



DOI

10.66073/ReFocus-Conf/
0910266



QR-kod
maqolaning DOI
sahifasini
ochadi

SAHIFALAR

1289–1291

TIL

Rus

IQTIBOS UCHUN

Турениязова Даметкен Айниязовна.
Изучение антиаритмической
активности и фармакологических
свойств производных
аминолупинина // «O'zbekiston
olima ayollarining mamlakat
taraqqiyotiga qo'shayotgan hissasi»
mavzusidagi xalqaro ilmiy-amaliy
konferensiya materiallari (Nukus, 2026-
yil 9–10-oktyabr). – Nukus, 2026. –
B. 1289–1291. – DOI: [https://doi.org/
10.66073/ReFocus-Conf/0910266](https://doi.org/10.66073/ReFocus-Conf/0910266)



«O'zbekiston olim ayollarining
mamlakat taraqqiyotiga
qo'shayotgan hissasi»

XALQARO ILMIY-AMALIY
KONFERENSIYA
NUKUS, 9–10-OKTYABR 2026

ИЗУЧЕНИЕ АНТИАРИТМИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТИ И ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИХ СВОЙСТВ ПРОИЗВОДНЫХ АМИНОЛУПИНИНА

Турениязова Даметкен Айниязовна

д.б.н., доцент.

e-mail: damet.t@mail.ru

Каракалпакский государственный университет

Аннотация: Исследование направлено на первичный скрининг антиаритмической активности производных аминолупинина, выявление взаимосвязи между их химическим строением и биологическим действием, а также оценку антиаритмической активности, безопасности и предполагаемого механизма действия наиболее перспективного соединения.

Ключевые слова: аминолупинин, хлоргидрат, строфантин, аконитин, механизм действия, SAR-анализ.

Введение. Поиск новых антиаритмических соединений с высокой эффективностью и приемлемым профилем безопасности остаётся актуальной задачей экспериментальной фармакологии. Перспективным направлением является создание производных природных алкалоидов, в частности аминолупинина, обладающих способностью влиять на возбудимость и проводимость миокарда.

Цель исследования – провести первичный скрининг антиаритмической активности производных аминолупинина, установить взаимосвязь между их химическим строением и биологическим действием, а также изучить антиаритмическую активность, безопасность и предполагаемый механизм действия наиболее перспективного соединения.

Материалы и методы. На первом этапе исследовано 17 производных аминолупинина, включавших 11 хлоргидратов замещённых бензоиловых эфиров аминолупинина и 6 N-лупиниланилинов. Антиаритмическую активность оценивали в модели аконитин-индуцированной фибрилляции желудочков у экспериментальных животных. Определяли латентный период возникновения аритмии, время до гибели и летальность. В качестве препарата сравнения использовали хлоргидрат лупинина, контрольным препаратом служила вода. На основании полученных результатов проведён SAR-анализ для оценки влияния природы и положения заместителей в ароматическом кольце на антиаритмическую активность.

На втором этапе наиболее перспективное соединение – хлоргидрат о-метилбензоиламидолупинина – исследовали на хлоридкальциевой, аконитиновой и строфантовой моделях аритмий у крыс. В качестве референс-препарата использовали

новокаиномид. Для оценки выживаемости животных и времени наступления летального исхода применяли метод Kaplan–Meier.

Результаты. Установлено, что все исследованные производные аминолупинина статистически значимо ($p < 0,05$) увеличивали латентный период возникновения аритмии в 8–13 раз по сравнению с контролем. Наиболее выраженный эффект выявлен у о-метил- и о-бромбензоиламидолупининов, применение которых сопровождалось увеличением времени до гибели животных в 6–8 раз.

Наиболее активным оказалось соединение – хлоргидрат о-метилбензоиламидолупинина. При его введении время до гибели животных при аконитиновой аритмии составило $16,3 \pm 3,4$ мин, что в 8,1 раза превышало показатель контроля и в 2,1 раза – показатель препарата сравнения. Для наиболее активных производных отмечено снижение летальности с 100 % в контроле до 33–66 %. Корреляционный анализ выявил статистически значимую связь между увеличением латентного периода аритмии и снижением летальности ($r = 0,78$; $p < 0,01$), что свидетельствует о взаимосвязи выраженности антиаритмического действия с повышением выживаемости животных.

Проведённый SAR-анализ показал зависимость антиаритмической активности от природы и положения заместителей в ароматическом фрагменте молекулы. Полученные данные позволили выделить хлоргидрат о-метилбензоиламидолупинина в качестве соединения-лидера для дальнейшего фармакологического исследования.

На втором этапе при изучении соединения на различных экспериментальных моделях аритмий оценивали выраженность защитного эффекта, продолжительность жизни животных и показатели выживаемости.

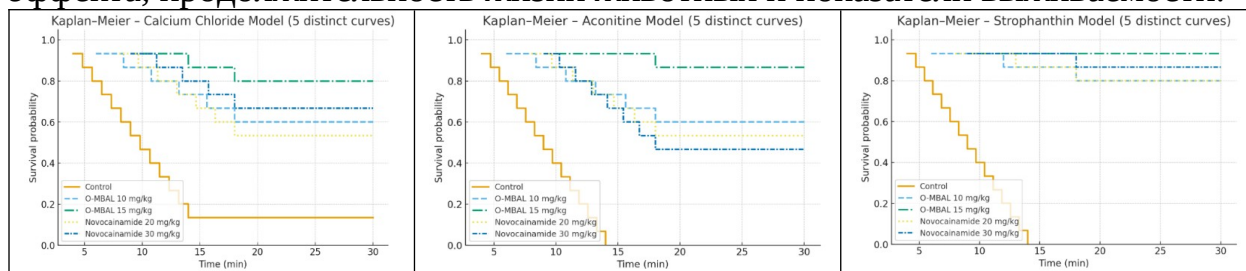


Рисунок 1. Дозо- и модель-зависимые различия в выживаемости по данным анализа Каплана–Мейера

Во всех исследованных моделях интоксикации О-MBAL в дозе 15 мг/кг демонстрировал наиболее выраженное сохранение выживаемости животных по данным анализа Каплана–Мейера.

Полученные результаты использованы для комплексной характеристики антиаритмического действия соединения, оценки его безопасности и определения перспектив дальнейшего доклинического изучения.

Выводы. В результате проведённого скрининга выявлены производные аминолупинина с выраженной антиаритмической активностью. Установлено, что наиболее перспективным соединением является хлоргидрат о-метилбензоиламидолупинина, который существенно увеличивает латентный период

аритмии, продлевает время выживания и снижает летальность экспериментальных животных. Выявленная зависимость «структура–активность» подтверждает влияние характера и положения заместителей на фармакологические свойства соединений. Комплекс полученных данных обосновывает дальнейшее изучение хлоргидрата о-метил-бензоиламидолупинина с целью оценки его механизма действия, терапевтического индекса и профиля безопасности.

Список литературы

1. Turenliyazova D.A., Kushiev Kh.Kh. Synthesis of modified lupinin derivatives. // *Austrian Journal of Technical and Natural Sciences*. - 2023, No. 9–10. <https://doi.org/10.29013/AJT-23-9.10-3-6>. URL: <https://ppublishing.org/archive/publication/882-synthesis-of-modified-lupinin-derivatives>
2. Turenliyazova D. A. Spectral analysis of amide derivatives lupinine alkaloid // *International Engineering Journal for Research & Development*. -2022. -Vol. 7. No. 3. Issue 3. <https://www.iejrd.com/index.php/%20article/view/2795>
3. Turenliyazova D.A., Kushiev Kh.Kh., Synthesis and research of biologically active compounds based on aminolupinin. // *International Journal of Materials Engineering*. -2023, 13(1) 1-3 DOI: 10.5923/j.ijme.20231301.01.
4. Турениязова Д.А., Кушиев Х.Х. Исследование некоторых производных аминолупинина на биологическую активность. // *Universum: химия и биология*, -Москва, - 2023, -1(115). №2). URL: <https://7universum.com/ru/nature/archive/item/16573>
5. Турениязова Д.А., Кушиев Х.Х. Биологические свойства лупинина и их производных. // *Вестник Каракалпакского государственного университета*. -2024, -№1, -С. 27-29.