

НОВІ АМІНОСПИРТИ ТА СУЛЬФОНАМІДИ З СУЛЬФОЛАНОВИМ ФРАГМЕНТОМ, ЯКІ ПРОЯВЛЯЮТЬ НЕЙРОТРОПНУ АКТИВНІСТЬ

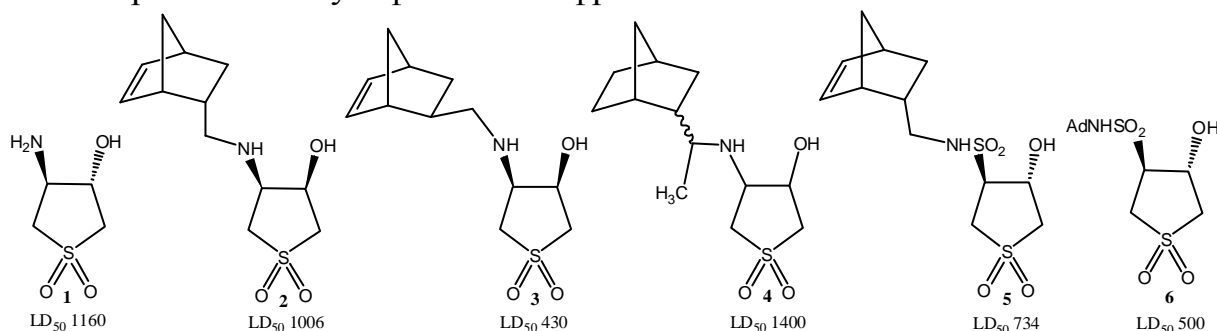
Заровна І.С.¹, Зленко О.Т.², Карпенко Д.В.³, Пальчиков В.О.¹

¹Дніпропетровський національний університет імені Олеся Гончара
пр. Гагаріна 72; e-mail: palchikoff@mail.ru

²Дніпропетровський медичинський інститут традиційної та нетрадиційної медицини

³Дніпродзержинський державний технічний університет

Сполуки з сульфолановим циклом не є природними, але є чимало даних про різноманітну біологічну активність таких сполук. Нами була досліджена нейротропна активність (анальгетичний, протисудомний, антигіпоксичний та транквілізуючий ефекти) аміноспиртів і сульфонамідів, що містять каркасний та сульфолановий фрагменти **1-6**.



Біологічні властивості синтезованих сполук вивчали в експериментах на дорослих безпородних білих мишах обох статей масою 20-30 г. Гостру токсичність визначали за методом Litchfield, Wilcoxon у модифікації В.Б. Прозоровського (1962); середня смертельна доза становить 430 -1400 мг/кг. Досліджувані речовини вводили у вигляді емульсії в ТВІН-40 внутрішньоочеревинно в дозі 1/10 ЛД₅₀. Анальгетичний та протисудомний ефекти визначені на моделях «hot plate» та коразолових судах. Оцінка антигіпоксичної дії проведена на моделі нормобаричної артеріально-гіпоксичної гіпоксії у замкнутому просторі. Транквілізуючу дію препаратів вивчали по зміні тривалості барбітурового сну. Активність оцінена у відсотках по відношенню до контрольної групи тварин.

Встановлено, що сполуки **5, 6** з сульфонамідним фрагментом є більш токсичними, ніж аміноспирти **1-4**; введення в молекулу каркасного фрагменту (норборненового, норборнанового чи адамантанового) позитивно впливає на прояв нейротропної активності. Досліджувані сполуки мають помірний анальгезуючий ефект, що перевищує показники для анальгіна в 1,5-5 разів, з максимальними показниками по величині знеболювального ефекту та тривалості дії для сульфонаміда **5** [1]; також помірно виражені антиконвульсантна та антигіпоксична дії (найбільший активний аміноспирт **3** - +113,2 та +44,44% відповідно). Найбільший транквілізуючий ефект виявлено для сполук **4, 5** +111 та +127% відповідно.

В цілому, введення в молекулу сульфонамідної групи значно розширює можливості використання нових сполук у якості потенційних нейротропних препаратів.