri; dipol-dipol qarşılıqlı təsiri və elektrostatik qarşılıqlı təsiri) hesabına reseptorların hissiyyatını müvəqqəti olaraq dayandırır.

11.3 Salisil turşusu və onun törəmələri

Salisil (o-hidroksibenzoy) turşusu hidroksibenzoy turşusunun üç izomerlərindən biri olub təbii maddələr qrupuna aiddir. Salisil turşusunun sirkə efiri spirei bitkisinin (*spiraea ulmaria*) çiçəklərində rast gəlinir. Bu efir hələ 1874-cü ildə kəskin əzələ revmatizmin müalicəsində tibbi praktikaya daxil olmuşdur. Salisil turşusu sənayedə fenolun birbaşa karbon dioksiddə karboksilləşməsindən (Kolbe reaksiyası) alınır. Karbon dioksid zəif elektrofil reagent olduğu üçün, reaksiyanı sürətləndirməkdən ötrü substratın nukleofil xassələrini gücləndirmək lazımdır. Buna görə reaksiya fenolun özü ilə deyil, onun Na duzu ilə aparılır, belə ki, fenoksid ion, fenola nisbətən güclü nukleofilliyə malikdir.

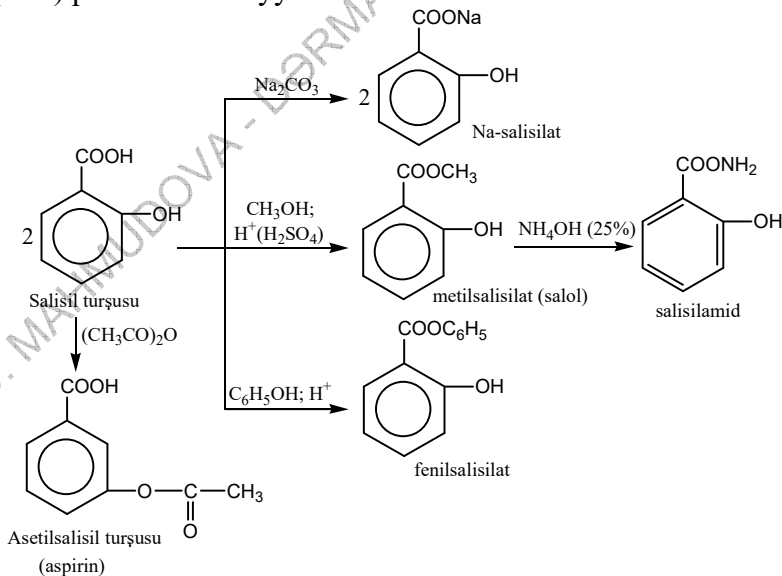


Salisil turşusu qızdırıldıqda asanlıqla dekarboksilləşərək fenol əmələ gətirir. Salisil turşusunda molekul daxili hidrogen rabitəsi

vardır ki, bu karboksilat ionunu stabiləşdirir və nəticədə onun turşuluğunu artırır ($pK_C=2,98$). Bu da benzo turşusunda ($pK_a=4,20$), p-hidroksibenzo turşusuna ($pK_a=4,58$) nisbətən artıqdır. p-hidroksibenzo turşusunun turşuluğu benzo turşusuna nisbətən zəifdir, bu da birincinin tərkibindəki $-OH$ qrupunun $+M$ effekti ilə izah olunur.

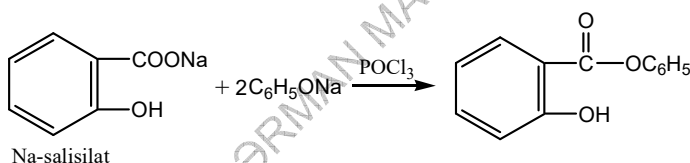
Salisil turşusu suda həll olur, dəmir (III)-xloridlə intensiv bənövşəyi rəng verir (fenolun hidroksil qrupunun vəsfi təyini) salisil turşusu antirevmatik, hərarəti endirən, göbələk əleyhinə xassələrə malikdir, lakin həzm traktını qıcıqlandırmaq xassəsinə malikdir, ona görə də yalnız xaricdən mazlar şəklində istifadə edilir. Daxilə onun törəmələri – efirləri və duzu qəbul edilir.

Salisil turşusu hər iki funksional qruplarına görə törəmələr əmələ gətirir. Na-salisil, $COOH$ qrupuna görə efirləri (metilsalisilat, fenilsalisilat) və $OH-$ qrupuna görə efiri - asetilsalisil turşusu (aspirin) praktiki əhəmiyyət kəsb edir.

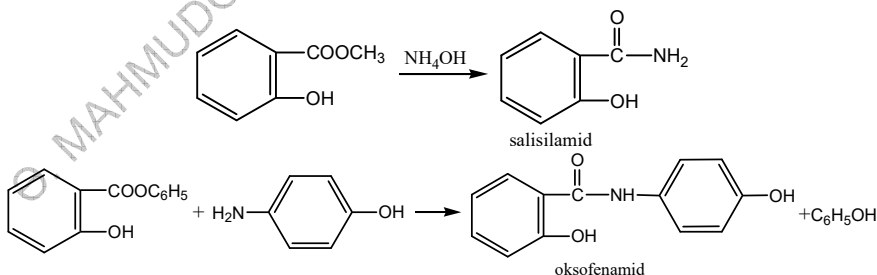


Saloldan başqa salisil turşusunun sadalanan törəmələri analgetik, hərərəti aşağı salan, iltihab əleyhinə təsirə malikdirlər. Metilsalisilat qıcıqlandırıcı təsirə malik olduğu üçün mazlar şəklində revmatizmdə, radikulit və artiritlərdə xaricə tətbiq edilir. Salol bağırsaq xəstəlikləri zamanı dezinfeksiyaedici kimi istifadə edilir, üstün xüsusiyyətlərindən biri ondan ibarətdir ki, maddə turş mühitdə hidroliz olunmur, yalnız bağırsaqlarda parçalanır. Fenilsalisilat həmçinin bir sıra dərman maddələri (mədənin turş mühitində davamlı olmayan dərman maddələrinin) üçün müdafiə qabıq qatı üçün istifadə olunur.

İlk dəfə fenilsalisilat 1886-cı ildə N.B.Nenski tərəfindən qıcıqlandırıcı təsiri olmayan antiseptik təsirli dərman maddələri almaq məqsədilə sintez edilir:



Salisil turşusunun amidləri aşağıdakı üsulla alınır:

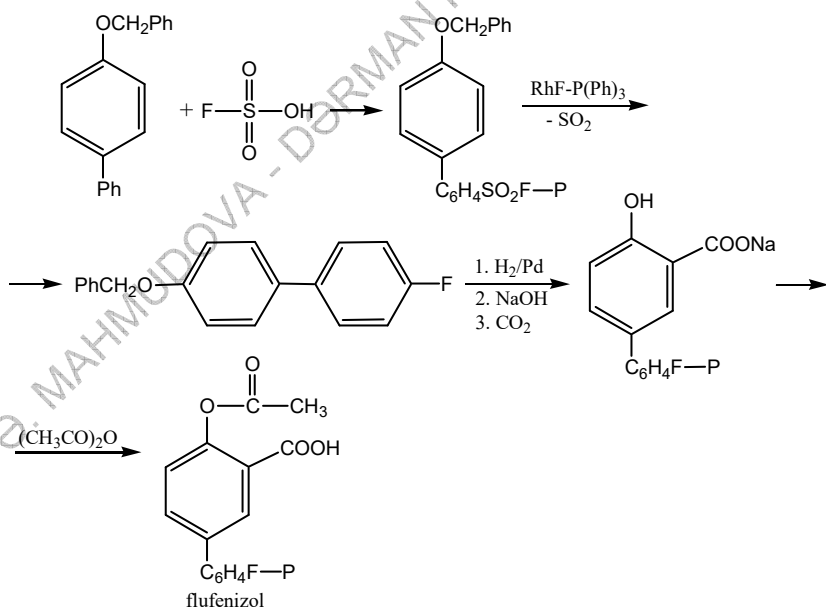


Aspirin XX yüzilliyin dərmanı adlanır, hal-hazırda da dünya miqyasında onun istehsalı 100 min ton təşkil edir. Aspirin

ağrıkəsici, hərarəti aşağı salan, iltihab əleyhinə xassələrə malik olmaqla yanaşı həmçinin, tromb əmələ gəlməsinin qarşısını alır, damar genişləndirici xassələrə malik olub infarkt və insultun profilaktikası üçün də istifadə edilir.

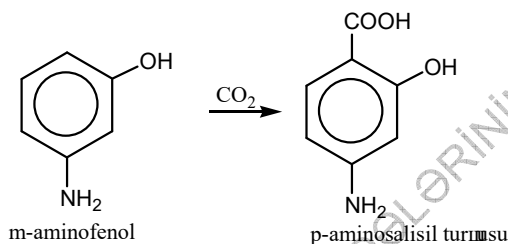
Salisilat fraqmentli digər dərman maddələrinin alınması üçün tədqiqatlar aparılır. Bu tədqiqatların nəticəsi olaraq flüfenizal preparatı alınmışdır ki, bu da iltihab əleyhinə təsirinə görə revmatoid artiridlərdə 4 dəfə aktivdir, mədənin selikli qışasına təsiri daha yumşaqdır.

Flüfenizal almaq üçün difenil törəməsi flüorsulfollaşdırılır, trifenilfosfin rodiumflorid iştirakı ilə kükürd dioksidlə eliminləşdirilir. Alınmış flüorid hidrogenləşdirilərək benzil müdafiə qrupu götürülür, alınmış fenolyat Kolbe üsulu ilə aril salisilata qədər karboksidləşdirilir.

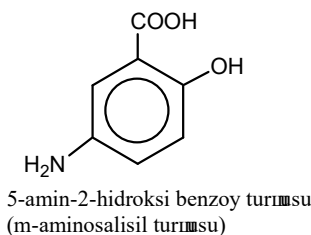


11.4 p-Aminosalisil turşusunun törəmələri

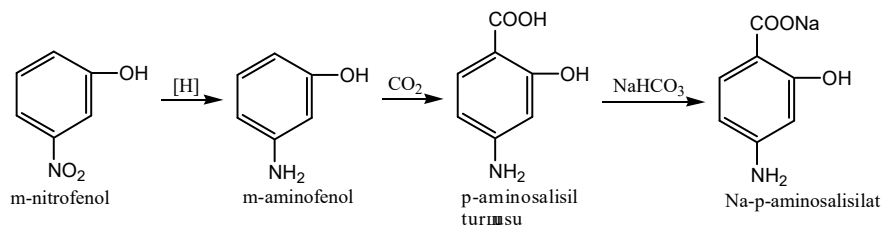
Salisil turşusunun digər törəmələrindən p-aminosalisil turşusu böyük əhəmiyyət kəsb edir (PAST). Bu da salisil turşusu kimi karboksilləşmə metodu ilə alınır. Bu zaman başlanğıc maddə kimi m-aminofenoldan istifadə edilir.



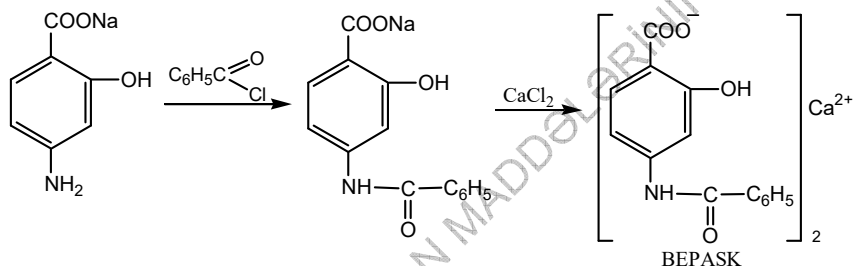
P-aminosalisil turşusu vərəm əleyhinə bakteriostatik təsirə malikdir. P-aminosalisil turşusunun vərəm əleyhinə təsiri mikroorqanizmlərin normal həyat fəaliyyəti üçün zəruri olan p-aminobenzoy turşusunun antoqonisti olması ilə izah edilir. Digər izomerlər bu təsirə malik deyildir, m-aminosalisil turşusu isə əksinə zəhərli maddədir.



P-Aminosalisil turşusu və onun törəmələri əsasən natrium para-aminosalisilat və bepask preparatları şəklində geniş tətbiq tapmışdır. Natrium p-aminosalisilat üçün başlanğıc maddə olaraq m-nitrofenol götürülür.



Bepaskı almaq üçün natrium p-aminosalisilata benzoy turşusunun xloranhidridi ilə təsir edirlər.

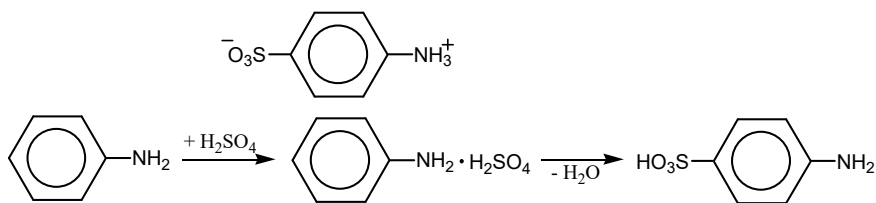


Bepask p-benzoilaminosalisil turşusunun kalsium duzudur. Bepask və natrium aminosalisilat vərəm əleyhinə tətbiq edilən preparatlardır. Müxtəlif formalı vərəm xəstəliklərində daxilə tətbiq edilir. Təsir mexanizmi sulfanilamid preparatlarının antibakterial təsiri ilə analojiidir.

11.5 Sulfanil turşusu və sulfanilamid preparatları

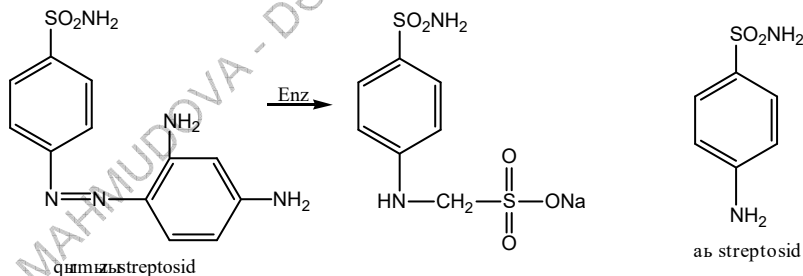
İkinci dünya müharibəsi başlamazdan əvvəl antimikrob təsirli tərkibində p-aminsulfanil amid qrupu saxlayan dərman maddələrinin böyük bir qrupu aşkar edildi.

Sulfanil turşusu – p-aminobenzol sulfoturşu anilinin sulfolaşmasından alınır və bipolyar ion şəklində mövcud olur:

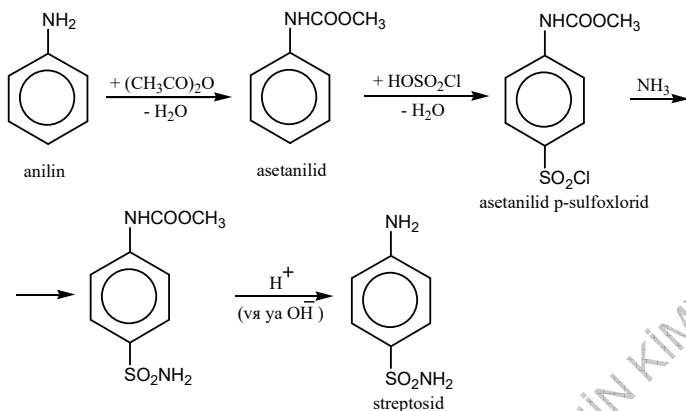


Sulfanil turşusunun boyalar istehsalında əhəmiyyəti böyükdür. Sulfanil turşusunun amidi (sulfanilamid) antibakterial xassəyə malik olan və sulfanilamidlər (sulfoamidlər) adlanan dərman maddələrinin sələfidir.

Sulfanilamid ilk dəfə 1908-ci ildə sintez olunub və boyalar istehsalında aralıq birləşmə kimi istifadə olunub. Onun antibakterial aktivliyi 1935-ci ildə müəyyən edilib. Streptokokk bakteriyalarını məhv etmək qabiliyyəti ilk dəfə qırmızı azoboyada müəyyən edilib və qırmızı streptosid adlandırılıb. Sonralar məlum olmuşdur ki, əsas təsiredici maddə onun metaboliti olan natrium sulfamoilfenilaminometilsulfanat olub “ağ” streptosidin suda həll olan formasıdır.

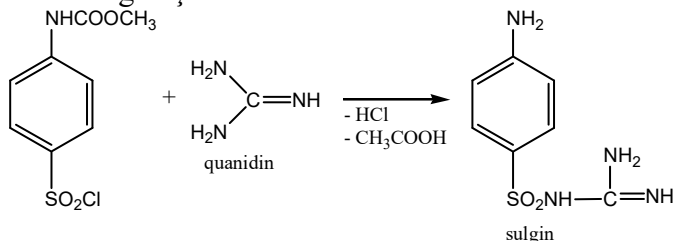


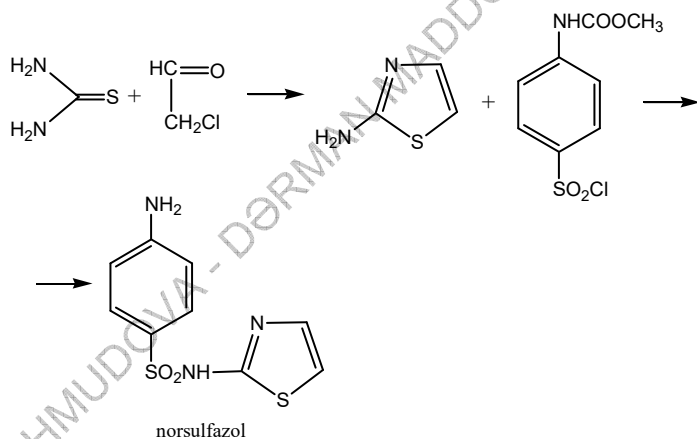
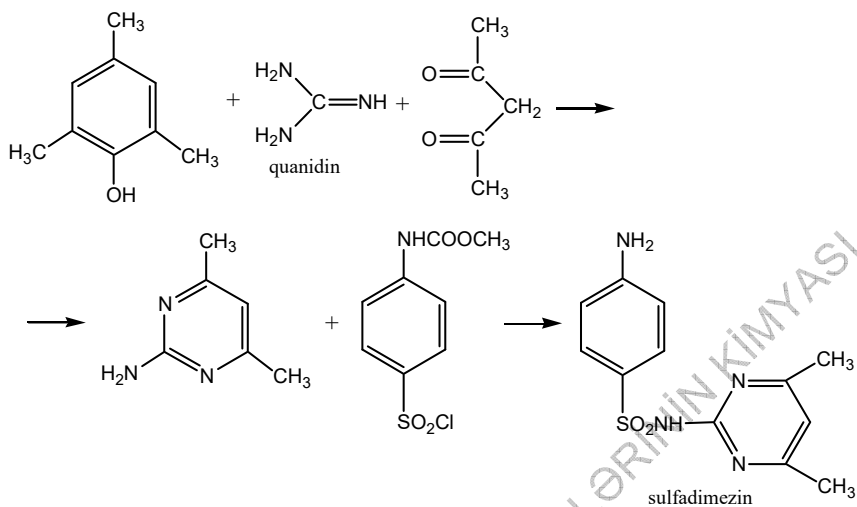
Streptosidi almaq üçün anilinin amin qrupunu oksidləşmədən qorumaq üçün əvvəlcə asetilləşdirilir, alınan asetanilid xlor sulfon turşusu ilə (HSO_3Cl) sulfirləşdirilir. Məhsulda xlor atomunu amin qrupu (streptosidin alınması) və ya RNH -qrupu ilə (sulfanilamidin törəmələri) əvəz etməklə məhsullar alınır.



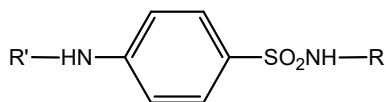
Bütün sulfanilamidlərin tərkibində mütləq sulfamid (sulfoamid) qrupu ($-SO_2NH_2$) vardır. Bu qrupun karboksamid ($-CONH_2$) və ya nitril ($C\equiv N$) qrupları ilə əvəzlənməsi antibakterial aktivliyin itirilməsinə səbəb olur. Müəyyən olunmuşdur ki, para-vəziyyətdə olan amin qrupu həmişə əvəz olunmamış qalmalıdır və benzol həlqəsində əlavə əvəzedicilər olmalı deyildir. Əks halda, birləşmənin antibakterial aktivliyi azalır. Orto- və meta-aminosulfobenzoy turşuları antibakterial aktivliyə malik deyillər.

Effektiv antibakterial xassəli maddələrin axtarışı məqsədilə sulfanilamidlərin on minlərlə törəməsi sintez edilmişdir. Lakin bunların bəzilərinin praktiki əhəmiyyəti vardır. 30-dan çox sulfanilamid preparatı tətbiq tapmışdır. Radikalı (R) heterotsiklik təbiəti olan törəmələrin aktivliyi yüksəkdir. Sulfadimezin, sulfadimetoksin, sulfapiridazin, etazol, norsulfazol və s. preparatlarından geniş istifadə olunur.





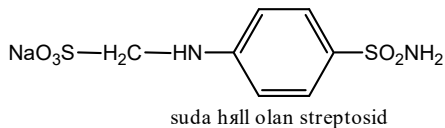
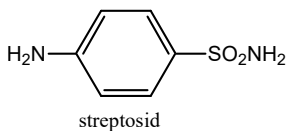
Sulfanilamid preparatlarının ümumi formulu



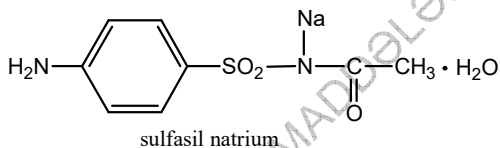
Radikalın təbiətinə görə sulfanilamidlər alifatik, aromatik və

aromatik heterotsiklik olmaqla 3 qrupa bölünür.

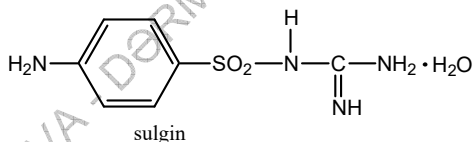
Alifatik törəmələr:



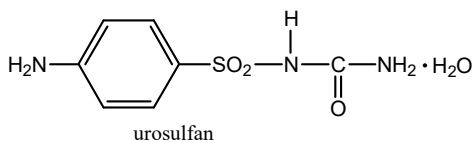
p-Sulfamidbenzolaminometan sulfonat natrium



p-Aminobenzolsulfonilasetanilid natrium

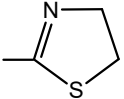
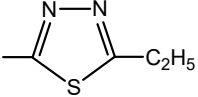
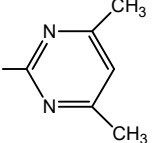
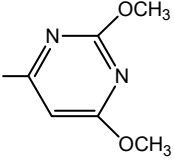
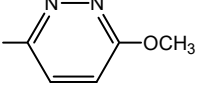
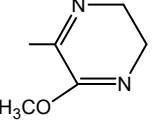


p-Aminobenzolsulfonilquanidin

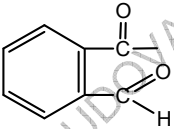
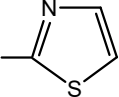
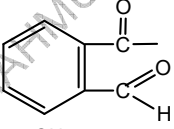
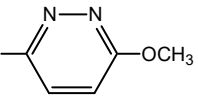
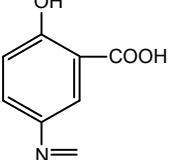
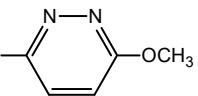


p-Aminobenzolsulfonil karbamid

Sulfanilamid preparatlarının heterotsiklik törəmələrinə aşağıdakılar aiddir: R' = H olduqda

R =		norsulfazol
		etazol
		sulfadimezin
		sulfadimetoksin
		sulfapiridazin
		sulfalen

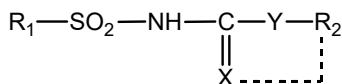
Aromatik-heterotsiklik törəmələr

R' =		R =		ftalazol
R' =		R =		ftazin
R' =		R =		salazopiridazin

Sulfanilamidlərin antibakterial təsiri ona əsaslanır ki, onlar mikroorqanizmlərdə fol turşusunun biosintezində iştirak edən p-aminobenzoy turşusunun antimetabolitləridir. Sulfanil turşusunun amidi ilə p-aminobenzoy turşusu oxşar quruluşa malikdirlər. Fol turşusunun insan orqanizmində sintez olunmaması bu tip antibiotiklərin seçici antibakterial təsirini izah edir. Beləliklə, sulfanilamidlər müəyyən bakteriyalarda (pnevmonokoklar, streptokoklar və s.) metabolik reaksiyaların qarşısını alır, eyni zamanda insan orqanizminə təsir etmir.

11.6 Sulfoturşuların alkiluridlərinin törəmələri

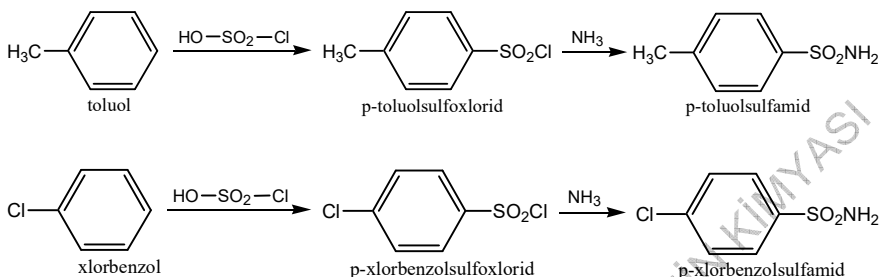
Sulfoturşuların alkiluridləri sulfamid preparatının kimyəvi quruluşu ilə onların fizioloji təsiri arasında əlaqənin öyrənilməsi zamanı sintez olunmuşdur. Hazırda 15000-dən çox sulfamid preparatları məlumdur ki, bunlar sulfonilkarbamid və onun törəmələri (sulfoniltiokarbamid, sulfoniltiosemikarbazid, sulfoamidokarbazid), həm də sulfoturşusunun heterilamidi (sulfonamidook-sadiazol, sulfonamidotiodiazol, sulfonamidopirimidin). Birləşmələrin ümumi formulu belədir:



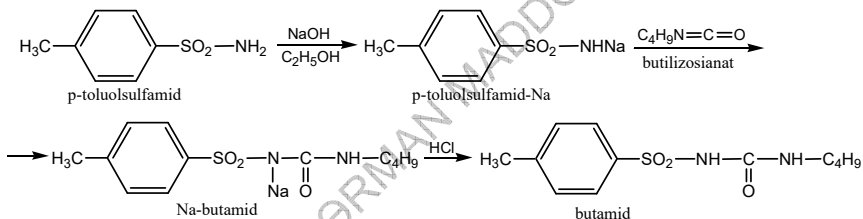
X və Y – O, S, N ola bilər. Hipoqlikemik təsiri SO_2 , $-\text{NH}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-$ qrupunun varlığı ilə əlaqədardır. SO_2 qrupunun CO , PO_2 , NH və CH_2 əvəz edilməsi və ya SO_2 və NH -qrupu arasında CH_2 qrupunun olması aktivliyinin azalmasına səbəb olur.

Sulfoturşuların alkiluridlərinə butamid, xlorpropamid və

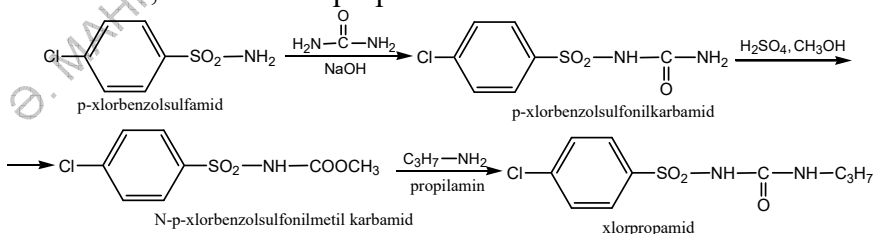
tsikloamid aiddir. Sulfoturşuların alkiluridlərinin sintezində p-toluolsulfamid və ya p-xlorbenzolsulfamiddən istifadə olunur:



Butamidi p-toluolsulfamid-natriuma butilizosianatla təsir etməklə alırlar:



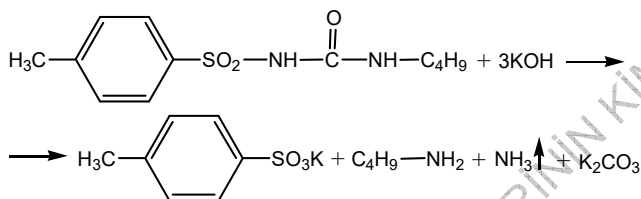
Analoji olaraq tsikloamid p-toluolsulfamid mono natrium duzu ilə tsikloheksilizosianatın qarşılıqlı təsirindən alınır. Xlorpropamidin sintezinin ilkin məhsulları isə p-xlorbenzolsulfamid, karbamid və propilamindir:



Butamid, xlorpropamid və tsikloamid əsasən ağ kristallik

maddələrdir. Onlar praktik olaraq suda həll olur, spirtdə və xloroformda yaxşı həll olur, efrdə isə az həll olur.

Butamidin kalium-hidroksid məhlulunda qızdırılması nəticəsində xüsusi iyə malik ammoniyak alınması ilə hidrolizə uğrayır:

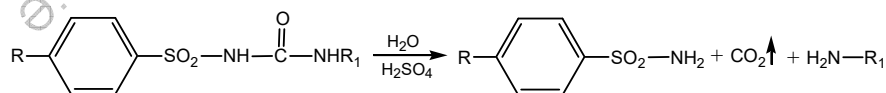


Eyni kimyəvi prosesi xlorpropamid və tsikloamidə də aid etmək olar.

Hidroliz prosesi həmçinin preparatların sulfat turşusuyla qaynadılması ilə də gedir.

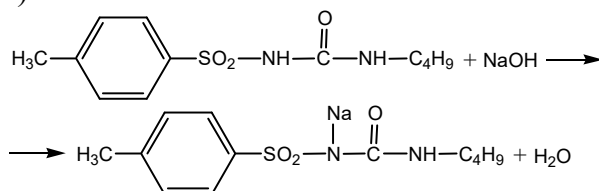
Alınan məhsula 30%-li natrium-hidroksid məhlulunun əlavə edilməsi özünəməxsus iyli amin damcılarının əmələ gəlməsilə nəticələnir. Preparatın 50%-li sulfat turşusunun iştirakı ilə davamlı qızdırılması, sonra soyudulması və neytrallaşması nəticəsində sulfamid qalığı ayrılır. Butamid və tsikloamidin analizi reaksiyası nəticəsində p-toluolsulfamid, xlorpropamidin analizi reaksiyasından isə p-xlorbenzolsulfamid alınır.

Turş mühidə hidrolizin ümumi sxemi belədir:



Preparatların miqdarı təyini neytrallaşma metodu ilə aparılır. Butamidi 0,1 n natrium-hidroksid məhlulu ilə titrləyirlər (indikator-

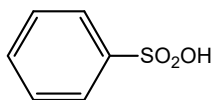
timolftalein):



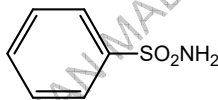
Tsiklamid və xlorpropamidin titrlənməsi də analoji olaraq aparılır.

Butamid, xlorpropamid və tsikloamid qipoqlikemik maddə kimi şəkərli diabetin müalicəsində istifadə olunur.

11.7 Sulfoturşuların amidlərinin törəmələri

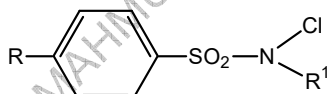


benzolsulfoturşu



benzolsulfamid

Tibbi praktikada istifadə olunan sulfoturşuların amidlərinin törəmələri 2 qrupa bölünür: I- sulfoturşuların amidlərinin xlorlu törəmələri, II- alkil ureidlərin törəmələri.

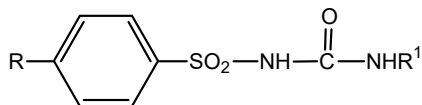


(I)

$\text{R} = \text{H}$; $\text{R}^1 = \text{Na}$ (xloramin B)

$\text{R} = \text{H}$; $\text{R}^1 = \text{Cl}$ (dixloramin B)

$\text{R} = \text{COOH}$; $\text{R}^1 = \text{Cl}$ (pantosid)



(II)

$\text{R} = \text{CH}_3$; $\text{R}^1 = \text{C}_4\text{H}_9$ (butamid)

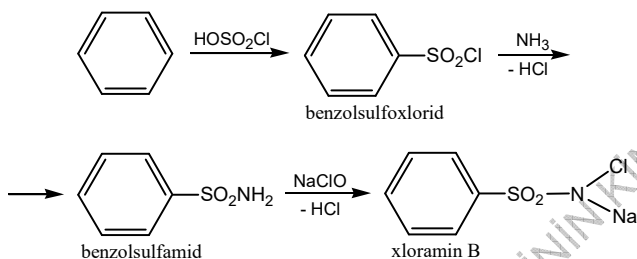
$\text{R} = \text{Cl}$; $\text{R}^1 = \text{C}_3\text{H}_7$ (xlorpropamid)

$\text{R} = \text{CH}_3$; $\text{R}^1 = \text{C}_6\text{H}_6$ (tsikloamid)

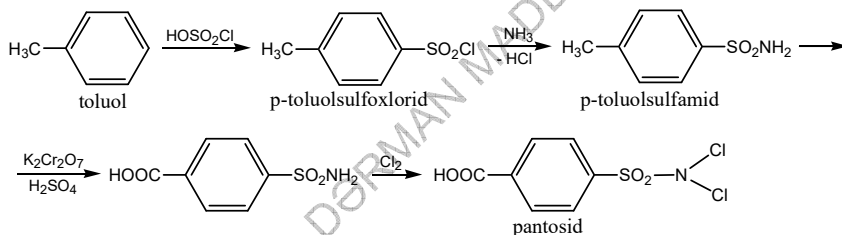
Xloramin B və dixloramin B onların benzoldan alınmasını

göstərir. Xaricdə həmçinin toluoldan alırlar.

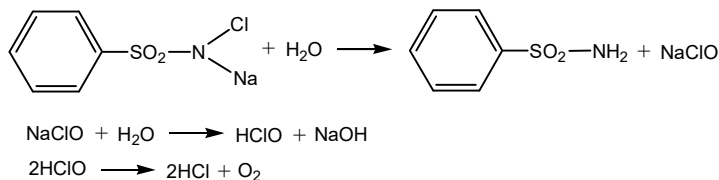
Pantosid və xloramini almaq üçün benzolsulfoturşunun amidini alıb və ona NaCl ilə təsir edilir:



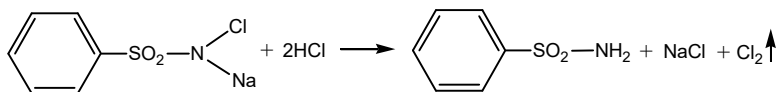
Pantosid toluoldan alınır:



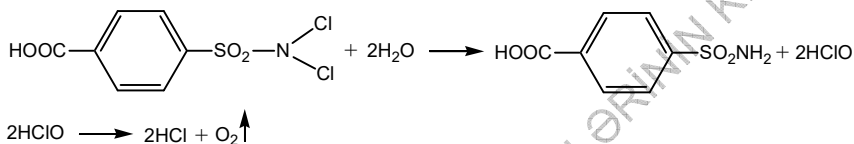
Xloramin və pantosid zəif xlor iyli kristallardır, kimyəvi xassələri hipoxloridlərə oxşardır, bu da molekulda aktiv xlor atomunun olması ilə əlaqədardır. Suda həll etdikdə xloramin NaClO əmələ gətirməklə hidrolizə uğrayır:



HCl turşusunun iştirakı ilə xloramin Cl_2 ayrılması ilə parçalanır.



Analoji olaraq pantosid də həmin reaksiyanı verir.



Xloramin və pantosid aktiv antiseptik vasitə kimi istifadə edilir. Xloramin infeksiyalı yaraların müalicəsində həmçinin dərinin iprit və digər toksik üzvi maddələrdən zərərsizləşdirmək üçün istifadə edilir (1,5-2% məhlul), əllərin və alətlərin dezinfeksiyası üçün (0,25-0,5% məhlul) infeksiyon xəstəliklərə qulluq zamanı alətlərin dezinfeksiyası üçün, pantosid isə suyun zərərsizləşdirilməsi üçün istifadə edilir. Bunun üçün tərkibində pantosid, natrium karbonat və natrium xlorid saxlayan həblərdən istifadə edilir.

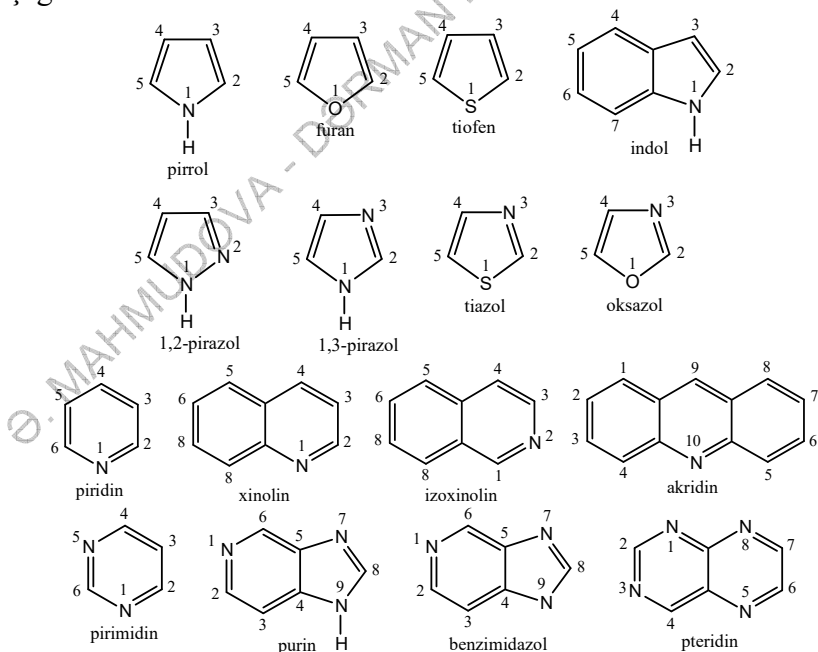
12. HETEROTSİKLİK BİRLƏŞMƏLƏR, TƏSNİFATI VƏ ÜMUMİ XARAKTERİSTİKASI

Tsiklin tərkibində karbon atomunun başqa, bir və ya bir neçə digər element atomu (heteroatom) olan tsiklik üzvi birləşmələrə heterotsiklik birləşmələr deyilir.

Həlqənin ölçüsü müxtəlif ola bilər. O, cümlədən, doymuşluq dərəcəsinə görə heterotsiklik birləşmələr – doymuş, doymamış və aromatik ola bilər.

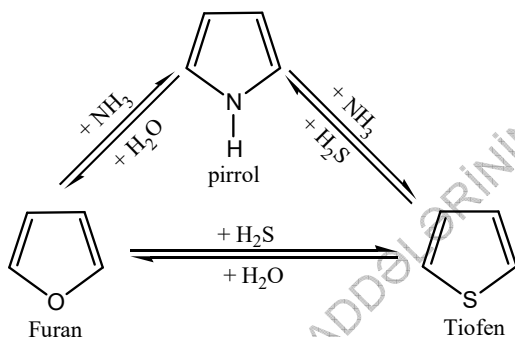
Təbiətdə tərkibində heteroatom olaraq oksigen, azot, kükürd olan beş və altıüzvlü aromatik heterobirləşmələr daha geniş yayılmışdır.

Müxtəlif təbii fizioloji aktiv maddələrin və dərman vasitələrinin tərkibinə daxil olan mühüm heterotsikllər aşağıdakılardır:



12.1 Beş üzvlü bir heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr

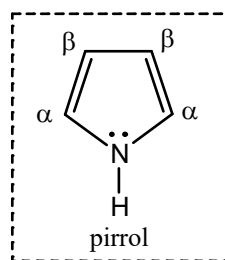
Bu qrupa beş üzvlü aromatik heterotsikllərə pirrol, furan və tiofen daxildir. Hər üç heterotsikl 400°C -də Al_2O_3 katalizatoru iştirakı ilə bir-birinə çevrilə bilər. (Yuriyev reaksiyası)



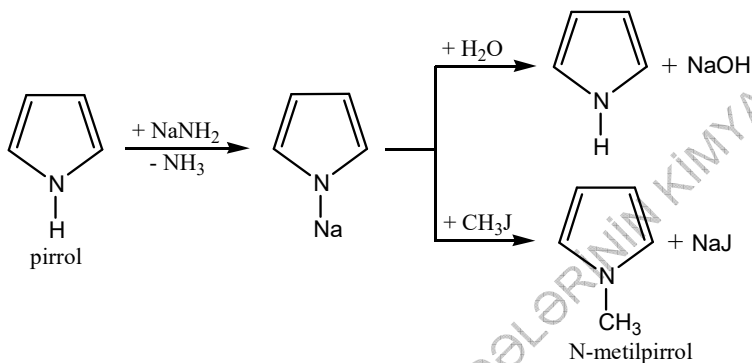
Hər üç maddədə həlqə daxilində elektron sıxlığı çoxdur. Buna görə də bu birləşmələr benzolla müqayisədə elektrofil əvəzetmə reaksiyalarına meyllidirlər və asan oksidləşirlər.

Pirrol – rəngsiz, praktiki olaraq suda həll olmayan, havada asan qonurlaşan mayedir. Pirrolda 2α və 2β vəziyyət vardır.

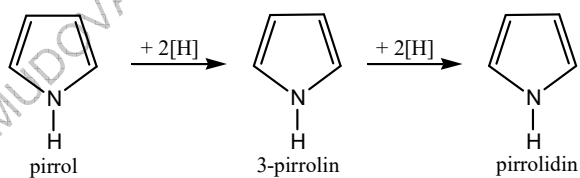
Pirrol da benzolda olduğu kimi müstəvi quruluşlu altielektronlu π -sistemə malikdir; sp^2 -hibrid halında olan 4 ədəd karbon atomunun hər birində bir ədəd və pirrolun sp^2 -hibrid halında azot atomunda isə bir cüt elektronun varlığı pirrolun aromatikliyini şərtləndirir. Azotun bu elektronları aromatik həlqənin bir hissəsidir, sərbəst deyildir və buna görə də pirrol praktiki olaraq əsasi xassələr göstərmir. Natriumla, kaliumla və natrium-amidlə (NaNH_2) reaksiyada pirrolun $-\text{NH}$ qrupu əksinə turşu xassəsi



göstərir. Alınan duzlar - natrium-pirrolat və ya kalium-pirrolat su ilə parçalanaraq ilkin pirrolun və qələvi-metalın hidroksidini əmələ gətirir.



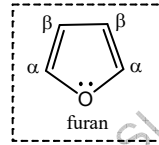
Pirrol - turşuların təsirinə qarşı davamsızdır, pirrolu mineral turşularla qızdırdıqda tünd rəngli qatı qətran alınır. Buna görə də, pirrolda əvəzetmə reaksiyaları qələvi mühitdə aparılır. Pirrolda α -vəziyyət daha çox reaksiyaya qabildir. Əgər o, tutulubsa, əvəzlənmə β -vəziyyətdə baş verir:



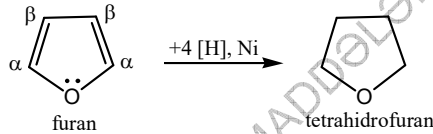
Pirrolidin (tsiklik ikili amin) qüvvətli əsasi xassəlidir. Onun həlqəsi bir sıra təbii birləşmələrin, dərman maddələrinin tərkibinə daxildir.

12.2 Furan və onun törəmələri

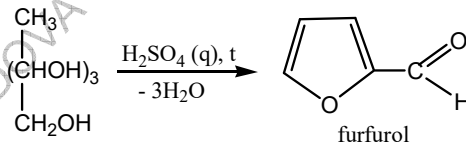
Furan da pirrol kimi mineral turşuların təsirindən həlqənin qırılması ilə nəticələnən polimerləşməyə məruz qalır və qətranlar əmələ gətirir.



Furan asanlıqla əvəzetmə reaksiyalarına daxil olur. Əvəzləyici α -vəziyyətdə daxil olur. Furan Ni katalizatoru iştirakı ilə hidrogenləşdikdə tetrahidrofuran alınır. Sonuncu maddədən həlledici kimi və 1,4-dibrombutan almaq üçün istifadə edilir:



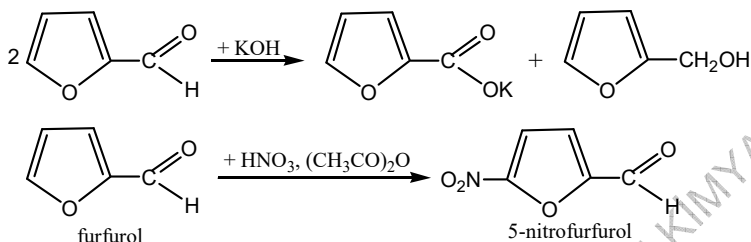
Ən mühüm törəməsi furfuroldur. Furfurol ağac emalı sənayesinin tullantılarından tərkibində təbii karbohidratlar olan bitki xammalını emal etməklə alırlar.



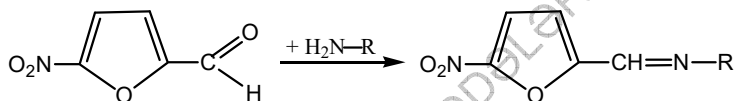
Furfurol aldehidlərə xas olan Kannisaro reaksiyasına daxil olur:

Furfurol kimyəvi xassəcə benzaldehidi xatırladır. O, asanlıqla reduksiya olunaraq uyğun spirtə çevrilir. Furfurolun 5-nitrotörəmələri güclü bakterisid xassəlidirlər. 5-nitrofurfurolu almaq üçün furfurol sirkə anhidridinin iştirakı ilə nitrolaşdırılır, sirkə anhidridindən istifadə etməkdə məqsəd aldehid qrupunu

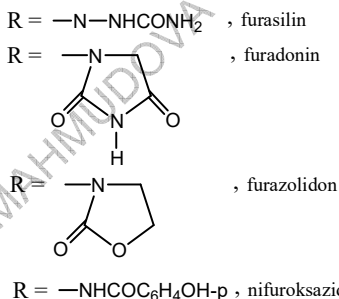
oksidləşmədən qorumaqdır və sonuncunun tərkibində amin qrupu olan birləşmələrlə kondensləşməsindən uyğun törəmələri sintez edilir:



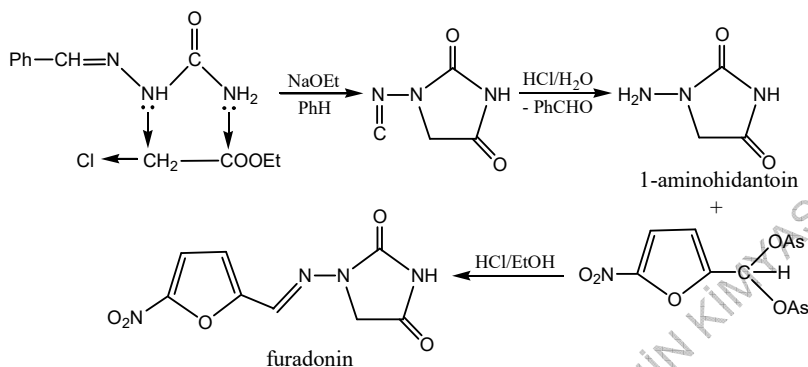
Sonrakı mərhələdə 5-nitrofurfurola müxtəlif aminlərlə təsir edirlər:



Ən çox istifadə olunan bu tip dərman maddələri furasilin, furazolidon və furadonindir. Bunlar qrammənfi və qrammüsbət bakteriyalar (bağırsaq çöpu, qarın yatalağı və s.) tərəfindən törədilən irinli-iltihablarda effektiv preparatlardır:

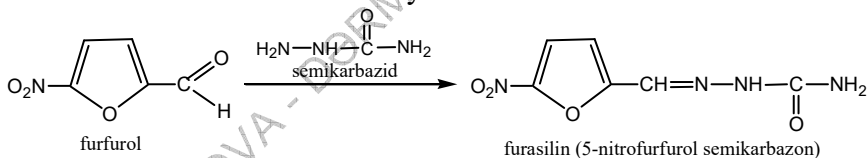


Furadonin alınması amin komponent olan 1-aminohidantonin nitrofurfurolun asetal forması ilə kondensləşməsi nitrofuran sırası dərman maddələrinin alınması üçün tipik reaksiyadır:



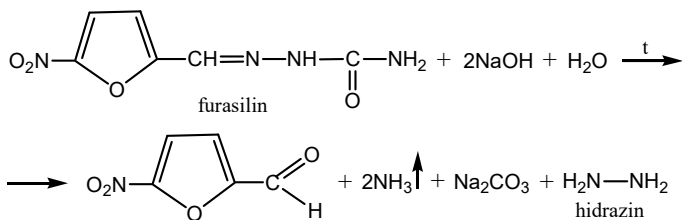
1-aminohidantoin xlor sirkə turşusunda xlor atomunun semikarbazonla əvəz edilməsi və molekul daxili tsikloaminləşməsi ilə alınır. Bu reaksiya natrium etilatın spirtdə məhlulunun iştirakı ilə qızdırmaqla aparılır. Alınmış birləşmədə azometin qrupu turş mühitdə hidroliz nəticəsində sərbəst 1-aminohidantoinə çevrilir.

Furazolidon analoji olaraq 5-nitrofurfurolun 3-aminooksazolidonla kondensasiyası nəticəsində alınır:



Nitrofuranın törəmələri olan bu preparatlar fiziki xassələrinə görə oxşar olub, iysiz sarı yaşılmıtl kristallik maddələrdir, acı dadlıdır. Onlar spirtdə və suda çox pis həll olurlar, demək olar ki, həll olmur. Dimetilfuramiddə pis həll olurlar.

Furasilini qələvi məhlulunda qızdırdıqda, ammoniyakın alınması ilə parçalanır:

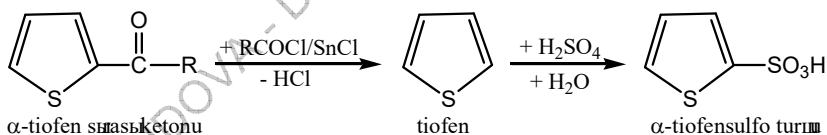
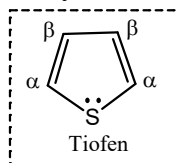


Bu reaksiya ilə furasilini furazalidondan ayırmaq mümkündür.

Furasilin irinli proseslərində, furodonun sidik yollarının iltihab proseslərində, furazolidon dizenteriya, paratit, qarın yatalağı və s. xəstəliklərdə tətbiq edilir.

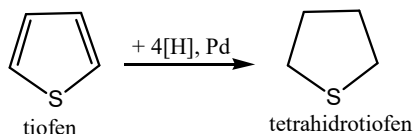
Tiofen kimyəvi və fiziki xassələrinə görə benzola yaxındır. Tiofen daş kömür qətranının tərkibində olur.

Tiofen pirrol və furana nisbətən elektrofil əvəztmə reaksiyalarına asan daxil olur, lakin mineral turşuların təsirinə davamlıdır. Məsələn, tiofen H_2SO_4 ilə bilavasitə sulfolaşır, tiofen-2-sulfoturşu alınır, nitrolaşdıqda isə 2-nitrotiofen alınır: asilləşdikdə isə tiofen sırası ketonları əmələ gətirir.



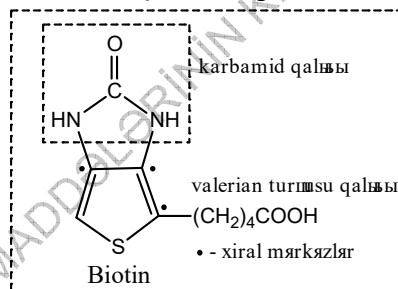
Tiofen törəmələri iltihab əleyhinə, antiseptik və yerli keyləşdirici təsirə malik olan ixtiol mazının tərkibinə daxildir.

Tiofen Pd katalizatoru iştirakı ilə hidrogenləşdikdə tetrahidrotiofen alınır.

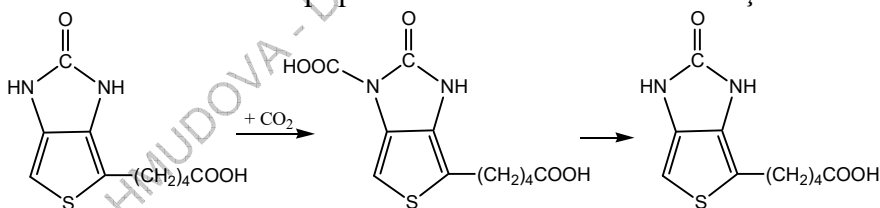


Biotin vitamini (vitamin H) tetrahidrotiofenin törəməsidir: o, çatışmadıqda orqanizmdə zülal və yağ mübadiləsi pozulur və dəri xəstəlikləri yaranır. Biotin molekulu tetrahidrotiofen həlqəsi ilə kondensləşmiş karbamid qalığı və valerian turşusu fraqmentindən ibarət bitsiklik sistemdir.

Biotin molekulunda üç xiral mərkəz vardır, buna görə də onun səkkiz fəza izomeri mümkündür. Bunlardan yalnız biri – (+)-biotin təbiətdə tapılıb, onun quruluşunda xiral mərkəzlərlə bağlı olan hər üç hidrogen atomu bir-birinə nisbətən sis-vəziyyətdədirlər.



Biotin karboksil qruplarının *in vivo* ötürülməsində iştirak edir:



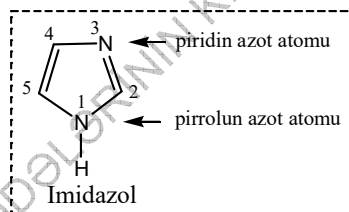
12.3. Beş üzvlü iki heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr

Qoşulmuş ikiqat rabitəli beş üzvlü həlqədə bir neçə heteroatom olduqda həlqədə elektron sıxlığının qeyri-bərabər paylanması bu birləşmələrin kimyəvi xassələrində özünü əks etdirir.

Elektrofil və nukleofil hücumların istiqamətlərini müəyyənləşdirir. Beş üzvlü iki heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr daha stabildirlər və onlarda elektrofil əvəzetmə reaksiyasında aktivlik aşağıdır. Bu birləşmələr üçün tautomer çevrilmələr və molekullarası hidrogen rabitələri əmələ gətirmək meyli xarakterikdir.

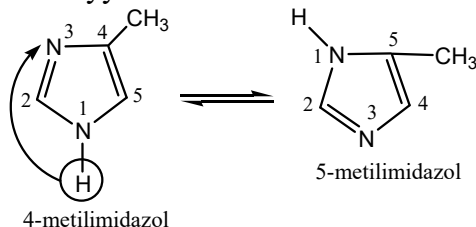
Mühüm nümayəndələri imidazol, pirazol, oksazol və tiazoldur.

İmidazol – həlqədə 1-ci və 3-cü vəziyyətdə iki ədəd azot atomu olan heterotsikldir. Bu atomlardan biri pirroldakı azot atomuna oxşardır və imidazolun zəif turşu xassələrinə cavabdehdir.



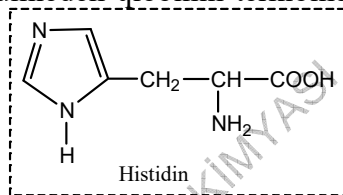
Digər azot atomu “piridin” azotuna oxşayır və imidazolun zəif əsası xassələrini müəyyənləşdirir. Beləliklə, imidazol amfoter birləşmədir, qüvvətli turşularla və qələvi metallarla duzlar əmələ gətirir.

Molekul daxili hidrogen mübadiləsi nəticəsində heterotsikllərdə prototrop tautomerliyi yaranır. Hidrogenin keçidi sürətlə baş verdiyindən (təqribən saniyədə 10 dəfə) 4 və ya 5-monoəvəzlənmiş imidazolları ayırmaq mümkün olmur. Buna görə də bu birləşmələri 4-(5-metilimidazol) kimi işarə edirlər. Bu onu göstərir ki, tautomerin birində metil qrupu 4-cü vəziyyətdə, digərində isə 5-ci vəziyyətdədir.

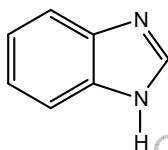


İmidazolun böyük bioloji əhəmiyyəti olan bir çox törəmələrinə təbiətdə rast gəlinir. Bunlardan ən mühümləri histidin α -aminturşusu və onun dekarboksilləşmə məhsuludur.

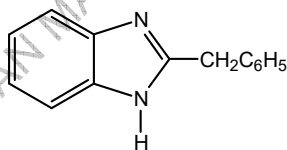
İmidazol – bir çox zülalların, o cümlədən qlobinin tərkibinə daxildir. Hemoqlobində imidazol fraqmentinin “piridin” azotu hesabına qlobin zülalı hemin dəmir atomu ilə birləşir. İmidazol həlqəsi bəzi alkaloidlərin tərkibində rast gəlinir.



Benzilimidazol – imidazol həlqəsinin benzol həlqəsi ilə kondensləşməsindən alınan heterotsikldir. Benzilimidazol bir çox təbii birləşmələrin, o cümlədən B₁₂ vitaminin, bir sıra dərman maddələrinin, məsələn, qan təzyiqini aşağı salan dibazolun tərkibinə daxildir.



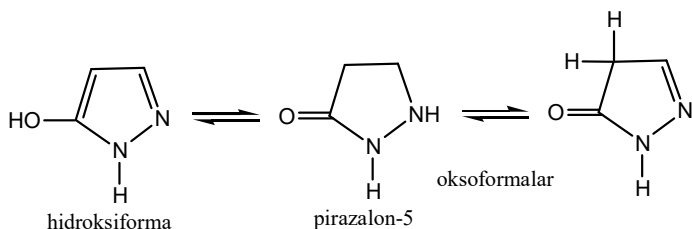
benzilimidazol



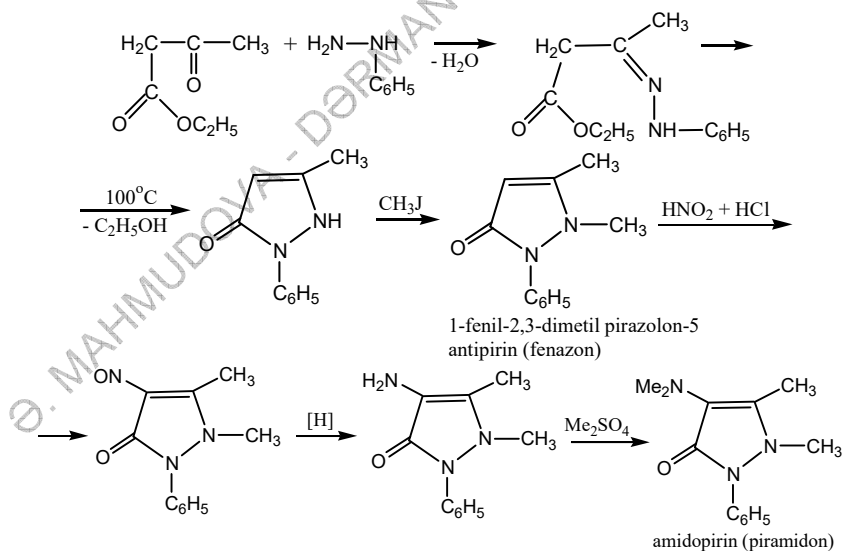
2-benzilbenzimidazol (dibazol)

Pirazol – imidazolun izomeridir. Pirazol həlqəsində azot atomları yanaşı yerləşiblər. Kimyəvi xassəcə bunların oxşarlıqları çoxdur. Pirazol amfoter xassəlidir. Pirazolun monotörəmələri üçün prototrop tautomeriya xarakterikdir.

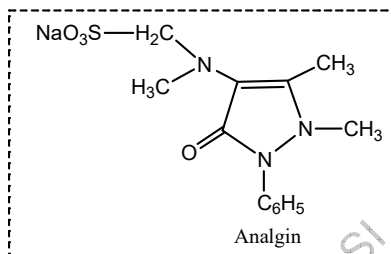
Pirazolun törəmələrinə təbiətdə rast gəlinməyib, lakin ondan lazımi dərman maddələri hazırlanır. Onların əksəriyyəti pirazalon-5 əsasında alınır. Pirazalonun hidroksi və iki oksiformaları arasında tautomer tarazlıq vardır:



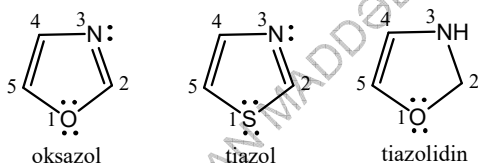
Pirazolon sırası dərman maddələrinin sintezi üçün ilkin maddə kimi asetosirkə efirindən ($\text{CH}_3\text{--CO--CH}_2\text{--COOC}_2\text{H}_5$) istifadə edilir. Onun fenilhidrazinlə kondensləşməsindən 1-fenil-3-metilpirazon-5 alınır. Bu maddənin isə metilləşməsindən 1-fenil-2,3-dimetilpirazon-5 (antipirin) əmələ gəlir. Antipirin aromatik xassəlidir. Onun 4-cü vəziyyətdə nitrolaşdırıb, sonuncunun reduksiya olunması və metilləşməsi nəticəsində 1-fenil-2,3-dimetil-4-dimetilaminopirazon-5 alınır:



Antipirin və amidopirin tibbdə hərarəti aşağı salan, ağrəkəsici və sakitləşdirici təsirə malik dərmanlar kimi istifadə edilir. Amidopirinin sulfotörəməsi olan analgin pereparatı isə aktivliyinə və təsir sürətinə görə antipirin və amidopirindən yüksəkdir.

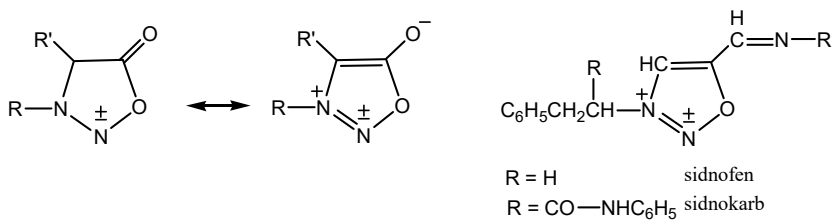


Oksazol və tiazol – iki müxtəlif heteroatomlu beşüzvlü heterotsiklik birləşmələrin nümayəndəsidir. Onlara imidazolda NH–qruplarının oksigen və kükürd atomları ilə əvəzlənmiş analogları kimi baxmaq olar.



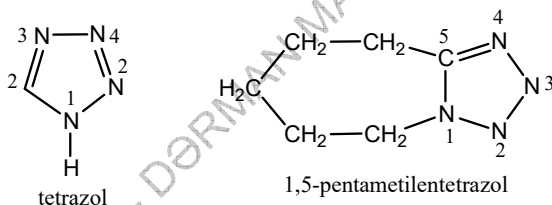
Oksazol və tiazol – zəif əsaslardır, elektrofil əvəzetmə reaksiyasına çətin daxil olurlar.

Tiazol həlqəsi B₁ vitaminin (tiamin) və kokarboksilaza kofermentinin, həmçinin bəzi dərman maddələrinin, məsələn, norsulfazolun tərkibinə daxildir. Tam hidrogenləşmiş tiazol həlqəsi – isə penisillin antibiotikin quruluş fraqmentidir. Üç heteroatomlu beşüzvlü heterotsiklik birləşmələrin xüsusi nümayəndələri 1,2,3-oksadiazolun törəmələri – sidnonlar adlanır. Onlar mezoion birləşmələrinə aiddirlər. Bu birləşmələrin quruluşu adi valent rabitələri ilə ifadə oluna bilmir, buna görə də onların tərkibini bir neçə ion formulu ilə əks etdirirlər.



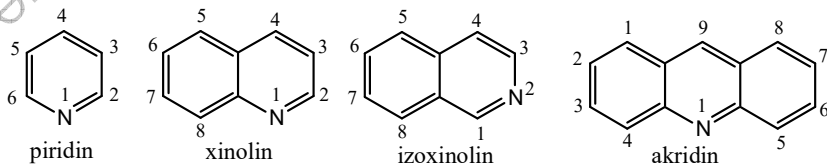
Bəzi sidnonlardan tibb praktikasında psixikani stimullaşdıran vasitələr kimi istifadə edirlər. Bunlara sidnoiminin törəmələri olan sidnofen və sidnokarb aiddirlər.

Tetrazol – dörd müxtəlif heteroatomlu beşüzvlü heterotsiklik birləşmələrin nümayəndəsidir. Onun törəməsi olan 1,5-pentametilen-tetrazol – korazol, tibb praktikasında mərkəzi sinir sisteminin stimulyatoru kimi istifadə olunur:

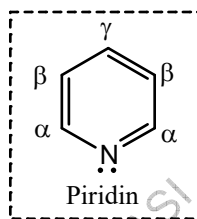


12.4. Altı üzvlü bir heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr

Bu qrupa piridin, xinolin, izoxinolin, akridin aiddirlər. Bunlardan ən vacibi piridindir.

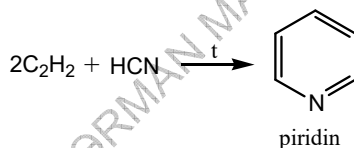


Piridin C_5H_5N su və üzvi həlledicilərdə yaxşı həllolan, xarakterik iyli, zəhərli, rəngsiz mayedir. Onun buxarları ilə nəfəs almaq ağır əsəb xəstəliyinə səbəb ola bilər. Piridin və onun homoloqları az miqdarda daş kömür qətranında olur.

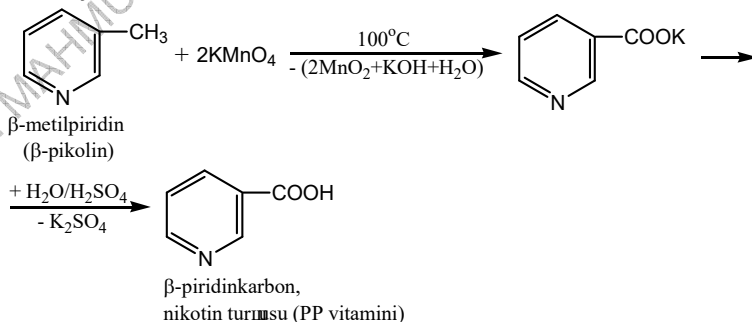


Piridin əsasi xassəsi aromatik heterotsiklik birləşmədir. Piridində azot atomu sp^2 -hibrid vəziyyətindədir, elektron-akseptor xarakterlidir. Azotun elektromənfililiyi karbon atomundakından böyük olduğundan, piridində benzola nisbətən elektron çatışmazlığı var. Nəticədə, piridin elektrofil əvəzetmə reaksiyasına çətin daxil olur, çətin oksidləşir, lakin asan hidrogenləşir.

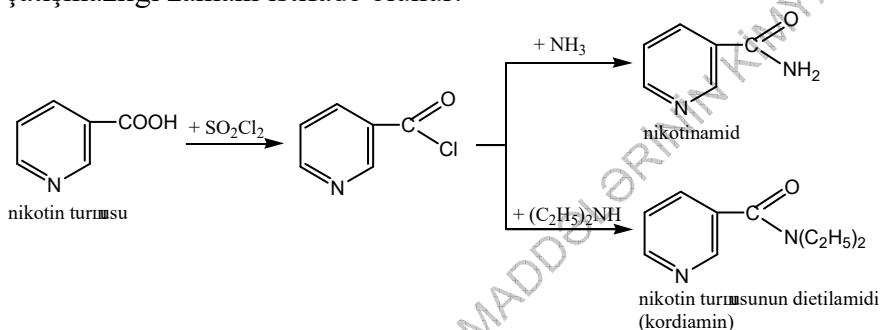
Közərmiş borudan asetilen və hidrogen sianid qarışığı buraxdıqda piridin alınır:



Piridinin homoloqları asan oksidləşərək müvafiq piridin karbon turşularına çevrilirlər, bu zaman piridin həlqəsi dəyişməz qalır. Məsələn: β -pikolin, β -pikolinkarbon turşusuna və ya nikotin turşusuna çevrilir:

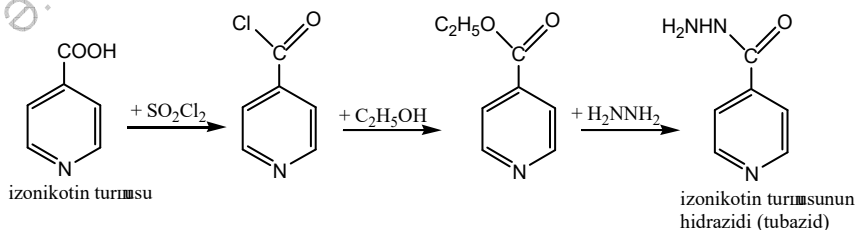


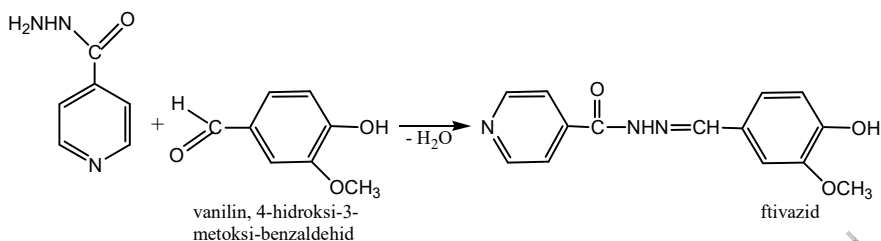
Nikotin turşusu və onun amidi, nikotinamid tibbdə pellaqra xəstəliyinin müalicəsində istifadə olunur, PP (B₅) vitaminin iki forması kimi tanınır. Nikotin-amid oksidləşmə-reduksiya reaksiyalarına kataliz edən ferment sistemlərinin tərkib hissəsidir, damarları genişləndirir, nikotin turşusunun dietilamidi - kordiamin isə mərkəzi sinir sisteminin stimullaşdıran vasitədir, ürək çatışmazlığı zamanı istifadə olunur:



γ -Pikolinin oksidləşməsindən γ -pikolinkarbon turşusu və ya izonikotin turşusu alınır. Bu turşu əsasında isə vərəm əleyhinə olan tubazid və ftivazid preparatları alınır.

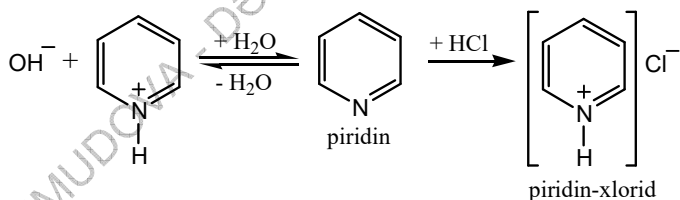
Tubazid (izonikotin turşusunun hidrazidi) almaq üçün izonikotin turşusunu ardıcıl olaraq tionilxloridlə, etanolla və sonra hidrazinlə işləyirlər. Tubazid həddən artıq zəhərliyədir. Onun zəhərliyini azaltmaq üçün aromatik aldehid olan vanilinlə işləyirlər, nəticədə ftivazid alınır:



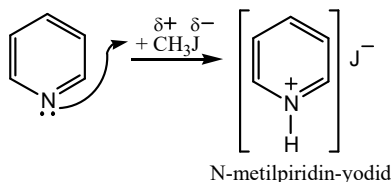


Piridin zəif əsası xassələrə malikdir. Bu da piridin azot atomunda sərbəst elektron cütünün varlığı ilə izah edilir. Piridin suda məhlulu lakmusu göy rəngə boyayır: mineral turşuların təsirindən isə piridin duzlarının kristalları əmələ gəlir.

Piridin əsası xassələri alifatik aminlərin əsası xassələrindən xeyli zəifdir. Bu da azot atomlarının sp^2 -hibrid vəziyyətdə olması ilə əlaqədardır. Piridində olan azot atomunun elektromənfililiyi adi aminlərdə sp^3 -hibrid halında olan azot atomunun elektromənfililiyindən böyük olduğundan, elektron cütünü özündə daha davamlı saxlayır:

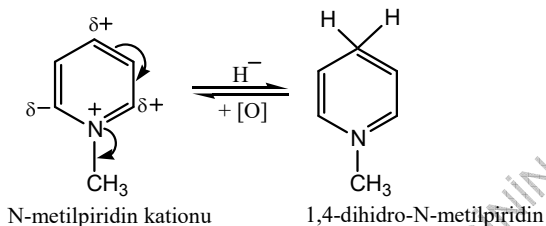


Piridində azot atomu nukleofil xassəlidir. Piridini alkilhalogenidlərlə işlədikdə dördlü alkilpiridin duzları alınır.

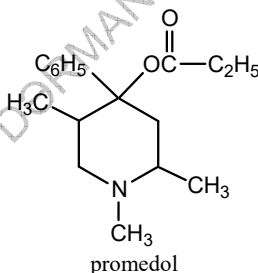


Bu cür duzlarda azot atomunun müsbət yükü hesabına piridin heterotsiklində elektron çatışmazlığı daha da böyük olur və nukleofil hücumə həssas olurlar.

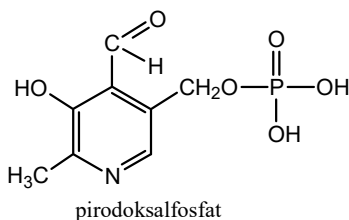
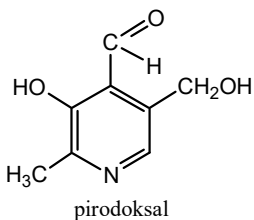
N-metilpiridin kationu reduksiya olunduqda 1,4-dihidro-N-metilpiridin alınır:



Piridin reduksiya benzolə nisbətən daha mülayim şəraitdə baş verir. Piridin hidrogenləşdikdə heksahidropiridin (piperidin) alınır. Piperidin həlqəsi ağrıkəsici dərman olan promedolun tərkibinə daxildir.

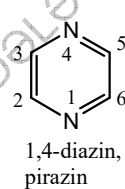
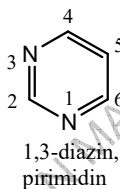
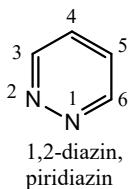


Piperidin və piridin nüvələrinə bir çox alkaloidlərdə rast gəlinir. Piridin əsas törəmələrindən olan bir sıra B qrup vitaminləri kofermentlər rolunda çıxış edirlər. Məsələn piridoksalın törəməsi olan piridoksalfosfat α -aminturşuların alınması ilə nəticələnən təkraraminləşmə reaksiyasının əsas iştirakçısıdır:



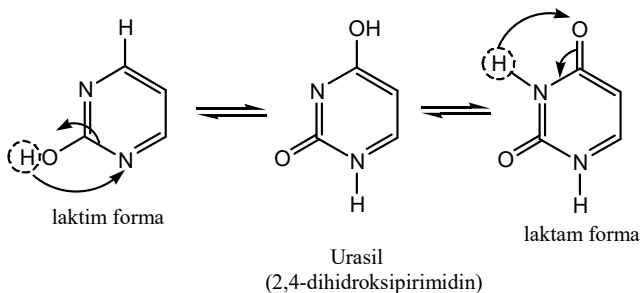
12.5. Altı üzvlü iki heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr

Bu qrupa bir-birinin izomeri olan piridazin, pirimidin və pirazin aiddirlər. Ümumi adları diazinlərdir.



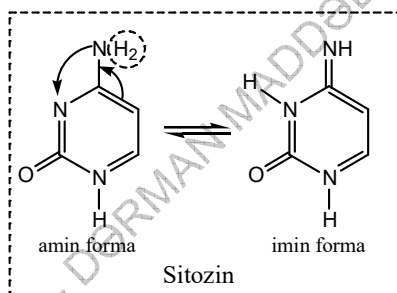
Bunların üçü də, yüksək ərimə temperaturuna malik, suda həllolan maddələrdir. Molekulları arasında davamlı hidrogen rabitələri vardır. Bu rabitələr nuklein turşularının quruluşunun formalaşmasında böyük rol oynayır.

Piridin həlqəsinə ikinci azot atomunun daxil edilməsi heterotsiklik həlqənin aktivliyini elektrofil əvəzetmə reaksiyalarında piridinlə müqayisədə azaldır. Bu zaman eyni zamanda diazinlərin əsasiliyi də azalır. Diazinlərin 1 molu yalnız 1 mol qüvvətli turşu ilə reaksiyaya girir və praktiki olaraq elektrofil əvəzetmə reaksiyalarına daxil olmurlar. Piridin tərəmələri urasil, sitozin, timin nuklein turşularının tərkib hissələridir. Onlar üçün laktim-laktam tautomerliyi xarakterikdir:

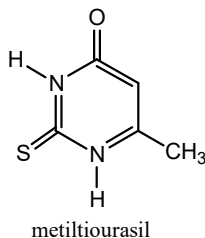
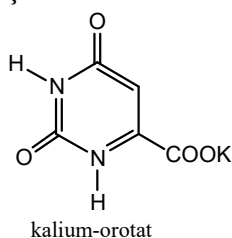


Adətən, tarazlıqda laktam forma (oksi forma) üstünlük təşkil edir. Hər iki halda aromatiklik şərti pozulmur.

Pirimidinin amin törəmələri üçün həmçinin, sitozində də mümkündür. Məsələn: sitozində amin forma üstünlük təşkil edir.

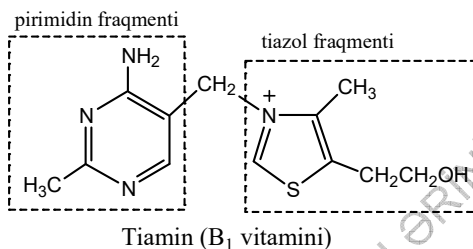


Bunların törəmələrindən dərman maddələri kimi istifadə olunur. Məsələn: urasil-6-karbon turşusunun (orat turşusu) kalium duzu mübadilə proseslərində stimulyatordur, metiltiourasil isə qalxanabənzər vəzin pozulması ilə bağlı olan xəstəliklərin müalicəsində işlədilir:



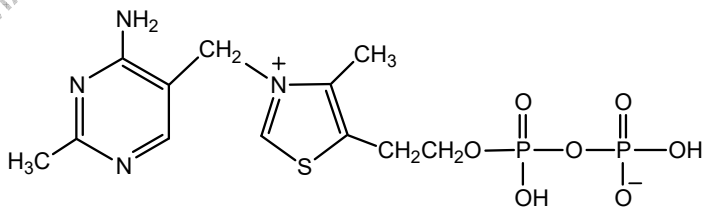
Pirimidin törəmələri bir sıra alkaloidlərin və sulfanamidlərin tərkibinə daxildir. Pirimidin törəmələrində hidroksil qruplarının olması onlara turşu xassəsi verir.

Tiamin - (B₁ vitamini) quruluşca bir-birilə metilen qrupu ilə birləşən pirimidin və tiazol həlqələrindən ibarətdir.



Burada tiazol azotu müsbət yükə malikdir (ammonium azotdur) və B₁ vitamini adətən, dörd əvəzlənmiş ammonium duzu (tiaminxlorid və ya tiaminbromid) şəklindədir. Neytral və qələvi mühitdə tiamin asan parçalanır. B₁ vitaminin orqanizmdə çatışmaması Şərqdə “beri-beri” adlanan ağır xəstəliyə səbəb olur.

B₁ vitamini orqanizmdə ona görə lazımdır ki, o, α-aminturşuların dekarboksilləşməsində və asetilkoferment A maddəsinin sintezində iştirak edən kokarboksilaza kofermentinin quruluşuna daxildir. Kokarboksilaza - tiaminlə difosfat (pirofosfat) turşusunun mürəkkəb efiridir, başqa sözlə tiamindifosfatdır.



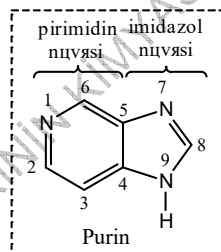
Tiamindifosfat (kokarboksilaza)

13. KONDENSLƏŞMIŞ HETEROTSİKLİK BİRLƏŞMƏLƏR

13.1 Purin əsasları

Purin əsasları təbiətdə purin və pteridin sırası birləşmələri şəklində yayılmışdır.

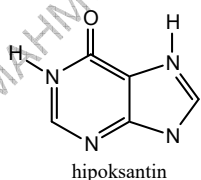
Purin sistemi aromatikdir. Bu da ikiqat rabitələr üzrə 8π -elektronu və 9-cu vəziyyətdə azot atomunun bölünməmiş elektron cütünə malik olması ilə əlaqədardır. Bu isə Hükkel ($4n+2$; $n=2$) qaydasına uyğundur.



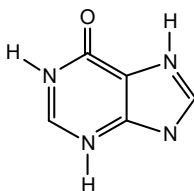
Purin 216°C -də əriyən, suda yaxşı həll olan maddədir, oksidləşdiricilərin təsirinə davamlıdır, amfoter xassəlidir, qüvvətli turşularla və qələvi metallarla duz əmələ gətirir.

Purinin ən mühüm birləşmələrindən olan hidroksi və aminpurinlər həyat fəaliyyəti prosesində iştirak edirlər.

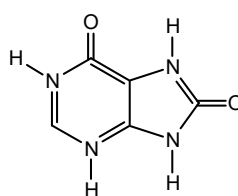
Hidroksipurinlərə bunlara aiddirlər: 6-hidroksipurin və ya hipoksantin. 2,6,8-trihidroksipurin və ya sidik turşusu orqanizmdə nuklein turşularının metabolizmində əmələ gəlirlər. Onlar kristal halda laktam formasındadırlar.



hipoksantin



ksantin

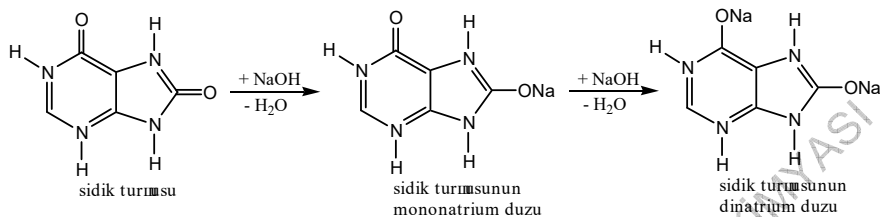


sidik turşusu

Hidroksipurinlərdə laktim-laktam tautomerliyi mümkündür.

Sidik turşusu orqanizmdə purin birləşmələrinin metabolizminin son məhsuludur, sutkada sidikdə 0,1-1q ayrılır. Bu,

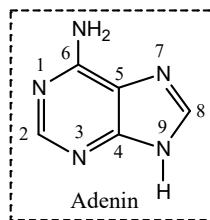
ikiəsaslı turşudur, suda pis, lakin qələvilərdə isə yaxşı həll olur. NaOH ilə mono- və ya dinatrium duzları əmələ gətirir.



Sidik turşusunun duzlarına uratlar deyilir. Orqanizmdə bəzi pozulmalar zamanı (məsələn, podaqra xəstəliyində) bu duzlar oynaqlarda, həmçinin böyrəklərdə daş şəklində toplanır.

Sidik turşusunu nitrat turşusu ilə qızdırıb, sonra soyudulmuş reaksiya qarışığı üzərinə ammoniyak əlavə etdikdə, intensiv bənövşəyi rəng əmələ gəlir. Bu xassədən purin törəmələrini təyin etmək üçün istifadə edirlər (mureksid reaksiyası).

Ksantin və hipoksantin kimyəvi xassələrinə görə sidik turşusuna çox oxşardır. Onlar amfoterdlər, turşu və qələvilərlə duzlar əmələ gətirirlər. Ksantinin N-metil törəmələri alkaloidlərə aiddirlər. Bunlardan kofein, teofillin və teobromin dərman maddələri kimi tibbdə geniş istifadə edilir.

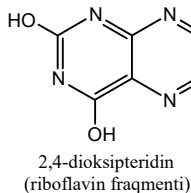
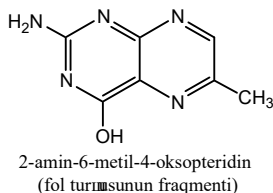


Bunların ən mühümləri 6-amin purin və ya adenin 2-amin-6-hidroksipurin və ya quanin-nuklein turşularının tərkibində mütləq vardır. Adenin həmçinin bəzi kofermentlərin tərkibinə də daxildir.

Adenin üçün N-7 və N-9 atomları arasında hidrogen atomlarının yerdəyişməsi hesabına yaranan prototrop tautomerliyi mümkündür. Suda məhlulda HN-7 tautomerin miqdarı 2,5 dəfə çoxdur.

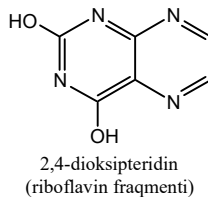
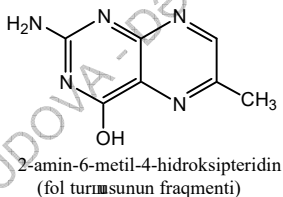
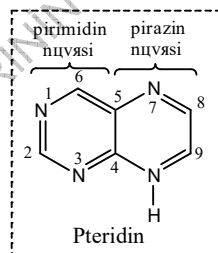
Adenin və quaninə nitrit turşusu ilə təsir etdikdə onların

dezaminləşməsi baş verir, uyğun olaraq hipoksantin və ksantin əmələ gəlir.

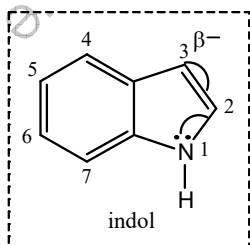


Pteridin – pirimidin və pirazin nüvələrinin kondensləşməsindən əmələgələn bitsiklik heterotsikldir. Pteridin sistemi aromatikdir, oksidləşdiricilərə qarşı davamlıdır, əsası xassələr göstərir.

Təbiətdə ən çox yayılanları hidroksi və aminpteridinlərdir. 2-Amin-6-metil-4-oksopteridin qalığı fol turşusunun, 2,4-dioksopteridin fragmenti isə riboflavinin (B₂ vitamini) tərkibinə daxildir.



İndol (benzopirrol) – benzol və pirrol həlqələrindən ibarət olan kondensləşmiş heterotsiklik birləşmədir.

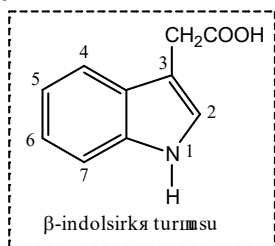


İndol aromatikdir. Naftalinə uyğun olaraq, onun π -sistemi 10 elektrondan ($4n+2$, $n=2$) təşkil olunub. Xassələrinə görə, indol pirrolu xatırladır. İndolun praktiki əsası xassələri yoxdur, asidofobdur, havada oksidləşmə nəticəsində tez qonurlaşır.

Elektrofil əvəzetmə reaksiyalarına asan daxil olur, əvəzlənmə əsasən, indolun pirrol həlqəsində β -vəziyyətdə (3-cü atomda) baş verir.

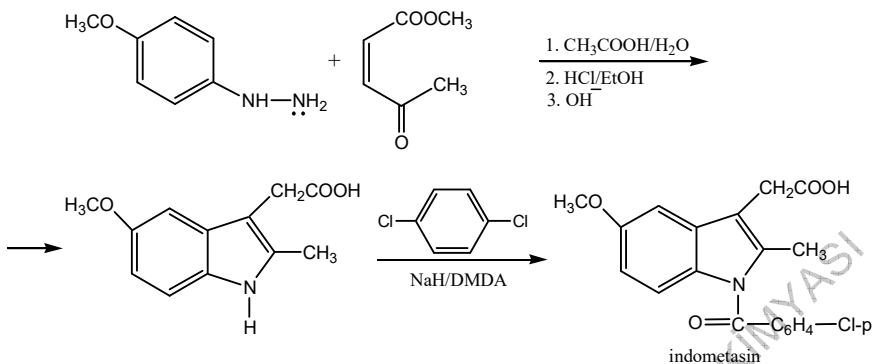
Bunlara ilk növbədə triptofan və onun metabolik çevrilmə məhsulları aiddirlər.

Triptofan – bitki və heyvan orqanizmlərində polipeptidlərin tərkibinə daxildir. Triptofanın çevrilməsindən alınan əsas məhsul serotoninidir. Fərz edilir ki, o, baş beynin neyromediatorlarından biridir. Orqanizmdə onun normal mübadiləsi pozulması şizofreniya xəstəliyinə gətirir. Serotonin oksidləşərək indolilsirkə turşusu şəklində sidiklə xaric olur.

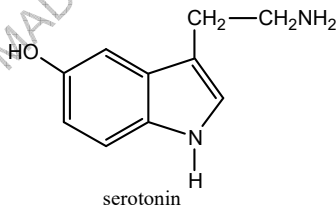
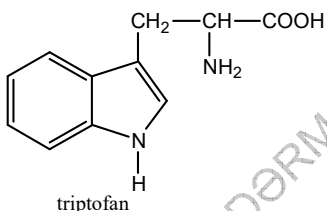


Triptofanın digər çevrilmə məhsulu β -indolilsirkə turşusu – **heteroauksin** adlanır. Heteroauksin bitkilərin boy hormonudur və kənd təsərrüfatında istifadə edilir. Bitki və heyvan orqanizmlərində polipeptidlərin tərkibinə daxildir.

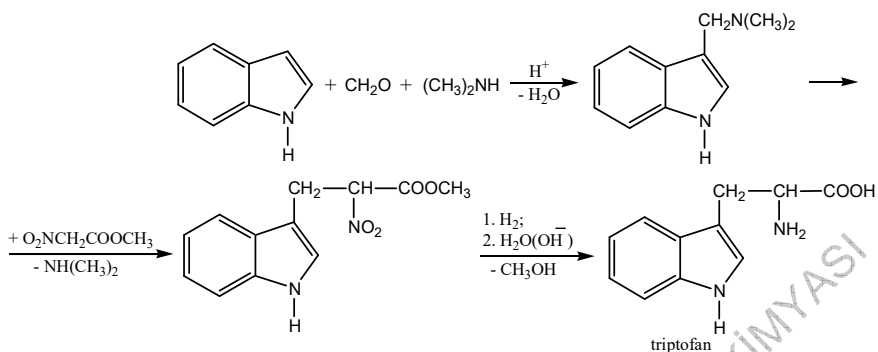
3-İndolil sirkə turşusunun törəməsi indometasin aktiv iltihab əleyhinə dərman vasitəsi olub revmatizm, artirit və digər xəstəliklərdə istifadə edilir. İndometasin qeyri-narkotik təsirli analqetikdir, prostaqlandinlərin biosintezinin inhibitorudur. Onun sənaye miqyasında sintezinin əsasını Fişer reaksiyası təşkil edir. Bunun üçün tələb olunan Şiff əsası p-metoksifenilhidrazinin 3-asetilpropion turşusunun metilatla sirkə turşusunda kondensləşməsindən alınır. Alınmış imin etanol və xlorid turşusu qarışığında qaynadılır, alınmış indolil sirkə turşusunun efiri qələvi hidrolizi ilə sərbəst turşuya çevrilir. Sonra p-xlorbenzoilxloridlə NaH iştirakı ilə indometasinə qədər asilləşdirilir:



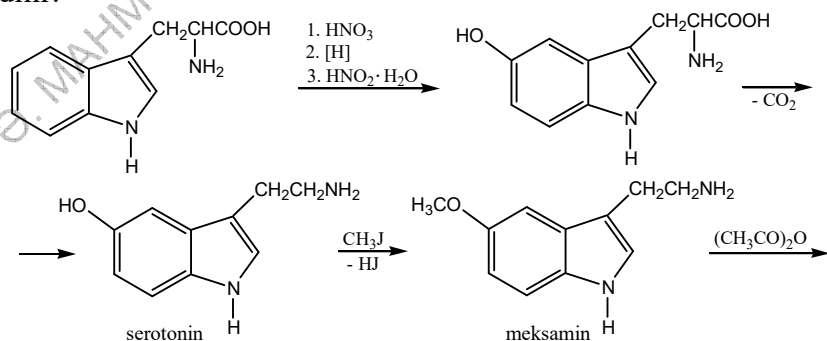
İndol əsasında bir sıra sintetik dərman maddələri alınır. Bunlar antidepressiya və psixikani aktivləşdirmək xassəsinə malikdir.

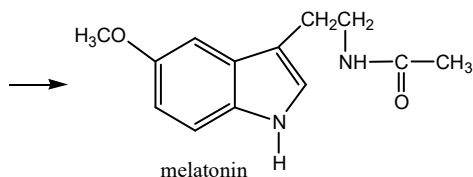


Triptofan həmçinin müalicəvi qida kimi istifadə edilir. Onun sintezinin birinci mərhələsində Mannix metodu əsasında indol aminometilləşdirilir. Alınmış 3-aminometil indol nitrosirkə turşusunun efiri ilə kondensləşdirilir. Reaksiyanın gedişi zamanı bu efinin metilen qrupu protonu ayıraraq karbanion əmələ gətirir ki, sonuncu da indolda dimetilamin qrupunu sıxışdırıb çıxararaq 3-indolilnitropropion turşusunun metilatını əmələ gətirir. Sonra nitro qrup amin qrupuna reduksiya edir və qələvi hidrolizindən triptofan və ya onun natrium duzu alınır.

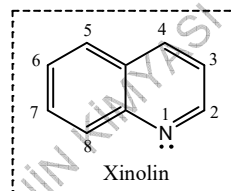


İndolun törəmələri içərisində təbii aminturşu triptofandan başqa digər bioloji aktiv maddələr – biogen amin (mərkəzi sinir sisteminin mediatoru olan serotonin, melatonin hormonu, sintetik dərman vasitəsi olan meksamin tibbi praktikada istifadə edilir). Serotonin hemorraqik sindromlarda trombozların müalicəsində istifadə edilir, hemostatik maddə olaraq qankeçirmənin müddətini qısaldır. Serotonin triptofana 5 vəziyyətinə hidroksil qrupunu daxil edib, amin turşunu dekarboksilləşdirməklə sintez edilir. Bu üsulla alınan serotoninini (3-(2-aminoetil)-5-hidroksiindolu CH_3J -lə metoksilləşdirməklə meksamin (5-metoksitriptamin) alınır ki, bu da şüa xəstəliyinin profilaktikası və müalicəsində istifadə edilir. Sonda meksamində birli amin qrupunun asilləşdirməklə melatonin hormonu sintez edilir. Melatonin yuxugətirici maddə kimi tətbiq edilir:

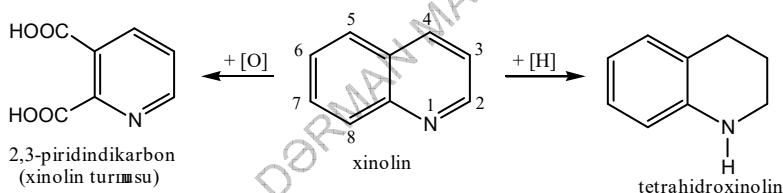




Xinolin - (2,3-benzipiridin) xassəcə piridinə oxşardır. Xinolin əsasi xassəlidir, alkilhalogenidlərin təsirindən dördlü xinolin duzları əmələ gəlir.



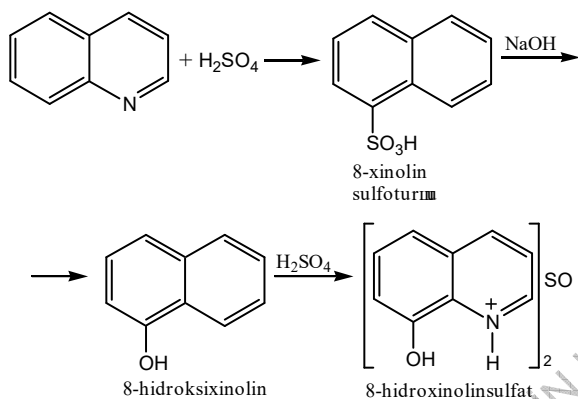
Xinolin reduksiya olunduqda piridin həlqəsi hidrogenləşir, tetrahidroxinolin əmələ gəlir. Oksidləşdikdə isə benzol həlqəsi qırılır, 2,3-piridindikarbon turşusu və ya tetrahidroxinolin alınır:



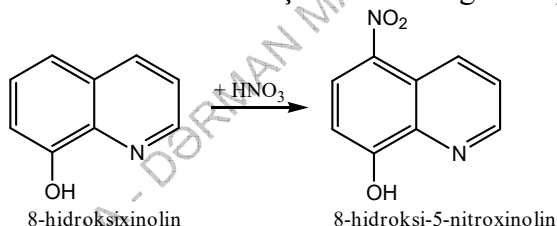
Xinolində elektrofil əvəzetmə reaksiyası benzola nisbətən çətin, lakin piridinə nisbətən asan gedir. Əvəzlənmə əsasən, benzol həlqəsində 5 və 8-ci vəziyyətlərdə baş verir.

Xinolin nüvəsi bir sıra alkaloidlərin və dərman maddələrinin tərkibinə daxildir. Xinolinin sulfolaşmasından alınan sulfoturşunu qələvilərlə əritməklə onu oksinə çevirirlər.

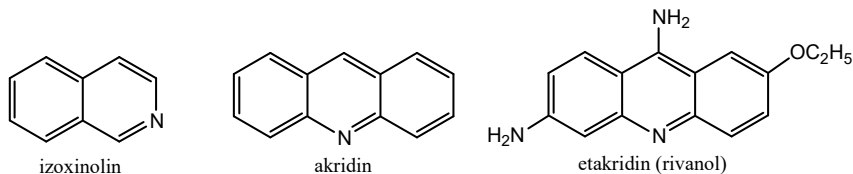
Sonuncunu isə sulfat duzu şəklində antiseptik maddə kimi istifadə edirlər:



8-hidroksixinolinin nitrotörəməsi olan 8-hidroksi-5-nitroxinolin (5-NOK) bakterisid xassəlidir, 8-hidroksixinolinin bir sıra birləşmələri bağırsaq bakteriyalarının həyat fəaliyyətinə lazım olan mikroelement ionları ilə birləşmələr əmələ gətirmişdir:



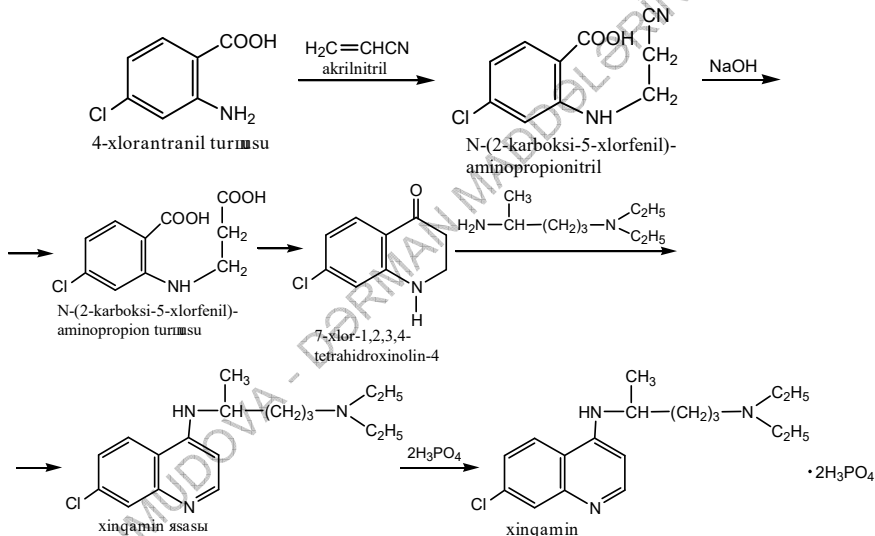
İzoxinolin - xinolinin izomeridir, xassəcə ondan az fərqlənir. Onun nüvəsi morfin və papaverinin tərkibinə daxildir. Akridin və onun törəmələri zəhərli, bəziləri güclü antibakterial xassəlidir. Məsələn, etakridin (rivanol) dezinfeksiyada istifadə olunur. Akrixin adlanan digər törəmədən isə tarixən malyariya xəstəliyinə qarşı istifadə olunub.



13.2 4-Aminoxinolin əsasında alınan dərman maddələri

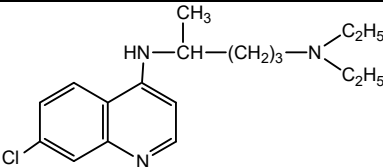
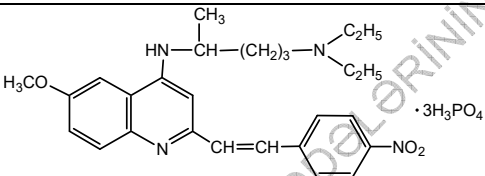
4-Aminoxinolindən alınan dərman maddələrinə xinqamin və trixomonasid aiddirlər. Bu maddələrin sintezinin ümumi prinsipi ilkin olaraq tərkibində karboksil qrupu və xlor atomu olan xinolin nüvəsinin alınmasına əsaslanmışdır. Daha sonra bu nüvəyə dietilaminoalkilamin radikalı birləşir və əsası xassəli maddəni duza çevirir.

Nümunə kimi xinqaminin sintezinin ümumi sxemində baxaq:



Xinqamin və trixomonasid bir-birindən fiziki xüsusiyyətlərinə görə fərqlənilir. Trixomonasid sarı rəngli, xinqamin isə ağ rəngli maddədir. Preparatları həmçinin ərimə temperaturuna görə də fərqləndirmək olar (cədvəl 13.2.1).

Cədvəl 13.2.1. Aminoxinondan alınan maddələrin xüsusiyyətləri.

Maddə	Kimyəvi quruluşu	Təsviri
Chingaminum- Xinqamin	 4-(1'-metil-4'-dietilaminobutilamino)-7-xlorxinolina difosfat	Ağ və ya zəif açıq sarı rəngli, iysiz, acı, kristallik toz. Ərimə temperaturu 214,5- 218 °C
Trichomonacidum- trixomonasid	 2-(4'-nitrostiril)-4-(1'-metil-4'-dietilaminobutilamino)-6-metoksixinolin trifosfat	Sarı və ya qonur sarı amorf toz. Ərimə temperaturu 158-160 °C.

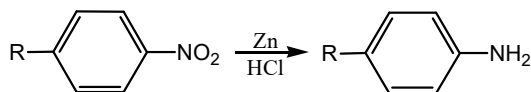
Üzvi əsasların fosfatları olan preparatlar suda yaxşı həll olur, üzvi həlledicilərdə isə ya çox az, ya da praktiki olaraq həll olmur. Su məhlullarda turş reaksiya verir.

QFX-nun həqiqiliyini sınaqdan keçirən zaman maddələrdə fosfat ionlarının aşkar edilməsi məsləhət görülür. Bundan ötrü ammonium molibdatdan istifadə etmək lazımdır. QF X-da maddələrin identifikasiyası üçün həmçinin ultra bənövşəyi sahələrdə spektrofotometriyanın istifadəsi nəzərdə tutulmuşdur. Xinqamin üçün udulmanın (257, 329, 343 nm) 3 maksimumunun olması müəyyənləşdirilir, trixomonasid üçün isə udulmanın 357 nm dalğa uzunluğunda xüsusi göstəricisi müəyyən olunur.

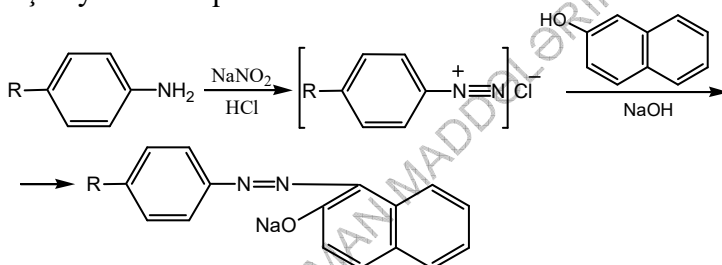
Maddələrin həqiqiliyinin sınaqdan keçirilməsi üçün onların əsaslarının qələvilərin təsiri ilə çökdürülməsi reaksiyalarından istifadə olunur. Xinqaminin əsasını aşkar edərkən sarı rəngli stabil ərimə temperaturuna (204,5-207° C) malik pikratın alınma

reaksiyasından istifadə olunur. Trixomonasid əsası kalium yodid məhlulu ilə reaksiyası vasitəsi ilə müəyyən edilir. Trixomonasid hidrogen yodidlə açıq sarı rəngli çöküntü verir.

Trixomonasid molekulunda nitroqrupun olmasını onu amin qrupa (turş mühitdə sink tozu) reduksiya etməklə müəyyən etmək olar:



Alınmış amin törəmələri β -naftolla azobirləşməyə və diazolaşmaya məruz qalır.



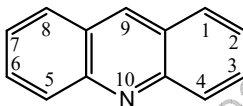
Alınmış azoboyaq açıq çəhrayı rəngdə olur. Xinqamin və trixomonasidin miqdarı təyini neytrallaşma metodu ilə həyata keçirirlər, belə ki onların məhlulları turş reaksiyaya malik olurlar. Hər iki maddənin miqdarı qiymətləndirilməsi üçün QF X susuz titrləmə üsulundan istifadə edir. 0,1 n HCl turşusu məhlulu ilə soyuq sirkə turşusu mühitində titrləyirlər (indikator kristallik bənövşəyi)

Maddələri yaxşı qablaşdırılmış portağal rəngli şüşə qutuda qaranlıqda saxlayırlar. Nəzərə almaq lazımdır ki, trixomonasid hiqroskopik maddədir. Xinqamin isə işığın təsiri ilə yavaş-yavaş parçalanır. Xinqamini bütün növ malyariyaların proflaktikası və müalicəsi üçün malyariyaya qarşı maddə kimi istifadə edirlər. Xinqamindən fərqli olaraq trixonomosid malyariyaya qarşı təsirə

malik deyil. Lakin o trixomonodla müqayisədə yüksək fəal maddədir. Onu xaricə və daxilə sutkada 0,3 q-a təyin edirlər.

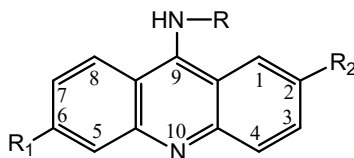
13.3 Akridinin törəmələri

Akridin piridinin nüvəsi və iki benzol tsiklindən təşkil olunan kondensləşmiş heterotsiklik sistemdir. Ona həmçinin xinolin və benzolun kondensləşmiş sistemi kimi baxmaq olar:



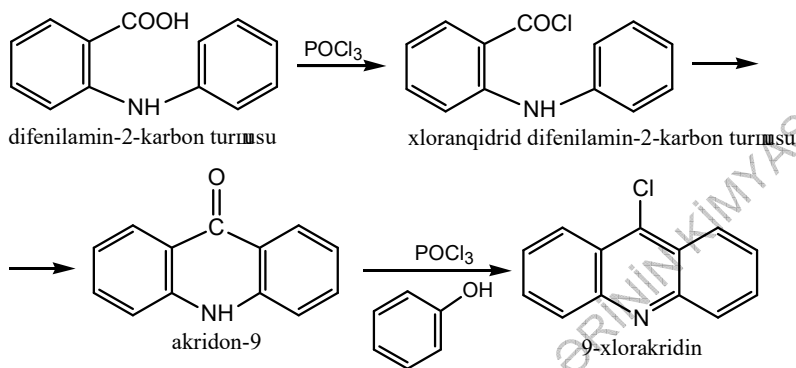
1912-ci ildə çox aktiv antiseptik maddə olan 6,9-diamino akridininin törəməsi - etakridin (rivanol) sintez olunmuşdur. 1932-1936-cı illərdə malyariya törədicilərinə qarşı daha yüksək kimyəvi fəallığa malik olan bir sıra 9-aminoakridin törəmələri alınmışdır. Akridinin və xinolinin kimyəvi quruluşundakı oxşarlığı bu tədqiqatı həyata keçirməyə imkan yaratdı. Malyariyaya qarşı daha effektiv maddə akrixin alındı.

9-aminoakridinin törəmələri - etakridin və akrixinin ümumi formulları:

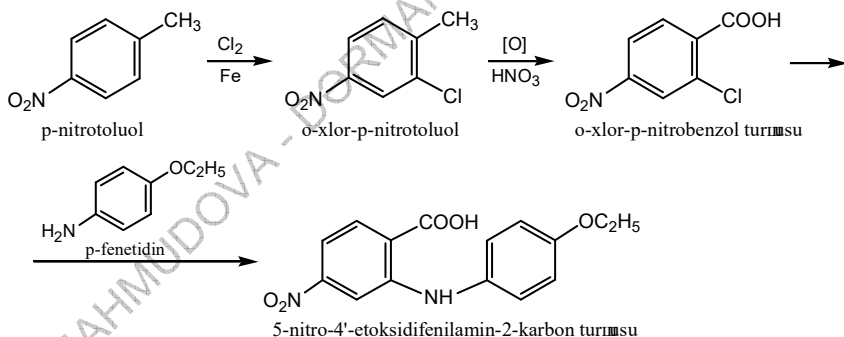


Akridinin törəmələrinin sintezinin orjinal üsulu O.Ş.Maqidsonom, A.M.Qriqovski tərəfindən verilmişdir. Difenil 2-karbon turşusuna fosfortriqlor oksidinin təsiri ilə qabaqcadan 9-

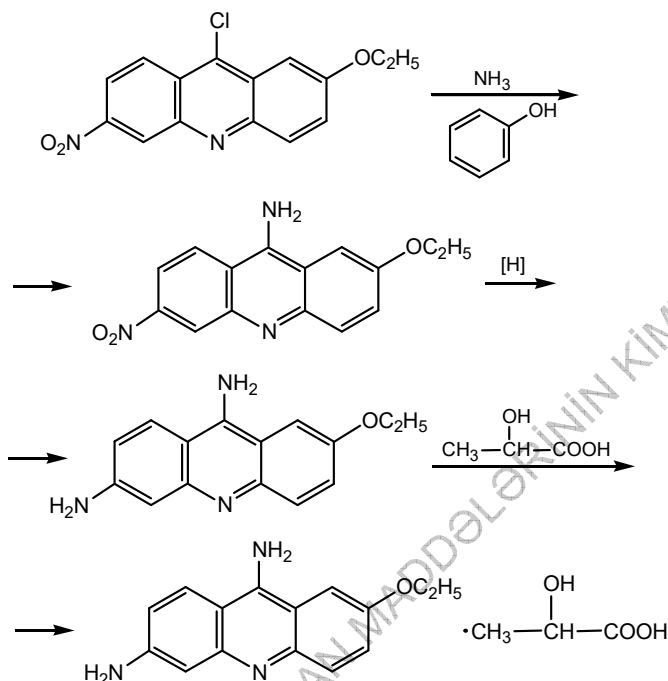
xlorakridinin törəmələrini almaq lazımdır. 9-xlorakridinin alınmasının ümumi sxemi aşağıdakı kimidir:



Etakridinin sintezi 2 mərhələdən ibarətdir. Əvvəlcə difenilamin-2- karbon turşusunun törəmələrini alırlar:



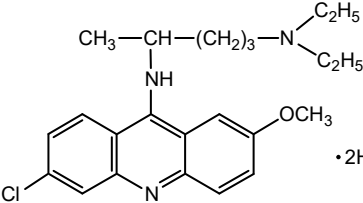
Sonra tsikl qapanır və 9-xlorakridinin törəmələri alınır. Alınmış 9-xlorakridinin törəmələri fenolun iştirakı ilə susuz mühitdə aminləşmə reaksiyasına daxil olur. Sonra nitro qrupu hidrolizə uğradılır və etakridin laktat alınır.



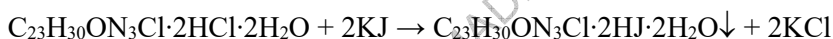
Etakridin laktat və akrixinin (akridinin digər törəmələri kimi) fiziki xüsusiyyətlərinə görə acı dadlı, iysiz, sarı, kiçik kristallik tozudur (cədvəl 13.3.1). Etakridin laktat suda və spirtdə az həll olur. Akrixin isə suda həll olur, spirtdə isə daha yaxşı həll olur. Hər iki maddə efirdə praktiki olaraq həll olurlar.

Cədvəl 13.3.1. Akridinin törəmələri olan maddələrin xüsusiyyətləri.

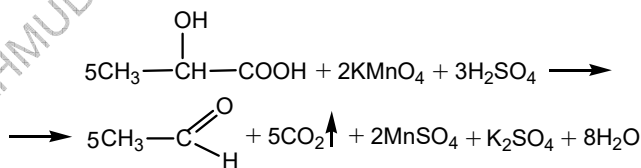
Maddə	Kimyəvi quruluşu	Təsviri
Aethacridini lactasetakridin laktat	2-etoksi-6,9-diaminoakridin laktat	Acı dadlı, iysiz, kristallik toz. Ərimə temperaturu 118-122 ° C

Acrichinum- akrixin	 2-metoksi-6-xlor-9-(1'-metil-4'-dietilaminobutilamino)- akridin dihidroxlorid	Acı dadlı, sarı, xırda kristallik toz. Ərimə temperaturu 248-250 ° C
------------------------	---	---

Etakridin laktatın və akrixinin həqiqiliyini yod və yodidlərlə reaksiyalarına görə müəyyən etmək mümkündür. Beləki, etakridin laktat 0,1 n yod məhlulu ilə spirtdə həll olan göy-yaşıl çöküntü əmələ gətirir. Akrixin isə kalium yodid məhlulu ilə sarı hidroyodid çöküntüsü verir:

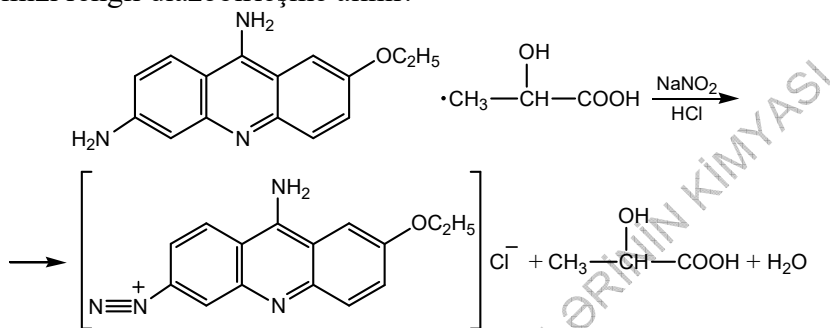


Maddələrin əsaslarının turşuluğu aşağıdakı kimi müəyyən edilir. Etakridin laktatda süd turşusunu müəyyən etmək üçün maddənin əsasını NaOH məhlulu ilə çökdürürlər. Turşulaşdırılmış filtrata isə kalium permanqanat məhlulu əlavə edirlər. Sonucu prosesə qızdırılmaqla nail olunur:



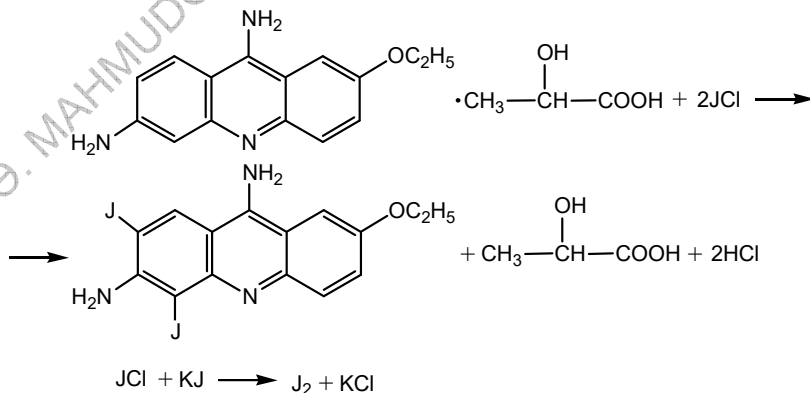
Akrixindəki xlorid turşusunu maddənin məhluluna azot turşusu əlavə etdikdən sonra aşkar edirlər. Akrixinin əsası olan nitrat suda həll olmayandır (sarı kristallik maddə). Filtrat xlorid iona müsbət reaksiya verir.

Turş mühitdə natrium nitritlə reaksiya etakridin laktat üçün spesifikdir. P.N.İvaxnenko, K.N.Baqdasarov müəyyən etmişdirlər ki, 6 vəziyyətində olan amin qrupların diazolaşması hesabına al qırmızı rəngli diazobirləşmə alınır.

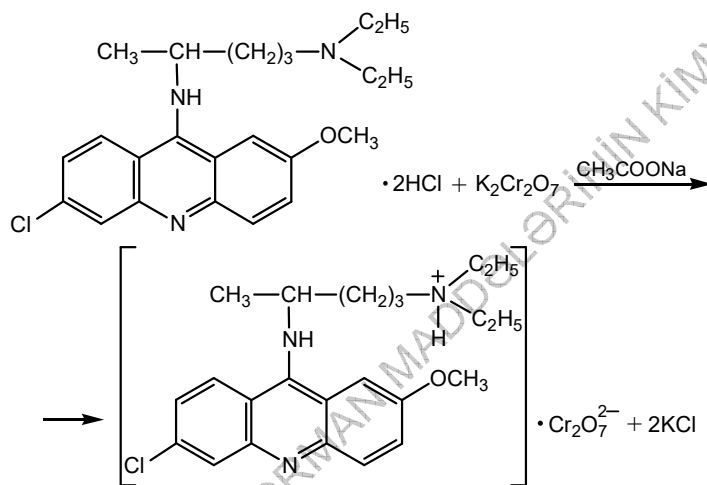


Həmin müəlliflər tərəfindən bu reaksiya əsasında etakridin laktatın fotokolorimetrik təyini üsulu verilmişdir.

Etakridin laktatın miqdarı təyini yodxlorometrik metodla həyata keçirirlər. Etakridini 0,1 n yodmonoxlorid məhlulu ilə çökdürürlər, 5,7- diyodetakridin çöküntüsünü süzməklə ayırırlar, filtrata kalium yodid əlavə edirlər və ayrılmış yodu natriumtiosulfatla titrləyirlər.



Akrixinin miqdarı təyini natrium asetatın iştirakı ilə kalium dixromatın titrli məhlulu ilə çökdürməklə müəyyən edirlər. Suda həll olmayan akrixin dixromat süzməklə ayrılır, 0,1 n kalium dixromat məhlulunun qalığını isə xlorid turşusunun iştirakı ilə yodometrik üsulla müəyyən edirlər:



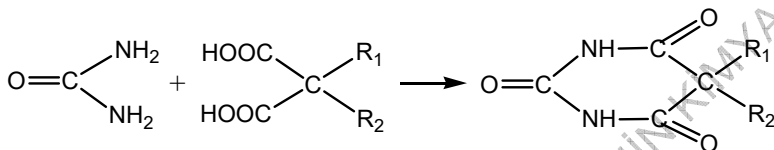
Akrixinin miqdarı təyini neytrallaşdırma metodu və efirin iştirakı ilə mümkündür (fenolftalein indikatoru).

Etakridin laktatı və akridini yaxşı qablaşdırılmış qutularda saxlayırlar. Akrixini və etakridin laktat məhlullarını işıqdan qorumaq lazımdır. Belə ki, onlar işıqda öz rənglərini dəyişərək çevrilməyə məruz qalırlar.

Etakridin laktatı antiseptik maddə kimi 0,05-0,2 %-li məhlul kimi xaricə tətbiq edirlər. Akrixindən malyariyaya qarşı maddə kimi istifadə edirlər (sutkada 0,3 q-a qədər maddə).

13.4 Barbitur turşusunun dərman təsirli törəmələri

Barbitur turşusunun törəmələri, yaxud tsiklik ureidlər, atsiklik ureidlərdən fərqli olaraq karbonat turşusunun tam amidinin - karbamidin malon turşusunun törəmələri ilə kondensləşməsindən alınır:



Kondensləşmə nəticəsində iki azot atomu saxlayan qapalı tsiklik sistem əmələ gəldiyindən barbiturlara pirimidinin törəməsi kimi də baxılır.

Barbitur turşusu özü farmakoloji təsirə malik deyil, lakin onun 5-ci karbon atomundakı hidrogenlərinin alkil radikalları ilə əvəz edilməsi onlara yuxugətiricilik xassəsi verir.

Barbituratların təsiri ilk dəfə 19-cu əsrin əvvəllərində E.Fişer və F.Merinq tərəfindən müəyyən edilmişdir. Barbitur turşusunun ilk törəməsi 1904-cü ildə E.Fişer tərəfindən alınmışdır. Son illərdə barbituratların bir sıra törəmələri alınmışdır. Bu birləşmələrin kimyəvi quruluşu ilə onların fizioloji təsiri arasında qanunauyğunluqların olması müşahidə edilmişdir. Müəyyən olunmuşdur ki:

1. 5,5 vəziyyətində tərkibində alkil, aril və digər radikallar saxlayan barbituratlar sakitləşdirici təsir göstərir.
2. 5,5 vəziyyətində alkil radikallarında karbon atomlarının sayı 5,6 olan uzun zəncirli törəmələri təsir effektivini artırır. Karbon zəncirinin sonrakı uzanması qıcıqlandırıcı təsir göstərir.
3. Karbohidrogen radikalının şaxələnməsi, radikalda doymamış rabitənin olması, həmçinin, spirt hidroksili və halogen

atomu (xüsusilə də brom atomu) saxlaması bu birləşmələrin farmakoloji effektivliyinə dərinləşdirir.

4. Barbituratların farmakoloji effekti artdıqca, onların yuxugətiricilik müddəti qısalmır.

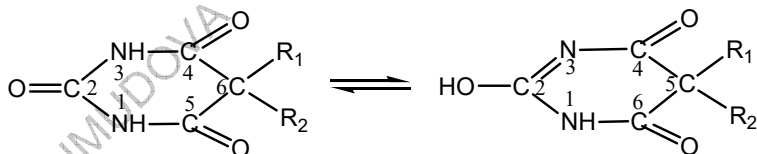
5. 5 vəziyyətində bir fenil radikalının olması barbituratların fizioloji təsirini artırır, bu zaman təsir müddətini dəyişmir, ikinci fenil radikalının daxil edilməsi yuxugətiricilik effektivliyinə zəiflədir.

6. İmid qruplarından birinə (1,3 vəziyyətində) alkil radikalının daxil edilməsi preparatların təsir müddətini qısaldır.

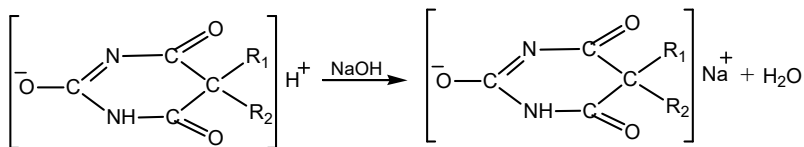
7. 1 vəziyyətindəki hidrogen atomunun aromatik turşu (məsələn, benzoy turşusu) qalığı ilə əvəz edilməsi preparata epilepsiya əleyhinə xassə verir.

8. Tiobarbitur turşusunun törəmələri nisbətən güclü təsirə malikdir, lakin oksigen saxlayan analoglarına nisbətən onların təsir müddəti qısadır.

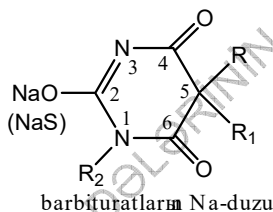
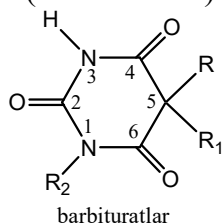
Barbituratların kimyəvi xassələri onların molekulyar quruluşu ilə əlaqədardır. Barbitur turşusunun törəmələri 5,5 vəziyyətində əvəzedicilər saxladığı üçün imin-imidol tautomer formasında mövcud olur:



İmidol və ya asi-forma barbitur turşusuna turşuluq xassəsi verir. Hidroksid ionunun iştirakı ilə onlar özlərini turşu kimi apararaq duz əmələ gətirə bilər.

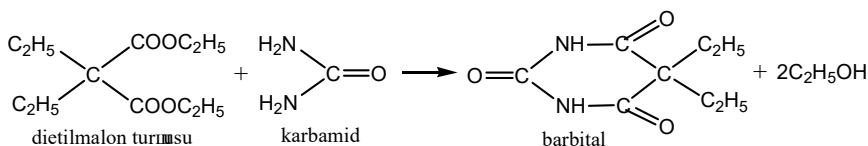
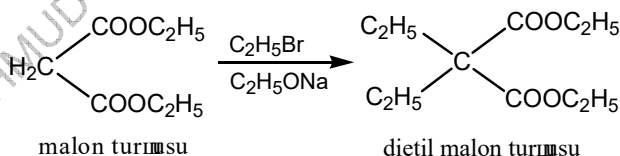


Tibbdə istifadə olunan barbitur turşusunun törəmələrini iki qrupa ayırmaq olar: barbituratlar (imid forma) və barbituratların natrium duzu (imidol forma)

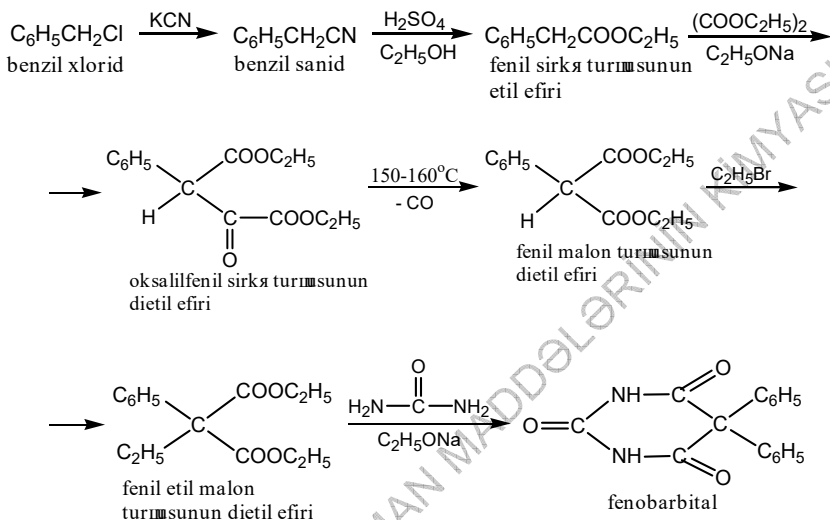


Barbituratlar – barbital, fenobarbital, benzonal və onların natrium duzları – natrium-barbital, barbamil, etaminal natrium, heksenal, tiopental natrium. Biri digərindən R, R₁ və R₂ radikallarına görə seçilir.

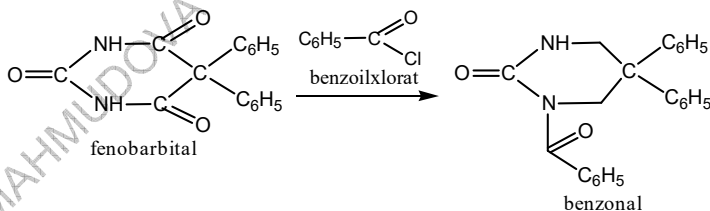
Barbitur turşusunun törəmələrinin sintezi iki mərhələdə aparılır. Əvvəlcə malon turşusunun müvafiq efiri alınır, ikinci mərhələdə efir sidik cövhəri ilə kondensləşdirilir:



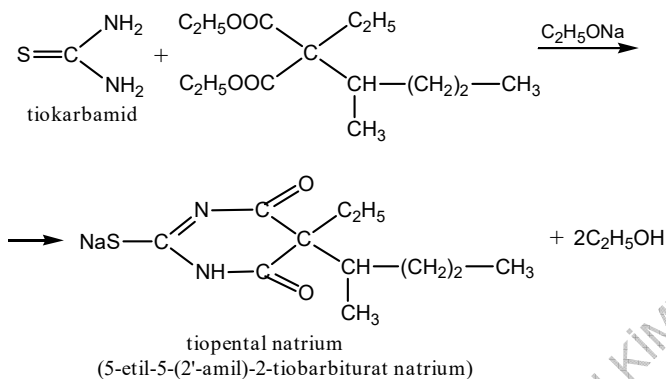
Fenobarbitalın alınması üçün ilkin maddə olaraq benzilxlorid götürülür və ondan feniletilmalon turşusunun dietil efiri sintez olunur. Sonra onu sidik cövhəri ilə kondensləşdirirlər.



Benzonal fenobarbitala piridin mühitində benzoilxloridlə təsir etməklə sintez edilir:



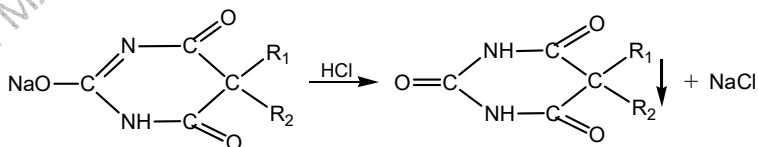
Tiopental natrium etilamil malon turşusunun dietil efirinin tiokarbamidlə kondensləşməsindən alınır. Reaksiya natrium etilat mühitində aparılır:



Barbituratlar iysiz, dadlı ağ kristallik maddələrdir. Natrium-barbituratlar ağ, iysiz, acı, dadlı kristallik və ya kiçik kristallik maddələrdir. Onlar suda və spirtə asan həll olur, efrdə isə praktik olaraq həll olmur. Bütün barbituratlar və onların natrium-duzları kobalt ionu ilə kompleks birləşmələr əmələ gətirir.

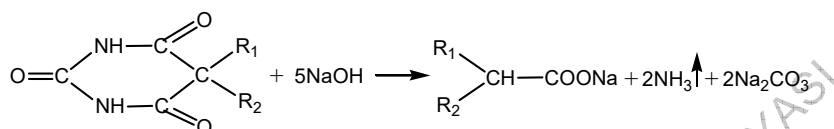
Barbitur turşusunun törəmələri sakitləşdirici və yuxugətirici maddə kimi istifadə olunur. Benzonal epilepsiyaya qarşı tətbiq edilir. Sakitləşdirici təsirinin davamlılığına görə barbitur turşusunun törəmələrini 3 qrupa: uzun davamlı preparatlar (barbital natrium, barbital, fenobarbital); orta davamlı preparatlar (natrium-etaminal, barbamil); qısa davamlı preparatlar (heksenal, tiopental-natrium).

Barbituratların natrium duzlarının təyini neytrallaşma reaksiyalarına əsaslanır:

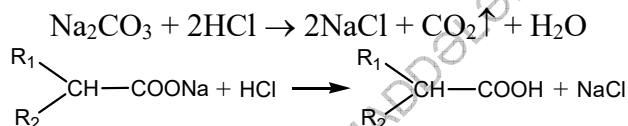


Alınmış çöküntü süzülür, su ilə yuyulur, qurudulur və ərimə temperaturu təyin edilir.

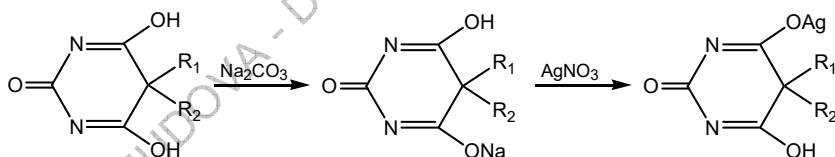
Barbituratlar və onların natrium duzlarının təyini onların qələvilərlə əridilməsi zamanı ammoniyakın ayrılması ilə parçalanma reaksiyalarına əsaslanır:



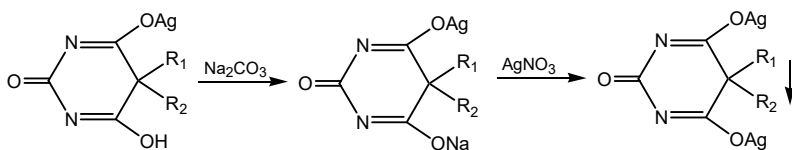
Sonra turşulaşdırıldıqda karbon dioksid və müvafiq yağ turşusunun iyi hiss edilir.



Barbituratların gümüş ionları ilə qarşılıqlı təsirindən suda həll olan birəvəzli və suda həll olmayan ikiəvəzli duzları əmələ gəlir:



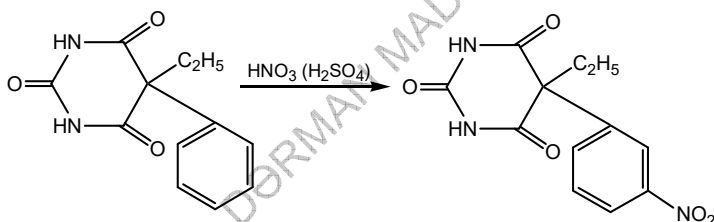
Gümüş duzları 4, 6 vəziyyətlərində hidrogen atomlarının metalla əvəz olunması nəticəsində əmələ gəlir. Natrium karbonatın iştirakı ilə əvvəlcə natrium duzu, sonra isə bir əvəzli gümüş duzu əmələ gəlir. Sonuncunun da gümüş nitratın artığı ilə qarşılıqlı təsirindən gümüş natrium duzu, sonra isə həll olmayan ikiəvəzli gümüş duzu əmələ gəlir:



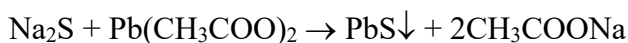
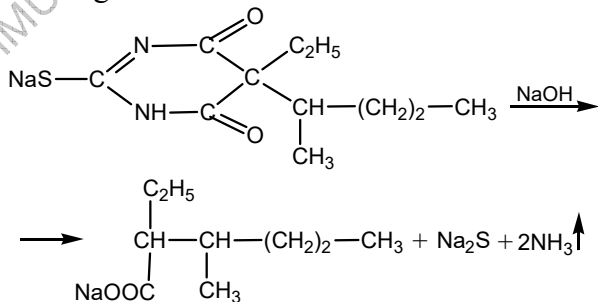
1 vəziyyətində əvəzedici saxlayan heksenal və benzonal yalnız birəvəzli gümüş duzları əmələ gətirir.

Preparatları bir-birindən ayırmaq üçün 1 və 5,5 vəziyyətində funksional qrupların reaksiyalarından istifadə edilir.

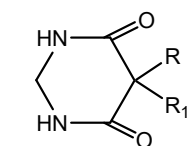
Fenobarbitalda fenil radikalının təyini sarı rəngli nitrobirləşmələr əmələ gətirməsinə əsaslanır. Reaksiya qatı nitrat və sulfat turşularının qarışığının təsiri ilə gedir, sarı rəngli fenobarbitalın m-nitrotörəməsinin alınması ilə xarakterizə olunur:



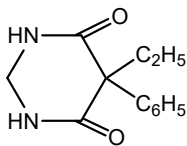
Tərkibində kükürd atomu saxlayan natrium tiopental natrium hidroksid və qurğuşun asetatın iştirakı ilə qara rəngli qurğuşunsulfid çöküntüsü əmələ gətirir:



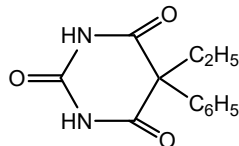
Barbituratlardan başqa tibbdə həmçinin heksahidropirimidin-dionun (heksamidin) törəmələrindən istifadə edilir:



heksahidropirimidindion



heksamidin



fenobarbital

Heksamidin fenobarbitaldan 2 vəziyyətində oksigen atomunun olmaması ilə fərqlənir. Heksamidin də benzonal kimi epilepsiya əleyhinə tətbiq edilir.

14. ANTİBİOTİKLƏR

Antibiotiklər mikroorqanizmlər tərəfindən sintez olunan və başqa mikroorqanizmlərin inkişafına mane olan maddələrdir.

Hal-hazırda 10 mindən artıq təbii və sintetik antibiotik məlumdur ki, onlardan təxminən yüzdən bir qədər artığı təbabətdə tətbiq edilir, həmçinin kənd təsərrüfatında bitkilərin və heyvanların xəstəliklərdən qorunmasında istifadə edilir. Dünya miqyasında antibiotiklərin ümumi istehsalı ildə 50 min ton təşkil edir.

Antibiotiklər mikroorqanizmlər, ali bitkilər, heyvani toxumalar tərəfindən əmələ gəlir, mikroorqanizmləri məhv edən və ya həyat fəaliyyətini zəiflədir. Antibiotiklərin üstünlüyü orqanizmə heç bir toksiki təsir göstərməməklə xəstəlik törədən mikroorqanizmləri məhv etməsidir.

Mikroorqanizmlərdə antoqonizmin olmasını ilk dəfə XIX əsrin 80-ci illərində L.Paster kəşf etmişdir. Bu hadisənin mahiyyəti ondan ibarətdir ki, mikroorqanizm ətraf mühitə digər mikroorqanizmlərin böyüməsinin və çoxalmasının qarşısını ala bilən müxtəlif maddələr ifraz edir. İlk dəfə antibiotikləri kif ştommindən almışlar.

Kifdən hələ X-XI əsrlərdə Azərbaycanda rinli yaralara qarşı istifadə olunurdu.

Kifin antibakterial xüsusiyyəti Pasterin işlərində öz əksini tapmışdır. Polotebnov təcrübi olaraq sübut etmişdir ki, rinli yaralarda kifdən istifadə etdikdə yaraların daha tez sağalması mümkündür. Lebedinskiy isə göstərdi ki, kif təsiri nəticəsində mədə-bağırsaq sistemində bakteriyaların azalması baş verir. Lakin həmin insanların kəşfi keçmiş rus çarlığı dövründə diqqətdən kənarda qaldı.

Buna görə də antibiotiklərin kəşfi ingilis mikrobioloqu olan

A.Fleminqin adı ilə əlaqədardır. O, 1929-cu ildə qızılı stafilokokklarda kifin antibiotik xüsusiyyətini təyin etdi. Fleminq onun adını pensilin qoydu, lakin onu təmiz halda ala bilməmişdi. Beləliklə, elmi faktların və təcrübi materialların yığılması nəticəsində artıq 1939-cu ildən başlayaraq antibiotik sahəsində tədqiqatlar durmadan artmağa başladı.

1948-ci ildə ilk dəfə olaraq polimiksin qrupundan olan antibiotiklər kəşf olundu. Sonrlar isə əsasən qlikozid tərkibli struktura malik antibiotiklərin alınmasına diqqət yetirildi.

Hal-hazırda 2000-ə qədər antibiotik məlumdur, onlardan yalnız 3%-i tibbdə tətbiq olunur. Antibiotiklərin əksəriyyəti mürəkkəb heterotsiklik quruluşa malikdir. Antibiotiklərin sintezi çox mürəkkəbdir, ona görə də sənaye miqyasında onlar mikrobioloji yollarla alınır.

Antibiotiklərin təsnifatı.

Dərman maddələri kimi tətbiq edilən antibiotik preparatları aşağıdakı kimi təsnif edilir.

1) Alitsiklik quruluşlu antibiotiklər: tetraskilin və onun sintetik analoqları.

2) Aromatik sıra antibiotikləri: levomesitin

3) Heterotsiklik antibiotiklər: pensillin, sefalosporin və onun yarımsintetik analoqları.

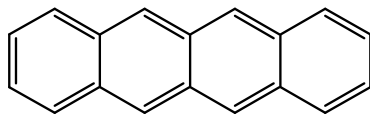
4) Qlükozid antibiotikləri: streptomisinlər, aminoqlükozid antibiotiklər – kanamisin.

5) Şiş əleyhinə antibiotiklər.

6) Polipeptid antibiotiklər.

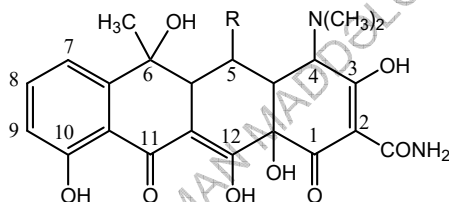
Alitsiklik antibiotiklər.

Təbii tetratsiklinlər. Bunların quruluşunun əsasını qismən hidrogenləşmiş tetrasen təşkil edir.



tetrasen

Tetratsiklinlərin ümumi formulu:



R = H (tetratsiklin)

R = OH (oksitetratsiklin)

Tibbdə tetratsiklin, tetratsiklin hidroxlorid, oksitetratsiklin hidroxlorid, oksitetratsiklin dihidrat duzları şəklində tətbiq edilir.

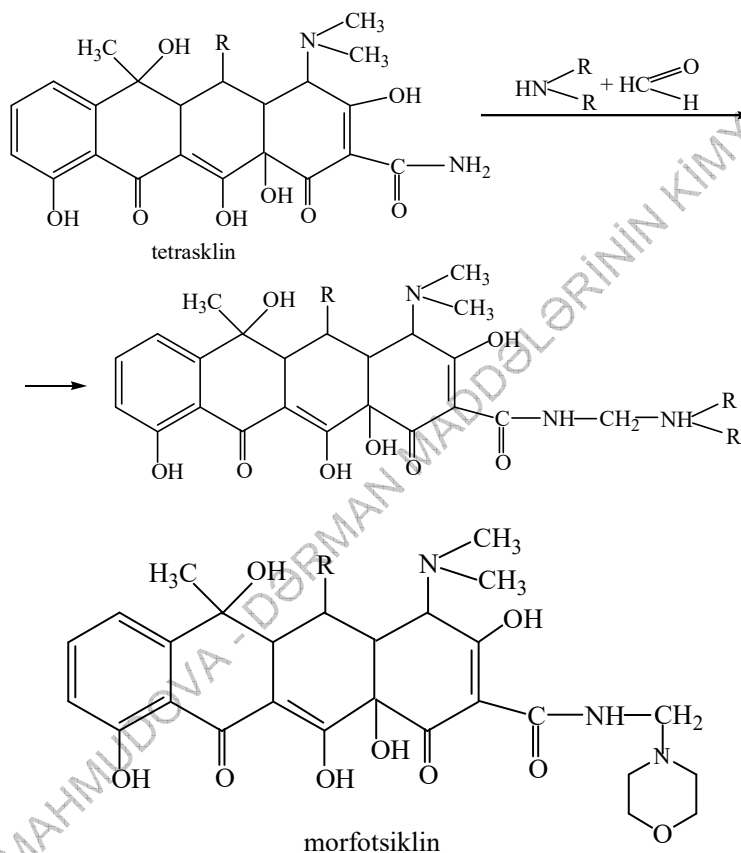
Oksitetratsiklin 5-vəziyyətində OH qrupunun olması ilə tetratsiklindən fərqlənir.

Tetratsiklinlər geniş təsir spektrinə malik olub, nəfəs yollarının, mədə-bağırsaq traktının infeksiyon xəstəliklərində həmçinin ağır septik xəstəliklərdə tətbiq edilir.

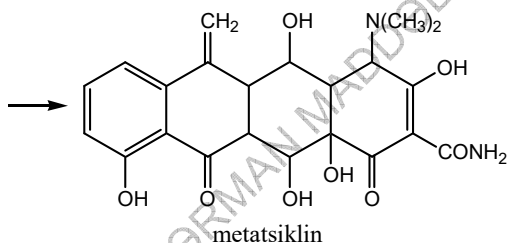
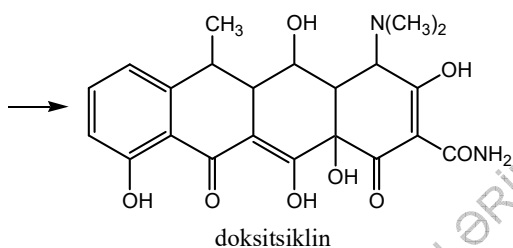
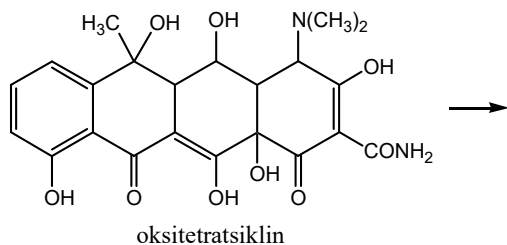
Tetratsiklinlərin yarımsintetik analoqları.

Təbii tetratsiklinlərin çatışmayan cəhəti onların nisbətən yüksək toksik olmasıdır. Bu da, onların yarımsintetik analoqlarının

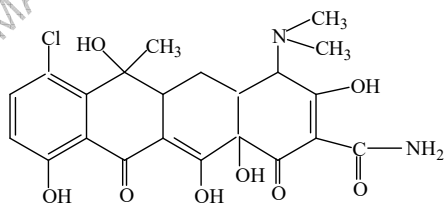
sintezinə gətirib çıxartdı. Məsələn, morfotsiklin doksitsiklin aşağıdakı sxem üzrə müvafiq olaraq tetratsiklin və oksitetratsiklindən alınır:



6-dezoksitetratsiklinlərdən dezoksilləşmə reaksiyaları nəticəsində doksitsiklin alınır, sonuncunun metil qrupunun metilen qrupuna dəyişməsi nəticəsində metatsiklin (6-dezoksi-6-dimetil-6-metil-5-oksitetratsiklin) alınır.



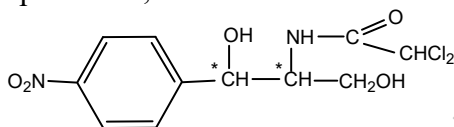
Sintetik tetratsiklinlər geniş antimikrob xassəsinə malikdir, hətta virus xəstəliklərində işlədilir. Bu tip antibiotiklərə aid olan biomisin pensillin və streptomisinə qarşı davamlı mikroorqanizmlər tərəfindən yaradılan xəstəliklərə qarşı müvəffəqiyyətlə tətbiq olunur.



Biomisin

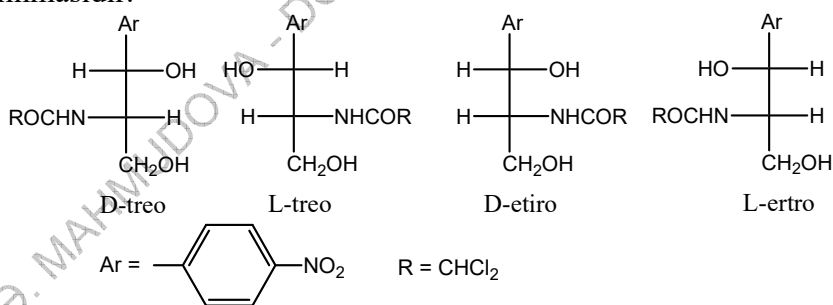
Aromatik sıra antibiotikləri.

Aromatik sıra antibiotiklərdən geniş tətbiq ediləni levomisetindir. 1949-cu ildə quruluşu müəyyən edilmiş və sintez edilmişdir. Bu da onun nisbətən sadə quruluşa malik olması ilə izah edilir. Nitrobenzolun törəməsi olub kimyəvi adı p-nitrofenol-2-dixlorasetoaminopropandiol-1,3-dür.

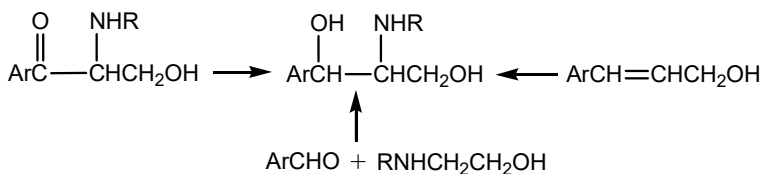


Levomisetin iki assimetrik C atomuna malik olub, stereoizomerinin sayı dördür: D-treo, L-treo, D-eritro, L-eritro. D(-) və L(+) eritro izomerləri toksik maddələr olub tibbdə tətbiq edilmirlər. Təbii levomisetin D(-) treo izomer quruluşa malikdir, levomisetin adı buradan götürülüb. L(+)-treo izomer fizioloji qeyri-aktiv birləşmədir.

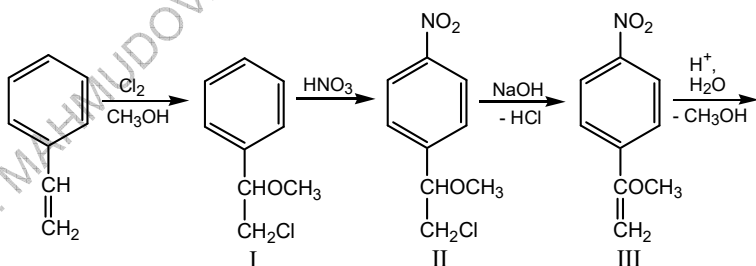
Levomisetinin sintezində əsas çətinlik yalnız D-treo izomerin alınmasıdır.

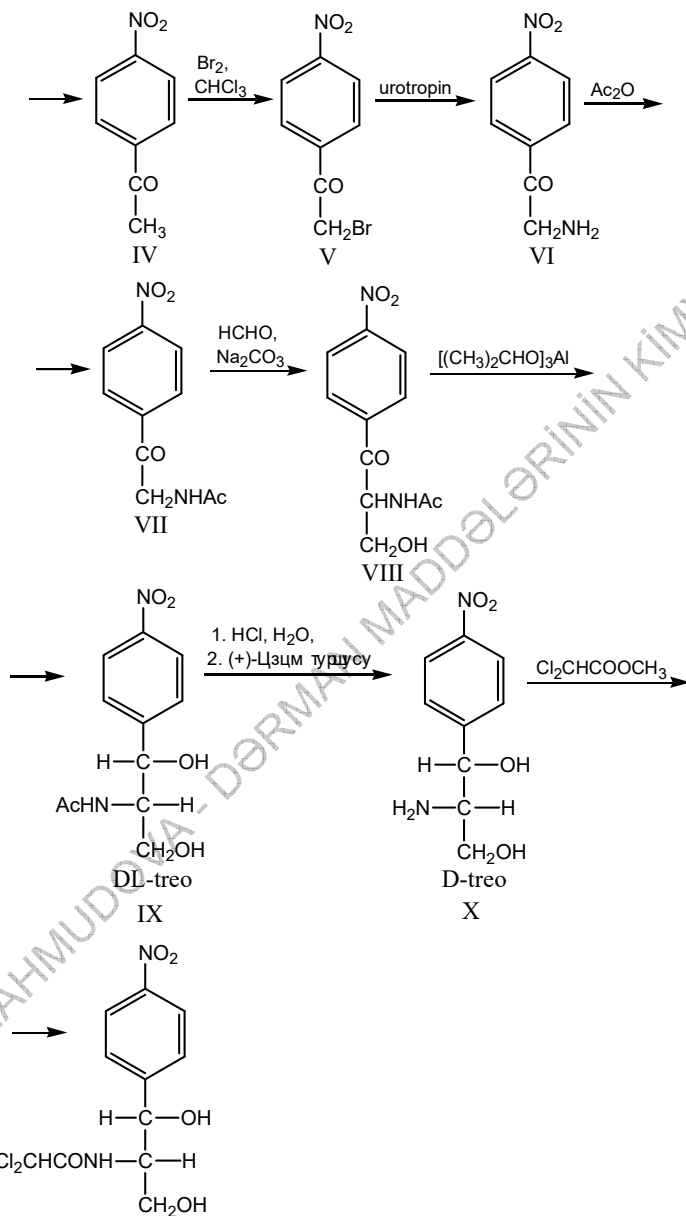


Levomisetinin sintezində propinfenolun törəmələrindən fenilpropen və həmçinin aromatik aldehidlərin ammoniyakla müvafiq aromatik aldehidlərin aldol kondensləşməsi reaksiyasından istifadə edilir:



Sənayedə sintez metodlarından biri də ilkin maddə olaraq stirola istifadə edilir. Stirola metil spirtində xlorun təsiri ilə birləşmə alınır və nitrolaşdırılır II. Nitrobirləşmədən qələvi mühitdə hidrogenxloridin ayrılması nəticəsində doymamış birləşmə III alınır ki, turş mühitdə ketona IV çevrilir. Sonuncunun bromlaşmasından bromlu törəmə V alınır, ona da urotropinlə təsir etməklə bromun amin qrupu ilə əvəz edilməsindən VI birləşmə alınır. Amin qrupunun mühafizəsi üçün asilləşdirildikdən sonra alınan VII birləşməyə formaldehidlə təsir edərək birləşməyə hidroksimetil qrupu daxil edilir. Oksoqrup alüminium izopropilatla reduksiya edilir və bu zaman treo- izomerin rasematı alınır IX. Optiki antipodlar çaxır turşusu ilə ayrılır. D-treo izomer ayrılır, metildixlorasetatla asilləşdirilir, levomisetin alınır:





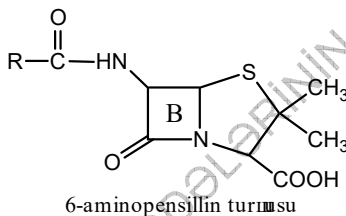
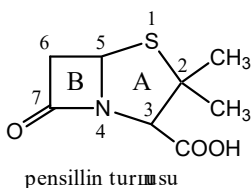
Levomisetin levomisetin stearat preparatları şəklində tətbiq

edilir.

Levomisetin mədə-bağırsaqdan asanlıqla sorulur. Dizenteriya, brüsilyoz qarın yatalağı və s.xəstəliklərdə tətbiq edilir.

Heterotsiklik quruluşlu antibiotiklər.

Penisillin – onun quruluşunun əsasını beşüzvlü tiazolidin (A) və dördüzvlü β -laktam tioaminlərin kondensləşmə məhsulu təşkil edir.

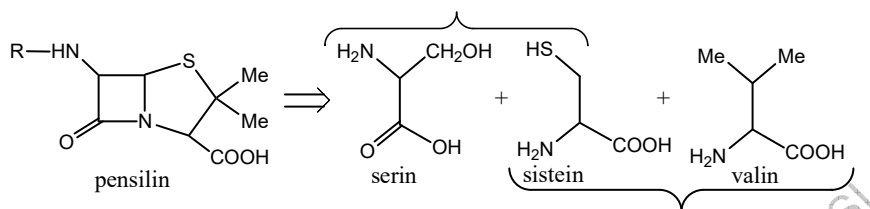


Penisillinlər 6-aminopenisillin turşusunun müxtəlif N-asilləşmiş məhsullarıdır. Penisillinləri adlandırarkən bu radikalların və asil radikalların adları nəzərə alınır. Məsələn, $R = C_6H_5CH_2$ – benzilpenisillin, $R = C_6H_5OCH_2$ – fenoksimetilpenisillin və s.

Penisillin heterotsiklik antibiotiklərə daxildir. Penisillinin quruluşunun əsası 5 üzvlü tiozolidin, 4 üzvlü β -laktam halqası təşkil edir. Penisillinlər 6-amino penisilin turşusunun müxtəlif asilləşmiş törəmələridir.

Penisillinin biosintezini nizamlanmış atomlar ilə araşdırdıqda müəyyən edilmişdir ki, qidalı mühitdə sistein və valin iştirak etdikdə penisillin əmələ gəlir. Bu qrup antibiotiklər zülalların eninə tikilməsini kataliz edən hüceyrə transpeptidazasının aktiv mərkəzi ilə kovalent rabitə əmələ gətirmək onu dezaktivləşdirir.

Molekulun tsiklik hissəsi formal olaraq serinlə sistein və ya sistein və valin α -aminturşulardan təşkil olunmuş dipeptid kimi təsvir etmək olar:



Sonuncu iki şərait mikroorqanizmlər tərəfindən penisillinaza fermentinin əmələ gəlməsi ilə izah edilir ki, bu da penisillinlərin laktam həlqəsinin açılmasına və 6-aminopenisillan turşusu törəmələri və qeyri-aktiv penisillin turşusu əmələ gətirir.

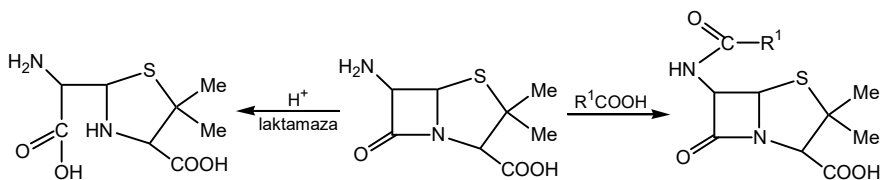
Penisillin qrupu antibiotikləri turşuların təsirinə qarşı davamsızdır, daxilə qəbul edildikdə laktam həlqəsi hidrolizə məruz qalır. Digər çatışmayan cəhəti isə onların məhdud təsir spektrlərinə malik olması və bakteriyalarda dözümlülük əmələ gəlməsinə səbəb olur.

Penisillinlərin spesifik bioloji aktivliyi molekuldakı tiozolidin və β -laktam halqası ilə əlaqədardır. Əgər bu hissələrdən biri pozularsa bioloji aktivlik itir. Antibiotik xassə göstərməsi onun fəza quruluşundan da asılıdır. Heterotsikllərə 2-ci, 3-cü vəziyyətdə birləşmiş qruplar bioloji aktivliyin əmələ gəlməsində əhəmiyyət kəsb etmir.

Penisillinlər quruluşca 6-amin qrupunda olan radikala görə fərqlənir.

• Benzil penisillin və onun əsasında əmələ gələn çoxlu sayda dərman preparatları kimyəvi müalicə effektivliyinin yüksək olması və toksikliyiinin aşağı olması ilə fərqlənilirlər.

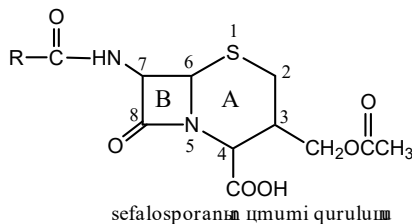
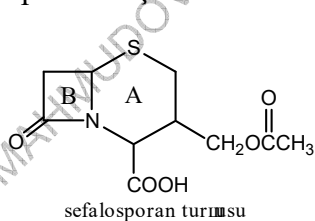
Reaksiya aşağıdakı sxem üzrə göstərilir:



Penisillinlər suda yaxşı həll olur, asan kristallaşan maddələrdir. Onlar spirtdə, efirdə və xloroformda həll olurlar, karbohidrogenlərdə isə həll olmurlar.

Penisillinlərin çoxu sərbəst halda davamlı birləşmə olmayıb, qüvvətli turşu xassəsinə malikdir. Çox vaxt onlar natrium, kalium duzları və ya üzvi əsaslarla duz şəklində alınır.

Sefalosporinlər – quruluşuna görə pensillinə yaxındır və tərkibində β -laktam tsikli var. Onların quruluşunun əsasında iki kondensləşmiş heterotsiklik tsikl – altıüzvlü qismən hidrogenləşmiş 1,3-tiozin (A) və dörd üzvlü β -laktam (B)-dən əmələ gələn sefalosporan turşusu durur.



Sefalosporan qrupu antibiotikləri 7-amino sefalosporan turşusunun törəmələridir. Bu tip antibiotiklər böyük təsir dairəsinə malikdir və penisillinə qarşı davamlı bakteriyalara təsir edir.

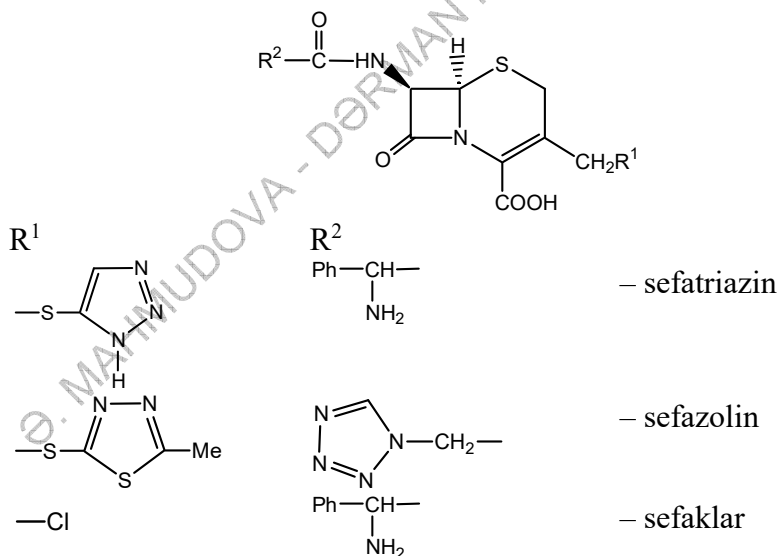
Sefalosporinlər – Cephalosporinum göbələklərinin metabolizm məhsulları olub β -laktamaza fermentinin təsirinə

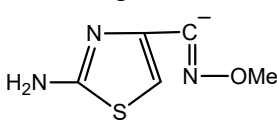
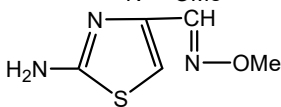
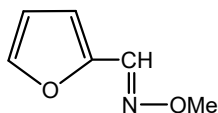
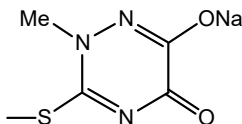
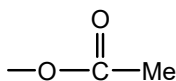
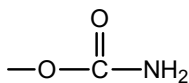
davamlı birləşmələrdir. Tibbi praktikaya 1960-cı ildə daxil olub, hal-hazırda bu qrupdan çox sayda təbii və yarımsintetik antibiotiklər istifadə edilir. Bunların da biotəsiri penisillinlərin təsir mexanizmi (patogen bakteriyaların hüceyrə örtüyünün sintezində iştirak edən transpeptidazın təsirini ləngidir).

Birinci nəsil sefalosporinlərdən olan sefatriazin, sefazolin, sefalotin, sefaloridin qrammüsbət bakteriyalara qarşı effektiv təsirə malikdir.

İkinci nəslin nümayəndələri olan sefaklor, sefuroksim qrammənfi bakteriyalara (bağırsaq çöplərinə qarşı) effektiv təsirə malikdir.

Üçüncü nəsil sefalosporinlərə sefotaksim və seftriakson aiddir ki, bunlar da daha geniş biotəsir diapazonuna malikdirlər, 1990-cı illərin əvvəllərində əcazılıq bazarında mühüm yer tutmuşlar.





– sefuroksim

– sefotaksim

– seftriakson

Hal-hazırda yeni dördüncü nəsil yaradılır ki, bunlar da əksər qrammüsbət və qrammənfi bakteriyalara qarşı yüksək effektivliyə malik olmaqla yanaşı, həm də laktamazlara qarşı yüksək dayanıqlığa malikdirlər.

Sefalosporin qrupu antibiotikləri fermentativ yolla alınan sefalosporin əsasında sintez edilir. Yalnız bir vəziyyətdə (6-amin qrupunda) əvəzedicilərin daxil edilməsi mümkün olduğu pensillinlərdən fərqli olaraq, sefalosporinlərdə həm 7-amin qrupunda, həm də C-3 vəziyyətində əvəz edicilərin daxil edilməsi mümkün olduğundan çox sayda müxtəlif dərman maddələrinin sintez edilməsinə şərait yaradır. Sefalosporin NaOCl/HCOOH mühitində iminolaktona qədər oksidləşdirilir, sonra 7-aminosefalosporan turşusuna hidroliz edilir. Bu turşu aminopeni sillian turşusundan fərqli olaraq fermentativ alınır. Daha sonra aminoturşu N-asilləşdirilir və 3- vəziyyətində asetil oksim qrupunda əvəzedicilər daxil etməklə müvafiq antibiotiklər alınır:



15. ALKALOİDLƏR

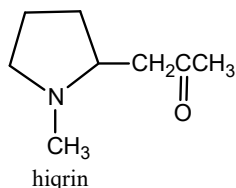
Alkaloidlər yüksək bioloji aktivliyə malik bitki mənşəli azotlu heterotsiklik birləşmələr olub bitkilərdə üzvi turşuların – limon, alma, oksalat, kəhrəbə və s. duzu şəklində rast gəlinir. Hal-hazırda 10000-dən çox alkaloid məlumdur. Alkaloidlər acı dadlı, rəngsiz kristallik maddələrdir. Alkaloidlər üçlü aminlər olub əsaslı xassəyə malikdirlər.

Alkaloidlər üzvi əsaslardır və turşularla duzlar əmələ gətirirlər. Alkaloidlər suda həll olmur, üzvi həlledicilərdə - efir, xloroform, benzolda həll olurlar. Onların duzları isə əksinə suda həll olur, üzvi həlledicilərdə həll olmurlar.

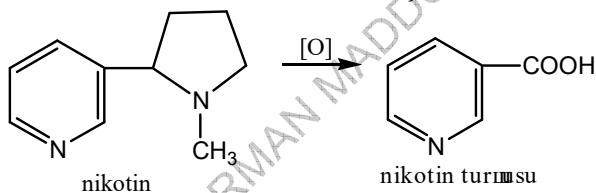
Alkaloidlərin əksəriyyəti optiki fəal birləşmələrdir. Əvvəllər alkaloidlər botaniki əlamətlərinə, yəni, bitki qruplarına görə təsnif edilmişdir, hal-hazırda isə onlar tərkibindəki azot əsaslarının təbiətinə görə təsnif edilir:

1. Piridin, piperidin və pirrolidinin törəmələri
2. Tropanın törəmələri
3. Purin alkaloidləri
4. İndol və imidazolun törəmələri
5. Xinin və izoxininin törəmələri

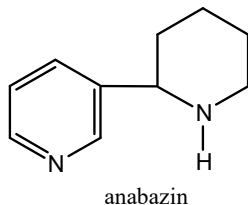
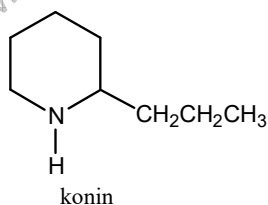
Piridin, piperidin və pirrolidinin törəmələri. Bunlara hiqrin, nikotin, anabazin, lobelin və s. aiddir. Hiqrinə pirrolidinin törəməsi kimi baxmaq olar. O pirrolun hidrogenləşməsinin törəməsi olub ən sadə alkaloidlərdən biridir. Hiqrin Amerikada bitən xüsusi bitki yarpağından ayrılır, ümumi stimullaşdırıcı təsirə malikdir.



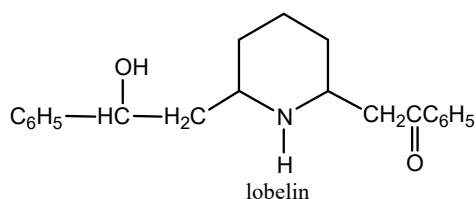
Nikotin sərbəst halda rəngsiz, yağvari mayedir. Tənbəki yarpağında 8%-ə qədər olur, zəhərlidir. Nikotini çoxlu miqdarda tütün sənayesi tullantılarından alırlar və kənd təsərrüfatı zərərvericilərinə qarşı istifadə edirlər. Tərkibində bir qat rabitələrlə birləşən piridin və pirrolidin həlqələri var. Nikotin vegetativ sinir sisteminə təsir edir və qan damarlarını daraldır. Nikotindən metil qrupunu qopardıqda nornikotin alınır. Nikotinin sərt şəraitdə oksidləşmə məhsullarından biri nikotin turşusudur.



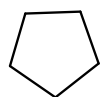
Konin və anabazin - molekullarında piperidin nüvəsi olan, çox zəhərli alkaloidlərdir. Konin dəri hissiyatında iştirak edən hərəkəti və hissi sinirlərin uclarını iflic edir. Anabazin böyükdən alınıb.



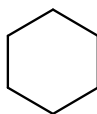
Lobelin və onun törəmələri və onun törəmələri xüsusi bitkilərdən alınır, tibbdə hidroxloridlər şəklində tənəffüsü stimullaşdıran səmərəli vasitə kimi istifadə edilir.



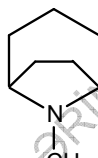
Tropan və onun törəmələri. Tropan kondensləşmiş piperidin və pirroldin tsklindən ibarət bitsiklik birləşmədir.



pirrolidin

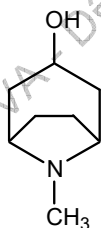


piperidin

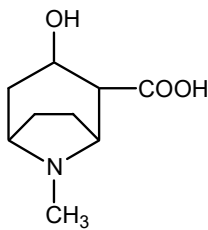


tropan

Bu qrup alkaloidlər və onların sintetik analoqlarının struktur əsasını tropan təşkil edir. Kimyəvi quruluşuna görə onlar iki qrupa ayrılırlar: spirtli törəmə tropin spirti və spirt-turşu törəməsi ekqonin törəmələri.



tropin



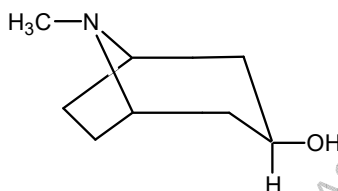
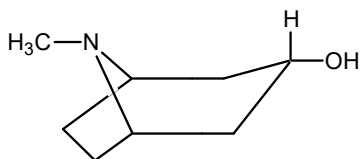
ekqonin

Tropan birləşmələrinin farmakoloji aktivliyi onun stereoquruluşundan asılıdır. Tropanın iki konfigurasiyasını göstərmək olar:

Yəhər- forma

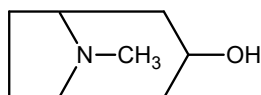
və

Kreslo- forma.

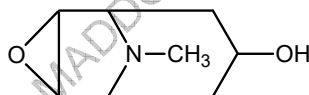


Tropən sırası alkaloid preparatlarına onların duzları daxildir: atropin-sulfat, skopolamin-hidrobromid və onun sintetik analoqları olan homotropin -hidrobromid, tropasin və tropafen.

Skopolamin - skopin spirtinin törəməsi olub tropindən 6,7 vəziyyətindəki oksigen atomunun olması ilə fərqlənir.

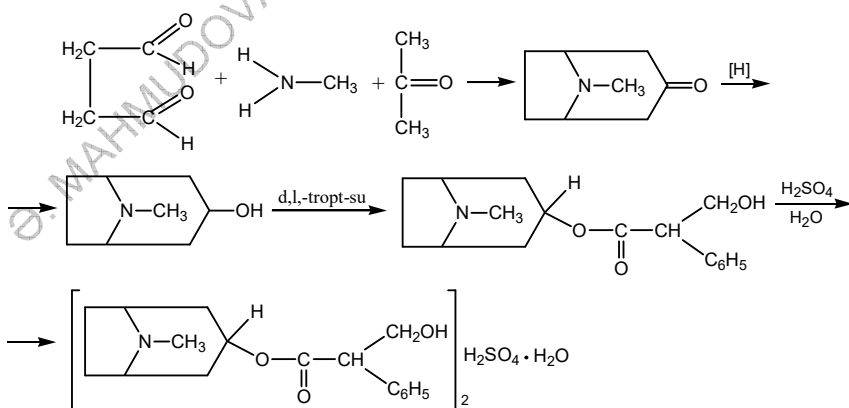


tropin spirti

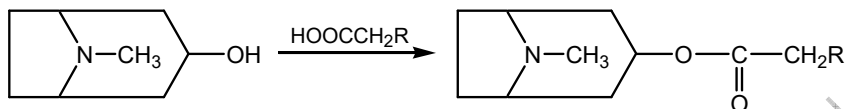


skopin spirti

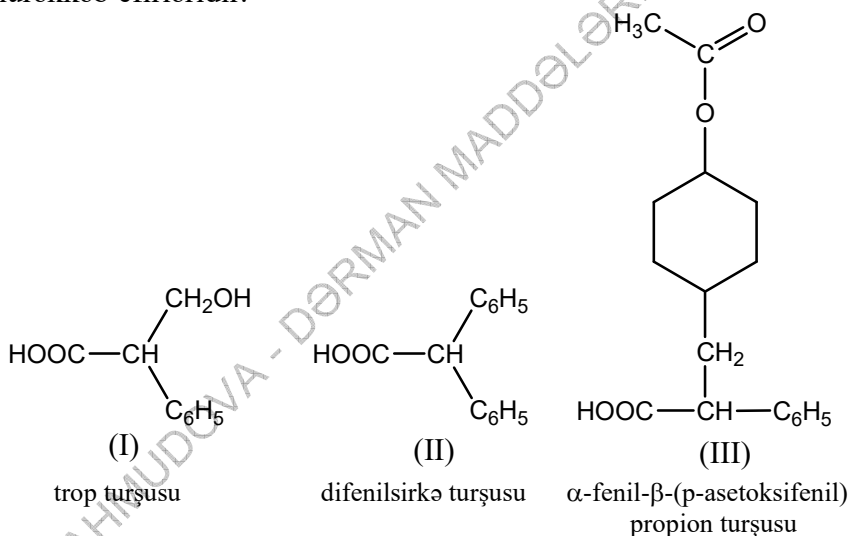
Atropinin sintezi 1917-ci ildə Robinson tərəfindən aşağıdakı sxem üzrə aparılmışdır:



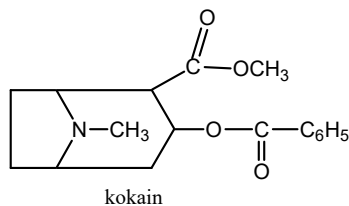
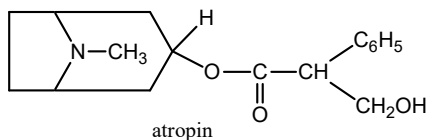
Tropan alkaloidlərinin sintetik analoqları tropindən aşağıdakı ümumi sxem üzrə alınır:



Beləliklə, atropin *d,l*-trop turşusunun (I), hiossiamin, skopolamin – *l*-trop turşusunun, tropasin difenilsirkə turşusunun (II), tropafen α -fenil- β -(*p*-asetoksifenil) propion turşusunun (III) mürəkkəb efirləridir.



Tropanın törəmələri atropin və kokain – tibdə istifadə olunan dərman maddələridir.



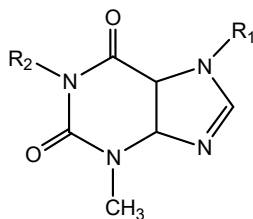
Atropin yüksək zəhərliliyinə baxmayaraq, göz qapağını genişləndirmək xassəsinə görə, tibb praktikasında işlədilir.

Kokain bitkilərdən alınır, tibbdə yerli keyləşdirici və narkotik vasitə kimi istifadə olunur.

Homotropin, tropasin və tropafenin sintezi zamanı difenil - sirkə və fenil β -propion turşusu və ya onların xloranhidridlərindən istifadə olunur. Tropan preparatları ağ kristallik maddələrdir. Ərimə temperaturları 186-194 °C arasında dəyişir. Bunlar əsasən suda yaxşı həll olur. Tropasin və tropafen xloroformda da yaxşı həll olur. Tropafen özünə məxsus iyi olan etilasetat əmələ gəlməsində iştirak edən asetoksi qrupunun olması ilə tropasindən fərqlənir.

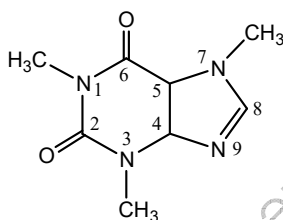
Atropin-sulfat çox kiçik dozada bronxial-asma, böyrəklərin və sidik yollarının spazmasında təyin edilir. Çox xəstəliklərin müalicəsində atropin-sulfat və homatropin hidrobromidin 0,5-1,0%-li məhlulundan istifadə olunur. Skopolamin-hidrobromid mərkəzi sinir sisteminə sakitləşdirici təsir göstərir. Skopolanin və hiosiamin tablet forması aeron adı altında profilaktikada hava və dəniz xəstəliklərinin müalicəsində təyin olunur. Tropasin parkinsonizm, pazez və iflic, bronxial asma xəstəliklərində təyin edilir. Hipertonik kriz və preferik qan dövranının pozulması xəstəliklərinin müalicəsində isə tropafenin 1-2%-li məhlulu təyin edilir.

Purin alkaloidləri. Bunlara kofein, teofillin və teobromin aiddir. Ümumi formulu:



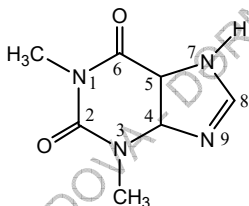
$R_1 = \text{CH}_3; \text{H}$

$R_2 = \text{CH}_3; \text{H}$

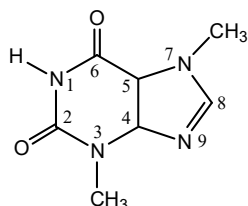


1,3,7-trimetilksantin (kofein)

Kofein sinir sistemini həyəcanlandırır və ürəyin fəaliyyətini artırır.



1,3-dimetilksantin (teofillin)

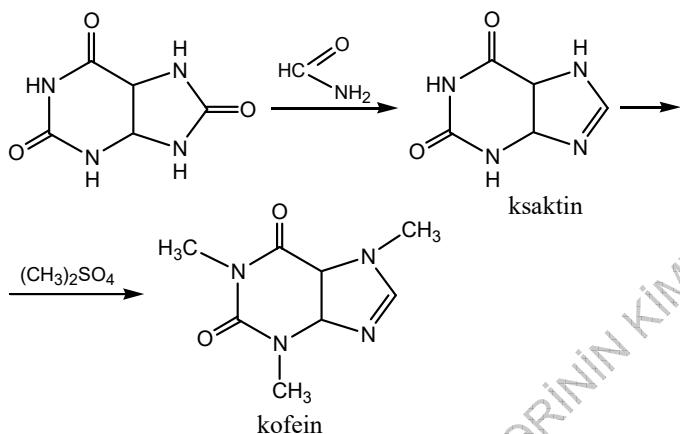


3,7-dimetilksantin (teobromin)

Teofillin və teobrominin ümumi stimulaşdırıcı qabiliyyəti bir qədər aşağı olub, lakin sidik qovucu xassəyə malikdirlər.

Purin alkaloidləri üçün xammal çay emalı sənayesi tullantılarıdır. Purin alkaloidlərinin sintez üsulu ilə alınmasının mümkünlüyü əlverişli ilkin maddənin olmasına əsaslanır.

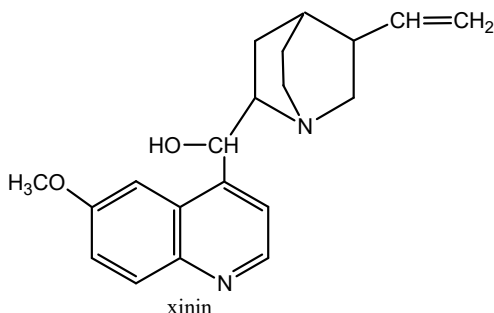
İlkin maddə olaraq götürülən sidik turşusu quşların tullantılarında 25%-ə qədər olur.



Kofeinə pH=8-9 olduqda KOH və CH₃OH ilə 60-70°C metilləşdirdikdə teobromin alınır.

Kofein, teofillin və teobromin ikiqat duzları şəklində tibbdə istifadə edilir. Kofein benzoat, teobromin salisilat duzu şəklində temisal adı ilə, teofillin isə diamin şəklində eufillin adı ilə tibbdə tətbiq edilir.

Xinin. Xinin Kolumbiya, Peru, Boliviya, Şərqi Afrikada bitən kinə ağacının qabığından alınan mühüm alkaloiddir. Kinə ağacının qabığının kütləyə 7,5%-ni xinin təşkil edir. Xinin rəngsiz, acıdadlı kristallardır. Sintetik yolla 1945-ci ildə alınmışdır.



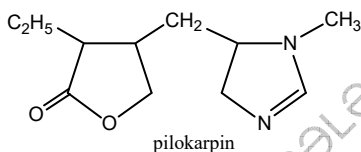
Dörd diastereoizomeri mövcuddur – dördü də malyariya əleyhinə güclü təsirə malik maddələrdir. Ən mühümü xinidin olub, bu da C₉ atomunun konfigurasiyası ilə fərqlənir, rəngsiz kristallar olub $t_{\text{er}}=173,5^{\circ}\text{C}$, $d_D^{20}=334,2$ antiartimik təsirə malikdir. Xinidin xininin – diastereoizomeri olub kinə ağacının qabığının kütləcə 0,25-1,25% təşkil edir. İkinci dünya müharibəsinə qədər xinin malyariya əleyhinə yeganə maddə olmuşdur. Təbii xinin hidroxlorid və sulfat duzları şəklində tibbdə tətbiq edilir. Müharibə zamanı kinə ağacının gətirilməsi qeyri-mümkün olduğundan malyariya əleyhinə sintetik dərman maddələrinin alınması sahəsində əhəmiyyətli işlər görülməyə başladı. Yaxın zamanlarda xloroxin formalı (ildırım sürətli malyariya) malyariya əleyhinə maddə kimi xinin yenidən mühüm əhəmiyyət kəsb etməyə başlamışdır.

Kinə ağacı avropalılara 16-cı əsrdən məlum olmuşdur: Cənubi Amerikadan olan yadellilər onunla malyariyanı müalicə edirdilər. Perunun vitse kralı, qraf Luis Xinxonun xanımı İspan yəhudilərinin məsləhəti ilə kinə ağacının qabığından alınan “qırmızı su” vasitəsilə malyariyadan müalicə olunmuşdur. 1640-cı ildə bu ağacın qabığı Avropaya gətirilir, lakin 1737-ci ilə qədər botaniklər tərəfindən qeydə alınmamışdır. 17-ci əsrdən yabanı bitən kinə ağacının qırılması başlanır ki, 19-cu əsrin ortalarında onun tamamilə məhv olması təhlükəsi yaranır. Peru hökuməti xinin istehsalında monopolyanı saxlamaq üçün ağacın toxumunun və əkin materialının ölkədən çıxarılmasına qadağa qoyur. Bütün bunlara baxmayaraq 1865-ci ildə Çarl Ledjeru kinə ağacının toxumunu əldə edir və Yava adasına gətirir, burada ilk plantasiyalar salınır. Hal-hazırda kinə ağacı bir sıra tropik ölkələrdə yayılmışdır.

Dünya miqyasında kinə ağacının emalı əsasən İndoneziyanın payına düşür. Kinə ağacı alkaloidləri qələvi mühitdə üzvi ekstragentlər tərəfindən ayrılır, sulfat turşusu ilə işlənir, bu zaman

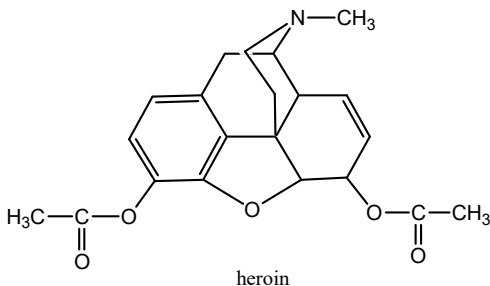
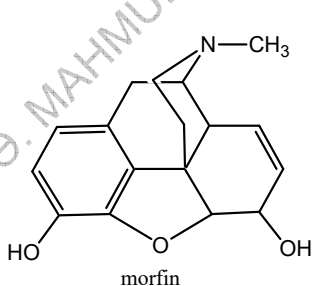
xinin sulfat çökür. Daha sonra tsinxonidin, xinidin və tsinxonin kristallarından ibarət qarışıq ayrılır.

İndol və imidazoun törəmələri. Bu qrup alkaloidlərə rezerpin və strixnin aiddir, əsasən bitkilərdən alınır. Rezerpin – qan təzyiqini aşağı salır. Strixnin isə güclü zəhərli maddədir az miqdarı həyəcanlaşdırıcı və tonusu artıran dərman kimi işlədilir. Pilokarpin-tərkibində imidazol həlqəsi olan alkaloidlərə aiddir və göz xəstəliklərində geniş istifadə olunur.



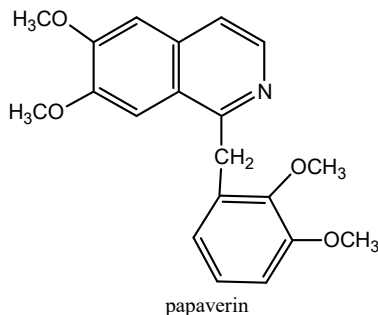
Xinolin və izoxinolinin törəmələri. Bu sıra alkaloidlərə kinə ağacının qabığında olan xiniyi misal göstərə bilərik. Xininin tərkibinə xiniolin və xinuklidin heterotsiklləri daxildir.

Xinolin və izoxinolin nüvələri optium alkaloidlərinin tərkibində vardır. Bunlardan ən mühüm – morfin - güclü ağrıkəsici xassəlidir, lakin uzun müddət işlətdikdə narkomaniyaya səbəb olur. Morfinin diasetil törəməsi heroin adlanır və narkotik maddədir.



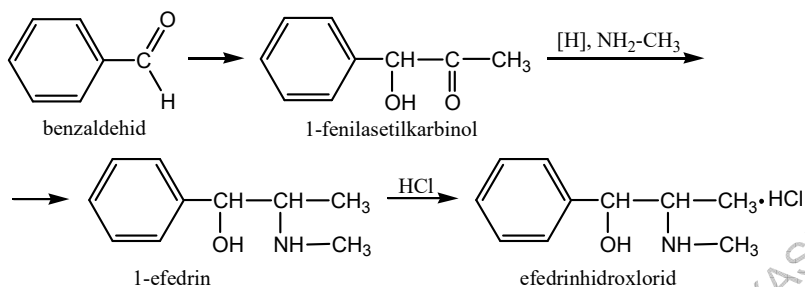
İzoxinolin nüvəli alkaloidlərə effektiv preparat olan papaverini

misal göstərmək olar.



Aromatik sıra alkaloidləri.

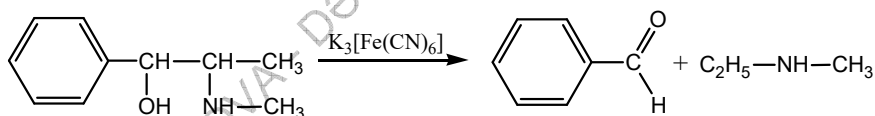
Bu qrupa daxil olan efedrin və onun diastereomeri olan psevdofedrin efedrinin (cırmoruq) müxtəlif növlərindən alınır. Eradan 3000 il əvvəl bu bitki çox geniş yayılmışdı və o xalq təbabətində geniş istifadə olunurdu. Zabaykaliyedə bitən efedrinin tərkibi daha keyfiyyətlidir. Keçmiş SSRİ-də bu bitki efedrinin alınması üçün əsas xammal idi. Efedrin xammaldan ümumi alkaloidlərin alınması üsulları ilə hasil olunur. Efedrin və psevdofedrin bir-birindən onların oksalat duzunun suda həll olmasına görə fərqlənir (psevdofedrinin oksalat duzu daha yaxşı həll olur). Efedrin molekulunda assimetrik karbon atomunun olması 2 diastereomerin əmələ gəlməsinə səbəb olur: onların hər ikisi 2 optik antipoddan təşkil olunub: sağ və sol. Efedrinin sol eritro izomeri biosintez vasitəsilə alınır, bu da benzaldehydin iştirakı ilə şəkərlərin maya vasitəsilə qıcqırmasına əsaslanır. Qıcqırma prosesinə optik izomerin reaksiya kütləsinin dəyişməsinə görə nəzarət edirlər. Sonra sol fenilasetilkarbinol metilaminləşdirilir və sonuncuya HCl təsirindən efedrin hidroxlorid alınır:



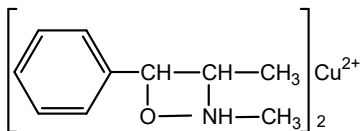
Efedrin spirtə həll olur, suda pis, efirdə isə praktiki olaraq həll olmur. Efedrin hidrokslorid (1-1-fenilaminopropanol-1 hidrokslorid) rəngsiz, iysiz acı dadlı ağ kristal maddədir. Ərimə temperaturu 33° - 36°C , qaynama temperaturu isə 216° - 220°C -dir.

Efedrinin tərkibini təyin etmək üçün iki üsuldən istifadə edilir:

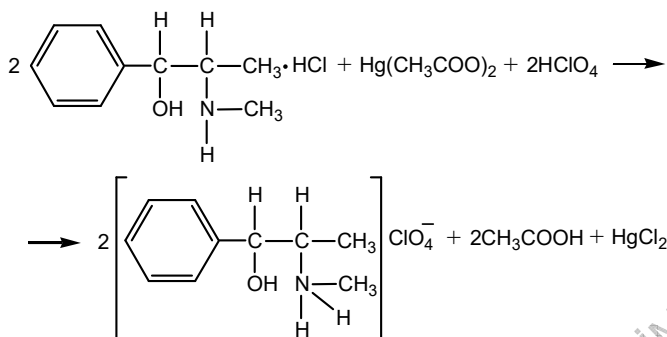
1-ci üsul efedrinin qırmızı qan dızunun təsirindən benzaldehidə parçalanması reaksiyasıdır. Bu da benzaldehidin özünəməxsus acı badam iyi verməsi ilə müəyyən edilir.



2-ci üsul efedrinin sulfat turşusunun mis duzu ilə rəngli reaksiyasına əsaslanır və aşağıdakı kompleks alınır:



Efedrin hidroksloridin miqdarı təyini üçün titrimetrik üsuldən istifadə olunur:



Preparatı həmçinin neytrallaşma və argentometrik üsullarla da təyin etmək olar. Efedrin qablaşdırılmış şəraitdə, gün işığı düşməyən yerdə saxlanılır. Efedrin hidroxloriddən bronxial asma, allergik xəstəliklərdə, yüksək arterial təzyiqdə istifadə olunur. Daxilə 0.025-0.05 qr həblər, əzələ daxilinə və venaya 1 ml 5 %li məhlul şəklində istifadə olunur. 2-5%-li məhlulu bəbək genəldici kimi işlədilir.

Alkaloidlərin miqdarı təyini fiziki (həllolma, ərimə temperaturu), kimyəvi (çökdürmə, rəngli reaksiyalar) və fiziki kimyəvi metodlarla öyrənilir. Alkaloid preparatlarının (sitizin, kodein, kofein, teobromin, teofillin, rezerpin) tərkibində duzlar, bromid, yodid, sulfat, nitrat, çaxır, benzoy, salisil turşuları olur. Alkaloidlərin tərkibindəki duzları təyin etmək üçün qüvvətli qələvilərdən istifadə olunur. Ümumiyyətlə alkaloidlərin təyində çökdürmə üsulu geniş tətbiq olunur. Bu zaman tərkibində ağır metallar olan reaktivlərdən gümüş (teobromin, teofillin), kobalt (sitizin, teobromin, teofillin), 3 valentli dəmir (sitizin), 2 valentli mis (efedrin) istifadə olunur.

Fiziki kimyəvi üsullardan spektrofotometriyanı göstərmək olar. Alkaloidlərin təyində titrimetrik analizdən daha geniş istifadə olunur.

16. VİTAMİNLƏR

Qida ilə qəbul edilən, həyat üçün zəruri olan və orqanizm tərəfindən energetik material kimi istifadə edilməyən bioloji aktiv maddələr vitaminlər adlanır. Birinci dəfə düyü kəpəyindən əldə edilmiş maddənin tərkibində amin qrupu olduğundan polşa alimi Kazimir Funk bu qrup birləşmələri vitaminlər adlandırdı. Latınca vita-həyat, vitamin-həyat amini deməkdir. Sonralar müəyyən edildi ki, vitaminlər qrupuna daxil olan maddələrin əksəriyyətinin tərkibində amin qrupu yoxdur. Lakin vitamin termini indiyə kimi geniş istifadə olunur.

Qida maddələrinin tərkibində vitaminlərin tamamilə olmaması nəticəsində əmələ gələn xəstəliklərə **avitaminozlar** deyilir. Eyni zamanda bir neçə vitaminin olmaması **polivitaminoz** adlanır. Qidada vitaminlərin tamamilə olmaması nadir hallarda təsadüf edilir. Lakin bu və ya digər vitaminin qismən çatışmazlığı nəticəsində baş verən xəstəliklər nisbətən geniş yayılmışdır, belə xəstəliklərə **hipovitaminozlar** deyilir. Hipovitaminoz hallarında orqanizmdə maddələr mübadiləsi bir qədər pozulur və bəzi kliniki əlamətlər müşahidə olunur. Vitaminlər insan və heyvan orqanizmlərində cüzi miqdarda olaraq, çox mühüm fizioloji rol oynayır.

Vitaminlərin həddindən artıq qəbul edilməsi də bir sıra xəstəliklərin əmələ gəlməsinə səbəb olur. Belə xəstəliklərə **hipervitaminozlar** deyilir. Hipervitaminoz həddindən artıq retinal və kalsiferolun qəbul edilməsindən irəli gəlir.

Vitaminlər yalnız hipo və ya avitaminoz hallarda istifadə edilmir, onlar həm də ürək-damar terapiyasında, əsəb, dəri, göz, mədə-bağırsaq xəstəlikləri zamanı da istifadə edirlər.

Vitaminlərin təsnifatı

İlk təsnifat onların həlledicilərə münasibətinə əsaslanır. Vitaminlər həlledicilərə münasibətinə görə iki qrupa bölünür:

1. Yağda həll olan vitaminlər.
2. Suda həll olan vitaminlər.

Vitaminlərin daha əlverişli təsnifatı onların kimyəvi təsnifatıdır ki, bu təsnifata görə vitaminlər aşağıdakı qruplar və altqruplar üzrə təsnif edilir:

I. Alifatik sıra vitamin preparatları.

1. Doymamış polioksi- γ -laktonların törəmələri olan vitaminlər - Askorbin turşusu - C vitamini.
2. Qlükon turşusunun efirləri Panqam turşusu.
3. β -amin turşuların törəmələri. Pantoten turşusu.

II. Alitsiklik sıra vitamin preparatları.

1. Tsikloheksenilizoprenid vitaminlər. Retinollar (A qrup vitaminləri).
2. Tsikloheksanaletilenhidridindən vitaminləri. Kalsiferollar (D qrup vitaminlər).

III. Aromatik sıra vitamin preparatları.

1. Naftoxinonun törəmələri.
 - a) K qrup təbii vitaminləri. Tilloxinonlar - K_1 qrupu vitaminləri, menaxinonlar - K_2 qrupu vitaminləri.
 - b) K qrup vitaminlərinin sintetik analoqları (menadion, vikasol)

IV. Heterotsiklik sıra vitamin preparatları.

1. Xromanın törəmələri.
 - a) Tokoferollar E qrup vitaminləri.
 - b) Flavanoid, P qrup vitaminlər.

Vitaminlər kimyəvi quruluşa malik üzvi birləşmələr olub həyat üçün zəruri hesab edilən bioloji aktiv maddələrdir.

Vitaminlərin cüzi miqdarda qəbulu orqanizmdə gedən kimyəvi çevrilmələrin və fizioloji proseslərin tənziminə səbəb olur.

Vitaminləri şərti olaraq latın əlifbasının müxtəlif hərfləri ilə işarə edirlər. Bundan əlavə bir sıra vitaminlərin adlandırılmasında iki prinsipdən istifadə edilir. Bunların birincisində vitaminlərin kimyəvi tərkibi, ikincisində isə bioloji təsir xüsusiyyəti (yəni onun hansı xəstəliyin qarşısını alması əsas götürülür).

Yağda həll olan vitaminlər

Rəmzi işarəsi	Kimyəvi adı	Bioloji təsir xüsusiyyəti
A vitamini	Retinal	Antikeeroftalmik vitamin
D vitamini	Kalsiferal	Antiraxitik vitamin
E vitamini	Tokoferal	Nəsiltörətmə vitamini
K vitamini	Filloxinon	Antihemorragik vitamin

Bundan başqa yağda həll olan vitaminlərə Q vitamini (ubixinon) və F vitamini (doymamış turşular kompleksi) daxildir.

Suda həll olan vitaminlər

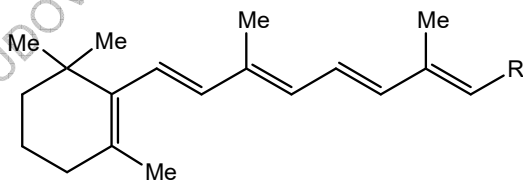
Rəmzi işarəsi	Kimyəvi adı	Bioloji təsir xüsusiyyəti
B ₁ vitamini	Tiamin	Antinevrit vitamini (aneyrin)
B ₂ vitamini	Riboflavin	
B ₃ vitamini	Pantoten turşusu	Antidermatit amili
B ₅ (PP) vitamini	Nikotin turşusu və ya Nikotinamid	Antipellaqra vitamini
B ₆ vitamini	Piridoksin	Antidermatit amili
B ₁₂ vitamini	Siankobalmin	Antianemik
B ₁₅ vitamini	Panqam turşusu	Antianemik
B _e vitamini	Fol turşusu	Antianemik
C vitamini	Askorbin turşusu	Antiskorbut vitamini

P vitamini	Sitrin	Keçiricilik vitamini
H vitamini	Biotin	Antisebborpeya vitamini
B ₁ vitamini	Kartitin	
U vitamini	s-metiltionin	

Tsikloheksenilizoprenoid vitaminlər, retinollar.

A vitamini (antikseroftalmik vitamin, retinol)

A vitamini (retinol) biratomlu doymamış tsiklik spirtidir. Normal şəraitdə açıq sarı rəngli kristallik maddə olan A vitamininin ərimə temperaturu 63-64°C-dir. A vitaminin molekulunda β -ionan həlqəsi və iki ədəd izopren qalığından (metilbutadien) ibarətdir. A vitamininin bir neçə vitameri məlumdur: retinol, retinal, retin turşusu. Retinol kənar hidroksimetil qrupuna malikdir (bu da dəri və sümük toxumasının normal funksiyası və artması, həm də spermanın əmələ gəlməsini stimullaşdırmaqdan ötrü vacibdir). Retinal aldehid qrupuna malikdir ki, bu da görmə prosesi üçün mühüm əhəmiyyət kəsb edir. Retin turşusu karboksil qrupuna malikdir, onun biofunksiyası retinola analojidir.



R = CH₂OH – retinol (A₁ vitamini)

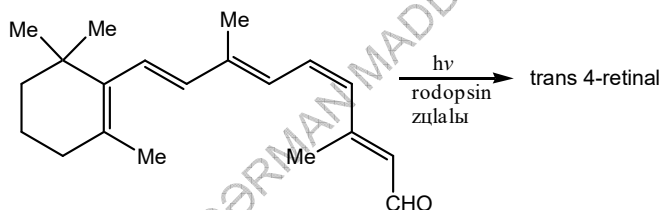
R = CHO – retinal

R = COOH – retin turşusu (A₂ vitamini)

A vitamininin çatışmazlığı nəticəsində erkən meydana çıxan əlamətlərdən biri toyuq və gecə korluğudur. Gecə korluğuna tutulan

şəxslərin gözünün qaranlığa qarşı adaptasiya qabiliyyəti pozulur. Bundan başqa dərinin qabıqlanmasına, ümumi arıqlamaya, iştah pozğunluqlarına səbəb olur. A – avitaminoz zamanı epitel hüceyrələrin normal inkişafı pozulur. Məsələn, göz yaşı vəzilərinin ifraz etdiyi göz yaşı azalır və ya tamamilə kəsilir, gözün buynuz qışası quruyur, buna da kseroftalmiya deyilir (yunanca xeros – quru, optalmos – göz deməkdir).

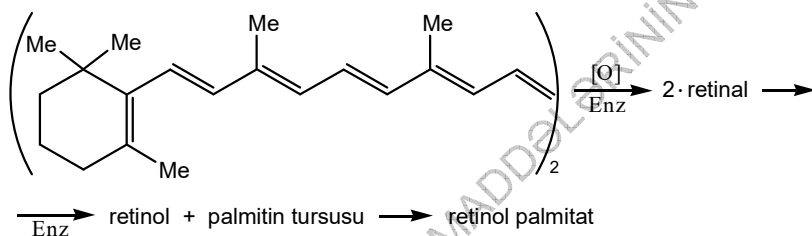
"A" vitamininin gözün görmə qabiliyyətinə təsir mexanizmi aydın edilmişdir. Sübut edilmişdir ki, A vitamininin oksidləşmiş forması olan retinalın sis izomeri opsin zülalının prostetik qrupunu təşkil edir. Retinal opsin ilə xromoproteid olan rodopsin əmələ gətirir. Rodapsin isə gözün işığa həssas olan əsas maddəsidir:



A vitamini yalnız heyvan mənşəli ərzaq məhsullarında olur. A vitaminin əsas təbii mənbələri balıq yağı, kərə yağı, süd, yumurta və qara ciyərdir. Bitkilərdə isə onun provitaminləri (karotin, kriptoksantin) geniş yayılmışdır. Bitkilərin tərkibində olan qırmızı-cəhrayı rəngli pigment maddələri-karotinlər heyvani orqanizmdə aşanlıqla A vitamininə çevrilirlər. Provitaminlər quruluş etibarı ilə vitaminlərə oxşayır və müəyyən şəraitdə vitaminə çevrilirlər. Tərkibində karotin olan bitki mənşəli qida məhsulları (yerkökü) A vitamininin çatışmazlığını aradan qaldırır. Karotinləri ilk dəfə Vagenroder almışdır. Onlar bitkilərdə və mikroorqanizmlərdə sintez olunurlar. İndiyə kimi karotinlərin üç növü öyrənilmişdir. α , β , γ -

karotinlər. Onlar bir-birindən tərkibinə daxil olan β -ionon halqalarının sayına görə fərqlənirlər. γ -karotində bir ionon həlqəsi, β -karotində iki β -ionon həlqəsi, α -karotin molekulunda isə bir β -ionon və bir α -ionon həlqəsi olur.

Karotin qaraciyər və bağırsaqlarda olan karotinoza fermentinin təsiri altında retinala parçalanır, retinal reduksiya olunaraq retinola çevrilir ki, o da ali yağ turşularının efirləri şəklində qaraciyərdə toplanır.

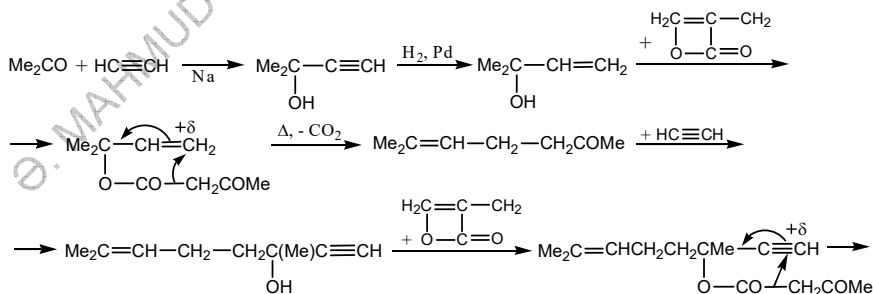


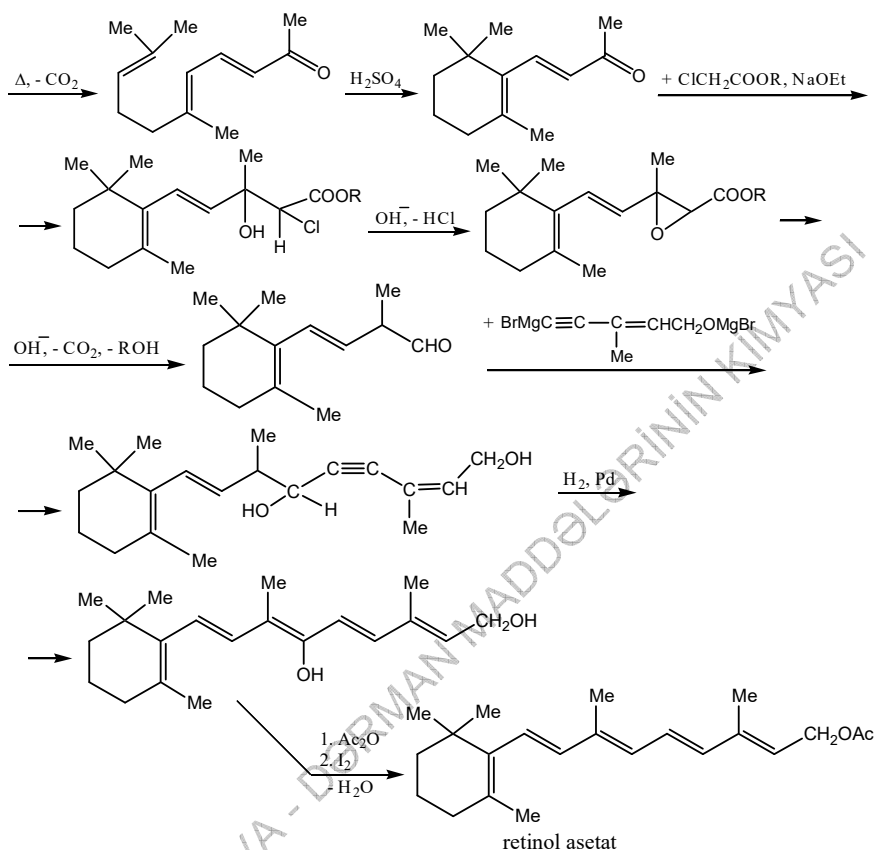
Yaşlı insanlar gündəlik tələbatı 1-2,5 mq-a bərabərdir. Bu profilaktik miqdardır. Bunu 2-5 mq karotinlə əvəz etmək olar. Xəstə insanlar üçün 10 mq, bu doza 30 mq-dan yuxarı olmamalıdır, çünki hipervitaminoza gətirib çıxara bilər.

A kompleks vitaminlərinin əsas alınma mənbələri balıqların qara ciyəridir. Təzə ciyər xırdalanır 82-85°C temperaturda 25% NaOH hidroliz olunur. Hidroliz nəticəsində retinolun zülallarla rabitəsi qırılır. Alınmış konsentrat dixloretanla ayrılır. Həllədicisi qovulur.

Dərman preparatı kimi retinol asetat şəklində tətbiq edilir. Vitamin A gözün, dərinin və bəzi soyuqdəymə və infeksiyon xəstəliklərin müalicəsində istifadə olunur. A vitamini sənayedə karbon zəncirini tədricən artırmaqla müxtəlif mərhələlərdə asetilen, aseton, diketon, xlor sirkə turşusu və metilvinilketonun iştirakı ilə

alınır. Asetilenin asetona və asiltörəmələrə birtipli elektrofil birləşmə reaksiyasından üçlü asetilen spirtlərin sintez edilməsində istifadə olunur. Spirtlərin asetilen rabitəsini palladium üzərində hidrogenləşdirməklə bərpa edirlər. Spirtlərin efirlərə qədər asilləşməsi reaksiyasını bu efirlərin aseetilen qrupunu növbəti dəfə termiki qruplaşdıraraq dekarboksilləşdirmə müşayiəti ilə 2 dəfə aparırlar. Ketotrein (psevdoionon) sulfat turşusunda (H_2SO_4) tsikilləşdirilərək β -iononu əmələ gətirir. Cod agentin iştirakı ilə β -iononu xlor sirkə turşusunun efirinə birləşdirərək xlorhidrinə çevirirlər, hansı ki, sonra onu dextlorlaşdırdıqda oksiran alınır. Oksiran cod şəraitdə qızdırdıqda hidroliz nəticəsində karbon dioksid (CO_2) ayrılır, heterotsiklin açılır və tərkibində 14 karbon atomu olan aldehid əmələ gəlir. Növbəti mərhələ tərkibində 20 karbon atomu olan spirtin sintezində aldehidin vinilasetilen spirti ilə dimaqneziumbromidin qarşılıqlı təsiri ilə tamamlanır. Bu üsulla sintez olunan asetilen törəməsi tetraendiola qədər selektiv birləşdirilir. Bunu da sonuncu 2 mərhələdə sirkə alhidridilə asilləşdirirlər və yodla işləməklə dehidratlaşdırırlar. Nəticədə O-asetat halında A vitamininin 2 qat rabitələrinə tam qoşulmuş *trans*-sistemi əmələ gəlir:



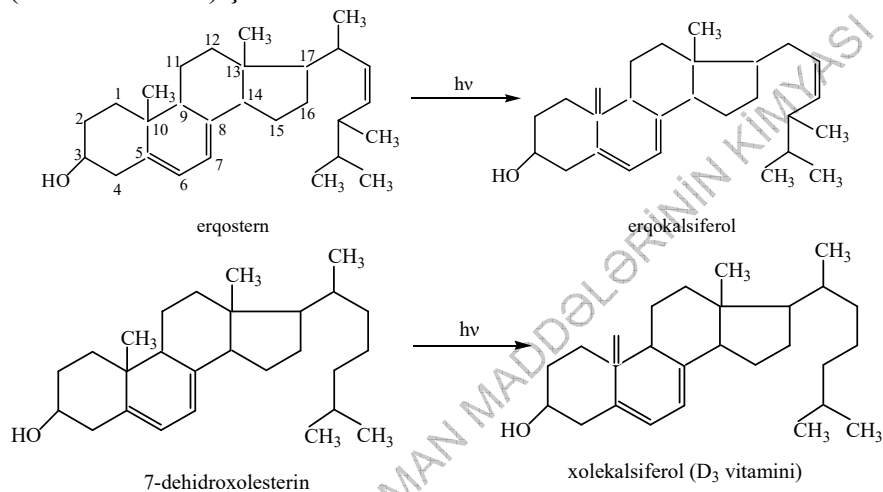


Tsikloheksanaletilenhidrindan vitaminləri Kalsiferollar

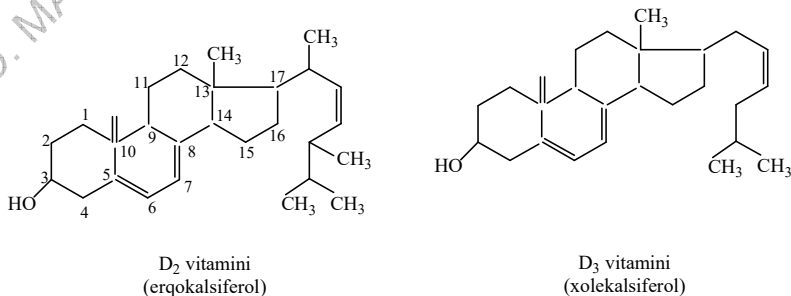
D vitamini (antiraxitik vitamin kalsiferol)

1919-cu ildə polyak alimi Quldsinski müşahidə etmişdir ki, raxitlə xəstələnmiş uşaqların dərisinə gün işığı və ultrabənövşəyi şüalarla təsir etdikdə onlar sağalırlar. Bir sıra heyvan və bitki mənşəli qida məhsulları ultrabənövşəyi şüaların təsiri altında antiraxitik təsirə malik olurlar. Müəyyən edilmişdir ki,

ultrabənövşəyi şüalar qida maddələrinin tərkibindəki bəzi sterinləri (xüsusilə də erqosterini və 7-dehidroxolesterini) raxit əleyhinə təsir göstərən maddəyə çevirir. Bu zaman erqosterin D₂ vitamininə (erqokalsiferola), 7-Dehidroxolesterin isə D₃ vitamininə (xolekalsiferola) çevrilir.



Erqosterin mayadan ekstraksiya etməklə alınır, eyni zamanda daha ucuz mənbəyi pensilinin istehsalında tullantı olan mitcelinlərdən alınır. Erqosterin ultra bənövşəyi şüaların təsiri ilə (fotoliz) prosesindən erqokalsiferon alınır. Bunun da çıxımı fotoliz şəraitindən, şüalanma mənbəyindən, müddətindən, dalğa uzunluğundan hv-dən asılıdır. Uzun müddət şüalandırmada toksik məhsullar alınır.



D vitamini bir neçə vitamer şəklində mövcuddur. Ən geniş yayılanı D₂ və D₃ vitaminləridir. D₃ vitamini insan orqanizminə D₂ vitamininə nəzərən aktiv təsir göstərir. Hər ikisi suda aktiv təsir göstərir. Hər ikisi suda həll olmayan kristallik maddədir. Yağlar və yağların həlledicilərində benzolda, xloroformal spirtə yaxşı həll olurlar.

D vitamininin hipovitaminozu zamanı sümüklərdə kalsium duzlarının miqdarı azalır. Buna görə sümüklər yumşalır və asanlıqla öz quruluşlarını dəyişirlər. Raxit xəstəliyinin ağır hallarında beyində ödem əmələ gəlir. Belə hallarda şişmiş beyin toxuması kəllənin yumşalmış sümüklərini asanlıqla genişləndirir, buna görə də raxitli xəstələrin başı böyük olur.

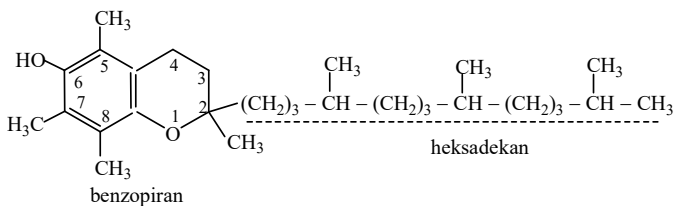
D vitamini kalsium və fosfor birləşmələrinin bağırsaq divarlarından sorulmasına yardım göstərir. Onun çatışmazlığı şəraitində qanda kalsium və fosforun miqdarı azalır.

D vitamininin təbii mənbələri süd, balıq yağı, qara ciyər, yumurta sarısı, kərə yağı. Gündəlik profilaktik tələbat 0,01-0,05 mq-dır. Raxitlə xəstələnmiş uşaqlar isə 1-1,5 mq-dır. Gündəlik tələbat 30-60 gün ərzində qəbul edilir.

Tokoferollar

E vitamini (nəsil törətmə vitamini tokoferol)

Bir sıra tədqiqatçılar (Evans və başqaları) 1936-cı ildə buğda rüşeymindən E vitamini qabiliyyətinə malik olan bioloji fəal üç birləşmə əldə etmişlər. Tərkibləri bir-birinə yaxın olan bu E vitaminlərinə α , β və γ tokoferol adı verilmişdir. Bu da yunancadan nəsil törətmək mənasını verir. Aşağıda α -tokoferolun formulu verilmişdir:



α tokoferol

β -tokoferolda 7-ci vəziyyətdə γ -tokoferolda isə 5-ci vəziyyətdə metil qrupu yoxdur.

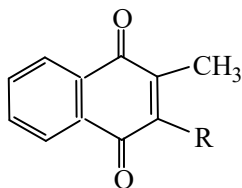
E-vitamini olmayan qida ilə müəyyən müddət bəslənmiş heyvanlarda E-avitaminoz müşahidə edilir və belə heyvanlarda nəsil törətmə qabiliyyətindən məhrum olur. Müəyyən edilmişdir ki, E vitamini təkcə nəsil törətmə qabiliyyətinə malik deyil, həmçinin eninə zolaqlı əzələlərin fizioloji halına əhəmiyyətli təsir göstərir. Onun avitaminozu eninə zolaqlı əzələlərin distrofiyası ilə nəticələnir. Əzələ distrofiyası maddələr mübadiləsinin pozğunluqları ilə birlikdə meydana çıxır.

E-vitamini qida məhsullarının tərkibində çox yayılmışdır. Pambıq yağı, kətan yağı, quru noxud, xəmir mayası, qara ciyər, kərə yağı, yumurta, südün tərkibində çoxlu miqdarda E-vitamini olur. Gündəlik tələbat 2-6 mq. Tibdə α -tokoferol asetat preparatı tətbiq edilir.



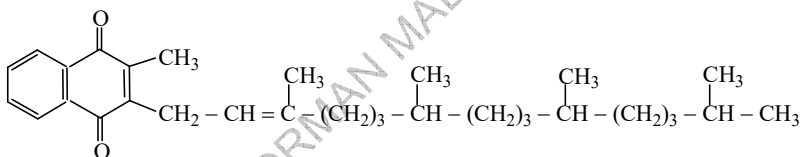
1929-cu ildə qansızmanın qarşısını alan bir vitamin müəyyən edilmişdir. Heyvan və bitki mənşəli ərzaq məhsullarından antihemorragik təsirə malik olan iki maddə K_1 və K_2 vitaminləri alınmışdır.

209

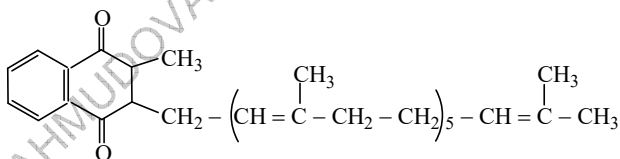


2-metil-1,4-naftoxinon

Yoncadan alınan K_1 vitamini ərimə temperaturu 20°C olan sarı rəngli maddədir. K_2 vitamini iylənmiş balıq unundan alınmışdır. Təzə balıq ununda K_2 vitamini olmur. Onu balığın çürüməsində iştirak edən bakteriyalar sintez edirlər. K_2 vitamininin ərimə temperaturu 52°C olan sarı rəngli kristallik maddədir. Onun bioloji aktivliyi K_1 vitamininə nisbətən zəifdir. (iki dəfə)



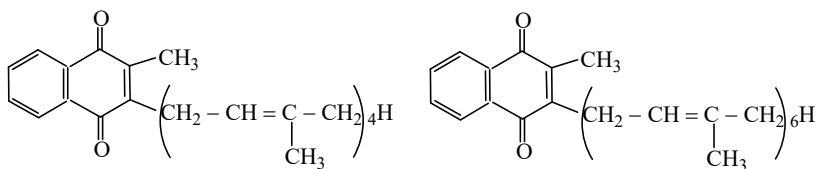
K_1 vitamini (filloxinon) 2-metil-3-fitil-1,4-naftoxinon



K_2 vitamini

Təbii K qrup vitaminləri şərti olaraq iki qrupa bölünür: filloxinonlar və menaxinonlar. K_1 – vitamini filloxinon təbiətdə geniş yayılmışdır. Bitkilərin yaşıl hissələrində

Menaxinonlar filloxinon-dan yan zəncirə görə fərqlənir.



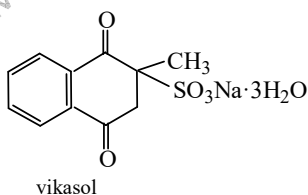
Təbii K qrup vitaminləri orqanizmə yalnız qida ilə daxil olur.

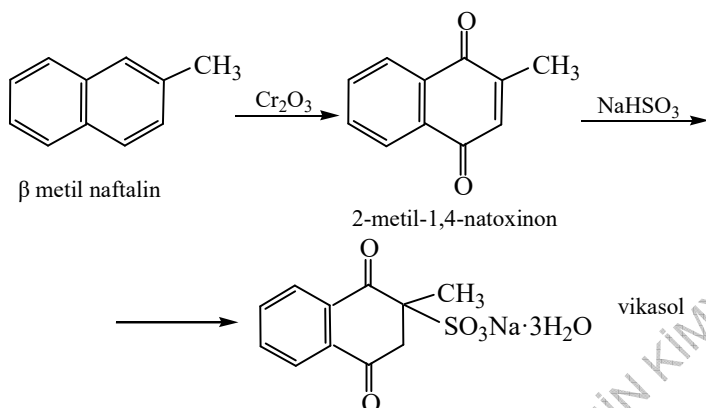
K vitamini qara ciyərdə protrombinin sintezini sürətləndirir. Protrombin qanın laxtalanmasında iştirak edən zülali maddədir. Laxtalanma prosesində protrombindən trombin əmələ gəlir. Trombin isə fibrinogenin fibrinə çevrilməsini təmin edir.

K vitamini həm qida ilə orqanizmə daxil olur, həm də normal bağırsaq florasında təşkil edən mikroorqanizmlər tərəfindən sintez edilir. İnsan və heyvanların bağırsaqlarında əmələ gələn K vitamini orqanizm üçün kifayət etdiyindən qida ilə ona əlavə K vitamini daxil edilməsinə ehtiyac qalmır.

K vitamininin sintetik analoqları

1947-ci ildə M.Ç.Şemyakin, A.B.Palladin və A.A.Şmuk tərəfindən eyni zamanda ayrı-ayrı laboratoriyalarda effektiv antihemorragig maddə sintez edildi. Vikasol K vitaminin sintetik analoqu olub ondan yan zəncirin olmamasına və suda həll olmasına görə fərqlənir, quruluşunun əsasını 2-metil 1,4-naftaxinon təşkil edir.

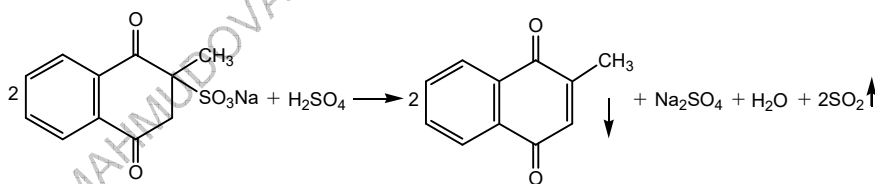




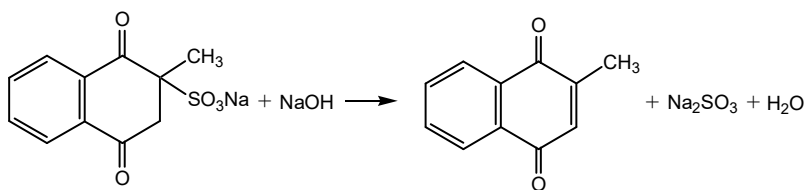
Vikasol kokskimya sənayesi məhsulu olan β -metil naftalin əsasında sintez edilir. Metilnaftalin xrom (VI) oksidlə 2-metil-1,4-naftaxinona (menadiona) oksidləşdirilir. Menadion hidrofily sulfoqrupun daxil edilməsi nəticəsində həll olan birləşməyə çevrilir.

Sulu məhlulda vikasol 2-metil-1,4-naftaxinon və natrium hidrosulfatoldan ibarət tarazlıq əmələ gətirir.

Vikasolun həqiqiliyi qatı sulfat turşusunun təsiri ilə natrium ionu və kükürd oksid əmələ gətirməsi ilə müəyyən edilir:

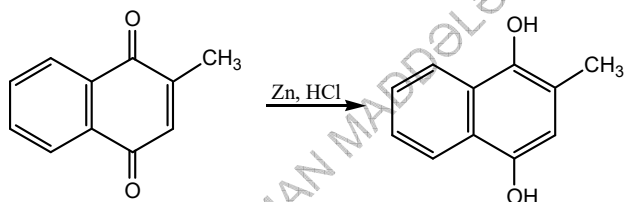


Vikasolun keyfiyyətini təyin etmək üçün ona qələvi məhlulu ilə təsir edirlər. Bu reaksiya nəticəsində 2-metil-1,4-naftoxinon alınır.

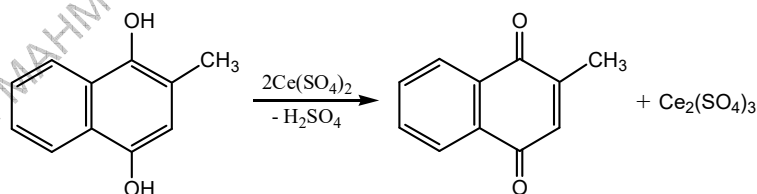


Bu reaksiya nəticəsində alınan çöüntü xloroformda ayrılır, qarışıqlardan təmizlənir və 2-metil-1,4-naftoxinon ərimə temperaturu (104-107 °C) təyin edilir.

Vikasolun həqiqiliyini yoxlamaq üçün 2-metil-1,4-naftaxinona HCl mühitində Zn tozu ilə təsir edirlər.



Alınmış 1,4-dioksi-2 metilnaftalin 0,1 N $\text{Ce}(\text{SO}_4)_2$ ilə titrlənir. Bu O-senantrolin indikatorundan istifadə edilir. $\text{Ce}(\text{SO}_4)_2$ 1,4-dihidroksi-2 metil naftalini turş mühitdə yenidən 2-metil-1,4-naftaxinona oksidləşdirir.

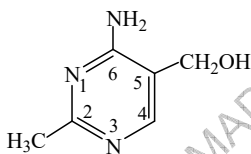


Ekvivalent nöqtədə o-fenantrolin qırmızı rəngdən göy rəngə çevrilir.

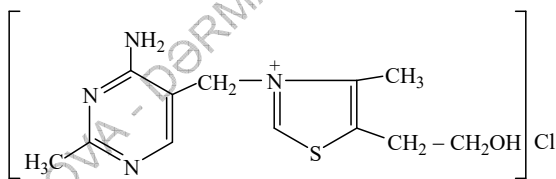
Vikasol spesifik kapillyar və digər qanaxmalar zamanında və əməliyyatlar qabağı qanaxmaların qarşısını almaq məqsədi ilə istifadə edilir.

B₁ vitamini (antinevrit vitamini aneyrin, tiamin)

1912-ci ildə polyak alimi K.Funk düyü kəpəyindən beri-beri xəstəliyinin müalicəsinə müsbət ətsir göstərən bioloji aktiv maddə aldı və bunu B₁ vitaminin molekulu iki komponentdən – primidin törəməsi olan 2-metil-5-hidroksimetil-6-aminopirimidindən və tiazol qalığından 4-metil-5-hidroksimetiltiazoldan təşkil olunmuşdur.



2-metil-5-hidroksimetil-6-aminopiridin

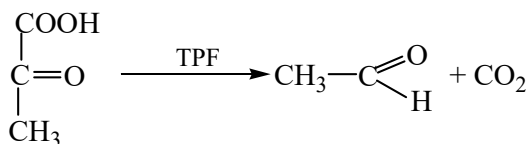


B₁ vitamini

Tərkibində həm kükürd, həm də amin qrupu olduğuna görə B₁ vitamininə tiamin deyilir. Suda həll olan rəngsiz kristallik maddədir.

Bağırsaqlardan sorulan B₁ vitamini qara ciyərdə ATF-lə reaksiyaya girərək tiamin-pirofosfata çevrilir.

Tiamin-pirofosfat dekarboksilazalar qrupuna aid olan fermentlərin kofermentidir. Bildiyimiz kimi dekarboksilazalar orqanizmdə piroüzüm turşusunun parçalanmasını sürətləndirən fermentdir.



Məlumdur ki, sulu karbonların parçalanmasından əmələ gələn piroüzüm turşusu sinir sistemi üçün zəhərli maddədir. B₁ vitamininin çatışmazlığı şəraitində ketoturşular başqa toxumalara nisbətən beyində daha çox yığılıb. Buna görə də beri-beri xəstəliyində ilk növbədə mərkəzi və periferik sinir sisteminə pozğunluqlar əmələ gəlir.

B₁ vitamininin ən mühüm mənbələri təmizlənmiş düyü, un, bundan başqa qarğıdalı, qoz, araxis. İnsanın gündəlik ehtiyacı 3-4 mq-a bərabərdir.

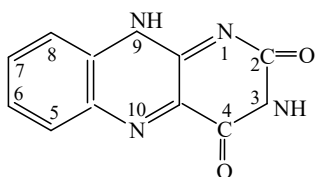
İzoalloksazinin törəmələri olan vitaminlər

B₂ vitamini (riboflavin, laktoflavin)

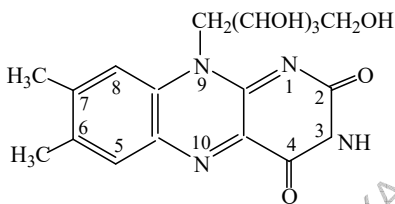
B qrup vitaminləri həmçinin flavin vitaminləri də adlanır. Bu birləşmələrlə maya, süd, ət, qara ciyər, yumurta ağı, arpa, buğda rüşeymləri zəngindir. Süddən alınan flaminlər laktoflavin, yumurta zülalından ovolflavin, limondan alınan sirtoflavin kimyəvi quruluşuna görə eyni olub, izoalloksazin və ribozadan təşkil olunub və bir adla - riboflavin adlandırılmışdır.

Müəyyən edilmişdir ki, yumurta sarısında və südün tərkibində heyvanların böyüməsini sürətləndirən sarı rəngli flüorosensiyaedici maddə var. Bu maddələrə flavinlər adı verilmişdir (flavin sarı deməkdir). Molekulyar tərkibinə görə, riboflavini (B₂ vitamini) iki maddənin birləşməsi hesab etmək olar. B₂ vitamini izoalloksazinin metillənmiş törəməsi ilə ribital spirtinin birləşməsindən ibarətdir.

Onun molekulunda ribital spirti izoalloksizinin 9-cu vəziyyətində yerləşən azot atomu ilə rabitələnir.



izoalloksazin



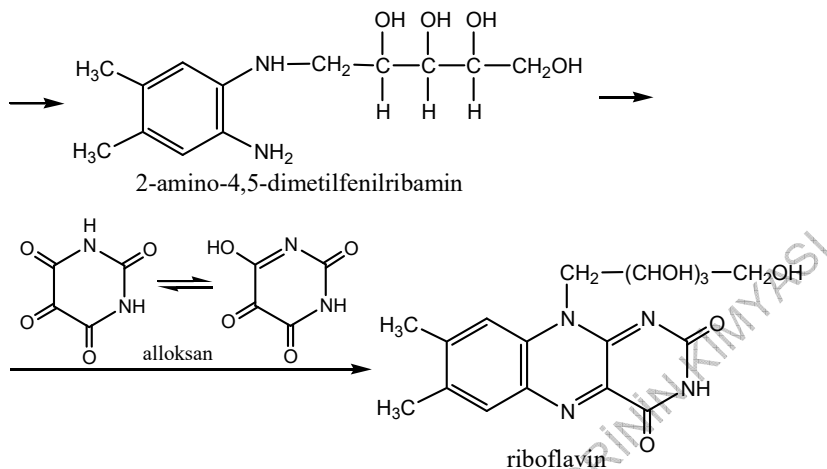
6,7-dimetil-9-β-D ribitil izoalloksozin

İnsan və heyvanların qidasında B₂ vitamini almadıqda ariboflavinoz əmələ gəlir. Ağız və gözün selikli qişasının zədələnməsi, tüklərin tökülməsi, boy inkişafının dayanması, ürək fəaliyyətinin çatışmazlığı bu avitaminozun əsas əlamətidir.

B₂ vitamini toxuma tənəffüsünün oksidləşmə-reduksiya reaksiyalarında iştirak edən flavin fermentlərinin prostetik qruplarının tərkibinə daxildir. B₂ vitamininin törəmələri olan flavinmono nukleotid (FMN) və flavinmononukleotid (FAD) bu fermentlərin kofermentlərini təşkil edir.

İnsan üçün B₂ vitamininin mənbəyi mayalar, qara ciyər, böyrəklər, balıq məhsulları, süd, yumurta sarısı və s. insan orqanizminə gündə 2-4 mq B₂ vitamini lazımdır.

Riboflavinin quruluşu xüsusi spesifikasiyə malikdir, cüzi dəyişikliyin edilməsi onun vitamin aktivliyinin itirilməsinə və antoqonistin əmələ gəlməsinə səbəb olur. Riboflavin reduksiya olunduqda sarı rəngini itirərək rəngsiz leykoriboflavinə çevrilir, oksidləşdikdə isə əksinə proses gedir.



β-amin turşuların törəmələri

B₃ vitamini (pantoten turşusu)

Pantoten (pantoz-yunanca hər yerdə olan deməkdir) turşusuna bütün toxumalarda (maya, ciyər, düyü, kürü) təsadüf edilir. Bu maddə 1933-cü ildə düyü kəpəyindən alınmışdır. Onun molekulu bir-birilə peptid rabitəsi vasitəsilə birləşmiş β-alanindən və α,γ-dihidroksi, ββ'-dimetilyağ turşusundan ibarətdir.

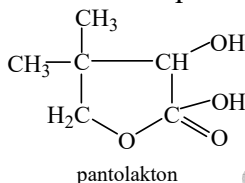


α, γ-dihidroksi, β,β'-dimetilbutiril-β alanin

Bu vitamin asetilləşmə reaksiyalarında (CH₃CO) asetil radikalının asetilləşən maddələrin molekullarına birləşdirilməsində iştirak edir. Pantoten turşusu koenzim A-nın tərkibinə daxildir.

Pantoten turşusunun çatışmazlığı nəticəsində heyvanlarda boy artma dayanır. Yağ mübadiləsi pozulur, qanda xolesterinin miqdarı azalır, qara ciyərdə və böyrəklərdə degenerasiya müşahidə edilir. İnsanlarda pantoten turşusunun avitaminozuna çox nadir hallarda təsadüf edilir.

Pantoten turşusunun D-izmeri bioloji təsirə malikdir. Rasemat aktivliyi 50%-dir. Polinevrit, nevrал mübadilə proses pozulması müxtəlif mənşəli yaralar zamanı tətbiq edilir.

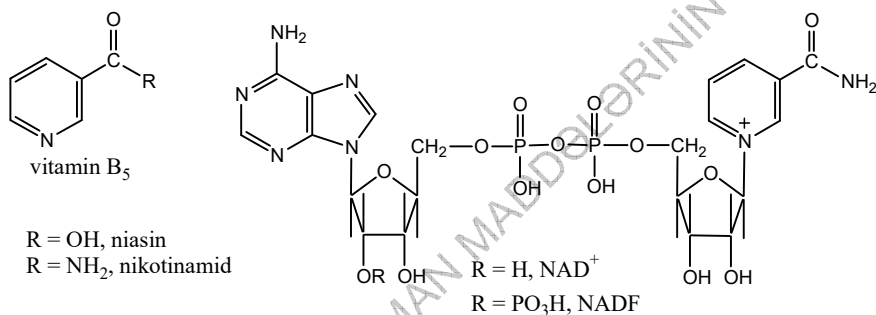


B₅ (PP) vitamini (antipellaqra vitamini, niasin)

PP vitamini adı altında kimyəvi quruluşuna görə bir-birinə yaxın olan iki maddə - nikotin turşusu və onun amidi (nikotinamidi birləşdirilir).

B₅ vitamini (Niasin) pellaqranın (onun köhnə adı – PP vitamini (Pellagra preventing)) sinir sistemi pozğunluqları, yaddaşın itməsi, ağır hallarda isə ölümə nəticələnən dəri xəstəliyi – pellaqranın müalicəsində istifadə olunur. Niasin sinir sisteminin, mədə-bağırsaq traktının fəaliyyətini tənzimləyir, normal metabolizmə kömək edir, sərbəst yağ turşularının bədənə xaric edilməsinin qarşısını alır və qan plazmasında xolesterinin miqdarını azaldır. Vitamin B₅ təkcə pellaqranın müalicəsində deyil, həmçinin infeksiyon sarılıq, bronxial astma, hipertoniya, ürək-damar xəstəliklərinin müalicəsində də məsləhət görülür. Son on illiklərdə məlum olmuşdur ki, dəmir xloridlə nikotinamid kompleksindən

orqanizmdə dəmirin itməsinə qarşı effektiv istifadə olunur. Sümük sınıqları zamanı onun kobalt xloridlə birləşməsindən istifadə məsləhət görülür. Nikotin turşusu onun Al (III) duzu ilə birləşməsi antispazmatik və damar genişləndirici təsir göstərir. Vitamin B₅ nikotinamid şəklində nikotinamiddənindinukleotid (piridin fraqmentilə oksidləşmiş forması, NAD⁺) və nikotinamiddənindinukleotidfosfat (NADF) kofermentinin tərkibinə daxildir:

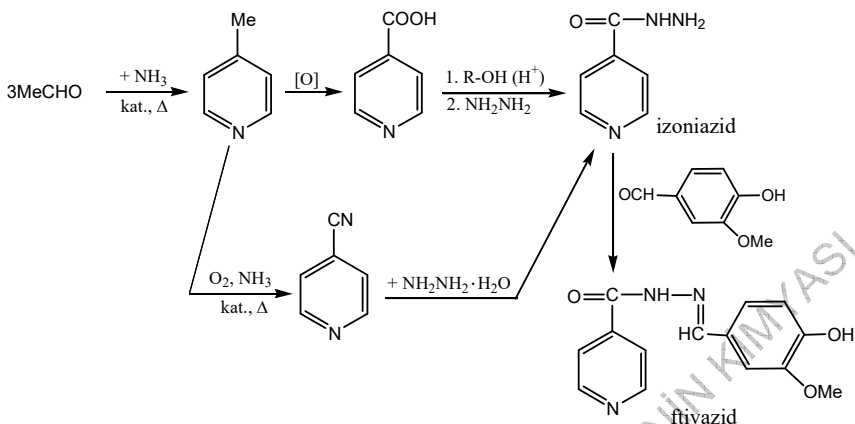


Hər iki koferment prostetik dehidrogenaz qrupuna daxil olub, oksidləşmə-reduksiya proseslərində iştirak edirlər. NAD⁺-ın aktiv hissəsi dehidrogenləşmə reaksiyalarında (onun piridin fraqmenti) substratdan (məsələn, spirt) hidrid-ion qəbul edir və ferment zəif əlaqəli NAD-H formasında bərpa olunur ki, bu da artıq 1,4-dihidropiridin fraqmentində iştirak edir. Sonra substratdan ayrılaraq proton məhluluna keçir. Beləliklə, bu yolla spirtədən aldehid və ya keton alınır. Niasinin sənayedə alınmasının bir neçə üsulu işlənilib hazırlanmışdır. Həmin üsulların hamısı çiçibabin reaksiyasında alınan 3-metilpiridin və ya 2-metil-5-etilpiridin oksidləşməsinə, alüminosilikat katalizatorunun iştirakı ilə 300-400 °C temperaturda akroleinin ammoniyakla buxar fazasında kondensləşməsinə və ya sulfat turşusunun iştirakı ilə 200°C temperaturda və yüksək təzyiqdə

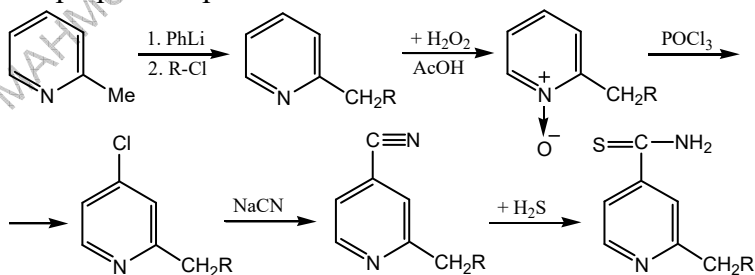
nikotafuril + 2-(2-hydroxyethyl) tetrahydrofuran-3-ol $\xrightarrow{K_2CO_3}$ niasin $\xrightarrow[2. KOH]{1. NHEt_3}$ kordiamin

221

mühüm əhəmiyyət kəsb edir. İnkişaf etmiş ölkələrin statistikasına təsdiq edir ki, dünyada baş verən dörd ölümdən birinin səbəbi vərəm xəstəliyidir. Bütün dünyada hər il vərəm xəstəliyindən üç milyona yaxın insan ölür (90-cı illərin əvvəllərinə qədər verilən məlumat). Hal-hazırda vərəm xəstəliyinin törədiciyi olan mikobakteriyaların (*Micobacterium tuberculosis*), hansı ki, insanın ağciyərində yerləşir, keçmişdə effektiv olan dərmanlara qarşı rezistentliyi (dözümlülük) yaranmışdır. Ona görə də, hazırda vərəm əleyhinə bir neçə dərmanın kombinasiyasından istifadə olunur. Buna baxmayaraq bir sıra mutənt mikobakteriyalar dərmanlara dözümlülük göstərərək yeddi müxtəlif preparatın tərkibinə daxil edilir. Son zamanlar məlum olub ki, biosistemin elə təcrid etmə üsulu tapılıb ki, bu da patogen bakteriyalarla antibakterial dərman maddələrinin rezistentliyini tezləşdirməklə istifadə edilməsi köhnə preparatlara qayıtmağa ümid verir. 1952-ci ildən vərəmə qarşı ən geniş istifadə olunan vasitə ucuz başa gələn və az zəhərli 4-piridin karbon turşusunun hidrazidi – izoniaziddir. O, nikotinamidin antaqonisti olmaqla, hüceyrədaxili redoks – proseslərinə nəzarət edir. Onun dəqiq təsir mexanizmi hələki məlum deyil. Fərz edilir ki, o mikobakteriya hüceyrələrinin divarlarının əmələ gəlməsində iştirak edən ali yağ turşularını əmələ gətirən fermenti təcrid edir. İzoniazid aşağıdakı sxemlə sintez olunur: Çiçibabin metodu ilə 4-pikolin alırlar və onu izonikotin turşusuna və ya onun nitrilinə oksidləşdirirlər. Sonra onu hidrazinin təsiri ilə efirə və ya hidrazid nitril əsasına çevirirlər. Vanilinin izoniazidlə kondensasiyasından daha bir vərəm əleyhinə preparat – ftivazid alınır. Ftivazid sələflərindən daha az toksiki təsirə malikdir:



Mikrobakteriyaların inkişafının yüksək dərəcədə qarşısını alan tioamidlər – etioamidlər və protioamidlər praktikada 45 il bundan əvvəl istifadə olunmağa başlanmışdır. Bu törəmələr tioizonikotin turşusu amidlərinin quruluşuna malikdir. Onları 2-pikolin əsasında sintez edirlər. Əvvəlcə fenillitlər və ona uyğun alkilhalogenidin təsiri ilə metil qrupunu etil və ya propilə qədər çatdırırlar, sonra hər iki homoloqu N-oksida qədər oksidləşdirirlər və qurğuşun (III) xloridlə 4-xlorpiridinə xlorlaşdırırlar. Sonuncuda xlor qrupu sianqrupu ilə nukleofil əvəz edilir, sonra birləşmədə sian qrupu hidrogen-sulfid təsiri ilə tioamid qrupuna çevrilir və axtarılan vərəm əleyhinə preparatlar protioamid və etioamid alınır:



R = Me, etioamid
R = Et, protioamid


CC(C)C(=O)NNC(=O)c1ccncc1
 iprazid

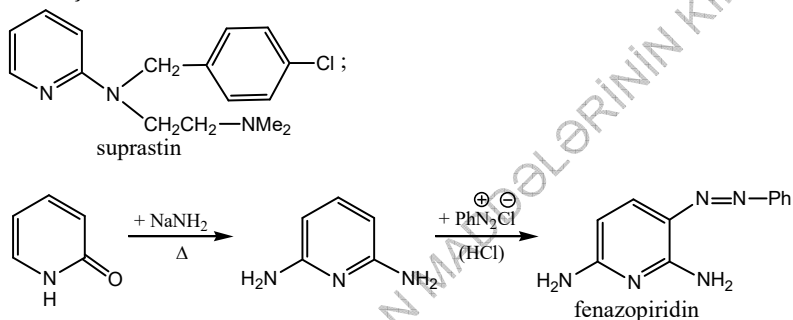

NC(=O)C(=O)NNC(=O)c1ccncc1
 nialamid



CC(=O)C=C + CCCCOC=C >> CC1=C(CCCC)OC(OCC)C1 >> CC1=C(CCCC)OC(=O)C1=O >> CC1=CC=C(CCCC)C(=O)N1 >> CC1=CC=C(CCCC)C(=O)O1



Aminopiridin qrupu özündə kifayət qədər bioloji aktiv törəmələr birləşdirir. Misal olaraq, suprastini göstərmək olar ki, antihistamin təsirə malik olub, allergik dermatozların müalicəsində istifadə olunur. Başqa bir misal, fenazopiridin triamin törəmələri: analgetik təsirə malik olub, ağrılarla müşayiət olunan sidik ifrazında istifadə olunur. Onu natrium amidlə qızdırmaqla 2-piridonun, sonra isə turş mühitdə fenildiazonixloridin diamin azobirləşməsi ilə iki qat diaminləşdirilməsindən alırlar:

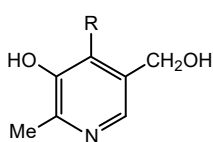


Pirimidinin törəmələri

B₆ vitamini (antidermatit vitamini, aderman, piridoksin)

B₆ vitaminləri qrupunu təşkil edən maddələr piridin törəmələridir. Bu qrupa piridoksol (piridoksin), piridoksol piridoksamin daxildir.

B₆ vitamininə - üç birləşmə aiddir ki, onlar bir-birindən C-4 əvəzedicisinin quruluşu ilə fərqlənilirlər: piridoksin, piridoksol və piridoksiamin, bunlar da orqanizmdə asanlıqla qarşılıqlı çevrilə bilirlər.

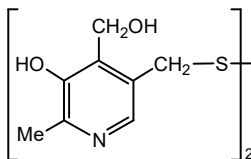


vitamin B₆

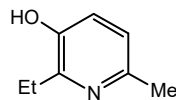
R = CH₂OH, piridoksin

R = CHO, piridoksal

R = CH₂NH₂, piridoksamin



piriditol

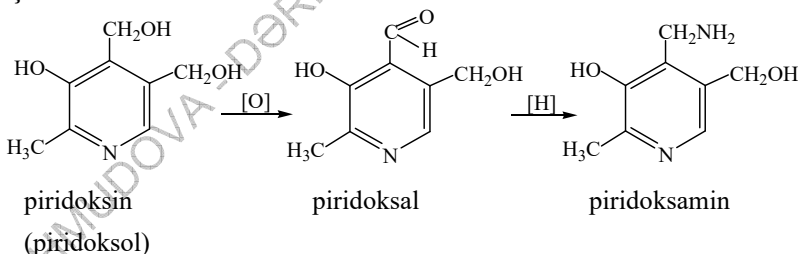


R = (-CH₂COOH), meksidol

R = HCl, emoksipin

Piridoksalfosfat aminqrupun zülal aminturşusuna keçməsində iştirak edən transaminaza fermentinin tərkibinə daxildir. Tibbdə piridoksin və piridoksalfosfat sinir sistemi xəstəliklərində (nevrologiya, radikulit və s.) və dəri xəstəliklərində (ekzema, psoriaz, neyrodermit) istifadə olunur. Piridoksinin disulfid törəməsi – piriditol - antidepressant təsirli psixiotrop agentlə sedativ komponentlərə aiddir. O, nootrop təsir göstərərək, baş ağrılarını azaldır.

B₆ qrup vitamininin xarakterik xüsusiyyətləri onların bir-birinə çevrilməsidir.



B₁₂ vitamini (antianemik vitamin, siankobalmin)

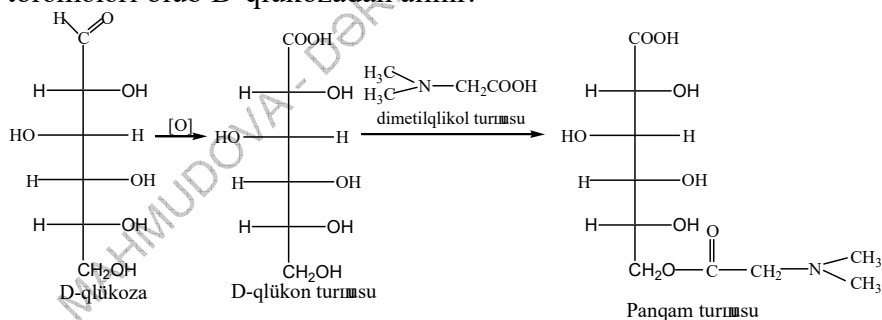
B₁₂ vitamin çatışmazlığı insanlarda bəd xassəli qanazlığı xəstəliyi əmələ gətirir. Buna görə də bu vitamin antianemik vitamin adlanır. B₁₂ vitaminin molekuluna həm sian qrupu, həm də kobalt atomu daxil olduğuna görə ona siankobalamin deyilir. B₁₂ vitamini qaramalın qara ciyərindən kristallik halda alınmışdır. Bu vitamin

mürəkkəb tərkibli birləşmədir. Bitkilərdə B₁₂ vitamininə az təsadüf olunur. Ərzaq məhsullarında qaramalın böyrəyində inək və keçi südündə, pendirdə, yumurta sarısında, qara ciyərdə çoxlu miqdarda B₁₂ vitamininə təsadüf edilir.

B₁₅ vitamini (panqam turşusu)

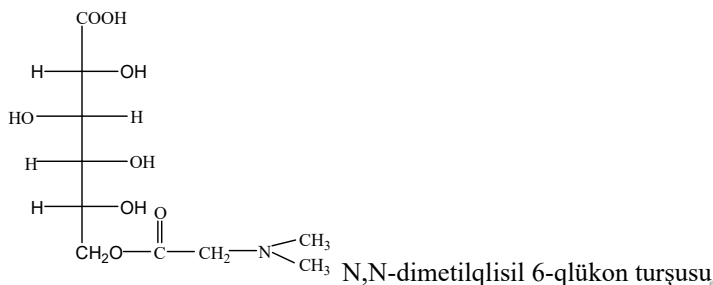
1950-ci ildə Tomiyama öküzün qara ciyərinin sulu ekstraktından bir maddə aldı və bunu B₁₅ vitamini adlandırdı. 1951-ci ildə Krebrs öz əməkdaşları ilə birlikdə ərik toxumunun sulu ekstraktından aktiv bir maddə alaraq ona panqam turşusu adı verdi. Sonralar düyü kəpəyinin pivə mayasının atın qara ciyərinin tərkibindən də panqam turşusu əldə edildi. B₁₅ vitamini ilə panqam turşusunun eyni maddə olduğu sübut edildi.

Panqam turşusu Ca duzu şəklində tətbiq edilir. Ca-panqamat və B₁₅ vitamini düyü tullantılarında, maya, qara ciyərdə və s. vardır. Kimyəvi tərkibinə görə D-qlükon və dimetilaminosirkə turşusunun törəmələri olub D-qlükozadan alınır.



Kalsium panqamat atresklerozun müxtəlif formalarını, qara ciyərin serrozu, xroniki qepatit və s. xəstəliklərin müalicəsində tətbiq edilir.

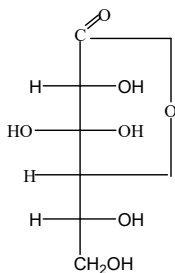
Panqam turşusu D-qlükon turşusunun dimetil aminsirkə turşusunun mürəkkəb efiridir.



B₁₅ vitamininin tərkibində mütəhərrik metil qrupları olduğuna görə o toxumalarda gedən metilləşmə reaksiyalarında iştirak edir.

C vitamini (antiskorbut vitamini, askorbin turşusu)

C vitamini və ya askorbin turşusu orqanizmdə çoxcəhətli təsirə malikdir. Oksidləşmə-reduksiya reaksiyalarında iştirak edir. Bununla bərabər qara ciyərin akitoksik təsirini stimula edib nizamlayır. Böyrəküstü vəzinin qabıq maddəsinin hormon sintezinə təsir edir. C vitaminin orqanizmdə sintez edilmir. Bitki mənşəli məhsullarda geniş yayılmışdır: naringi, göyərtili, limon, portağal və s.



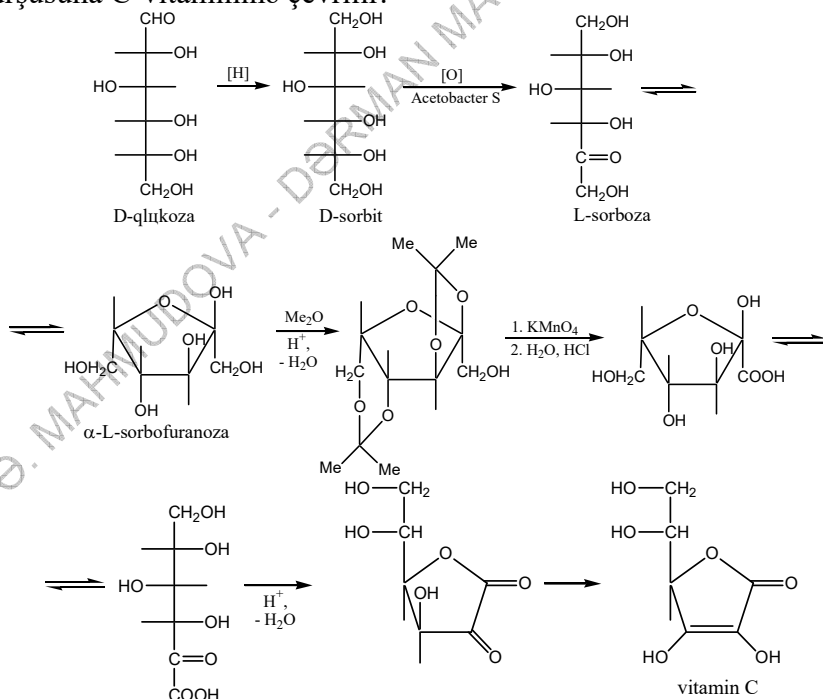
L-askorbin turşusu

Kimyəvi tərkibinə görə C vitamini γ -lakton 2,3 dehidro turşusunun γ -laktonudur. Rəngsiz kristallik maddə olub, ərimə temperaturu -192°C -dir. Turş dadı olub suda spirtə yaxşı həll olur. Gündəlik tələbat 150-200 mq-dır.

Sinqa xəstəliyinin müalicəsində, müxtəlif mənşəli qan axmalarda, iynfeksion xəstəliklərdə, qara ciyər, və s. xəstəliklərində tətbiq edilir.

Askorbin turşusunu C vitamini ilə zəngin olan bitkilərdən almaq olar.

Sənayedə D-qlükozadan, əvvəlcə onu katalitik hidrogenləşdirməklə D-sorbit alınır, onun da AsetbacterS-in iştirakı ilə dərin bakteriokimyəvi oksidləşməsindən D-sorbit L-sorbozaya çevrilir, o isə öz növbəsində sis- vəziyyətdə hidrəksil qrupları saxlayan L-sorbofuranoza, sonrakı mərhələdə oksidli birləşmə əmələ gətirir. KMnO_4 iştirakı ilə tautomer qarışığa çevrilir. 2-oksoqulon turşusu turşu katalizator iştirakı ilə tsiklodehidratasiyası və enollaşması 3-oksolakton əmələ gətirir ki, o da L-askorbin turşusuna C-vitamininə çevrilir.



MÖVZULARA AİD TEST TAPŞIRIQLARI

**Mövzu: Üzvi dərman preparatları haqqında ümumi məlumat.
Dərman maddələrinin quruluşu ilə orqanizmə təsiri arasında əlaqə**

1. Alifatik birləşmələrə OH qrupu daxil etdikdə həmin qrupun sayına uyğun olaraq:

- A) fizioloji təsir zəifləyir
- B) ağrıkəsici təsiri artır
- C) fizioloji təsir güclənir
- D) narkotik təsir artır
- E) toksiki təsir artır

2. Yerli anesteziyaedici təsiri olan kokainəbənzər maddələrin (kokain, novokain və dikain) tərkiblərində hansı funksional qruplar var:

- I - Benzol nüvəsi
- II - Karbonil qrupu
- III - Hidroksil qrupu

- A) I, II
- B) II, III
- C) III
- D) I
- E) I, III

3. Hansı birləşmə ağır metallarla birləşərək zəxərsiz maddələr əmələ gətirir?

- 1 - unitol
- 2 - urotropin
- 3 - xloralhidrat
- 4 - dikaptol
- 5 - karbromal

- A) 1, 4
- B) 1, 5
- C) 1, 2
- D) 3, 4

4. Molekulunda bir və ya bir neçə tiol (SH) qrupunun olması maddəyə hansı xassə verir?

- 1 - ağır metallarla birləşmə qabiliyyəti
- 2 - reduksiya qabiliyyəti
- 3 - polimerləşmə qabiliyyəti

4 - asan oksidləşərək sulfoturşu əmələ gətirmək qabiliyyəti

5 - asan oksidləşərək disulfidlər əmələ gətirmək qabiliyyəti

A) 1, 5

B) 1, 4

C) 1, 2

D) 3, 4

E) 2, 5

5. Molekula hansı qruplar daxil olunduqda fizioloji təsir və toksiklik zəifləyir:

I - Sulfo

II - Karboksil

III - Halogen atomları

A) I, II

B) I, III

C) II, III

D) I, II, III

E) yalnız II.

6. Hansı halda spirtlərin bioloji fəallığının azalması ardıcılığı düzgün verilib?

I - birli

II - ikili

III - üçlü

A) III, II, I

B) I, II, III

C) II, III, I

D) III, I, II

E) II, I, III

7. Verilmiş aromatik birləşmələrin antiseptik xassələrinin artma ardıcılığını düzgün göstərin.

I - C_6H_6

II - C_6H_5COOH

III - $C_6H_4(OH)COOH$

A) I, II, III

B) III, II, I

C) II, III, I

D) III, I, II

E) II, I, III

8.Sulfanilamid törəmələri olan dərman maddələri sintez edilərkən hansı qrup müvafiq olaraq hansı reaktivlə mühafizə olunur?

- a - NO_2
- b - NH_2
- c - SH
- d - SO_2
- e - $\text{N} - \text{CH}_3$
- 1 - $(\text{CH}_3\text{CO})_2\text{O}$
- 2 - CH_3COOH
- 3 - CH_3OH
- 4 - COOH
- 5 - $\text{C}_2\text{H}_5\text{OH}$
- A) b - 1
- B) a - 2
- C) c - 5
- D) d - 4
- E) e - 3

9. Verilmiş dərman maddələri ilə onların fizioloji təsiri arasında düzgün əlaqəni müəyyən edin.

- I - dikaptol
- II - xloralhidrat
- III - urotropin
- IV - unitol
- 1- əks zəhər
- 2-iltihab əleyhinə
- 3-sakitləşdirici, yuxugətirici
- 4-ağrıkəsici
- A) I-1, II-3, III-2, IV-1
- B) I-1, II-2, III-3, IV-4
- C) I-4, II-3, III-2, IV-1
- D) I-2, II-4, III-1, IV-2
- E) I-3, II-2, III-4, IV-3

10. Levomisetinin izomerləri ilə onların bioloji fəallığı arasında əlaqəni müəyyən edin.

- I - D(-) eritro
- II - D(-) treo
- III - L(+) eritro
- IV - L(+) treo

- 1-antibakterial
- 2-toksiki
- 3-bioloji qeyri fəal
- 4-analgetik
- A) I-2, II-1, III-2, IV-3
- B) I-3, II-2, III-4, IV-1
- C) I-4, II-3, III-2, IV-1
- D) I-2, II-1, III-3, IV-4
- E) I-1, II-4, III-1, IV-2

Mövzu: Alifatik birləşmələrin halogenli törəmələrinin mühüm dərman preparatları

1. Ftorotanın kimyəvi adını göstər:

- A) 1 - xlor - 1 – brom- 2, 2, 2 – triflüor etan
- B) 1, 1 - diflor - 2 - xlor - 2 - brom etan
- C) 1, 1, 1 - triflor - 2, 2 – dixlor etan
- D) 1, 1 - diflor - 2, 2 - dixlor - brom etan
- E) 1, 1, 1 - triflor – 2, 2 - dixlor etan

2. Ftorotanı almaq üçün hansı maddələrdən istifadə olunur?

- A) $F_3C - CH_2Cl$ və Br_2
- B) $F_3C - CH_2Cl$ və Cl_2
- C) $Br_3C - CH_2Cl$ və Cl_2
- D) $Cl_3C - CH_2Cl$ və Br_2
- E) $Cl_3C - CH_2J$ və F_2

3. $JCH_2 - SO_3Na$ quruluşuna malik preparat necə adlanır və hansı məqsəd üçün işlədilir?

- A) serqozin – rentgen –kontrast maddə kimi
- B) yodoform – rentgen –kontrast maddə kimi
- C) yodoform – antiseptik maddə kimi
- D) serqozin – antiseptik maddə kimi
- E) yodmetansulfonat – yuxugətirici maddə kimi.

4. Xloroformun alınmasında hansı maddələrdən istifadə edilir?

- I - H_3C-CH_2OH
- II - $CaOCl_2$
- III - $HCHO$
- IV – $Ca(OH)_2$
- A) I, II IV
- B) I, II, III

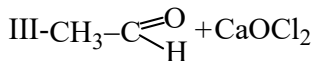
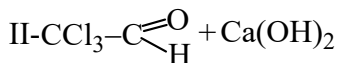
- C) II, III
D) I, IV
E) III, IV

5. Narkotik təsirli maddələrə aiddir:

- I - $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{Cl}$
II - CHJ_3
III - $\text{C}_5\text{H}_{11}\text{Cl}$
IV - CF_3CHClBr

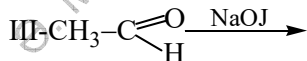
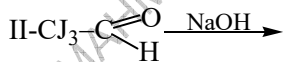
- A) I, IV
B) II, IV
C) I, II, IV
D) Yalnız IV
E) III, IV

6. Dərman təsirli törəmələrdən olan xloroformun etil spirtindən alınma ardıcılığını göstər.



- A) I, III, II
B) I, II, III
C) III, II, I
D) II, I, III
E) II, III, I

7. Yodoformun alınma mərhələlərinin ardıcılığını sadalayın.



- A) I, III, II
B) I, II, III
C) III
D) II, I, III
E) III, I, II

8. Aşağıda narkotik təsirli maddələr verilmişdir. Hansı halda bu maddələrin narkotik təsirlərinin müqayisəsi düzgün verilmişdir?

I - Xloretan ($\text{CH}_3\text{CH}_2\text{Cl}$)

II – Ftorotan ($\text{CF}_3 - \text{CHBrCl}$)

III - Xloroform (CHCl_3)

A) II > III > I

B) I > II > III

C) I > III > II

D) III > I > II

E) II > I > III

9. Yodoformun elektroliz üsulu ilə sintezində alınan birləşmələrin ardıcılığını müəyyən edin.

1 - triyodaseton

2 - triyodmetan

3 - triyodasetaldehid

4 - aseton

5 - asetaldehid

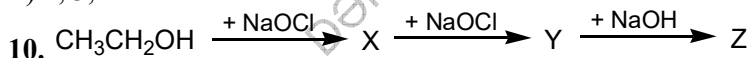
A) 5, 3, 2

B) 1, 4, 2

C) 4, 1, 3,

D) 3, 2, 1

E) 1, 3, 2



Sxemdə alınan X, Y və Z maddələrinə uyğun birləşmələri müəyyən edin.

1 - xloroform

2 - xloral

3 - xloralhidrat

4 - aseton

5 - asetaldehid

A) X - 5, Y - 2, Z - 1

B) X - 4, Y - 2, Z - 1

C) X - 2, Y - 4, Z - 3

D) X - 5, Y - 4, Z - 1

E) X - 4, Y - 3, Z - 2

11. Verilmiş dərman maddələri ilə onların fizioloji təsiri arasında əlaqəni müəyyən edin.

a - xloralhidrat

b - yodoform

c - serqozin

d - ftoratan

e - xloroform

1 - antiseptik

2 - rentgen –kontrast maddə

3 - narkotik

4 - yuxugətirici

5 - sakitləşdirici

A) a - 4, 5; b - 1; c - 2; d - 3; e - 3

B) a - 1; b - 1, 3; c - 2; d - 5; e - 3

C) a - 4, 5; b - 2; c - 1; d - 3; e - 3

D) a - 3; b - 4, 5; c - 1; d - 2; e - 1

E) a - 1; b - 2; c - 3; d - 4; e - 5

12. Ftorotanı almaq üçün hansı istifadə edilən maddələr arasında düzgün əlaqəni müəyyən edin.

I- $\text{Cl}_3\text{C} - \text{CH}_2\text{Br}$

II- $\text{Br}_3\text{C} - \text{CH}_2\text{Cl}$

III- $\text{F}_3\text{C} - \text{CH}_2\text{Cl}$

IV- $\text{J}_3\text{C} - \text{CH}_2\text{Br}$

1- Cl_2

2- J_2

3- F_2

4- Br_2

A) III və 4

B) I və 3

C) II və 3

D) IV və 1

E) I və 4

13. Verilmiş dərman maddələri ilə onların fizioloji təsiri arasında əlaqəni müəyyən edin.

I - yodoform

II - serqozin

III - ftoratan

III - xloroform

IV –yodmetansulfonat

1- antiseptik

2- narkotik

3-analgetik

4- rentgen –kontrast maddə

A) I-1, II-4, III-2, IV-4

B) I-3, II-2, III-4, IV-1

C) I-4, II-3, III-2, IV-1

D) I-2, II-1, III-3, IV-4

E) I-1, II-4, III-1, IV-2

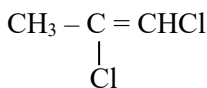
Mövzu: Spirtlərin, sadə və mürəkkəb efirlərin dərman təsirli törəmələri

1. Qliserini almaq üçün propilenin 500°C temperaturda xlorlaşdırılması zamanı hansı xlorlu birləşmə alınır?

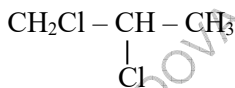
A) $\text{ClCH}_2 - \text{CH} = \text{CH}_2$

B) $\text{CH}_3\text{CH} = \text{CHCl}$

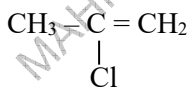
C)



D)



E)



2. Difenilsirkə turşusu və β - dietilaminoetilxloridin qarşılıqlı təsirindən diarilalifatik turşuların törəməsi olan hansı dərman preparatı sintez olunur?

A) spazmolitin

B) diprofen

C) tifen

D) aprofen

E) metasin.

3. Difenilsirkə turşusu və β - di - n - propil - aminoetilmerkaptan əsasında diarilalfatik turşuların törəməsi olan hansı dərman preparatı sintez olunur?

A) diprofen

B) spazmolitin

C) tifen

D) aprofen

E) metasin

4. Diarilalfatik turşuların törəmələri olan dərman preparatlarından hansı yodmetilat şəklində tətbiq olunur?

A) metasin

B) aprofen

C) tifen

D) diprofen

E) spazmolitin

5. Aprofen aşağıdakı hansı maddələr əsasında sintez edilir?

A) difenilpropion turşusu və β dietilammino etilxlorid əsasında

B) difenil sirkə turşusu və α dietilammino metilxlorid əsasında

C) difenilpropion turşusu və dietilammino metilxlorid əsasında

D) difenil sirkə anhidridi və β dietilammino etilmerkaptan əsasında

E) difenil sirkə anhidridi və β dietilammino etilxlorid əsasında.

6. Nitroqliserinin parçalanma məhsulları hansı variantda düzgün göstərilib?

1 - NO

2 - N₂

3 - CO

4 - H₂O

5 - CO₂

6 - O₂

A) 2; 4; 5 ; 6

B) 1; 3; 4; 6

C) 2; 3; 4

D) 1; 4; 5; 6

E) 1; 4; 5

7. Arilalfatik turşularının mürəkkəb efirlərinin mühüm dərman pereparatları verilməmiş sıranı göstərin.

- 1 - aprofen,
- 2 - dimedrol
- 3 - tifen,
- 4 - nitranol
- 5 - diprofen,
- 6 - metasin
- 7 - spazmolitin
- A) 1; 3; 5; 6; 7
- B) 2; 4; 7
- C) 1; 3; 4; 5; 6
- D) 2; 4; 6
- E) 1; 3; 5; 7

8. Aşağıdakı maddələrdə hidroksil qruplarının sayının artması ardıcılığını göstərin.

- 1 - xloralhıdrat
- 2 - unitol
- 3 - qliserin
- 4 - dikaptol
- A) 2; 4; 1; 3
- B) 2; 4; 3; 1
- C) 1; 2; 3; 4
- D) 3; 1; 4; 2
- E) 1; 2; 4; 3

9. Aşağıdakı maddələrdə hidroksil qruplarının sayının azalması ardıcılığını göstərin.

- 1 - qliserin
- 2 - unitol
- 3 - xloralhıdrat
- 4 - dikaptol
- A) 1 ; 3; 4; 2
- B) 2; 4; 3; 1
- C) 1; 2; 3; 4
- D) 3; 1; 4; 2
- E) 1; 2; 4; 3

10. Dietilefirində göstərilən qruplarının varlığını hansı maddələrlə təyin etmək olar?

- a - peroksid
- b - aldehid

1 - K_2CO_3 ,

2 - $FeSO_4$

3 - $CaCl_2$,

4 - K_2HgJ_4

5 - KJ

6 - K_2CO_3 .

A) a - 5; b - 4

B) a - 4; b - 5

C) a - 2; b - 1

D) a - 1; b - 3

E) a - 2; b - 3

11. Diarilalifatik turşuların törəməsi olan aprofen hansı birləşmələr əsasında sintez olunur?

1 - difenilsirkə turşusu

2 - difenilsirkə turşusunun xloranhidridi

3 - difenilpropion turşusu

4 - difenilhidroksisirkə turşusu

5 - β - dietilaminoetilxlorid

6 - və β - dietilaminoetilmerkaptan

A) 3 və 5

B) 2 və 6

C) 1 və 6

D) 3 və 5

E) 4 və 6

12. Diarilalifatik turşuların törəməsi olan spazmolitin hansı birləşmələr əsasında sintez olunur?

1 - difenilsirkə turşusu

2 - difenilsirkə turşusunun xloranhidridi

3 - difenilpropion turşusu

4 - difenilhidroksisirkə turşusu

5 - β - dietilaminoetilxlorid

6 - β - dietilaminoetilmerkaptan

A) 1 və 5

B) 2 və 6

C) 1 və 6

D) 3 və 5

E) 4 və 6

13. Diarilalifatik turşuların törəməsi olan tifen hansı birləşmələr

əsasında sintez olunur?

- 1 - β - dietilaminoetilxlorid
- 2 - β - dietilaminoetilmerkaptan
- 3 - difenilsirkə turşusu
- 4 - difenilsirkə turşusunun xloranhidridi
- 5 - difenilpropion turşusu
- 6 - difenilhidroksisirkə turşusu

- A) 2 və 4
- B) 2 və 6
- C) 1 və 6
- D) 3 və 5
- E) 4 və 6

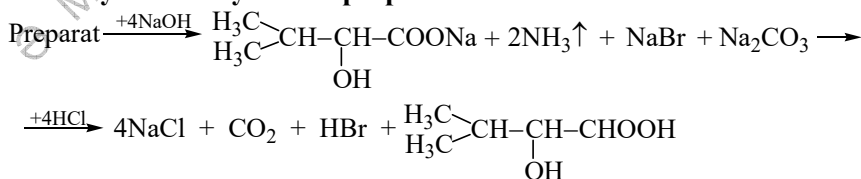
14. Diarilalifatik turşuların törəməsi olan diprofen preparatı hansı birləşmələr əsasında sintez olunur?

- 1 - β - dietilaminoetilxlorid
- 2 - β - dietilaminoetilmerkaptan
- 3 - β - di - n - propil - aminoetilmerkaptan
- 4 - difenilsirkə turşusu
- 5 - difenilsirkə turşusunun xloranhidridi
- 6 - difenilpropion turşusu
- 7 - difenilhidroksisirkə turşusu

- A) 3 və 5
- B) 2 və 6
- C) 1 və 6
- D) 3 və 7
- E) 4 və 6

Mövzu: Aldehidlər, karbon turşuları, alifatik amin turşular və onların dərman təsirli törəmələri

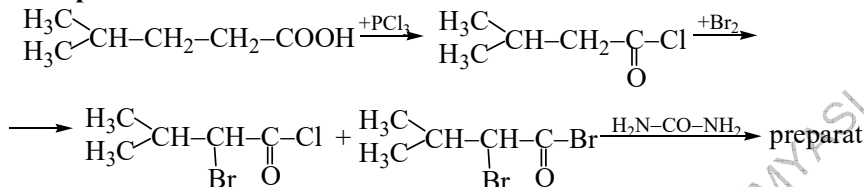
1. Bu təyini reaksiya hansı preparata xasdır?



- A) bromizoval
- B) meprotan

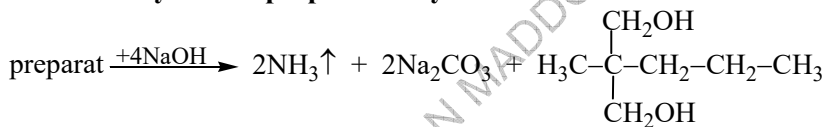
- C) karboxolin
D) novembixin
E) karbromal

2. Preparat hansı maddədir?



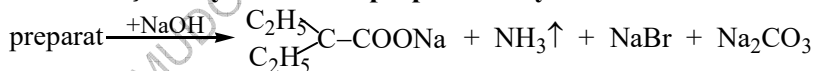
- A) bromizoval
B) tsiklofosfan
C) serqozin
D) meprotran
E) benzotef

3. Bu reaksiya hansı preparatın təyininə istifadə olunur?



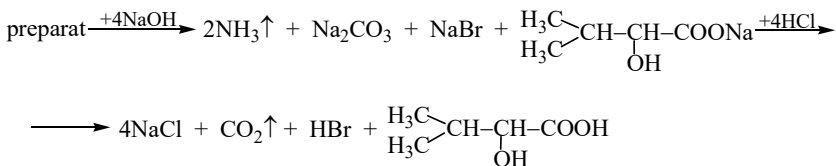
- A) meprotran
B) karboxolin
C) bromizoval
D) karbromal
E) metionin

4. Verilmiş reaksiyadan hansı preparatın təyininə istifadə olunur?



- A) karbromal
B) karboxolin
C) benzotef
D) bromizoval
E) meprotran

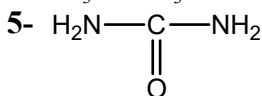
5. Bu reaksiya vasitəsilə hansı preparat təyin olunur?



- A) bromizoval
- B) karboxolin
- C) karbromal
- D) meprotran
- E) metionin

6. Urotropin hansı birləşmələr əsasında alınır?

- 1 - $\text{CH}_2 = \text{O}$
- 2 - $\text{CH}_3\text{CH} = \text{O}$
- 3 - NH_3
- 4 - CH_3COCH_3



- A) I, III
- B) III, IV
- C) II, III
- D) I, V
- E) IV, V

7. Dərman preparatları kimi işlədilən alifatik aminturşuların nümayəndələri olan qlütamin turşusu, metionin və aminalon molekullarının hər üçündə hansı funksional qruplar vardır?

- I - NH_2
- II - COOH
- III - C_6H_5
- IV - OH

- A) I, II
- B) II, III
- C) III, IV
- D) I, III
- E) II, IV.

8. Uretanların qələvi ilə təyini reksiyasında hansı birləşmələr alınır?

- 1 - $\text{R}-\text{CH}_2\text{COOH}$
- 2 - NH_3

3 - R - CH₂OH

4 - CO₂

5 - NaBr

6- NH₄(SO₄)₂

A) 1; 2; 5

B) 1; 2; 3

C) 2; 3; 4

D) 3; 4 ; 6

E) 4; 5; 6

9. Uretanların sulfat turşusu ilə təyini reksiyasında hansı birləşmələr alınır?

1 - R - CH₂COONa

2 - NH₃

3 - R - CH₂OH

4 - CO₂

5 - NaBr

6- NH₄(SO₄)₂

A) 3; 4; 6

B) 1; 2; 3

C) 2; 3; 4

D) 1; 4 ; 6

E) 4; 5; 6

10. Karbromal hansı birləşmələr əsasında sintez edilir?

1 - izovalerian turşusu

2 - HBr

3 - dietilsirkə turşusu

4 - PBr₃

5 - H₂N-CO-NH₂

6- H₂N-CO-Cl

A) 3,4,5

B) 3,4,6

C) 1,4,5

D) 1,4,6

E) 1,2,5

11. İzobromal hansı birləşmələr əsasında sintez edilir?

1 - izovalerian turşusu

2 - HBr

3 - dietilsirkə turşusu

- 4 - PBr_3
 5 - $\text{H}_2\text{N}-\text{CO}-\text{NH}_2$
 6- $\text{H}_2\text{N}-\text{CO}-\text{Cl}$
 A) 1,4,5
 B) 1,2,6
 C) 3,4,5
 D) 1,4,6
 E) 1,2,5

12. Meprotran preparatı hansı birləşmələr əsasında sintez edilir?

- 1 - 2-metil-2-propil-propandiol-1,3
 2 - HBr
 3 - 2-metil-2-propil-propandiol-1,3
 4 - PBr_3
 5 - $\text{Cl}-\text{CO}-\text{NH}_2$
 6- $\text{H}_2\text{N}-\text{CO}-\text{NH}_2$
 A) 3,5
 B) 1,6
 C) 1,5
 D) 4,6
 E) 1,4

13. Atsiklik ureidlərin alınmasında verilmiş maddələrin istifadə ardıcılığını göstərin.

- 1 - $\text{R}-\text{CH}_2\text{COOH}$
 2 - $\text{NH}_2-\text{CO}-\text{NH}_2$
 3 - $\text{R}-\text{CH}_2\text{OH}$
 4 - PBr_3 ;
 5 - $\text{Cl}-\text{CO}-\text{NH}_2$
 A) 1; 4; 2
 B) 1; 2; 3
 C) 2; 3; 4
 D) 3; 4; 5
 E) 5; 3; 4

14. Bromizovalın alınması reksiyasında istifadə edilən reagentlərin düzgün ardıcılığını göstər.

- 1- Br_2
 2- PCl_3
 3- Cl_2
 4- $\text{H}_2\text{N}-\text{CO}-\text{NH}_2$

5- $\text{H}_2\text{N}-\text{CO}-\text{Cl}$

- A) 2; 1; 4
- B) 1; 2; 3
- C) 2; 3; 4
- D) 3; 4; 5
- E) 5; 3; 4

15. Bromizovalın alınması reksiyasında alınan birləşmələrin düzgün ardıcılığını göstərin.

- 1- α -brom izovalerian turşusunun brom anhidridi
- 2- izovalerian turşusunun xlor anhidridi
- 3- α -brom izovalerian turşusunun xlor anhidridi
- 4- izovalerian turşusunun brom anhidridi
- 5- bromizoval

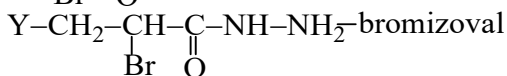
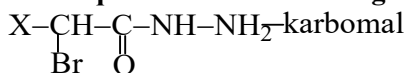
- A) 2; 1; 5
- B) 4; 3; 5
- C) 2; 3; 5
- D) 3; 4; 5
- E) 4; 1; 5

16. Karboxolinin alınması istifadə edilən reagentlərin düzgün ardıcılığını göstər.

- 1- 2-xloretnanol
- 2- karbamin turşusunun xloranhidridi
- 3- trimetilamin
- 4- etilen oksid
- 5- karbamin turşusu
- 6- dimetilamin

- A) 4; 1; 2; 3
- B) 1; 5; 6
- C) 1; 4; 2; 3
- D) 5; 2; 1; 3
- E) 4; 1; 5

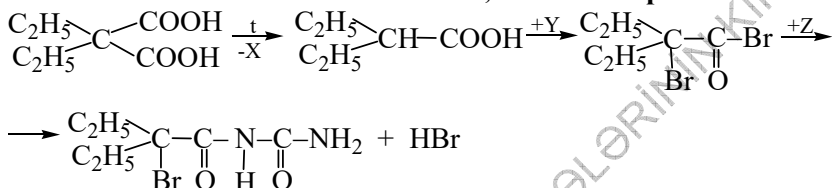
17. Karbromal və bromizoval preparatının kimyəvi quruluşunda müvafiq X və Y radikallarını göstərin.



1 - NH_2

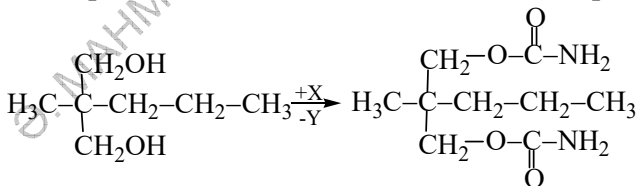
- 2 - (CH₃)₂
 3 - (C₆H₅)₂;
 4 - (C₂H₅)₂
 5 - (NH₂)₂
 A) X - 4; Y - 2
 B) X - 2; Y - 4
 C) X - 4; Y - 1
 D) X - 1; Y - 2
 E) X - 5; Y - 6

18. Karbromalın alınması sxemində X, Y və Z - i tapın.



- 1 - CO₂;
 2 - PBr₅
 3 - HBr
 4 - NH₂ - CO - NH₂
 5 - H₂O;
 6 - NH₃
 A) X - 1; Y - 2 ; Z - 4
 B) X - 5; Y - 3 ; Z - 6
 C) X - 1; Y - 5; Z - 4
 D) X - 1; Y - 3; Z - 6
 E) X - 6; Y - 3; Z - 5

19. Meprostanın alınması sxemində X və Y - i tapın.



- 1 - NH₂ - CO - NH₂
 2 - H₂O
 3 - HCl
 4 - HOOC - CO - NH₂

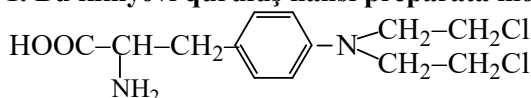
5 - Cl - CO - NH₂

- A) X - 5 ; Y - 3
- B) X - 1; Y - 2
- C) X - 2; Y - 5
- D) X - 4; Y - 3
- E) X - 1; Y - 4

Mövzu: Fosfat turşusu amidlərinin dərman təsirli törəmələri.

Bis - (β - xloretil) –amin törəmələri alınması və fizioloji təsiri.

1. Bu kimyəvi quruluş hansı preparata məxsusdur?



- A) sarkolizin
- B) novembixin
- C) tsiklofosfan
- D) benzotef
- E) xlorbutin

2. Göstərilən preparatlardan hansı kimyəvi tərkibcə fosfat turşusu diamidinin N - bis (β - dietil) - N; - O - trimetilen efiridir?

- A) tsiklofosfan
- B) dikaptol
- C) nitranol
- D) erinit
- E) tiofosfamid

3. Fosfat turşusunun N - benzoil - N', - N'' di(etilen) triamidi adlanan preparatı göstərin.

- A) benzotef
- B) tiofosfat
- C) tsiklofosfan
- D) novembixin
- E) serqozin

4. Novembixin preparatının kimyəvi adı necədir?

- A) 2 - xlor propil N - (bis β - xloretil) amin
- B) N - benzoil - N', N'' - (dietilen) triamidi
- C) N', N'', N''' trietilen triamidi
- D) 4 - N - bis β - xloretil aminfenol yağ turşusu
- E) N - bis (β - xloretil) N' - O - trimetilen triefiri

5. Kimyəvi adına görə (4 - N - bis β - xloretil aminofenil yağ turşusu)

adlandırılan preparat hansıdır?

- A) xlorbutin
- B) sarkolizin
- C) novembixin
- D) tsiklofosfan
- E) diprofen

6. Bədxassəli şişlərin müalicəsində tətbiq olunan preparatları göstərin.

- 1 - metionin
- 2 - novembixin
- 3 - meprostan
- 4 - tsiklofosfan
- 5 - sarkolizin
- 6 - benzotef

- A) 2, 4, 5, 6
- B) 2, 3, 5, 6
- C) 1, 2, 4, 5
- D) 1, 3, 5
- E) 2, 5, 6

7. Fosfat turşusu amidlərinin dərman təsirli törəmələrinə hansı birləşmələr aiddir?

- 1 - metionin
- 2 - novembixin
- 3 - tsiklofosfan
- 4 - benzotef
- 5 - sarkolizin
- 6 - tiofosfamid

- A) 3, 4, 6
- B) 2, 3, 4, 6
- C) 1, 2, 4, 5
- D) 2, 3, 5
- E) 2, 4, 6

8. Bis - (β - xloretil) - amin törəmələrinə aid olan dərman preparatlarının sırasını göstərin:

- 1 - tiofosfamid
- 2 - novembixin
- 3 - tsiklofosfan
- 4 - benzotef

5 - sarkolizin

6 - xlorbutin

A) 2, 3, 5, 6

B) 2, 3, 4, 6

C) 1, 2, 4, 5

D) 2, 3, 5

E) 2, 4, 6

9. Tiofosfamidin sintezi üçün hansı maddələrdən istifadə olunur?

1 - tiofosfat turşusunun xloranhidridi

2 - tionilxlorid

3 - dietanolamin

4 - fosfat turşusunun xloranhidridi

5 - etilenimin

A) 1 və 5

B) 2 və 4

C) 3 və 5

D) 3 və 4

E) 4 və 5

10. Tsiklofosfanın alınması reaksiyasında istifadə edilən maddələri düzgün ardıcılıqla göstərin.

1 – POCl_3

2 – SOCl_2

3 - dietanolamin

4 - PCl_3

5 - trietanolamin

A) 5,2,1

B) 3,1,2

C) 3,5,4

D) 3,4,2

E) 5,2,4

11. Benzotefin alınması reaksiyasında istifadə edilən maddələri düzgün ardıcılıqla göstərin.

1 – POCl_3

2 – benzoamid

3 - PCl_3

4 - etilenimin

A) 2,3,4

B) 2,1,4

- 12. Tiofosfamidin sintezi reaksiyasında istifadə edilən maddələri düzgün ardıcılıqla göstərin.**

2- trietanolamin

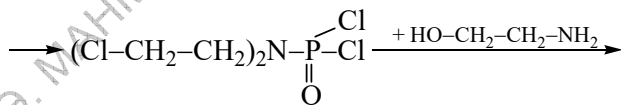
4 - etilenimin

- 13. Novembixinin sintezi reaksiyasında istifadə edilən maddələri düzgün ardıcılıqla göstərin.**

2- propilenimin

4 - etilenoksid

- 14. Tsiklofosfanın alınması sxemində X, Y, Z - i tapın.**


$$3 - \text{HCl}$$
4 - SOCl_2

5 - POCl_3

A) X - 4 ; Y - 5; Z - 2

B) X - 1; Y - 2; Z - 3

C) X - 3; Y - 5; Z - 2

D) X - 4; Y - 1; Z - 5

E) X - 5; Y - 4; Z - 1

15. Verilmiş kimyəvi adlara müvafiq olan dərman maddələrinin adlarını ardıcıl olaraq göstərin?

I - fosfat turşusunun N - benzoil - N', N'' - di(etilen) - triamidi

II - fosfat turşusu diamidinin N - bis - (β - xloretil) - N', O - trimetilen efiri

III - tiofosfat turşusunun N', N'', N''' - tri(etilen) triamidi

IV - 2 - xlorpropil - bis - (β - xloretil) - amin hidroxlorid

V - 4 - N - bis β - xloretil aminfenol yağ turşusu

1 - tiofosfamid

2 - novembixin

3 - tsiklofosfan

4 - benzotef

5 - xlorbutin

A) I - 4, II - 3, III - 1, IV - 2, V - 5

B) I - 2, II - 5, III - 1, IV - 4, V - 3

C) I - 5, II - 1, III - 4, IV - 3, V - 2

D) I - 3, II - 4, III - 2, IV - 1, V - 5

E) I - 4, II - 5, III - 3, IV - 2, V - 1

E) I - 2, II - 4, III - 1

Mövzu: Fenol və p - aminofenolun dərman təsirli törəmələri

1. Fenolların mühüm antiseptik xassəyə malik olan törəməsi timolun kimyəvi adını göstərin.

A) 2 - izopropil - 5 metil fenol

B) 3 - izopropil - 1 metil fenol

C) 5 - izopropil - 2 metil fenol

D) 4 - izopropil - 6 metil fenol

E) 2 - propil - 4 metil fenol

2. Parasetamolun kimyəvi adı:

A) p - asetaminfenol

B) o - asetaminfenol

C) m - asetaminfenol

D) p - nitrofenol

E) o - nitrofenol.

3. Fenasetinin kimyəvi formulunu göstərin

A) $C_2H_5O-C_6H_4-NHCOCH_3$

B) $CH_3O-C_6H_4-NHCOC_2H_5$

C) $CH_3O-C_6H_4-NHCOCH_3$

D) $H_2N-C_6H_4-OC_2H_5$

E) $C_2H_5O-C_6H_4-NHCOC_2H_5$

4. Parasetamolun kimyəvi formulu hansıdır?

A) $HO-C_6H_4-NHCOCH_3$

B) $HO-C_6H_4-NHCOOH$

C) $HO-C_6H_4-NHCOC_2H_5$

D) $CH_3O-C_6H_4-NHCOCH_3$

E) $C_2H_5O-C_6H_4-NHCOC_2H_5$

5. Aminofenolların bəzi törəmələri dərman maddələri kimi işlədilir.

Bu qəbildən olan dərman maddələrini göstərin.

I - fenasetin

II - aspirin

III - parasetamol

A) I, III

B) I, II

C) II, III

D) I, II, III

E) yalnız I.

6. Dərman maddəsi kimi işlədilən və aromatik aminlərin

nümayəndəsi olan fenasetinin tərkibinə hansı funksional qruplar daxildir?

I - C_6H_5

II - $-NH-CO-$



III -

A) I, II

B) II, III

C) I, III

D) I, II, III

E) yalnız II.

7. Sənayedə salisil turşusunun alınmasında hansı reagentlərdən istifadə edilir?

1 - $\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_3$

2 - $\text{C}_6\text{H}_5\text{OH}$

3 - $\text{C}_6\text{H}_5\text{ONa}$

4 - COCl_2

5 - CO_2

A) 3 və 5

B) 2 və 4

C) 1 və 5

D) 1 və 4

E) 3 və 4

8. P – aminofenolun törəmələrini göstərin.

I - fenasetin

II - anestezin

III - parasetamol

IV - novokain

V - dikain

A) I, III

B) I, II, III

C) II, IV

D) II, IV, V

E) III, V

9. P – aminofenolun törəmələrini göstərin.

I - fenasetin

II - anestezin

III - parasetamol

IV - kofein

V - novokain

A) I, III

B) I, II, III

C) II, IV

D) III, IV, V

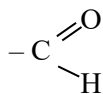
E) III, V

10. Dərman maddəsi kimi işlədilən və aromatik aminlərin nümayəndəsi olan fenasetinin tərkibinə hansı funksional qruplar daxildir?

I - C_6H_5

II - $\text{NH} - \text{CO} -$

III -



A) I, II

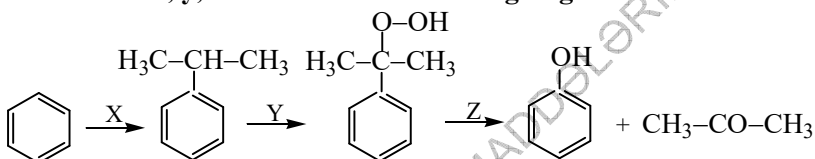
B) II, III

C) I, III

D) I, II, III

E) yalnız II.

11. Sxemdə x, y, z maddələrinin ardıcılığını göstərin.



1 - $\text{CH}_2=\text{CH} - \text{CH}_3$

2 - $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_3$

3 - $\text{CH}_2=\text{CH}_2$

4 - O_2

5 - H_2SO_4

6 - H_2O

A) 1 ; 4; 5

B) 1; 2; 3

C) 3; 4; 6

D) 2; 6; 5

E) 2; 4; 1

12. Fenolftaleynin alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcılığını göstərin.

1 - O_2

2 - ftal anhidridi

3 - fenol

4 - naftalin

A) 4 ; 1; 2; 3

B) 1; 2; 3 ; 4

C) 3; 4; 1; 2

D) 2; 1; 4; 3

E) 3; 4; 1; 2

13. P-aminofenolun alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcılığını göstərin.

1 – p-HO-C₆H₅-NO₂

2 –HNO₃

3 - fenol

4 – Zn/HCl

A) 3 ; 2; 1; 4

B) 1; 2; 3 ; 4

C) 3; 4; 1; 2

D) 2; 1; 4; 3

E) 3; 4; 1 ; 2

14. P-aminofenolun alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcılığını göstərin.

1 – fenol

2 –NaNO₂

3 – p-HO-C₆H₅-NO

4 – H₂S/NH₃

A) 1; 2; 3 ; 4

B) 3 ; 2; 1; 4

C) 3; 4; 1; 2

D) 2; 1; 4; 3

E) 3; 4; 1 ; 2

15. Fenasetinin alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcılığını göstərin.

1 – HO-C₆H₅-NH₂

2 –CH₃(CO)₂O

3 – H₂N-C₆H₅-O C₂H₅

4 – C₂H₅OH

A) 1; 4; 3 ; 2

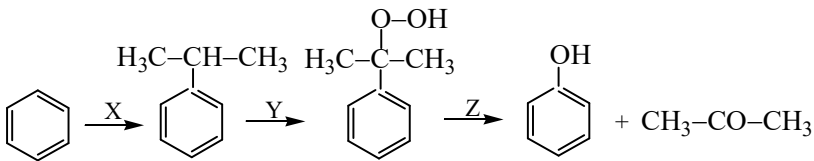
B) 3 ; 2; 1; 4

C) 3; 4; 1; 2

D) 2; 1; 4; 3

E) 3; 4; 1 ; 2

16. Sxemində x, y, z maddələrini göstərin.



1 - $\text{CH}_2=\text{CH}-\text{CH}_3$

2 - $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_3$

3 - $\text{CH}_2=\text{CH}_2$

4 - O_2

5 - H_2SO_4

6 - H_2O

A) X - 1 ; Y - 4; Z - 5

B) X - 1; Y - 2; Z - 3

C) X - 3; Y - 4; Z - 6

D) X - 2; Y - 6; Z - 5

E) X - 2; Y - 4; Z - 1

17. Aşağıda verilmiş dərman maddələrinin kimyəvi adlarını müvafiq olaraq göstərin?

a - anestezin

b - fenasetin

c - parasetamol

d - dikain

1 - 1 - etoksi - 4 - asetaminbenzol

2 - p - aminobenzoy turşusunun etil efiri

3 - 1 - metoksi - 4 - asetaminbenzol

4 - p - asetaminofenol

5 - para - butilaminobenzoy turşusunun β - dimetilamin etil efiri

A) a - 2, b - 1, c - 4, d - 5

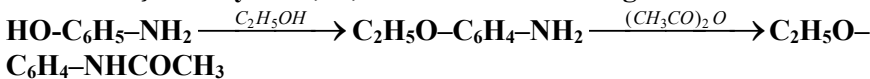
B) a - 4, b - 3, c - 5, d - 2

C) a - 2, b - 3, c - 4, d - 1

D) a - 5, b - 4, c - 3, d - 2

E) a - 1, b - 2, c - 3, d - 5

18. Verilmiş reaksiyada I, II, və III maddələri düzgün adlandırın.



(I)

(II)

(III)

A) I - p-aminofenol, II-1-etoksi-4-aminbenzol, III-fenasetin

B) I - fenetidin, II - parasetamol, III-1-etoksi- 4- asetaminbenzol

- C) I – p-aminofenol, II- fenetidin, III- parasetamol
 D) I – p-aminofenol, II-1-etoksi-4-aminbenzol, III- 1-metoksi - 4 - asetaminbenzol

E) I – p-aminofenol, II-1-etoksi-4-aminbenzol III-fenetidin

19. Verilmiş dərman maddələri ilə onların kimyəvi adları arasında düzgün əlaqəni göstərin.

I- parasetamol

II- fenasetin

III- fenetidin

IV- timol

V- fenolftalein

1- 2-izopropil- 5-metil fenol

2- 1-etoksi-4-asetaminbenzol

3- p-asetaminfenol

4- 1- etoksi-4-aminbenzol

5- 1,1-di-(4-oksifenil)benzodihidrofuran-3-on

A) I - 3, II- 2, III - 4, IV – 1, V-5

B) I - 1, II- 2, III - 3, IV – 4, V-5

C) I - 4, II- 5, III - 1, IV – 2, V-3

D) I - 2, II- 1, III - 5, IV – 3, V-4

E) I - 4, II- 3, III - 2, IV – 5, V-1

Mövzu: Aromatik turşuların dərman təsirli törəmələri

1. Salisil turşusunun kimyəvi adını göstər.

A) o - hidoksibenzoy turşusu

B) p - hidoksibenzoy turşusu

C) m - hidoksibenzoy turşusu

D) p - amino benzoy turşusu

E) m - amino benzoy turşusu

2. Oksafenamidin alınması reaksiyasını göstərin.

A) $C_6H_4(OH)COOC_6H_5 + H_2N - C_6H_4 - OH \rightarrow C_6H_4(OH)CONH - C_6H_4 - OH + C_6H_5 - OH$

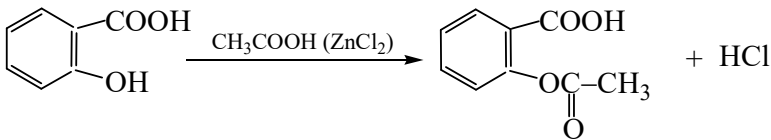
B) $C_6H_4(OH)COOCH_3 + NH_4OH \rightarrow C_6H_4(OH)CONH_2 + CH_3OH + H_2O$

C) $C_6H_4(OH)C_6H_5 + H_2N - C_6H_4 - OH \rightarrow C_6H_4(OH)CONH - C_6H_4 - OH + C_6H_5 - OH$

D) $C_6H_4(OH)COOH + HO - CH_3 \rightarrow C_6H_4(OH)COOCH_3 + H_2O$

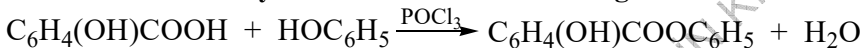
E) $C_6H_4(OH)COOH + HO - C_6H_5 \rightarrow C_6H_4(OH)COOC_6H_5$

3. Yuxarıdakı reaksiya hansı dərman maddəsinin sintezini göstərir ?



- A) aspirinin sintezini
- B) metilsalisilatın alınmasını
- C) fenilsalisilatın alınmasını
- D) oksofenamidin sintezini
- E) salolun alınması

4. Yuxarıdakı reaksiya hansı maddənin sintezini göstərir?



- A) fenilsalisilatın
- B) asetilsalisil turşusunun
- C) metilsalisilatın
- D) oksafenamidin
- E) salisilamidin

5. Salisil turşusunun dərman təsirli efirlərinə hansılar aiddir?

- I - fenilsalisilat
- II - amilsalisilat
- III - asetilsalisilat
- IV - oksofenamid
- V - metilsalisilat

- A) I, III, V
- B) I, II, V
- C) II, IV, V
- D) I, IV, V
- E) I, III, IV

6. Aşağıdakı xassələr hansı birləşməyə uyğundur?

- 1 - sənayedə Kolbe reaksiyası ilə alınır
- 2 - qızdırdıqda dekarboksilləşərək fenola çevrilir
- 3 - antiseptik, hərarəti aşağı salan maddələr
- 4 - həm fenol, həm turşu xassəyə malikdir

- A) salisil turşusu
- B) asetilsalisil turşusu
- C) benzoy turşusu
- D) hippur turşusu
- E) ftal turşusu

7. P- aminsalisil turşusunun törəmələrini göstərin?

I - natrium - para - aminsalisilat

II - aspirin

III - novokain

IV - fenasal

V - bepaks

A) I, V

B) II, IV

C) I, IV, V

D) II, III

E) I, III

9. Oksofenamid hansı maddələrin qarşılıqlı təsirindən alınır?

I - p - aminfenol

II - fenilsalisilat

III - o - aminfenol

IV - m - aminfenol

A) I, II

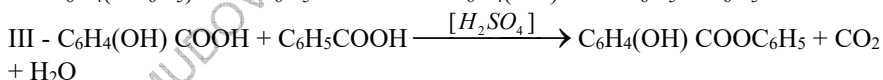
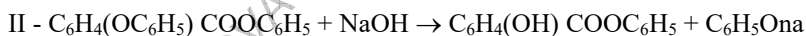
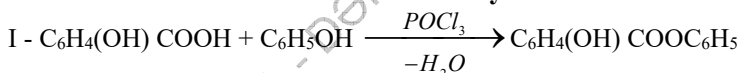
B) II, III

C) II, IV

D) I, II, III

E) II, III, IV

10. Salol dərman maddəsi hansı reaksiyalar vasitəsilə sintez edilir.



A) yalnız I

B) I, II

C) I, III

D) II, III

E) I, II, III.

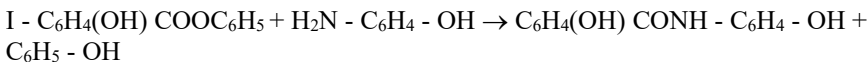
11. Verilmiş dərman maddələrinin alınma reaksiyalarını adlarının verildiyi ardıcılıqla göstərin.

a - salol

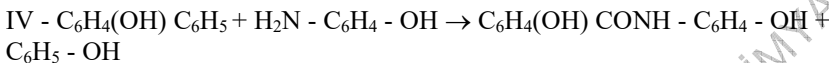
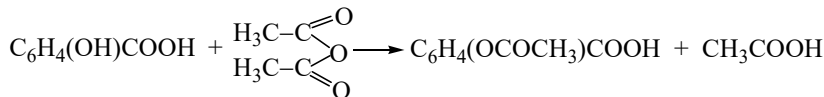
b - aspirin

c - oksofenamid

d - metilsalisilat



III -



A) V, III, I, II

B) I, III, V, II

C) V, II, IV, I

D) I, IV, V, II

E) I, II, V, IV

12. Bepaksın alınması reaksiyasında aşağıdakı birləşmələrin alınma ardıcılığını göstərin:

1 - p - aminosalisil turşusunun Na duzu

2 - p - aminosalisil turşusu

3 - m - nitrofenol

4 - p - benzoilaminosalisil turşusunun Ca duzu

5 - m - aminofenol

6 - p - benzoilaminosalisil turşusunun Na duzu

A) 3, 5, 2, 1, 6, 4

B) 5, 3, 2, 6, 1, 4

C) 2, 3, 5, 4, 6, 1

D) 1, 2, 3, 4, 5, 6

E) 6, 4, 2, 1, 5, 3

13. Salisilamidin alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcılığını göstərin.

1- metil spirti

2- salisil turşusu

3- metilsalisilat

4- NH_4OH

A) 2, 1, 3, 4

B) 1, 3, 2, 4

C) 2, 3, 4, 1

D) 1, 2, 4, 3

E) 4, 2, 1, 3

14. Oksofenamidin alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcillığını göstərin.

1- p-aminofenol

2- fenilsalisilat

3- natrium salisilat

4- natrium fenolyat

A) 3, 4, 2, 1

B) 1, 3, 2, 4

C) 2, 3, 1, 4

D) 1, 2, 4, 3

E) 4, 2, 1, 3

15. Na-p-aminosalisilatın alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcillığını göstərin.

1- m-aminofenol

2- m-nitrofenol

3- CO₂

4- p-aminosalisil turşusu

5- NaHCO₃

A) 2, 1, 3, 4, 5

B) 1, 3, 2, 4, 5

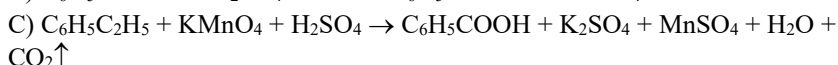
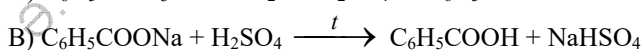
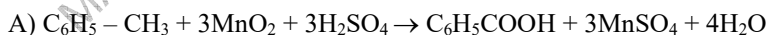
C) 2, 3, 1, 5, 4

D) 4, 2, 1, 5, 3

E) 5, 4, 1, 3, 2

Mövzu: Benzoy turşusu və p - aminbenzoy turşusunun törəmələri

1. Tibbdə istifadə olunan daha təmiz benzoy turşusu hansı üsulla alınır:



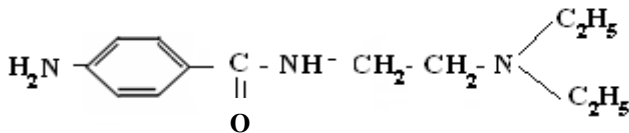
2. Kimyəvi təbiətinə görə dikain:

- A) para - butilaminobenzoy turşusu β - dimetilamin etil efirinin hidroxlorididir
 B) para - aminobenzoy turşusunun β - dietilamin efirinin hidroxlorididir
 C) para - aminobenzoy turşusunun etilxlorididir
 D) para - aminosalisil turşusunun metil efiridir
 E) üzvi turşuların dihalogenli törəmələridir

3. P - aminobenzoy turşusunun törəmələri üçün başlanğıc maddə kimi hansı birləşmədən istifadə edilir?

- A) p - nitrobenzoy turşusu
 B) p - aminofenol
 C) anilin
 D) pikrin turşusu
 E) p - nitrofenol

4. Bu hansı maddənin quruluş formuludur?



- A) novokainamid
 B) novokain
 C) anestezin
 D) dikain
 E) kokain

5. Aromatik aminlərin dərman maddəsi kimi işlədilən törəmələrindən olan dikainin kimyəvi adı:

- A) p - butilaminobenzoy turşusunun β - dimetilaminoetil efiri
 B) p - aminobenzoy turşusunun etil efiri
 C) 2, 4, 6 - trimetilamin - xlorid
 D) 2, 4, 6 - trimetil - N - dietilamiasetamin
 E) 2, 4, 6 - trimetil - N - dimetilaminasetanilin - xlorid.

6. Anestezin preparatının kimyəvi adı necədir?

- A) p - aminbenzoy turşusunun etil efiri
 B) m - aminbenzoy turşusunun etil efiri
 C) o - aminbenzoy turşusunun etil efiri
 D) p - aminbenzoy turşusu
 E) m - aminbenzoy turşusu.

7. P - aminbenzoy turşusunun β - dietilamitetil efinin hidroxloridi yerli anesteziyaedici kimi işlədilir. Bu preparatın adı necədir?

- A) novokain
- B) anestezin
- C) ftalazol
- D) dikain
- E) etazol.

8. Adları çəkilən preparatlardan hansı para - aminobenzoy turşusunun törəmələridir?

- I - anestezin
- II - dikain
- III - parasetamol
- IV - novokain
- V - biseptol
- A) I, II, IV
- B) II, III, IV
- C) III, IV, V
- D) IV, V
- E) I, III, V

9. Sulfakamfokain preparatının tərkibinə hansı birləşmələr daxildir:

- I – novokain
- II – p - aminobenzoy turşusu
- III – sulfakamfora turşusu
- IV – su
- V – brom kamfora
- A) I, III, IV
- B) II, III, IV
- C) I, III, V
- D) II, III, V
- E) I, II, V

10. Aromatik aminlərə aid olan dərman preparatlarını göstərin.

- I - Fenetidin
- II - Salisilamid
- III - Fenasetin
- IV - Parasetamol
- A) I, III, IV
- B) II, III, IV
- C) II, IV

- D) yalnız I
E) yalnız IV.

11. Hansı preparatlar p - aminobenzoy turşusunun törəmələrinə aid olan dərman maddələridir?

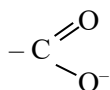
- I - Dikain
II - Anestezin
III - Fenasetin
IV - Novokainamid

- A) I, II, IV
B) II, III, IV
C) I, II, III
D) yalnız I
E) yalnız II.

12. Yerli anestiziyaedici kimi işlədilən novakain preparatının tərkibinə hansı funksional qruplar daxildir?

I – NH₂

II -



III — C₂H₅

IV - SO₂

- A) I, II, III
B) II, III, IV
C) I, IV
D) yalnız I
E) yalnız II.

13. Novokainin alınması reaksiyasında aşağıdakı birləşmələrin alınma ardıcılığını göstərin:

1 - p - nitrobenzoy turşusunun etil efiri

2 - p - nitrobenzoy turşusu

3 - anestezin

4 - p - nitrotoluol

5 - novokain

- A) 4, 2, 1, 3, 5
B) 5, 3, 2, 4, 1
C) 2, 3, 1, 4, 5

D) 1, 2, 3, 4, 5,

E) 3, 4, 2, 1, 5

14. Novokainin alınması reaksiyasında istifadə olunan maddələrin düzgün ardıcillığını göstərin.

1- C_2H_5OH

2- p-nitrotoluol

3- p-aminobenzoy turşusunun β -dietil aminoetil efiri

4- p-nitrobenzoy turşusu

5- p-nitrobenzoy turşusunun etil efiri

6-anestezin

A) 2, 4, 1, 5, 6, 3

B) 1, 3, 2, 4, 5, 6

C) 2, 3, 1, 5, 6, 4

D) 4, 2, 1, 5, 3, 6

E) 5, 4, 1, 3, 2, 6

15. Anestezin alınması reaksiyasında istifadə olunan reagentlərin düzgün ardıcillığını göstərin.

1- C_2H_5OH

2- p-nitrotoluol

3- $K_2Cr_2O_7$

4- p-nitrobenzoy turşusu

5- p-nitrobenzoy turşusunun etil efiri

6- p-aminobenzoy turşusunun etil efiri

A) 2, 3, 4, 1, 5, 6

B) 1, 4, 2, 5, 3, 6

C) 2, 3, 1, 5, 6, 4

D) 4, 2, 1, 5, 3, 6

E) 5, 4, 1, 3, 2, 6

16. Tibbi praktikada geniş tətbiq edilən dərman preparatlarının adı ilə kimyəvi adı

arasında uyğunluğu göstərin?

I - novokainamid

II - novokain

III - anestezin

IV - dikain

1 - p - Aminobenzoy turşusunun β - dietilaminoetil efrinin hidroxloridi

2 - p - Butilaminobenzoy turşusunun β - dimetilaminoetil efrinin hidroxloridi

3 - p - Aminobenzoy turşusunun β - dietilaminoetilamidinin hidroxloridi

4 - p - Aminobenzoy turşusunun etil efiri

5 - p - Aminobenzoy turşusunun dietil amidi.

A) I - 3, II - 1, III - 4, IV - 2

B) I - 2, II - 3, III - 4, IV - 5

C) I - 5, II - 4, III - 3, IV - 2

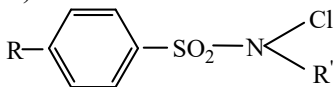
D) I - 1 II - 3, III - 4, IV - 5

E) I - 3, II - 5, III - 2, IV - 1

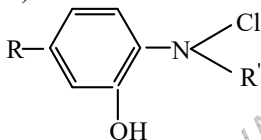
Mövzu: Sulfanil turşusunun amidlərinin xlorlu törəmələri
Sulfanilamid preparatları

1. Sulfoturşuların amidlərinin xlorlu törəmələrinin ümumi formulunu göstərin.

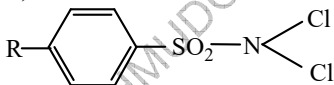
A)



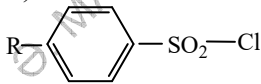
B)



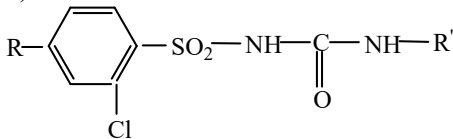
C)



D)

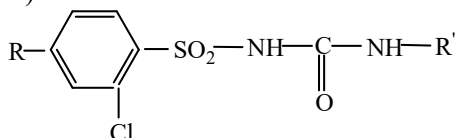


E)

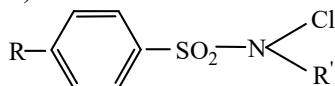


2. Sulfo turşuların alkil ureidlərinin törəmələrinin ümumi formulunu göstərin.

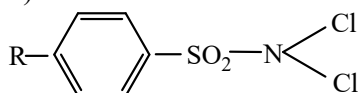
A)



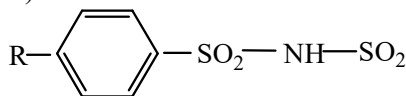
B)



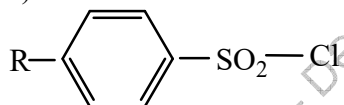
C)



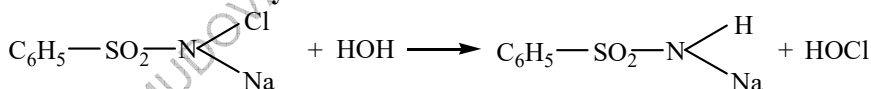
D)



E)



3. Göstərilən sxem nəyi ifadə edir?



A) Xloramin məhlullarının dezinfeksiyaedici təsirini.

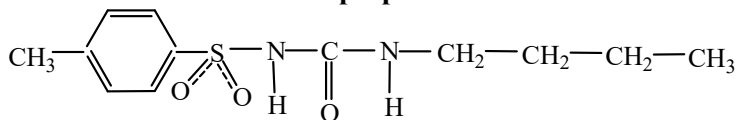
B) Xloraminin reduksiya olunduğunu.

C) Xloraminin tərkibindəki xlor atomunun hidrogenlə əvəz olunmasını.

D) Xloraminin hidratlaşması.

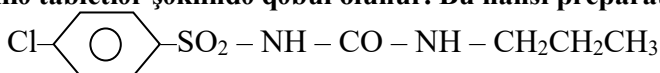
E) Xloraminin oksidləşmə reaksiyasını.

4. Göstərilən formul hansı preparata məxsusdur?



- A) Butamid
- B) Xloramin
- C) Pantosid
- D) Xlorpropamid
- E) Bepaks

5. Verilmiş quruluşa malik maddə şəkərli diabetin müalicəsində daxilə tabletlər şəklində qəbul olunur. Bu hansı preparatdır?

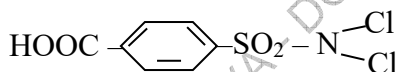


- A) xlorpropamid
- B) xloramin
- C) pantosid
- D) fenasetin
- E) butamid.

6. N - dixlor - para - karboksibenzolsulfamid dezinfeksiya məqsədləri üçün antiseptik maddə kimi işlədilir. Bu preparatın adını göstərin.

- A) pantosid
- B) xloramin
- C) butamid
- D) parasetamol
- E) xlorpropamid.

7. Verilmiş formul hansı preparatın formuludur?



- A) pantosid
- B) xloramin
- C) dixloramin
- D) tsiklamid
- E) novokainamid

8. Sulfo turşuların alkil ureidlərinin törəmələrinə hansı preparatlar aiddir?

- 1 - Dixloramin
- 2 - Tsikloamid
- 3 - Pantosid
- 4 - Butamid
- 5 - Xlorpropamid

- A) 2, 4, 5
- B) 1, 2, 3,
- C) 1, 3, 5
- D) 3, 4, 5
- E) 2, 3, 5

9. Sulfoturşuların amidləri və onların törəmələrinə aid olan dərman preparatları hansılardır?

- I - Xloramin
- II - Butamid
- III - Xlorpropamid
- IV - Ksikain

- A) I, II, III
- B) II, III, IV
- C) II, IV
- D) yalnız I
- E) yalnız II.

10. Sufo turşuların amidlərinin xlorlu törəmələrinə hansı preparatlar aiddir?

- 1 - Xloramin
- 2 - Dixloramin
- 3 - Pantosid
- 4 - Butamid
- 5 - Propamid

- A) 1, 2, 3
- B) 1, 2, 3, 4
- C) 1, 2, 5
- D) 1, 3, 4
- E) Hamısı

11. Sulfanilamid preparatlarının heterotsiklik törəmələrini göstərin.

- 1 - norsulfazol
- 2 - sulgin
- 3 - etazol
- 4 - sulfadimezin
- 5 - streptosid
- 6 - urosulfan

- A) I, III , IV
- B) II, III, IV
- C) II, IV

D) yalnız I

E) yalnız II.

12. Sulfanilamid preparatlarının alifatik törəmələrini göstərin:

1 - sulgin

2 - etazol

3 - sulfadimezin

4 - streptosid

5 - urosulfan

A) I, IV, V

B) II, III, IV

C) II, IV

D) yalnız I

E) yalnız II.

13. Sulfanilamid preparatlarının heterotsiklik törəmələrini göstərin.

1 - sulgin

2 - etazol

3 - sulfadimezin

4 - streptosid

5 - urosulfan

6 - norsulfazol,

A) 2; 3; 6

B) 1; 4; 5

C) 1; 3; 5

D) 2; 4; 6

E) 2; 3; 5

14. Sulfakamfokain preparatının tərkibinə hansı birləşmələr daxildir:

I – novokain

II – p - aminobenzoy turşusu

III – sulfakamfora turşusu

IV – su

V – brom kamfora

A) I, III, IV

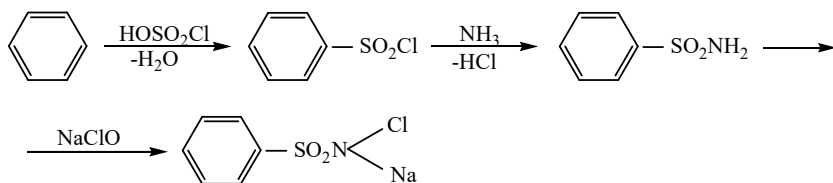
B) II, III, IV

C) I, III, V

D) II, III, V

E) I, II, V

15. Aşağıdakı reaksiya üzrə alınan maddələrin adını alınma ardıcılığı ilə göstətin:



- 1 - benzolsulfoamid
 2 - xloramin
 3 - streptosid
 4 - benzolsulfoxlorid

- A) 4, 1, 2
 B) 2, 3, 4
 C) 1, 2, 3
 D) 4, 2, 3
 E) 3, 1, 4

16. Xloraminin alınması reaksiyasında istifadə olunan reagentlərin düzgün ardıcılığını göstərin.

- 1- HOSO_2Cl
 2- benzol
 3- NaClO
 4 – NH_3

- A) 2, 1, 3, 4
 B) 1, 4, 2, 3
 C) 2, 3, 1, 4
 D) 4, 2, 1, 3
 E) 4, 1, 3, 2

17. Pantosidin alınması reaksiyasında istifadə olunan reagentlərin düzgün ardıcılığını göstərin.

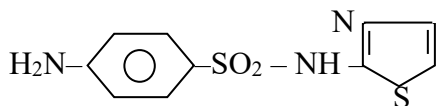
- 1- HOSO_2Cl
 2- toluol
 3 –p- toluolsulfoxlorid
 4 –p- toluolsulfoamid
 5- p- benzolsulfoturşunun amidi

- A) 2, 1, 3, 4, 5
 B) 1, 4, 2, 5, 3
 C) 2, 3, 1, 5, 4
 D) 4, 2, 1, 3, 5
 E) 5, 1, 3, 2, 4

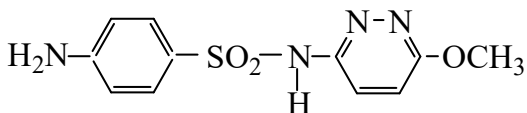
18. Verilmiş dərman maddələrinin adlarına müvafiq ardıcılıqla

kimyəvi quruluşunu göstərin: streptosid - sulfadimetoksin - norsulfazol - sulfodimezin.

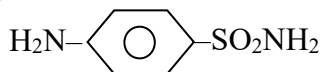
1 -



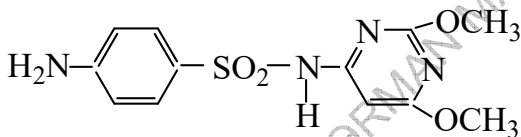
2 -



3 -



4 -



A) 3; 4; 1; 2

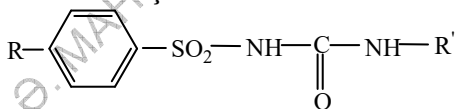
B) 3; 2; 1; 4

C) 1; 2; 3; 4

D) 2; 3; 1; 4

E) 4; 1; 2; 3

19. Sulfoturşuların alkilureidlərinin ümumi formuluna görə



cədvəldəki X, Y və Z - i müəyyən edin.

Preparatın adı	R	Radikallar
Butamid	X	R'
Xlorpropamid	Cl	C ₄ H ₉
		Y

Tsikloamid

Z

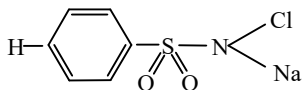


- X Y Z
- A) CH_3 ; C_3H_7 ; CH_3
B) CH_3 ; CH_3 ; C_3H_7
C) C_3H_7 ; CH_3 ; CH_3
D) CH_3 ; C_2H_5 ; CH_3
E) CH_3 ; CH_3 ; CH_3

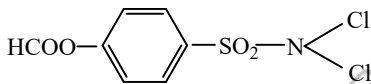
20. Sufo turşuların amidlərinin xlorlu törəmələri olan dərman maddələrinə müvafiq olan kimyəvi quruluşu göstərin.

- a - Xloramin
b - Dixloramin
c - Pantosid

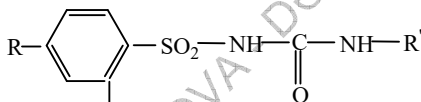
1 -



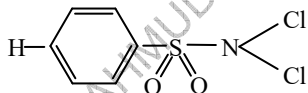
2 -



3 -



4 -



- A) a - 1; b - 4; c - 2
B) a - 2; b - 4; c - 3
C) a - 1; b - 2; c - 4
D) a - 4; b - 3; c - 1
E) a - 2; b - 1; c - 2

21. Aşağıdakı dərman maddələrinin alınmasında müvafiq olaraq başlangıç maddə kimi hansı birləşmədən istifadə edilir?

- a - xloramin

- b - pantosid
 1 - benzol
 2 - toluol
 3 - fenol
 4 - timol
 5 - krezol
 A) a - 1, b - 2
 B) a - 2, b - 1
 C) a - 3, b - 4
 D) a - 5, b - 2
 E) a - 4, b - 3

22. Sulfanilamid preparatlarının heterotsiklik və alifatik törəmələri arasında müvafiq əlaqəni göstərin.

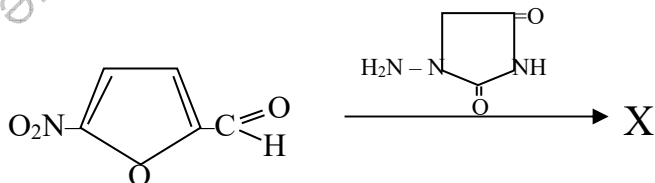
I- heterotsiklik

II- alifatik

- 1 - norsulfazol
 2 - sulgin
 3 - etazol
 4 - sulfadimezin
 5 - streptosid
 6 - urosulfan
 A) I-1,3,5 ; II-2,4,6
 B) I-1,2,3 ; II-4,5,6
 C) I-1,3,4 ; II-2,5,6
 D) I-3,5,6 ; II-1,2,4
 E) I-4,5,6 ; II-1,2,3

Mövzu: Dərman təsirli heterotsiklik birləşmələr. Beş üzvlü bir və iki heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr

1. Alınan Z maddəsi hansı dərman maddəsidir?



- A) furadonin
- B) furazolidon
- C) furasamid
- D) fenasetin
- E) furasillin

2. Furasilin, furadonin, furazalidonun alınmasında başlanğıc maddə olaraq hansı birləşmədən istifadə edilir?

- A) 5 - nitrofurfurol
- B) furfurol
- C) 5 - nitrofurfurol asetat
- D) nitrofuran
- E) furan

3. Antipirinin kimyəvi adı nədir?

- A) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil pirazolon - 5
- B) 2 - metil - 5, 8 - dimetiloksifuro(2¹, 3¹, 6, 7) xrom
- C) 1, 2 - dimetil - 4n - butilpirazolidindion - 3, 5
- D) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil - 4 - metilamin pirazolon - 5
- E) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil - 4 - dimetilamin pirazolon - 5

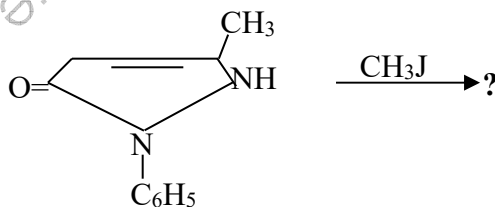
4. Amidopirinin kimyəvi adı nədir?

- A) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil - 4 - dimetilamin pirazolon - 5
- B) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil pirazolon - 5
- C) 2 - metil - 5, 8 - dimetiloksifuro(2¹, 3¹, 6, 7) xrom
- D) 1, 2 - difenil - 4n - butilpirazolidindion - 3, 5
- E) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil - 4 - metilamin pirazolon - 5

5. Analqinin kimyəvi adı nədir?

- A) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil - 4 - metilamin pirazolon - 5 - H
- B) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil - 4 - dimetilamin pirazolon - 5
- C) 1 - fenil - 2, 3 - dimetil pirazolon - 5
- D) 2 - metil - 5, 8 - dimetiloksifuro(2¹, 3¹, 6, 7) xrom
- E) 1, 2 - difenil - 4n - butilpirazolidindion - 3, 5

6. Alınan məhsulu göstərin:



- A) antiprin
- B) amidoprin
- C) promedol
- D) pirazalon
- E) analgin

7. 5 üzvlü 1 hetero atomlu heterosiklik birləşmələrin sadə nümayəndlərini göstər:

- 1 - tiazol
- 2 - tiofen
- 3 - pirazol
- 4 - pirrol
- 5 - furan
- 6 - oksazol

- A) 2, 4, 5
- B) 1, 3, 5
- C) 2, 4, 6
- D) 1, 3, 6
- E) 3, 5, 6

8. Hansı dərman maddələri pirazolun törəmələridir?

- I - Nootropil
- II - Naftizin
- III - Furasillin
- IV - Norsulfazol
- V - Salol.

- A) II, IV
- B) I, II, III
- C) III, IV, V
- D) II, III, V
- E) I, IV, V.

9. Antipirin, amidopirin və analgin haqda deyilənlərdən hansıları doğrudur?

- I - Hər üçünün alınması üçün ilkin maddə kimi asetosirkə turşusunun etil efirindən və fenilhidrazindən istifadə edilir.
 - II - Analqin antipirindən alınır
 - III - Amidopirin analqindən alınır
 - IV - Amidopirin antipirindən alınır
 - V - Analqin 4 - aminantipirindən alınır.
- A) I, II, IV, V

- B) I, III, IV, V
- C) I, II, III
- D) II, III, IV, V
- E) III, IV, V.

10. Furasilin preparatı tibbdə hansı məqsədlər üçün istifadə edilir?

- I - Xaricə irinli – iltihab proseslərinin profilaktikasında;
- II - Daxilə bakteriyal dizenteriyanın müalicəsində;
- III - Cərrahi əməliyyatlarda yuxu gətirici kimi.

- A) I, II
- B) I, III
- C) II, III
- D) yalnız I
- E) yalnız III

11. Furadonin preparatı tibbdə hansı məqsədlər üçün istifadə olunur?

- I - Sidik yollarının infeksiyon xəstəliklərində
- II - Soyuqdəyməyə qarşı
- III - Narkoz kimi

- A) yalnız I
- B) I, II
- C) yalnız II
- D) I, III
- E) yalnız III

12. Asetosirkə efirindən əv aşağıda verilən reagentlərin hansından istifadə etməklə pirazalon - 5 - in törəmələri olan antipirin və amidopirin almaq olar:

- 1- $\text{NH}_2 - \text{NH} - \text{C}_6\text{H}_5$
- 2- $\text{NH}_2 - \text{NH}_2$
- 3- $\text{NH}_2 - \text{NH} - \text{C}_2\text{H}_5$
- 4- $\text{C}_3\text{H}_7\text{J}$
- 5- CH_3J

- A) 1, 5
- B) 2, 5
- C) 3, 5
- D) 1, 4
- E) 2, 4

13. Beşüzvlü heterotsiklik birləşmələrin törəmələri olan aşağıdakı dərman maddələrinə uyğun olaraq onların kimyəvi adlarını müvafiq

ardıcılıqla göstərin: amidopirin - analqin - antipirin .

1 - 1 - fenil - 2, 3 - dimetilpirazolon – 5

2 - 1 – fenil - 2, 3 - dimetil - 4 - dimetilaminopirazolon – 5

3 - 1 - Fenil 2, 3 - dimetil - 4 - metilaminopirazolon - 5 - metan natrium sulfanat

A) 2, 3, 1

B) 1, 3, 2

C) 3, 2, 1

D) 1, 2, 3

E) 2, 1, 3

14. Beşüzvlü heterotsiklik birləşmələrin törəmələri olan aşağıdakı dərman maddələrini alınma ardıcılığı ilə göstərin.

1 - antipirin

2 - analqin

3 - amidopirin

A) 1, 3, 2

B) 1, 2, 3

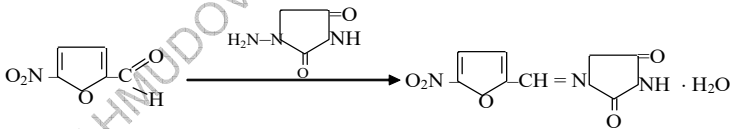
C) 2, 1, 3

D) 3, 1, 2

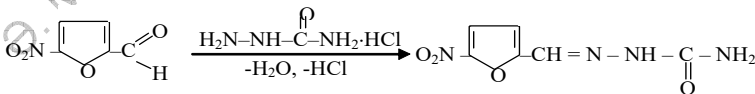
E) 2, 3, 1

15. Beşüzvlü heterotsiklik birləşmələrin törəmələri olan aşağıdakı dərman maddələrinin adları verilmiş ardıcılığa - furazolidon - furasilin - furadonin uyğun olaraq onların müvafiq alınması reaksiyasını göstərin:

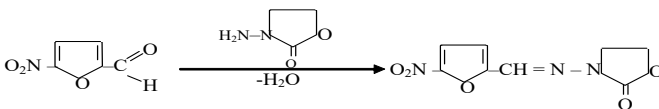
1 -



2 -



3 -



- A) 3, 2, 1
 B) 1, 2, 3
 C) 2, 1, 3
 D) 3, 1, 2
 E) 2, 3, 1

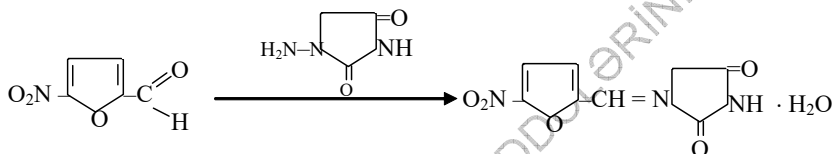
16. Verilmiş dərman maddələri ilə onların müvafiq alınma reaksiyaları arasında uyğunluğu göstərin:

I- furazalidon

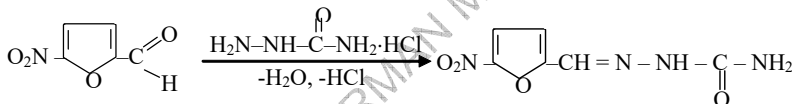
II- furasilin

III-- furadonin

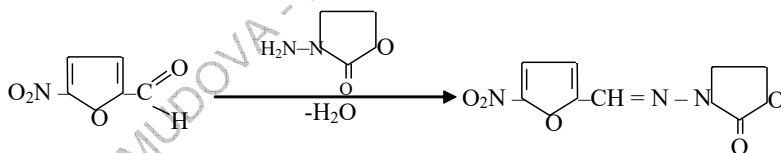
1 -



2 -



3 -



- A) I-3, II-2, III-1
 B) I-1, II-2, III-3
 C) I-3, II-1, III-2
 D) I-2, II-3 III-1
 E) I-2, II-1, III-3

17. 5 üzvlü 1 hetero atomlu və 5 üzvlü 2 hetero atomlu heterosiklik birləşmələrin sadə nümayəndələri arasında uyğun əlaqəni göstərin.

I - 5 üzvlü 1 hetero atomlu heterosiklik birləşmə

II - 5 üzvlü 2 hetero atomlu heterosiklik birləşmə

1 - tiazol

- 2 - tiofen
 3 - pirazol
 4 - pirrol
 5 - furan
 6 - oksazol
 A) I -2,4,5 ; II -1,3,5
 B) I-1,2,3 ; II-4,5,6
 C) I-1,3,4 ; II-2,5,6
 D) I-3,5,6 ; II-1,2,4
 E) I-4,5,6 ; II-1,2,3

18. 5 üzvlü 1 hetero atomlu və 5 üzvlü 2 hetero atomlu heterosiklik birləşmələrin törəmələri olan dərman maddələri arasında uyğun əlaqəni göstərin.

I - 5 üzvlü 1 hetero atomlu heterosiklik birləşmə

II -5 üzvlü 2 hetero atomlu heterosiklik birləşmə

1 - furazolidon

2- analqin

3- furasilin

4 - amidopirin

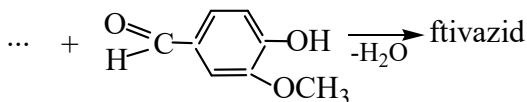
5- antipirin

6- furadonin

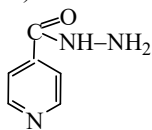
- A) I -1,3,6 ; II -2,4,5
 B) I-1,2,3 ; II-4,5,6
 C) I-1,3,4 ; II-2,5,6
 D) I-3,5,6 ; II-1,2,4
 E) I-4,5,6 ; II-1,2,3

Mövzu: Altıüzvlü bir və ikiheteroatomlu heterotsiklik dərman preparatları

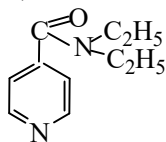
1. Aşağıda verilən reaksiyada nöqtələrin yerində hansı maddə olmalıdır?



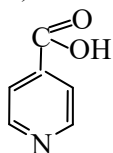
A)



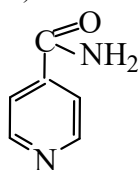
B)



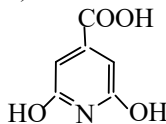
C)



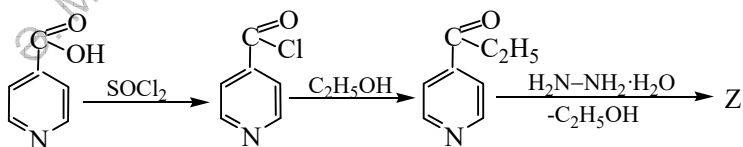
D)



E)



2. Reaksiyada alınan Z maddəsi izonikotin turşusunun hansı törəməsidir?



A) izoniazid

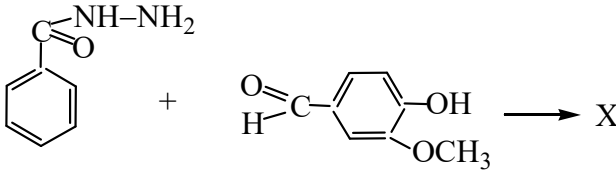
B) larusan

C) salyuzid

D) metazid

E) ftivazid

5. Reaksiya nəticəsində alınan X maddəsini göstərin?



A) ftivazid

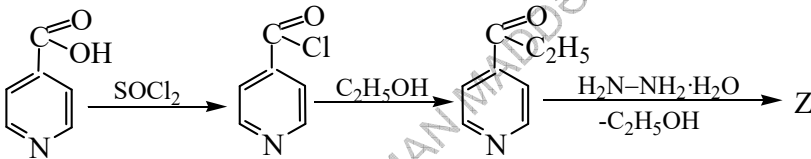
B) tubazid

C) izoniazid

D) salyuzid

E) metazid

6. Verilmiş reaksiyadan alınan Z maddəsi izonikotin turşusunun hansı törəməsidir?



A) izoniazid

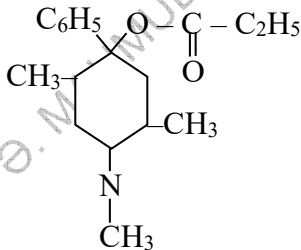
B) larusan

C) salyuzid

D) metazid

E) ftivazid

8. Bu kimyəvi quruluşun hansı maddəyə aid olduğunu müəyyən edin.



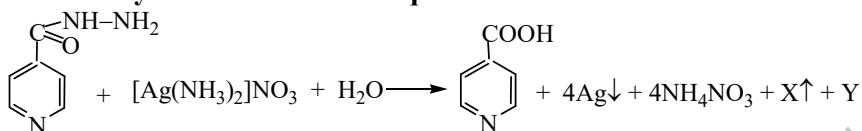
A) promedol

B) validol

C) analgin

- D) antiprin
E) tsiklodol

11. Reaksiya nəticəsində alınan qazlar hansılardır?



- 1 - NH_3
2 - H_2
3 - O_2
4 - N_2
5 - H_2O
A) 1, 4
B) 2, 5
C) 1, 3
D) 2, 5
E) 4, 5

12. Verilənlərdən hansı pirimidinin törəmələridir?

- 1 - urasil
2 - metiltiourasil
3 - sulfadimezin
4 - nikotin amid
5 - izoniazid
A) 1, 2, 3
B) 3, 4, 5
C) 1, 3, 4
D) 3, 4
E) 4, 5

13. İzonikotin turşusunun törəmələri olan dərman preparatlarını göstərin?

- 1-izoniazid
2-ftalazol
3-salol
4-metazid
5-ftivazid
6-metasin
A) 1,4,5
B) 1,3,6

C) 2,4,6

D) 3,4,5

E) 4,6,7

14. Ftivazid preparatının alınmasında istifadə olunan reagentlərin reaksiyada istifadə ardıcılığını düzgün göstərin.

1 - hidrazin

2 - γ - piridin karbon turşusu

3 - tionilxlorid

4 - 4 - hidroksi - 3 - metoksi - benzaldehid

5 - etil spirti

A) 2, 3, 5, 1, 4

B) 4, 3, 2, 1, 5

C) 2, 3, 1, 4, 5

D) 1, 4, 3, 5, 2

E) 2, 3, 4, 1, 5

15. İzoniazidin alınması reaksiyasında aşağıdakı birləşmələrin alınma ardıcılığını düzgün göstərin:

1 - γ - piridin karbon turşusunun etil efiri

2 - izoniazid

3 - γ - piridin karbon turşusu

4 - γ - piridin karbon turşusunun xlor anhidridi

A) 3, 4, 1, 2

B) 4, 3, 2, 1

C) 4, 3, 1, 2

D) 1, 4, 3, 2

E) 1, 3, 4, 2

16. Ftivazidin alınması reaksiyasında aşağıdakı birləşmələrin alınma ardıcılığını göstərin:

1 - izonikotin turşusunun xlor anhidridi

2 - izonikotin turşusu

3 - izonikotin turşusunun izoniazidi

4 - ftivazid

5 - izonikotin turşusunun etil efiri

A) 2, 1, 5, 3, 4

B) 5, 3, 2, 1, 4

C) 2, 1, 5, 4, 3

D) 1, 2, 3, 5, 4

E) 3, 2, 1, 4, 5

17. İzoniazid preparatının alınmasında istifadə olunan reagentlərin reaksiyada istifadə ardıcılığını düzgün göstərin.

- 1 - tionilxlorid
- 2 - γ - piridin karbon turşusu
- 3 - hidrazin
- 4 – etil spirti

- A) 2, 1, 4, 3
- B) 4, 3, 2, 1
- C) 2, 3, 1, 4
- D) 1, 4, 3, 2
- E) 2, 3, 4, 1

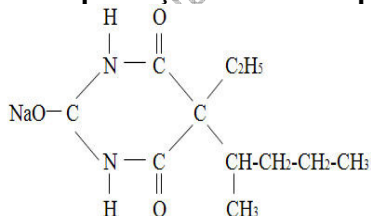
18. İzoniazidin alınması reaksiyasında aşağıdakı birləşmələrin alınma ardıcılığını göstərin:

- 1 - izonikotin turşusunun xlor anhidridi
- 2 - izonikotin turşusu
- 3 - izonikotin turşusunun izoniazidi
- 4 – izonikotin turşusunun etil efiri

- A) 2, 1, 4, 3
- B) 4, 3, 2, 1
- C) 1, 2, 3, 4
- D) 1, 4, 2, 3
- E) 2, 4, 3, 1

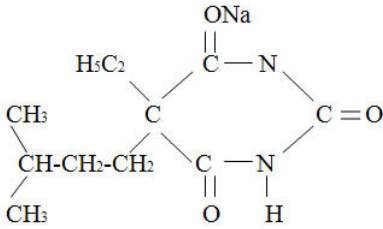
Mövzu: Barbitur turşusunun dərman təsirli törəmələri. Bitisklik və heterotsiklik birləşmələr

1. Bu quruluş hansı dərman preparatının quruluşudur?



- A) Etaminal - natrium
- B) Heksenal
- C) Barbital
- D) Fenobarbital
- E) Metiltiourasil

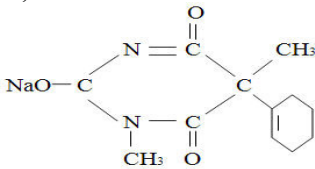
2. Bu quruluş hansı dərman preparatının quruluşuna uyğun gəlir?



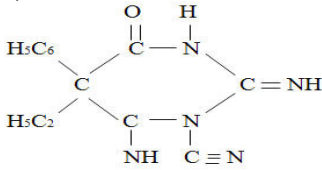
- A) Barbamil
B) Heksenal
C) Etaminal - natrium
D) Barbital
E) Metiltiourasil

3. Heksenalın formulu göstərin.

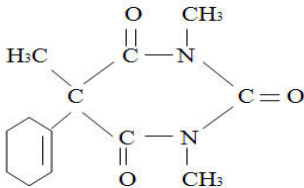
A)



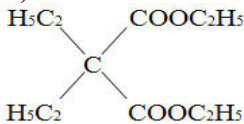
B)



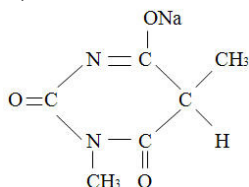
C)



D)



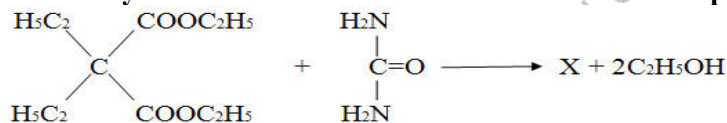
E)



4. Benzonal preparatı hansı birləşmələr əsasında sintez olunur?

- A) Fenobarbital və benzoilxlorid
- B) Heksenal və benzoilxlorid
- C) Barbamil və benzilxlorid
- D) Fenobarbital və benzilxlorid
- E) Barbitur turşusu və benzoilxlorid

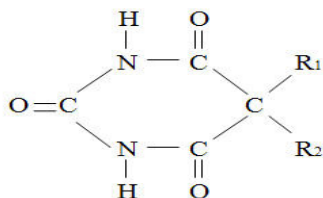
5. Reaksiya nəticəsində alınan X maddəsi hansı dərman preparatıdır?



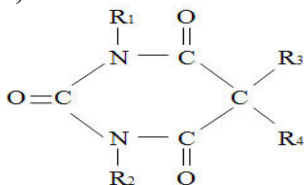
- A) Barbitur
- B) Benzonal
- C) Heksenal
- D) Fenolbarbital
- E) Barbamil

6. Barbitur turşusunu törəmələrinin ümumi formülünü göstərin.

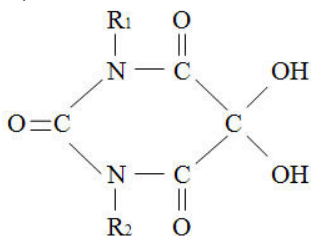
A)



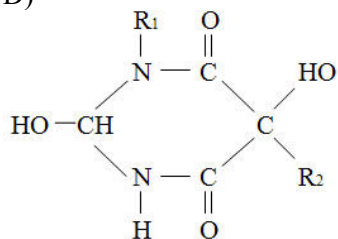
B)



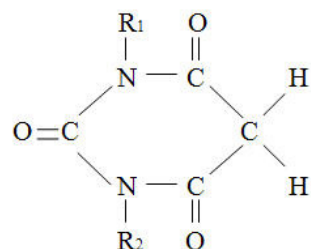
C)



D)



E)



7. Benzonal preparatı hansı birləşmələr əsasında sintez olunur?

- 1- fenobarbital
- 2-heksenal
- 3-barbamil
- 4-benzilxlorid
- 5- benzoilxlorid

A) 1, 5

B) 1, 4

C) 2, 4

D) 3, 5

E) 2, 5

8. Barbitur turşusu hansı birləşmələrin kondensləşməsindən alınır?

- 1- sidik cövhəri

- 2-hidrazin
- 3-tiokarbamid
- 4- malon turşusu
- 5- kəhrəba turşusu

- A) 1, 4
- B) 1, 5
- C) 2, 4
- D) 3, 4
- E) 2, 5

9. Aşağıdakı dərman maddələrindən hansıları xinolinin törəməsi olan dərman maddəsidir?

- I - Dimedrol
- II - Rivanol
- III - 5 - NOK
- IV - NO - Şpa
- V - Entereseptol

- A) III, V
- B) II, I
- C) III, IV
- D) II, V
- E) III, I.

10. Barbitur turşusunun törəmələri olan adları aşağıda verilmiş dərman maddələrinə uyğun olaraq onların kimyəvi adlarını müvafiq ardıcılıqla göstərin: barbital - barbamil - fenobarbital

- I - 5 - etil - 5 - fenilbarbitur turşusu
- II - 5, 5 - dietil barbitur turşusu
- III - 5 - etil - 5 - izoamibarbiturat natrium

- A) II, III, I
- B) I, III, II
- C) III, II, I
- D) I, II, III
- E) II, I, III

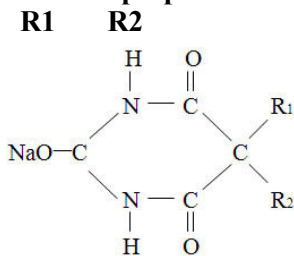
11. Fenobarbital preparatının sintezini ardıcıl olaraq göstərin

- 1 - Fenilmalon turşusunun dietilesterinin alınması
- 2 - Fenilasetat turşusunu etil efirinin alınması
- 3 - Feniletilmalon turşusunun dietilefirinin alınması
- 4 - Benzilsianidin sintezi

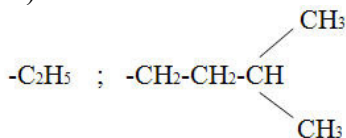
- A) 4, 2, 1, 3

- B) 1, 4, 2, 3
 C) 4, 1, 3, 2
 D) 3, 1, 2, 4
 E) 2, 3, 4, 1

12. Birləşmədə R1 və R2 radikalları aşağıdakı cavablardan hansında barbamil preparatına uyğun gəlir ?



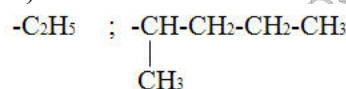
A)



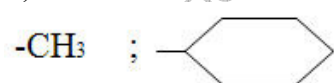
B) - C₂H₅ ; - C₂H₅

C) - C₂H₅ ; - C₆H₅

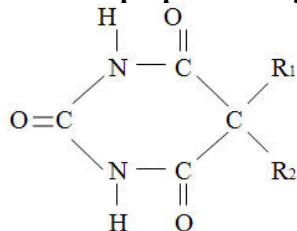
D)



E)



13. Birləşmədə R1 və R2 radikalları aşağıdakı cavablardan hansında Barbital preparatına uyğun gəlir ?

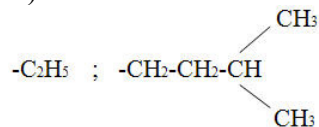


R1 R2

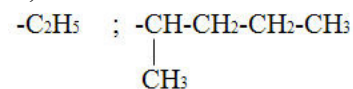
A) - C₂H₅ ; - C₂H₅

B) - C₂H₅ ; - C₆H₅

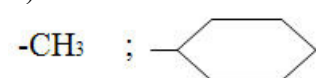
C)



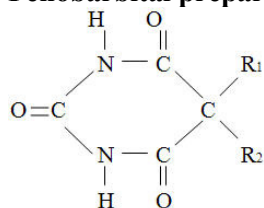
D)



E)



14. Birləşmədə R1 və R2 radikalları aşağıdakı cavablardan hansında Fenobarbital preparatına uyğun gəlir ?

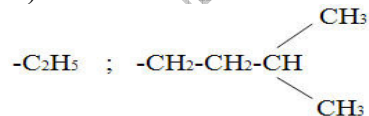


R1 R2

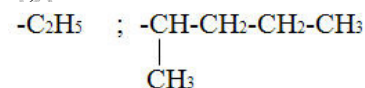
A) - C₂H₅ ; - C₆H₅

B) - C₂H₅ ; - C₂H₅

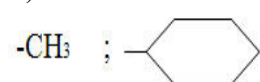
C)



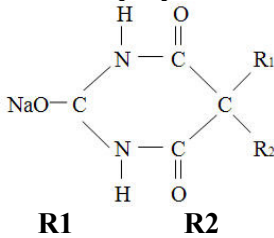
D)



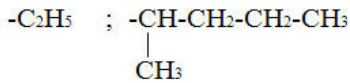
E)



15. Birləşmədə R₁ və R₂ radikalları aşağıdakı cavablardan hansında etaminal preparatına uyğun gəlir ?

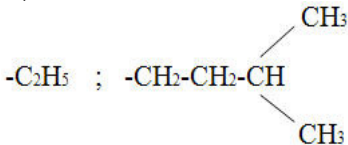


A)



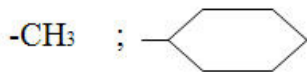
B) - C₂H₅ ; - C₆H₅

C)

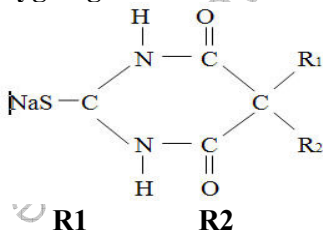


D) - C₂H₅ ; - C₂H₅

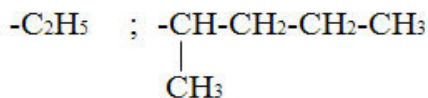
E)



16. Birləşmədə R₁ və R₂ radikalları hansı halda tiopental preparatına uyğun gəlir ?



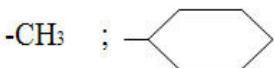
A)



B) - C₂H₅ ; - C₂H₅

$$-\text{C}_2\text{H}_5 \quad ; \quad -\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array}$$

E)



a -etaminal

c -benzonal

d- barbitol

I - 5-etil-5-izoamibarbiturat natrium

II - 5-etil-5-(2^I - amil)- barbiturat-natrium

III - 5, 5-dietil barbitur tursusu

IV – 1-benzoil-5 -etil -5 –fenil-barbitur tursusu

A) a - II, b - I, c - IV, d - III

B) a - II, b - I, c - III, d - IV

C) a - I, b - IV, c - III, d - II

D) a - IV, b - I, c - II, d - III

E) a - I, b - II, c - III, d - IV

1. Kofein, teobromin və teofillinin quruluşları nə ilə fərqlənirlər?

A) metil qruplarının sayı və vəziyyətinə görə

B) karboksil grubunun sayına göre

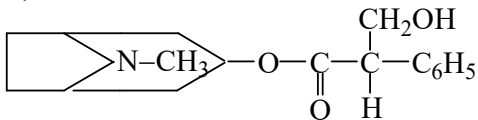
C) karbonil qruplarının vəziyyətinə görə

D) hidroksil gruplarının sayına göre

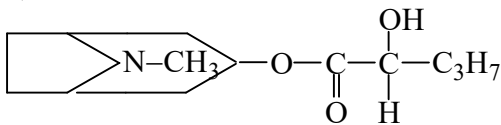
E) amin qruplarının vəziyyətinə görə

2. Atropinin kimyəvi formulunu göstərin.

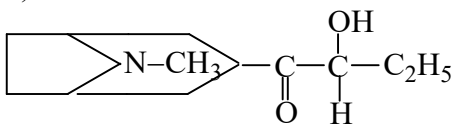
A)



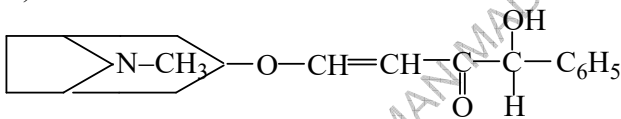
B)



C)

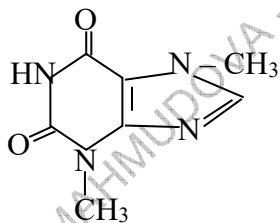


D)



E) Hec biri

3. Bu kimyəvi formul hansı alkaloid preparatına aiddir?



A) teobromin

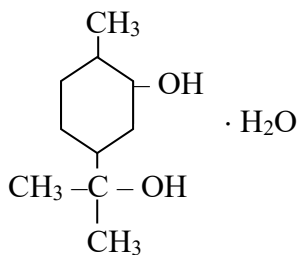
B) teofillinə

C) kofein

D) temisal

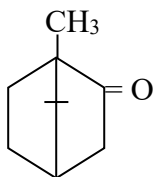
E) eufillin

4. Tibbdə bəlgəmgətirici maddə kimi işlədilən və quruluşlu maddə hansı preparatdır?



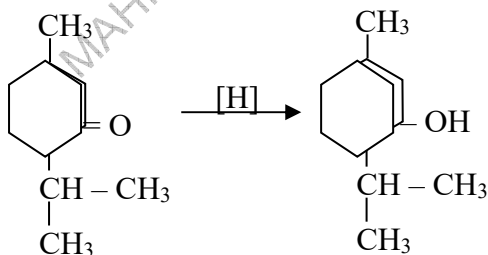
- A) terpinhidrat
- B) mentol
- C) validol
- D) kamfora
- E) novakain

5. Verilmiş quruluşa malik preparat hansıdır?



- A) kamfora
- B) bromkamfora
- C) mentan
- D) terpinhidrat
- E) mentol

6. Verilmiş reaksiya ilə sintez olunan preparat zəif antiseptik, sakitləşdirici, iltihaba qarşı və ağrıkəsici təsirə malikdir? Bu hansı preparatdır.



- A) mentol

- B) validol
- C) kamfora
- D) novakain
- E) mental

7. Sənayedə mentol hansı birləşmələr əsasında sintez olunur?

- I- m -krezol
- II- o- krezol
- III- p - krezol
- IV- izopropilxlorid
- VI- izoamil spirti
- VI- izopropil spirti

- A) I, IV
- B) II, V
- C) III, IV
- D) I, V
- E) VI

8. Monotsiklik terpenlərə aid maddələr olan sıranı göstərin:

- I - mentol
- II - terpinhidrat
- III - kamfora
- IV - temisal
- V - validol

- A) I, II, V
- B) II, III
- C) II, IV, V
- D) I, IV
- E) I, III, V

9. Tropan törəmli alkaloidlər olan sıranı göstərin.

- I - hiossiamin
- II - kokain
- III - kofein
- IV - atropin
- V - teofillin

- A) I, II, IV
- B) II, III
- C) II, IV, V
- D) I, IV
- E) III, V

10. Purin alkaloidlərinin ikiqat duzlarına aid olan preparatları göstərin.

I – kofein benzoat,

II - teobromin

III - eufillin

IV - temisal

V - teofillin

A) I, III, IV

B) II, III

C) II, IV, V

D) I, IV

E) III, V

11. Aşağıdakılardan hansılar alkaloidlərə aid olan biheterotsiklik birləşmələrdir?

I - Benzopirrol

II - Teobromin

III - Analgin

IV - Teofillin

V - Kofein.

A) II, IV, V;

B) I, II, III;

C) I, IV, V;

D) III, IV, V;

E) II, III, IV.

12. Monoterpenoidlər qrupuna aid olan preparatlar hansılardır?

I - mentol

II - terpinhidrat

III - kamfora

IV - bepask

A) I, II, III

B) II, III, IV

C) I, II, IV

D) yalnız I

E) yalnız III.

13. Monoterpenoidlər qrupuna aid olan preparatlar hansılardır?

I - mentol

II - terpinhidrat

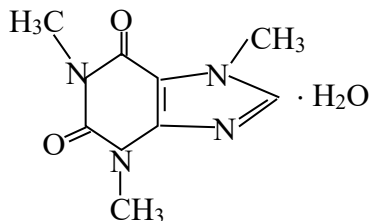
III - kamfora

IV - bepask

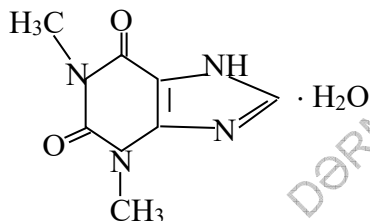
- A) I, II, III
B) II, III, IV
C) I, II, IV
D) yalnız I
E) yalnız III.

14. I və II formulları hansı alkaloid preparatlarına aiddir?

I -

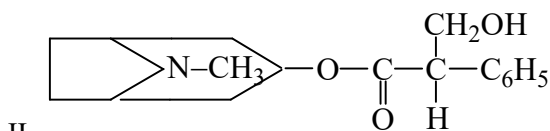
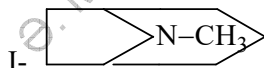


II -



- A) I - kofein, II - teofillin
B) I - kofein, II - teobromin
C) I - teobromin, II - kofein
D) I - teofillin, II - kofein
E) I - teobromin, II - teofillin.

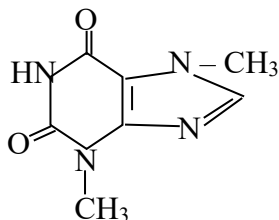
15. I və II formulları hansı alkaloid preparatlarına aiddir?



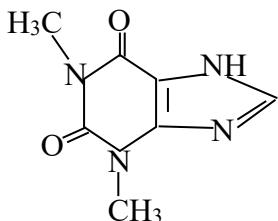
- A) I-tropan , II-atropin
 B) I- ekqonin , II-atropin
 C) I-tropan, II- ekqonin
 D) I-ekqonin,II- kokain
 E) I-tropan, II-kokain

16. I və II formulları hansı alkaloid preparatlarına aiddir?

I-



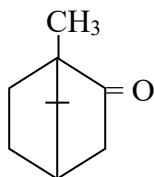
II-



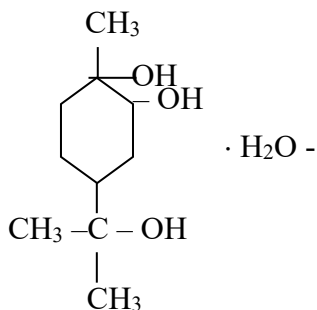
- A) I – teobromin , II - teofillin
 B) I - kofein, II - teobromin
 C) I - teobromin, II - kofein
 D) I - teofillin, II - kofein
 E) I - teofillin ,II - teobromin

17. Verilmiş formullara uyğun dərman maddələrini göstərin.

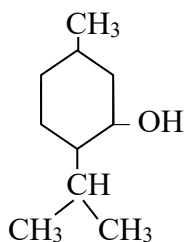
I-



II-



III -



- A) I – kamfora, II – terpinhidrat, III- mentol
 B) I - mentol, II– terpinhidrat ,III- kamfora
 C) I – kamfora, II- mentol ,II- terpinhidrat,
 D) I – terpinhidrat, II- mentol, III- kamfora
 E) I – terpinhidrat, II – kamfora, II –mentol

18. Düzgün uyğunluğu göstərin.

I-Tropan sırası alkaloidlər

II-Purin alkaloidləri

1-Kofein

2-Teofillin

3-Atropin

4-Teobromin

5-Kokain

A) I-3,5 II-1,2,4

B) I-2,3,4 II-1,5

C) I-1,3,5 II-2,4

D) I-2,4,5 II-1,3

E) I-2,4 II-1,3,5

19. Verilmiş kimyəvi adlara uyğun dərman maddələrini göstərin.

I- 3, 7 - dimetilksantin

II-1, 3, 7 - trimetilksantin

III- 1, 3 - dimetilksantin

1-kofein

2-teofillin

3-teobromin

A) I – teobromin , II – kofein, III-teofillin

B) I - kofein, II - teobromin , III-teofillin

C) I - teobromin, II-teofillin, II - kofein

D) I - teofillin, II -kofein, III- teobromin

E) I-kofein, II - teofillin,III- teobromin ,

Mövzu: Antibiotiklər

1. 5 üzvlü tiazolidin və 4 üzvlü β laktam tioaminlərin kondensləşmə məhsulunu göstərin;

A) penisilin

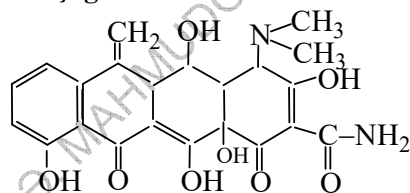
B) eritromisin

C) levomisetin

D) sefolosporin

E) kanamisin

2. Aşağıdakı formul hansı maddənin formuludur?



A) metatsiklin

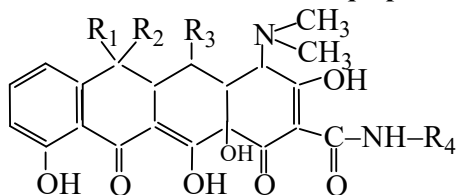
B) morfotsiklin

C) oksitetratsiklin

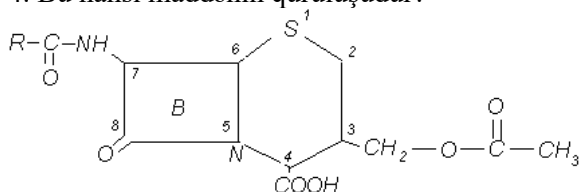
D) doksitsiklin

E) tetratsiklin

3. Göstərilən formul hansı qrup antibiotiklərə aiddir?



- A) tetratsiklinin yarımsintetik qrup antibiotiklərinə
 B) sefalosporin qrup antibiotiklərinə
 C) makrolid antibiotiklərə
 D) penisillinlərə
 E) təbii tetratsiklinlərə
4. Bu hansı maddənin quruluşudur?



- A) 7 amino sefalosporan turşusu
 B) 7 amino pensilin turşusu
 C) 6 - aminopensillin turşusu
 D) levomisetin
 E) streptomisin

5. Oksitetrasiklin tetrasiklindən nə ilə fərqlənir?

- A) 5 - vəziyyətdə OH qrupunun olması ilə
 B) amin qrupunun olması ilə
 C) aldehyd qrupunun olması ilə
 D) 2 π rabitənin olması ilə
 E) keto qrupunun olması ilə

6. Levomisetin hansı izomerləri toksiki olduğu üçün tibbdə tətbiq olunmur ?

- I - D(-) eritro
 II - D(-) treo
 III - L(+) eritro
 IV - L(+) treo
- A) I, III
 B) II, IV

- C) I, II
- D) II, III
- E) I, IV

7. Yarımsintetik tetratsiklinləri göstərin.

- 1- ampisillin
- 2- morfotsiklin
- 3-oksasiklin
- 4- metatsiklin
- 5- doksitsiklin

- A) 2, 4, 5
- B) 1, 3
- C) 1, 3, 4
- D) 3, 5
- E) 2, 5

8. Yarımsintetik pensillinləri göstərin:

- 1- ampisillin
- 2-benzilpensillin
- 3-oksasillin
- 4-fenoksimetilpensillin
- 5-metisiklin

- A) 1, 3, 5
- B) 1, 3
- C) 2, 3, 4
- D) 2, 3, 5
- E) 2, 5

9. Təbii pensillinləri göstərin.

- 1- ampisillin
- 2-benzilpensillin
- 3-oksasillin
- 4-fenoksimetilpensillin
- 5-metisillin

- A) 2, 4
- B) 1, 3
- C) 2, 3
- D) 3, 5
- E) 2, 5

10. Pensillin quruluşunun əsasını hansı maddələr təşkil edir?

- 1-5 üzvlü pirozolidin

2-5 üzvlü tiozolidin

3-4 üzvlü β – laktam həlqəsi

4-4 üzvlü α – laktam həlqəsi

A) 2, 3

B) 1, 4

C) 1, 2

D) 2, 4

E) 1, 3

11. Dərman maddələri kimi ətbiq edilən alitsiklik quruluşlu antibiotiklər, aromatik sıra antibiotiklər, heterotsiklik antibiotiklər və qlükozid antibiotikləri ardıcıl olaraq göstərin.

1- Pensillin

2-Tetratsiklin

3-Levomisetin

4-Streptomisin

A) 3, 1, 2, 4

B) 1, 2, 3, 4

C) 4, 3, 2, 1

D) 1, 3, 2, 4

E) 3, 2, 1, 4

12. Verilmiş antibiotiklərə uyğun olan düzgün mulahizələri göstərin.

I- Tetratsiklin

II- Levomisetin

III- Pensillin

a- Heterotsiklik antibiotiklərə aiddir. Quruluşunun əsasını 5 – üzvlü tiozolidin və 4 – üzvlü β – laktam həlqəsi təşkil edir

b- Aromatik sıra antibiotiklərə aiddir. 2 assimetrik C atomuna malik olub 4 stereoizomeri vardır

c- Alitsiklik quruluşlu antibiotiklərə aiddir. Quruluşunun əsasını qismən hidrogenləşmiş tetrasen təşkil edir

A) I – c; II – b; III - a

B) I – a; II – c; III - b

C) I – b; II – c; III - a

D) I – c; II – a; III - b

E) I – a; II – b; III – c

13. Düzgün uyğunluğu göstərin.

I- Təbii pensillin

II- Yarımsintetik pensillinlər

- 1- metisillin
 - 2- benzilpensillin
 - 3- ampisillin
 - 4- fenoksimetilpensillin
 - 5- oksasillin
- A) I – 2, 4; II – 1, 3, 5
 - B) I – 1, 3, 5; II – 2, 4
 - C) I – 1, 3, 4; II – 2, 5
 - D) I – 3, 4; II – 1, 2, 5
 - E) I – 1, 5; II – 2, 3, 4

14. Aşağıda verilmiş tetratsiklinləri uyğun olaraq seçin.

I - Yarımsintetik tetratsiklinlər

II - Sintetik tetratsiklinlər

- 1- metatsiklin
 - 2- morfotsiklin
 - 3- biomisin
 - 4- doksitsiklin
- A) I – 1, 2, 4; II – 3
 - B) I – 2, 3, 4; II – 1
 - C) I – 1, 3, 4; II – 2
 - D) I – 1, 4; II – 2, 3
 - E) I – 1, 3; II – 2, 4

15. Levomisetinin izomerləri ilə onların bioloji fəallığı arasında əlaqəni müəyyən edin.

I - D(-) eritro

II - D(-) treo

III - L(+) eritro

IV - L(+) treo

- 1-antibakterial
 - 2-toksiki
 - 3-bioloji qeyri fəal
 - 4-analgetik
- A) I-2, II-1, III-2, IV-3
 - B) I-3, II-2, III-4, IV-1
 - C) I-4, II-3, III-2, IV-1
 - D) I-2, II-1, III-3, IV-4
 - E) I-1, II-4, III-1, IV-2

Mövzu: ALKANLARIN HALOGENLİ TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi № 1

Tədqiq edilən dərman maddələri:

Xloroform, yodoform, ftorotan.

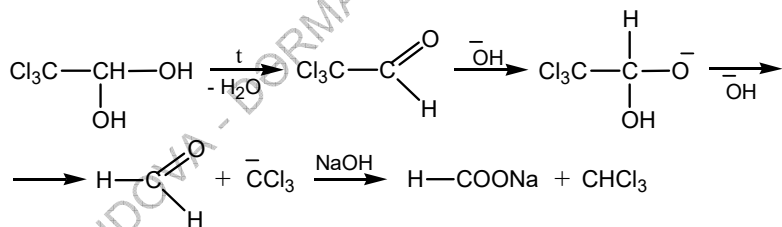
Mövzunun aktuallığı:

Bu qrup dərman maddələri əsasən narkoz üçün (Etilxlorid, xloroform, ftorotan) və ya antiseptik kimi (yodoform) tətbiq edilir.

1. Xloralhidratdan xloroformun alınması.

Materiallar:

Xloralhidrat, 10%-li natrium-hidroksid məhlulu.

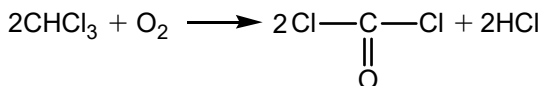


Sınaq şüşəsinə 1 q kristallik xloralhidrat tökülür və üzərinə 2-3 ml 10%-li natrium hidroksid məhlulu əlavə edilir. Sınaq şüşəsinin ağzına əyri qazaparan boru ilə təchiz edilmiş tıxac keçirilir. Qazaparan borunun ucu xaricdən buz ilə soyudulan sınaq şüşəsinə salınır və qarışıq ehtiyatla qızdırılır. Alınan xloroform qovulur (qaynama temperaturu +62 °C) və boş sınaq şüşəsinə yığılır. Xloroform şirintəhər iyli mayedir.

b) Xloroformun rəngli reaksiyası.

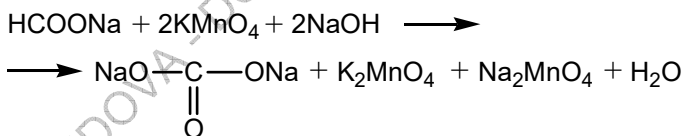
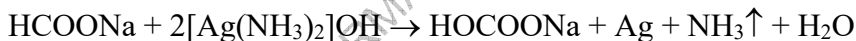
Materiallar:

1%-li rezorsin məhlulu, 1%-li natrium-hidroksid məhlulu, xloroform.



İcərisində 3 ml xloroform olan sınaq şüşəsinə 3 ml 1%-li rezorsin məhlulu, 6 ml 1%-li natrium-hidroksid məhlulu əlavə edilərək qızdırılır. Məhlul sarı-qırmızı rəngə boyanır. Məhlul iki hissəyə bölünür. Bir hissəsinin üzərinə gümüş-nitrat məhlulu əlavə edilir. Məhlulun bulanması xlorid ionunun varlığını göstərir.

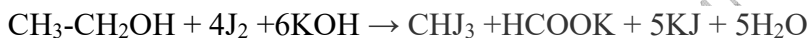
c) Qarışqa turşusunun təyin edilməsi.



Əvvəlki reaksiyadan qalan hidroliz məhlulu bərabər miqdarda olmaqla iki sınaq şüşəsinə tökülür. Bu sınaq şüşələrindən birinə təzəcə hazırlanmış gümüş-hidroksidin ammoniyakda məhlulu, o birinə isə bir neçə damcı 1%-li kalium-permanqanat məhlulu əlavə edilir. Birinci sınaq şüşəsində gümüş çökür (gümüş güzgü reaksiyası), ikincisində isə məhlul yaşıl rəng alır, qələvi mühitdə KMnO_4 reduksiya olunaraq K_2MnO_4 -ə çevrilir ki, müvafiq turşunun da anionları yaşıl rənglidir.

2. Etil spirtindən yodoformun alınması

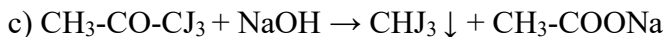
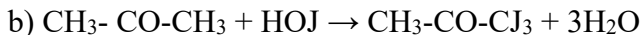
Lazım olan reaktivlər və qablar: 1-2 ml etil spirti, 4q J₂ və 10 q KJ-un 100 ml suda məhlulu, qatı NaOH və ya KOH məhlulu, sınaq şüşələri, ağac ştativ, stəkan, üçayaq. Reaksiya aşağıdakı sxem üzrə gedir:



İşin icrası: Sınaq şüşəsinə 1-2 ml spirt töküüb üzərinə 2-4 ml su əlavə edərək içərisində su olan stəkanda sacayağı üstündəki asbestli tor üzərində 60⁰-yə qədər qızdırılır və içərisinə 8-10 ml yod məhlulu əlavə edilir. Yodun rəngi yox olanadək damcı-damcı qələvi məhlulu əlavə edilib çalxalanır. Bunun nəticəsində yodoformun sarı rəngli kristalları cökür. Yodoformun iyi (xəstəxana iyinə oxşar) hiss edilir.

3. Asetondan yodoformun alınması

Sınaq şüşəsinə 3-4 ml aseton məhlulu töküüb, üzərinə yodun KJ-də məhlulundan 2-3 ml əlavə edilir. Məhlulun rəngi şəffaflaşana kimi üzərinə NaOH məhlulu əlavə edilib, aralıq qarışdırılır. Bu zaman xüsusi iyə malik olan sarı rəngli yodoformun kiçik kristalları əmələ gəlir. Asetonun yodoforma çevrilməsi aşağıdakı reaksiyalar üzrə gedir:



Mövzu: ALKANOLLARIN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

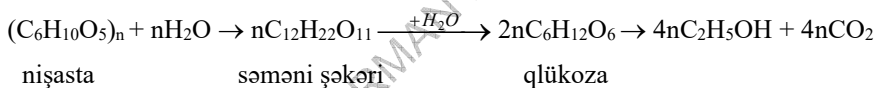
Laboratoriya işi № 2

Tədqiq edilən dərman maddələri: Alkanollar; etanol, qliserin

Mövzunun aktuallığı:

Bu qrup dərman maddələri müxtəlif tibbi məqsədlər üçün: həll edici və ekstragent (etil spirti), antiseptik maddə (tibbi spirt), yumşaldıcı kimi mazların və məlhəmlərin əsas tərkib hissəsi olaraq (qliserin) və digər dərman maddələri.

1. Tərkibində nişasta olan bitki xammalından etil spirtinin alınması



Kartofun əsas tərkib hissəsi nişastadır. Kartofda 20%-ə qədər nişasta vardır. Kartofdan spirtin alınması nişastanın bir neçə kimyəvi çevrilmələrə uğraması ilə əlaqədardır. Kartof horrasına səmənı qatılır. Səmənidə olan diastaz fermenti nişastanı səməni şəkərinə (maltozaya) çevirir.

Səmənidən sonra qarışığa maya qatılır. Mayada iki növ ferment vardır. Bunlardan biri maltaza fermentidir ki, səməni şəkərini (maltozanı) qlükozaya parçalayır. İkinci ferment isə zimaza adlanır; bu qlükozanı qıcqırdıb spirt və karbon qazına parçalayır. Bu çevrilmələr yuxarıda reaksiyada göstərilmişdir. Biz çevrilmələri sadə şəkildə göstərmişik, həqiqətdə isə çevrilmələr daha mürəkkəb şəkildə gedir.

Lazim olan reaktivlər, qablar və cihazlar: Bişmiş kartof-100q, göy səməni-20 q, J_2 və KJ, əhəng suyu və ya barium-hidroksid məhlulu- 50 ml, qidalı məhlul (kalium-nitrat 5q + maqnezium-xlorid 2,5 q + kalsium-nitrat 2,5 q + kalium-hidrofosfat 2,5 q) – 250 ml, tutumu 1 l olan stəkan və ya kolba; həvəng, soyuducu və ya uzun şüşə boru, defleqmatör, allonj, termometr, Tişşenko şüşəsi, su hamamı, pivə mayası- 15 qr, su – 250 ml, termostat və ya quruducu şkaf, kalsium-xlorid borusu, rezin və şüşə borular.

İşin icrası. 100 q bişmiş kartof əzilir stəkan və ya kolbaya yerləşdirilir, üzərinə 250 ml su və 20 q həvəngdə əzilmiş səməni əlavə edilir, qarışdırılır, 60-65°C temperaturda 1 saat müddətində qızdırılır. Bu zaman nişasta fermentativ hidrolizə məruz qalır və disaxaridə (səməni şəkərinə) çevrilir. Nişastanın tamamilə hidroliz etməsini yoxlamaq üçün həmin qarışıqdan az miqdar götürüb sınaq şüşəsinə töküüb üzərinə yodun kalium yodiddə məhlulu əlavə edilir. Əgər qarışıqda nişasta qalarsa, yod ilə göy-bənövşəyi rəng məhlul əmələ gətirəcək. Bu zaman qızdırılma daha 20-25 dəqiqə davam etdirilir. Nişasta tamamilə hidrolizə uğradıldıqdan sonra qarışıq 1l-lik stəkana boşaldılır, üzərinə az miqdar suda əzilmiş 15q maya əlavə edilir və qarışdırılaraq quruducu şkafda və ya termostatda 30-35°C temperaturda 3-4 gün saxlanılır. Qıcqırma prosesi əvvəlcə yavaş, daha sonra şiddətlə gedir, qarışıq köpüklənir, karbon qazı ayrılır. Karbon qazının ayrılması qurtardıqdan sonra kolba defleqmatör və soyuducuya birləşdirilib distillə edilir.

Bu zaman etil spirti və su qarışığı distillə edilib qəbulediciyə yığılır. Etil spirtinin varlığı onun yanması, yodoform reaksiyası və oksidləşərək sirkə aldehidinə çevrilməsi ilə müəyyən edilir.

Bunun üçün 200ml-lik kolbaya distillatdan bir qədər əlavə edilir və kolbanın ağzına bırıq ucu sivri olan şüşə boru keçirilmiş

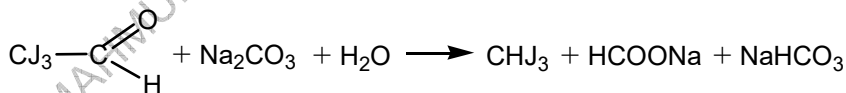
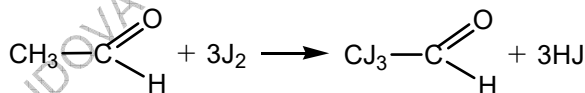
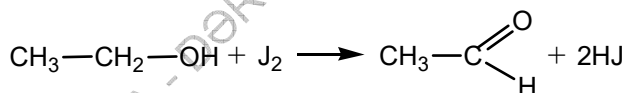
tıxac taxılır, şüşə borunun sivri ucu tıxacdan yuxarıda qalmalıdır. Kolba asbestli tor üzərində qızdırılır və şüşə borudan çıxan buxar yandırılır. Bununla da distillatda etil spirtinin varlığı müəyyən edilir.

Bu üsulla etil spirtini tərkibində nişasta olan istənilən bitki xammalından (düyü, qarğıdalı, arpa, buğda, çovdar və s.) almaq mümkündür.

2. Yodoform sınağı

Ləvazimat: etil spirti, kristallik yod, kristallik soda

Sınaq şüşəsinə 2 q kristallik soda, 10 ml su və 2 ml etil spirti tökülərək su hamamında 60 °C-yə qədər qızdırılır, üzərinə qarışdırmaqla 2 q yod əlavə edilir. Məhlul sarı rəngə boyanır və tədricən rəngsizləşir. Məhlul 4-5 saat sakit buraxılır. Bir qədər sonra sarımtıl çöküntü alınır.



Mövzu: SADƏ VƏ MÜRƏKKƏB EFİRLƏRİN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi № 3

Efirlər: dietil efiri (tibbi efir, narkoz üçün efir), nitroqliserin, dimedrol.

Mövzunun aktuallığı:

Bu qrup dərman maddələri müxtəlif tibbi məqsədlər üçün: narkoz üçün (tibbi efir), həll edici və ekstragent (tibbi efir), nitroqliserin (spazmolitik), dimedrol (antihistamin) və digər dərman maddələri kimi istifadə edilir.

1.Nitroqliserinin həqiqiliyinin təyini reaksiyaları

a) Oksidləşmə reaksiyası: 10 ml 1%-li nitroqliserinin spirt məhlulu 1 ml NaOH ilə qarışdırılaraq su hamamında spirt tam yox olanadək buxarlandırılır. Qalıq 1,5 q xırdalan-mış KHSO_4 ilə qarışdırılır və köpüklənmə və kömürləşmə başlayana qədər qızdırılır. Bu zaman akroleyinin xarakterik iyi hiss olunur.

b) Nitrat ionunun təyini reaksiyası: Bir neçə damcı nitroqliserin məhlulunun üzə-rinə bir qədər difenil - amin məhlulu əlavə edilir. Bu zaman göy rəng müşahidə olunur.

2.Dimedrolun təyini reaksiyası

0,01 q dimedrol dərman maddəsi saat şüşəsi üzərinə yerləşdirilir və üzərinə 2-3 damla qatı sulfat turşusu əlavə edilir. Bu zaman sarı rəng alınır ki, bu da 2-3 damla su əlavə edildikdə itir.

Mövzu: ALDEHİDLƏRİN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi №4

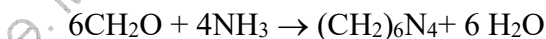
1.Urotropinin (heksametilentetraamin) alınması

Lazım olan reaktivlər və qablar: formalin 8-10 ml, ammonium-hidroksid 10 ml, çini kasa, stəkan, şüşə çubuq, tərəzi və daşları, asbestli tor, sacayağı.

İşin icrası.

A. Çini kasanın çəkisi təyin edilib içərisinə formalin tökülür və yenidən çəkilərək formalinin miqdarı müəyyən edilir. Sonra daima şüşə çubuqla qarışdırmaqla üzərinə, formalinin iyi yox olana kimi, ammonium-hidroksid əlavə edilir. İçərisində qarışıq olan çini kasa asbetli tor üzərində, qarışığın həcmi yarı olana qədər qızdırılır. Sonra stəkənə yarısına qədər su tökülür və ağzına həmin çini kasa qoyularaq asbestli tor üzərində, su tamamilə buxarlaşana qədər qızdırılır. Su tamamilə buxarlaşdıqdan sonra qızdırma dayandırılır, çini kasa soyudulur və içindəki ağ kütlə (kristallar) ilə birlikdə çəkilərək alınan urotropinin miqdarı və buna əsasən formalinin faizi hesablanır.

Formaldehid itkisiz olaraq urotropinə çevrilir:



2.Formaldehidin həqiqiliyinin təyini reaksiyaları

a) Gümüş-güzgü reaksiyası: 1 ml 0,1 M AgNO_3 məhlulunun üzərinə 5-6 damcı ammoniyak məhlulu əlavə edilir və sonra 3 damcı formaldehid məhlulu əlavə edilir, su hamamında $50-60^\circ\text{C}$ -də qızdırılır. Bu zaman sınaq şüşəsinin divarlarında güzgüyə bən-zər

və yaxud boz çöküntü şəklində metallik gümüş ayrılır.

b) Aurin sınağı: 5 ml qatı H_2SO_4 üzərinə 0,01-0,02 q salisil turşusu, 2-3 damcı formaldehid məhlulu əlavə edilir və su hamamında 1 dəq qızdırılır. Bu zaman qırmızı rəng müşahidə edilir.

3.Heksametilentetraaminin (urotropin) həqiqiliyinin təyini reaksiyaları

a)Hidroliz reaksiyası: 2ml urotropin məhlulu (1/10) durulaşdırılmış H_2SO_4 əlavə edilir. Bu zaman formaldehidin xarakterik iyi hiss olunur. Sonra isə 2 ml 30% NaOH əlavə edilir və qızdırılır. Bu zaman ammoniyakın iyi hiss olunur.

b)Aurin sınağı: 2-3 damla urotropin məhlulu (1/10) üzərinə 0,01q salisil turşusu və ya natrium salisilat və 2-3 damla qatı H_2SO_4 əlavə edilir. Bu zaman çəhrayı rəng müşahidə edilir.

4.Xloralhidratın təyini reaksiyası

0.5ml 10%-li xloralhidrat məhlulu üzərinə 1 ml NaOH əlavə edib, qarışdırılır. Bu zaman xloroform ayrılır bu da onun özünəməxsus iyi ilə müşahidə olunur. Sonra bunun üzərinə bir neçə xırda rezorsin kristalları əlavə edilib. Qızdırılır. Bu zaman məhlul çəhrayı rəngə boyanır.

Mövzu: KARBON TURŞULARI VƏ ONLARIN TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi №5

Dərman təsirli karbon turşularının duzları: kalium asetat, kalsium laktat, kalsium qlükanat, natrium sitrat

Mövzunun aktuallığı:

Göstərilən qrup dərman maddələri tibbi praktikada geniş istifadə edilir: kalium asetat- “K” ionlarının mənbəyi və diuretik vasitə kimi, kalsium laktat və kalsium qlükanat- “Ca” ionlarının mənbəyi və anti alergen maddə kimi istifadə edilir. Karbon turşuları və onların duzları üçün bir sıra ağır metalların duzları ilə vəsfi reaksiyalar xarakterikdir ki, bu reaksiyalar nəticəsində kompleks birləşmələrin rəngli çöküntüləri və ya məhlulları alınır.

1.Dəmir (III) xloridlə reaksiya:

2 ml kalium asetat (1:10) məhlulu üzərinə 0,5ml FeCl_3 məhlulu əlavə edilir. Bu zaman qırmızı qonur rəng alınır. 5ml kalsium qlükanat (1:50) məhlulu üzərinə 2 damla FeCl_3 məhlulu əlavə edilir. Bu zaman açıq yaşıl rəng müşahidə olunur.

Mürəkkəb efirlərin alınması reaksiyası

2.Kalium asetatın həqiqiliyinin təyini reaksiyası:

2 ml kalium asetat (1:10) məhlulu 2 ml qatı sulfat turşusu və 0,5 ml 95%-li etil spirti ilə qarışdırılaraq qızdırılır. Bu zaman etil-asetatın özünəməxsus iyi müşahidə olunur.

3.Kalium laktatın təyini reaksiyası

a) Laktat anionunun təyini

0,25 q preparat 5 ml suda həll olunur. 10%-li sulfat turşusu ilə turşulaşdırılır, qırmızı-bənövşəyi rəng alınanadək kaliumpermanqanat məhlulu əlavə edilib, qızdırılır. Bu zaman asetaldehidin

xarakterik iyi hiss olunur.

b) Kalsium ionunun təyini

1 ml preparat məhlulunun üzərinə ammonium oksalat əlavə edilir. Bu zaman sirkə turşusunda həll olmayan duru mineral turşularda həll olan ağ çöküntü əmələ gəlir.

4.Natrium sitratın təyini reaksiyası

c) Sitrat anionunun təyini

0,25 q natrium sitrat 3 ml suda həll edilir. Üzərinə 1 ml CaCl_2 məhlulu əlavə edilir. Bu zaman otaq temperaturunda həll olan kalsium sitrat əmələ gəlirki bu da qızdırıldıqda çökür. Alınmış çöküntü xlorid turşusunda həll olur. “Na” ionu isə natrium ionu üçün xarakterik reaksiyalarla təyin edilir.

5.Kalsium qlükanatın təyini

0,05 q dərman preparatının üzərinə duru sulfat turşusu əlavə edilir və qaynayanadək qızdırılır. Sonra soyudulur və üzərinə 3-5 damla ammonium oksalat əlavə edilir. Bu zaman NH_4OH məhlulunda həll olmayan lakin duru mineral turşularda həll olan çöküntü əmələ gəlir.

Mövzu: AMİN TURŞULAR VƏ ONLARIN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi №6

Mövzunun aktuallığı:

Dərman təsirli amin turşular tibbi praktikada bir komponentli və çox komponentli dərman maddələri kimi geniş tətbiq edilir. Tədqiq edilən dərman maddələri müxtəlif fizioloji təsir göstərir: Məsələn, nootrop, psixotrop (qammaamino yağ turşusu, qlutamin turşusu, pirasetam), hemostatik (aminokapron turşusu), mukolitik (asetilsistein). Metionin qaraciyərin toksiki zədələnməsi və profilaktikası zamanı, sistein kataraktanın müalicəsində tətbiq edilir.

Amin turşular: Qlutamin turşusu, aminokapron turşusu, sistein, asetilsistein, metionin, pirasetam (nootropil).

İşin məqsədi:

Amin turşu və onların törəmələrini saxlayan dərman maddələrinin keyfiyyətinin və həqiqiliyinin təyini.

1.Ninhidrinlə reaksiya. (ümumi qrup reaksiyası). Qeyd edək ki, ninhidrin reaksiyası amin turşuları üçün xarakterik keyfiyyət reaksiyasıdır. Birli alifatik aminlər ninhidrinlə qızdırıldıqda aldehidlərə qədər oksidləşir. Birinci mərhələdə ninhidrin diketooksihidridənə reduksiya olunur. Ayrılan ammoniyak ninhidrin və onun reduksiya olunmuş forması ilə kondensləşərək göy-bənövşəyi boyaq verir (Rüman bənövşəyisi).

İşin gedişi:

0,02q qlutamin və yaxud aminokapron turşusu 1 ml suda həll edilir. 5-6 damla ninhidrin məhlulu əlavə edilir və qaynayana qədər

qızdırılır və bu zaman göy-bənövşəyi rəngli boyaq alınır.

2.Qlutamin turşusunun həqiqiliyinin təyini.

Qlutamin və rezorsin kristalları sınaq şüşəsində yerləşdirilir və qızdırılır. Üzərinə 5 damla qatı sulfat turşusu əlavə edilir. Bu zaman yaşıl-qəhvəyi rəng alınır. Soyutduqdan sonra üzərinə 5ml su və ammoniyak məhlulu əlavə edilir. Bu zaman yaşıl flüorossensiya edən qırmızı-bənövşəyi rəng alınır.

3.Metioninin təyini reaksiyası.

Azacıq metioninin kristalının üzərinə 3-4 damla su və 1 damla 10%-li natrium asetat məhlulu və 2 damla 2,5%-li mis asetat əlavə edilir. Bu zaman açıq bənövşəyi göy rəngli çöküntü əmələ gəlir.

2.Sınaq şüşəsində 3-4 damla 30%-li NaOH məhlulu 1-2 dəq. 0,001q metioninlə qızdırılır. Soyutduqdan sonra alınmış qarışıqdan 1 damla 5% nitropurid məhlulu ilə isladılmış süzgəc kağızının üzərinə yerləşdirilir. Bu zaman moruğu-qırmızı rəng alınır.

4.Sisteinin həqiqiliyinin təyini.

1)0,005q preparat 1ml suda həll edilir və üzərinə 1-2 damla FeCl_3 məhlulu əlavə edilir.Bu zaman tez itən göy bənövşəyi rəng alınır.

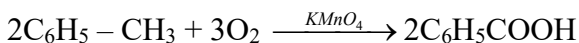
2)0,5-1ml sistein məhlulu üzərinə 2-3 damla NaOH və 1-2 damla 1%-li natrium nitoprussid məhlulu əlavə edilir. Bu zaman qırmızı-bənövşəyi rəng alınır.

Mövzu: AROMATİK TURŞULAR VƏ ONLARIN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi № 7

1. Benzoy turşusunun alınması

Toluolun oksidləşməsindən benzoy turşusunun alınması:



Lazım olan reaktivlər, qablar və cihazlar: toluol- 4 ml, kalium-permanqanatın 5%-li məhlulu – 250 ml, sulfat turşusu – 6 ml, damcı qfı, su hamamı, çini kasa, hava eks soyuducusu, Libix soyuducusu, süzgəc kağızı, qfı, ikideşikli tıxac, yumrudub kolba – 300 ml-lik, ikiboğazlı allonj, metal ştativ.

İşin icrası: İçərisinə toluol və kalium-permanqanat məhlulu tökülmüş kolba su hamamına salınıb metal ştativə bərkidilir, kolbanın ağzına ikibogazlı allonj taxılır. Allonjun bir borusuna soyuducu, digərinə isə damcı qfı keçirilir, kolbadakı qarışıq üzərinə damcı qfından sulfat turşusu əlavə edilib məhlul rəngsizləşənə qədər qaynar su hamamında qızdırılır. Məhlul rəngsizləşdikdən sonra əkssoyuducu Libix soyuducusu ilə əvəz edilib reaksiyaya girməyən toluol disstillə edilir, məhlul isladılmış süzgəc kağızından süzülüb, filtrat soyudulur. Bu zaman benzoy turşusu duzunun kristalları çökəcəkdir. Süzməklə kristallar ayrılıb bir neçə dəfə soyuq su ilə yuyulur (suzgəcdə) və suzgəc kağızı arasında qurudulur, 5 q-a qədər məhlul alınmalıdır. Təmiz benzoy turşusu 120-121⁰-də əriyir.

Eyni qayda ilə orto-kisilolu oksidləşdirib orto-ftal turşusunu

almaq olar.

Benzoy turşusunun süblimasiyası (Qış bağı)

Tutumu 200 ml olan stəkana 2-3 q benzoy turşusu tökülüb içərisinə saman çöpləri atılır. Stəkanın ağzı saat şüşəsi ilə örtülüb alov üzərində qızdırılır. Bir neçə dəqiqədən sonra saman çöpləri benzoy turşusunun iynəvari kristalları ilə bürünmüş (örtülmüş) olur ki, bu da qışda bağdakı ağacların budaqlarının qarla örtülməsini xatırladır, ona görə də buna qış bağı deyirlər.

Mövzu: BEŞÜZVLÜ BİR VƏ İKİ HETEREATOMLU HETEROTSİKLİK BİRLƏŞMƏLƏR VƏ ONLARIN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi № 8

1. 5-Nitrofuran sırası dərman maddələrinin törəmələrinin NaOH-la müxtəlif şəraitdə qarşılıqlı təsiri

1) 0.01 q furasilin 5 ml 10%-li NaOH və 5 ml su qarışığında həll edilir. Bu zaman narıncı- qırmızı rəng əmələ gəlir. Alınmış məhlul qızdırıldıqda NH_3 - un ayrılması müşahidə edilir.

2) 0.01 q furadonin 5 ml 30%-li NaOH və 5 ml su qarışığında həll edilir. Bu zaman tünd qırmızı rəng müşahidə edilir.

2. 5-Nitrofuran törəmələrinin ağır metal ionları ilə kompleks və duz əmələ gətirməsi reaksiyaları

0.04 q dərman maddəsi 8 ml 0.15 M NaOH məhlulunda həll edilir. Alınmış məhlul 3 sınaq şüşəsinə bölünərək tökülür. 1-ci sınaq şüşəsinə 2-3 damla CuSO_4 , 2-ci sınaq şüşəsinə $\text{Co}(\text{NO}_3)_2$, 3-cüyə isə FeCl_3 məhlulu əlavə edilir. Alınmış məhlulun rəngi müəyyən edilir.

3. 5-Nitrofuran törəmələrinin qələvilərin spirtdə məhlulu ilə təyini

0.01 q dərman maddəsi 3 ml asetonunda və yaxud dimetilformaamid məhlulunda həll edilir. Bu zaman sarı rəng müşahidə edilir. 2 damla 1 M KOH 50 %-li spirtə məhlulu əlavə edildikdə rəngin tündləşməsi müşahidə edilir.

4. Antipirin və amidopirinin dəmir-3 xloridlə təyini reaksiyası

Sınaq şüşəsinə bir neçə antipirin kristalları yerləşdirilir. İki damla su və 1%-li dəmir-3 xlorid məhlulu əlavə edilir. Bu zaman intensiv və dayanıqlı narıncı-qırmızı rəng alınır ki, bu da dayandıqdan sonra itir. Müqayisə üçün digər proberkaya bir neçə amidopirin kristalları yerləşdirilir və üzərinə 2 damla su, 1 damla dəmir-3 xlorid məhlulu əlavə edilir. Bu zaman tez itən bənövşəyi rəng alınır. Sınaq şüşəsinə yenidən 3 damla dəmir-3 xlorid əlavə edilir. Rəng yenidən əmələ gəlir. Bir qədər çox qahr və tədricən itir. Antipirin dəmir-3 xlorid ilə rəng verməsi ferropirinin kompleks birləşməsinin əmələ gəlməsi ilə izah edilir. Amidopirinin isə oksidləşmə məhsullarının əmələ gəlməsi ilə izah edilir. Dəmir-3 xlorid ilə reaksiya amidopirin və antipirini bir-birindən fərqləndirən keyfiyyət reaksiyasıdır.

1. Antipirinin dəmir-3 xlorid ilə rəng vermə səbəbini izah edin.
2. Amidopirinin dəmir-3 xlorid ilə rəng vermə reaksiyasını izah edin.

5. Antipirin və amidopirinin nitrit turşusu ilə reaksiyası.

Sınaq şüşəsinə bir neçə antipirin kristalları yerləşdirilir. Üzərinə 2 damla su, 1 damla 10%-li sulfat turşusu və 1 damla 5%-li natrium nitrit məhlulu əlavə edilir. Bu zaman zümrüdü yaşıllıq alınır ki, bu da tədricən xüsusilə də natrium nitridin artıqlığı nəticəsində itir. Müqayisə üçün digər sınaq şüşəsində bir neçə amidopirin kristalları yerləşdirilir. Üzərinə 1 damla 10%-li sulfat turşusu və 1 damla 5%-li natrium nitrit məhlulu əlavə edilir. Bu

zaman tez itən dayanıqsız bənövşəyi rəng alınır. Əgər rəng tez itərsə, üzərinə bir qədər də amidopirin əlavə edilir və amidopirinlə rəngli oksidləşmə məhsulları əmələ gəlir. Dəmir-3 xlorid ilə olduğu kimi nitrit turşusu ilə reaksiya əczaçılıqda antipirin və amidopirini təyin etmək və onları bir-birindən fərqləndirmək üçün istifadə edilir.

1. Antipirinin nitrit turşusu ilə reaksiyasının sxemini yazın.
2. Amidopirinin nitrit turşusu ilə reaksiyası hansı mexanizm ilə gedir?

Ə. MAHMUDOVA - DƏRMAN MADDƏLƏRİNİN KİMYASI

Mövzu: ALTIÜZVLÜ BİR VƏ İKİ HETEREATOMLU HETEROTSIKLİK BİRLƏŞMƏLƏR VƏ ONLARIN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ

Laboratoriya işi № 9

1.Piridin qrupu dərman maddələrinin həqiqiliyini xarakterizə edən reaksiyalar

a) Piridin həlqəsinin təyini reaksiyası (Tsinker reaksiyası) :

Reaksiyanı 2,6- vəziyyətdə sərbəst piridin törəmələri olan dərman maddələri ilə də aparmaq olar (nikotin turşusu, nikotin amin, kordiamin).

İşin gedişi: 0,01-0,05 q dərman preparatının üzərinə 0,05 q 2,4-dinitroxlörbenzol və 3 ml 95%-li spirt əlavə edib , 2-3 dəq qaynadılır. Soyuduqdan sonar 2 damla Na qələvisi məhlulu əlavə edilir. Bu zaman tədricən qırmızı - kərpici rəngə keçən qonur qırmızı rəng alınır.

b) Polimetin boyasının alınması:

1 ml dərman preparatı (1:200) üzərinə 1 damla 5 %-li ammonium rodanid, 8 damla 5%-li xloramin – B məhlulu və 5 ml 2%-li anilin əlavə edilib qarışdırılır. Bu zaman narıncı rəng əmələ gəlir.

c) Kompleks əmələgəlmə və oksidləşmə reaksiyaları:

0,1 q dərman maddəsi 5 ml suda həll edilir, 4-5 damla CuSO_4 məhlulu əlavə edilir. Bu zaman mavi çöküntü alınır, qarışdırdıqda məhlul da mavi rəngə boyanır. Qızdırıldıq-da məhlul və çöküntü açıq yaşıl rəngə çevrilir. Bu zaman qaz qabarcıqları ayrılır.

2.Nikotin turşusunun dietilamidi (kordiamin)

1. Hidrolitik parçalanma.

İşin gedişi:

2-3 damla dərman maddəsi 3 ml Na qələvisi ilə qızdırılır. Bu zaman dietilamin ayrılır. Bu da xarakterik kəskin iyinə görə müşahidə olunur.

2.İkqiət və üçqat kompleks birləşmələrin əmələ gəlməsi.

İşin gedişi:

5 ml 10 %-li dərman məhlulu üzərinə 5 ml mis-sulfat məhlulu əlavə edilir. Bu zaman göy rəng müşahidə edilir. 3 ml ammonium-rodanid.məhlulu əlavə etdikdən sonra parlaq yaşıl rəngli çöküntü əmələ gəlir.

3.Piridin həlqəsinin təyini reaksiyası (Tsinke rreaksiyası).

İşin gedişi:

2-3 damla dərman preparatı 0,05 q və 2,4-dinitrotrixlorbenzol 3 ml 95 %-li spirtə həll edilib 1 dəq müddətində qaynadılır. Bu zaman məhlul sarı rəngə boyanır. Məhlulu soyutduqdan sonra 1 damla qatı Na qələvisiəlavə edilir. Bu zaman bənövşəyi rəng alınır ki, qələvinin sonrakı əlavəsindən sonra qonur-qırmızı rəngə keçir. Reaksiya məhsulunun rəngini izoniazid və fiitivozidlə aparılan analoji reaksiyanın məhsulunun rəngi ilə müqayisə etməli.

2. Nikotin turşusunun həqiqiliyinin təyini

1. Piroliz reaksiyası nəticəsində piridinin alınması.

İşin gedişi:

0,1 q dərman maddəsi 0,1 q susuz Na_2CO_3 ilə qızdırılır. Bu zaman piridinin xarakterik iyi hiss olunur.

2. Turşuluq xassəsinə görə ağır metal duzları ilə kompleks əmələ gətirməsi.

İşin gedişi:

3 ml isti dərman məhlulunun (1:100) üzərinə 1 ml mis-sulfat məhlulu əlavə edilir. Bu zaman göy çöküntünün əmələ gəlməsi müşahidə edilir.

3.Üçqat kompleks birləşmənin əmələ gəlməsi.

İşin gedişi:

10 ml isti dərman məhlulunun üzərinə (1:100) 0,5 ml mis-sulfat və 2 ml ammonium-rodanid məhlulu əlavə edilir. Bu zaman yaşıl rəng əmələ gəlir.

Laboratoriya işi № 10

1. Ftivazidin təyini reaksiyaları

a) Piridin həlqəsinin təyini raksiyası (Tsinke reaksiyası) :

Reaksiya məhsulunun rənginə diqqət yetirməli və izoniazidlə müqayisə etməli.

İşin gedişi: 0,01-0,05 q dərman preparatının üzərinə 0,05 q 2,4-dinitroxlörbenzol və 3 ml 95%-li spirt əlavə edib, 2-3 dəq qaynadılır. Soyudulduqdan sonar 2 damla Na qələvisi məhlulu əlavə edilir. Bu zaman sarı qonur rəng alınır ki, bud a saxladıqda intensivləşir.

b) Dərman preparatının amfoter xassəsini xarakterizə edən reaksiya:

0,05 q dərman maddəsi zəif qızdırılmaqla 10 ml 95 %-li spirtə həll edilir və soyudulur. 1 damla qatı qələvi məhlulu əlavə etdikdə məhlulun açıq sarı rəngi narıncı sarı rəngə keçir.

c) Vanilin qalığının təyini :

0,05 q dərman maddəsi 10 ml duru xlorid turşusunda həll edilir. Bu zaman vanilinin xarakterik iyi hiss olunur.

d) Gümüş-güzgü reaksiyası (Hidrozin qalığının oksidləşməsi) :

0,001 q dərman maddəsi 2 ml suda həll edilib, üzərinə gümüş nitratın ammoniyakda məhlulundan 1ml əlavə edilir. Bu zaman sarı çöküntü alınır. Su hamamında qızdır-dıqda sınaq şüşəsinin divarlarında gümüş güzgü alınır.

2. Piridoksin hidroxlorid

1.İndofenol boyasının əmələ gəlməsi.

İşin gedişi:

0,01 q dərman maddəsi 10 ml suda həll edilir. Alınmış məhluldan 0,1 ml götürüb üzərinə 1 ml su və 2 ml ammonium bufer məhlulu 1 ml 2,6-dixlorxinon xloramid məhlulu və 2 ml butil spirti əlavə edilir. Bir dəqiqə ərzində qarışdırılır. Bu zaman mavi rəng əmələ alınır.

2.Rəngli fenolyatın alınması.

İşin gedişi:

1 ml həmin məhluldan götürüb üzərinə 2 damla dəmir-2 xlorid məhlulu əlavə edilir. Bu zaman duru sulfat turşusu əlavə etdikdə qırmızı rəng əmələ gəlir.

İSTİFADƏ OLUNMUŞ ƏDƏBİYYAT SİYAHISI

1. Məhərrəmov A.M., Allahverdiyev M.Ə., Qurbanova M.M. Dərman maddələrinin sintezi, Bakı, 2007
2. Солдатенков А.Т., Колядина Н.М., Щендрик И.В. Основы органической химии лекарственных веществ, М.: Химия, 2013, 192 стр.
3. Беликов В.Г. Фармацевтическая химия. В 2 ч: Учебн. пособие - М., 2007, 624 с.
4. Яхонтов Л.Н., Глушков Р.Г. Синтетические лекарственные вещества. Москва.: Медицина, 1983
5. Джилкрист Т. Химия гетероциклических соединений. М.: Мир, 1996, 464 с.
6. Беликов В.Г. Синтетические и природные лекарственные средства. Москва.: Высшая школа, 1993.
7. Евстигнеева Р.П. Тонкий органический синтез. М.: Химия, 1991, 184 с.
8. Граник В.Г. Лекарства. Фармакологический, биохимический и химический аспекты. М.: Вузовская книга, 2001.-408с
9. Лукевиц Э., Игнатович Л. Гетероциклы на мировом рынке лекарственных средств. Рига.: Ин-т орг. синтеза, 1992, 40 с.
10. Машковский М.Д., Лекарственные средства. Москва.: Новая волна, 2002. -Т. 1,2.
11. Граник В.Г. Основы медицинской химии. М.: Вузовская книга, 2001.-384 с.
12. Теддер Дж., Нехватал А., Джуб А. Промышленная органическая химия. М.: Мир, 1977, 700с.
13. Кнорре Д.Г., Мызина С.Д. Биологическая химия. М. : Высшая школа, 1998.
14. Тюкавкина Н.А., Бауков Ю.И. Биоорганическая химия. М. : Дрофа, 2008, 542 с.
15. Травень В.Ф. Органическая химия. М.: Академкнига; 2013 Т.1-368с, Т-520с., Т.3-392с.
16. Грандберг И.И. Органическая химия. М.: Дрофа, 2002

MÜNDƏRİCAT

	Səh.
Ön söz	4
Giriş	5
1.1 Dərman maddələrinin xammal mənbələri	11
1.2 Dərman maddələrinin metabolizmi	13
1.3 Dərman maddələrinin saxlanması zamanı baş verən fiziki-kimyəvi proseslər	15
1.4 Dərman maddələrinin sintezinin əsas problemi	19
1.5 Sintez edilmiş birləşmələrin quruluşu ilə onların orqanizmə təsiri arasında əlaqə	23
1.6 Dərman maddələrinin fəza quruluşu ilə fizioloji təsiri arasında əlaqə	26
2. ALİFATİK KARBOHİDROGENLƏRİN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ	32
2.1 Alkanlar	32
3. ALİTSİKLİK BİRLƏŞMƏLƏRİN FİZİOLOJİ FƏAL TÖRƏMƏLƏRİ	35
3.1 Tsiklopropan	35
3.2 Adamantan törəmələri	37
4. ALİFATİK SIRA HALOGENLİ TÖRƏMƏLƏRİNİN MÜHÜM DƏRMAN PREPARATLARI	40
4.1 Alkilhalogenidlər	40
4.2 Alkanolların fizioloji fəal nümayəndələri	45
5. ALDEHİDLƏR VƏ KARBON TURŞULARI. ONLARIN FİZİOLOJİ FƏAL TÖRƏMƏLƏRİ	48
5.1 Aldehidlər	48
5.2 Alifatik karbon turşularının dərman preparatları	52
5.3 Alifatik aminturşuların fizioloji fəal nümayəndələri	55
5.3.1. 2-Amino-1,5-pentandikarbon turşusu (qlütamin turşusu)	56

5.3.2. 2-Amino-4-metiltiobutan turşusu (metionin)	57
5.3.3. γ -Aminyağ turşusu (QAYT)	60
5.3.4. ϵ -Aminheksan turşusu	66
5.3.5 ϵ -Aminokapron turşusu	66
6. SADƏ VƏ MÜRƏKKƏB EFİRLƏRİN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ	68
6.1. Tibbi efir - dietil efiri, narkoz üçün efir	68
6.2. Sadə arilalifatik efirlər	70
6.3 Nitrit turşusunun mürəkkəb efiri	71
6.4 Nitrat turşusunun mürəkkəb efirləri	71
6.5 Arilalifatik turşuların mürəkkəb efirləri	74
7. DİXLORDİETİLAMİN FARMAKOFOR QRUPLU XƏRÇƏNG ƏLEYHİNƏ MADDƏLƏRİNİN SİNTEZİ	77
7.1 2,2'-Dixlordietilaminlərin törəmələri	78
7.2 Fosfat turşusu amidlərinin dərman təsirli mühüm törəmələri	79
8. KARBONAT TURŞUSUNUN AMİDLƏRİNİN DƏRMAN TƏSİRLİ TÖRƏMƏLƏRİ	84
8.1. Uretanların törəmələri olan dərman preparatları	84
8.2. Atsiklik ureidlərin törəmələrinin dərman təsirli törəmələri	87
9. AMİNSPİRTLƏR VƏ ONLARIN EFİRLƏRİNİN TÖRƏMƏLƏRİ	92
10. ARENLƏRİN DƏRMAN TƏSİRLİ MÜHÜM TÖRƏMƏLƏRİNİN SİNTEZİ	95
10.1 Fenollar və onların törəmələrinin sintezi	95
10.2 p-Aminofenol və onun törəmələrinin sintezi	102
11. AROMATİK TURŞULARIN MÜHÜM TÖRƏMƏLƏRİNİN SİNTEZİ	104
11.1 Benzoy turşusu – C_6H_5COOH	104
11.2 p-Aminobenzoy turşusu və onun törəmələrinin sintezi	105
11.3 Salisil turşusu və onun törəmələrinin sintezi	109

11.4 p-Aminosalisil turşusunun törəmələrinin sintezi	113
11.5 Sulfanil turşusu və sulfanilamid preparatlarının sintezi	114
11.6 Sulfoturşuların alkiluridlərinin törəmələri	120
11.7 Sulfoturşuların amidlərinin törəmələri	123
12. HETEROTSİKLİK BİRLƏŞMƏLƏR, TƏSNİFATI VƏ ÜMUMİ XARAKTERİSTİKASI	126
12.1 Beş üzvlü bir heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr	127
12.2 Furan və onun törəmələrinin sintezi	129
12.3. Beş üzvlü iki heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr	133
12.4 Altı üzvlü bir heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr	138
12.5 Altı üzvlü iki heteroatomlu heterotsiklik birləşmələr	143
13. KONDENSLƏŞMİŞ HETEROTSİKLİK BİRLƏŞMƏLƏR	146
13.1 Purin əsasları	146
13.2 4-Aminoxinolinə alınan dərman maddələri	154
13.3 Akridinin törəmələri	157
13.4 Barbitur turşusunun dərman təsirli törəmələri	163
14. ANTİBİOTİKLƏR	171
15. ALKALOİDLƏR	185
16. VİTAMİNLƏR	198
MÖVZULARA AİD TEST TAPŞIRIQLARI	230
LABORATORİYA İŞLƏRİ	307
İSTİFADƏ OLUNMUŞ ƏDƏBİYYAT SİYAHISI.....	329