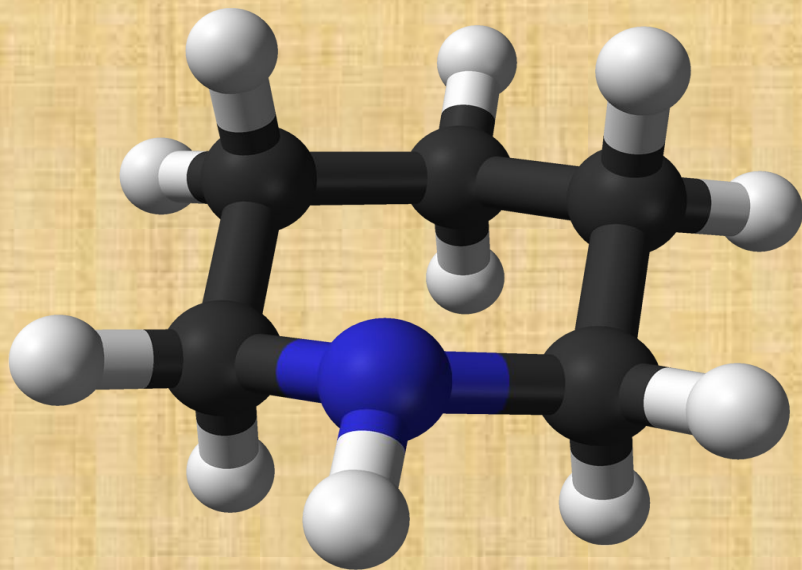




# Жаңадан синтезделген химиялық қосылыстың жедел уыттылығын скрининг деңгейінде зерттеу



Студенттер: Қызырхан Э.Д.  
Жакияева А.Ж.  
Нұрғалымов Н.С.  
Ғылыми жетекші: Амиркулова М.К.

## Өзектілігі:

Соңғы жылдары дәрілік препараттармен жедел улану салдарынан өлім көрсеткіштері жыл сайын өсуде. Олардың ең негізгі себебі химиялық қосылыстардан алынған препараттардың көлемінің артуына байланысты. Сондықтан, бүгінгі таңда жаңадан синтезделген химиялық қосылыстардың жедел уыттылығын зерттеу замануи фармакологияның басты мақсаты.



## Жұмыс Мақсаты:

Жаңадан синтезделген қосылыстардың жедел уыттылығын дәстүрлі тәсілдермен зерттеу және `GUSAR` бағдарламасы арқылы, алынған нәтижені дәлелдеу.

## Зерттеу

### материалы:

А.Б. Бектуров атындағы ХҒЗИ лабораториясында жаңадан синтезделіп жасалған МАВ-216, МАВ-217, МАВ-218, МАВ-219, МАВ-220, МАВ-221 шифрланған жаңа пипериден туындылары қолданылды.

# Міндеттері:

I

- Препараттың жедел уыттылығын дәстүрлі тәсілмен тері астына енгізу арқылы анықтау

II

- Дәстүрлі әдістердің нәтижесінде алынған мәліметтерді компьютерлік «GUSAR» программасында дәлелдеу

III

- Химиялық қосылыс арасындағы байланыстарды анықтау

# Әдістері

Жаңа пиперидин туындыларының жедел уыттылығын тәжірибелік зерттеу ҚР Фармакологиялық комитетімен бекітілген әдістемелік нұсқаны және Н.А.Миронов басшылығымен құрастырылған клиникаға дейінгі зерттеу әдістемесі негізінде жүргізілді. Зерттелуге алынған химиялық қосылыстардың жедел уыттылығын анықтау үшін лабораториялық ақ тышқандар алынды. Тышқандардың салмағы 18-25 гр арасында, әр түрлі жынысты.

Гетероциклді  
қосылыс

## Пиперидин

Күшті негіз,  
оңай тұз түзіп,  
аминдерге тән  
қасиеттер  
көрсетеді

Қазақстанда  
медицинада,  
жергілікті  
анестезия  
ісінде  
қолданылып  
жүр

Еріткіштер  
алуда және  
жағармай  
құраушылары  
ретінде  
қолданылады









Соединения и препараты сравнения	ЛД <sub>50</sub> мг/кг	P-коэффициент корреляции
МAB-216	625±20,9	P <sub>1</sub> <0,001 P <sub>2</sub> <0,001 P <sub>3</sub> <0,05
МAB-217	575±18,9	P <sub>1</sub> <0,001 P <sub>2</sub> <0,001 P <sub>3</sub> <0,001
МAB-218	600±20,0	P <sub>1</sub> <0,001 P <sub>2</sub> <0,001 P <sub>3</sub> <0,001
МAB-219	650±19,2	P <sub>1</sub> <0,001 P <sub>2</sub> <0,001 P <sub>3</sub> <0,001
МAB-220	680±20,2	P <sub>1</sub> <0,001 P <sub>2</sub> <0,001 P <sub>3</sub> <0,001
МAB-221	357±16,8	P <sub>1</sub> >0,05 P <sub>2</sub> <0,01 P <sub>3</sub> < 0,001
Тримекаин	375±3,1	
Лидокаин	230±35,7	
Новокаин	480±1,0	

Кесте №1



## Кесте №2

Қосылыстар	ЛД50 көрсеткіші (дәстүрлі тәжірибе)	GUSAR
МАВ-216	625 +\ - 19,6	705
МАВ-217	575 +\ - 19,0	500
МАВ-218	502 +\ - 20,0	500
МАВ-219	525 +\ - 18,5	500
МАВ-220	575 +\ - 19,6	498
МАВ-221	357 +\ - 18,9	452

# MAV-216

Диалоги | ХАРАКТЕРИСТИКА.d | Пикабу | Письмо отправлено | gusar acute toxicity – | Gusar – create QSAR | way2drug.com/gu: X

← way2drug.com way2drug.com/gusar/acutoxpredict/socket2.php?id=50549786a041bf5be0ae503a2ad6b980

## Rat acute toxicity predicted by GUSAR

Rat IP LD50 (mg/kg)	Rat IV LD50 (mg/kg)	Rat Oral LD50 (mg/kg)	Rat SC LD50 (mg/kg)
179,400 in AD	53,840 in AD	229,600 in AD	811,00 in AD

### Acute Rodent Toxicity Classification of Chemicals by OECD Project

Rat IP LD50 Classification	Rat IV LD50 Classification	Rat Oral LD50 Classification	Rat SC LD50 Classification
Class 4 in AD	Class 4 in AD	Class 3 in AD	Class 3 in AD

IP - Intraperitoneal route of administration  
IV - Intravenous route of administration  
Oral - Oral route of administration  
SC - Subcutaneous route of administration

# MAV-217-219

Диалоги | ХАРАКТЕРИСТИКА.d | Пикабу | Письмо отправлено | gusar acute toxicity -- | Gusar - create QSAR | way2drug.com/gu... | + | - | X

way2drug.com way2drug.com/gusar/acutoxpredict/socket2.php?id=50549786a041bf5be0ae503a2ad6b980

## Rat acute toxicity predicted by GUSAR

Rat IP LD50 (mg/kg)	Rat IV LD50 (mg/kg)	Rat Oral LD50 (mg/kg)	Rat SC LD50 (mg/kg)
179 in AD	150,55 in AD	611,0 in AD	500,01 in AD

### Acute Rodent Toxicity Classification of Chemicals by OECD Project

Rat IP LD50 Classification	Rat IV LD50 Classification	Rat Oral LD50 Classification	Rat SC LD50 Classification
Class 4 in AD	Class 4 in AD	Class 3 in AD	Class 3 in AD

IP - Intraperitoneal route of administration  
IV - Intravenous route of administration  
Oral - Oral route of administration  
SC - Subcutaneous route of administration



# MAВ-220

way2drug.com way2drug.com/gusar/acutopredict/socket2.php?id=50549786a041bf5be0ae503a2ad6b980

## Rat acute toxicity predicted by GUSAR

Rat IP LD50 (mg/kg)	Rat IV LD50 (mg/kg)	Rat Oral LD50 (mg/kg)	Rat SC LD50 (mg/kg)
179 in AD	150,55 in AD	715,015 in AD	498,66 in AD

### Acute Rodent Toxicity Classification of Chemicals by OECD Project

Rat IP LD50 Classification	Rat IV LD50 Classification	Rat Oral LD50 Classification	Rat SC LD50 Classification
Class 4 in AD	Class 4 in AD	Class 3 in AD	Class 3 in AD

IP - Intraperitoneal route of administration  
IV - Intravenous route of administration  
Oral - Oral route of administration  
SC - Subcutaneous route of administration

# MAВ-221

way2drug.com way2drug.com/gusar/acutopredict/socket2.php?id=50549786a041bf5be0ae503a2ad6b980

## Rat acute toxicity predicted by GUSAR

Rat IP LD50 (mg/kg)	Rat IV LD50 (mg/kg)	Rat Oral LD50 (mg/kg)	Rat SC LD50 (mg/kg)
310,10 in AD	80,0 in AD	715,015 in AD	452,95 in AD

### Acute Rodent Toxicity Classification of Chemicals by OECD Project

Rat IP LD50 Classification	Rat IV LD50 Classification	Rat Oral LD50 Classification	Rat SC LD50 Classification
Class 4 in AD	Class 4 in AD	Class 3 in AD	Class 3 in AD

IP - Intraperitoneal route of administration  
IV - Intravenous route of administration  
Oral - Oral route of administration  
SC - Subcutaneous route of administration

# ҚОРЫТЫНДЫ:

**ЖОҒАРЫДА КӨРСЕТІЛГЕН МӘЛІМЕТТЕРДІ ҚОРЫТА КЕЛЕ, БІЗДІҢ ЗЕРТТЕП ОТЫРҒАН ҚОСЫЛЫСТАРЫМЫЗДЫҢ ЖЕДЕЛ УЫТТЫЛЫҒЫ ЭТАЛОНДЫҚ ПРЕПАРАТТАРДАН ТӨМЕН. БІРАҚ, МАВ-221 ҚОСЫЛЫСЫНЫҢ УЫТТЫЛҒЫ ЭТАЛОНДЫҚ ПРЕПАРАТ ТРИМЕКАИНГЕ САЙМА-САЙ ЕКЕНДІГІ АНЫҚТАЛДЫ. ЖҰМЫСЫМЫЗДЫҢ КЕЛЕСІ МАҚСАТЫ ЗЕРТТЕУ БАРЫСЫНДА ӨЛГЕН ТЫШҚАНДАРДЫҢ ӨЛІМ СЕБЕБІН АНЫҚТАУ ҮШІН ЕҢ СЕЗІМТАЛ АҒЗАЛАРДЫ ГИСТОЛОГИЯЛЫҚ ЗЕРТТЕУ ЖӘНЕ 'PASS' БАҒДАРЛАМАСЫ АРҚЫЛЫ ФАРМАКОЛОГИЯЛЫҚ БЕЛСЕНДІЛІКТЕРІН БОЛЖАУ.**



# Назарларыңызға рахмет!

