

АНАЛГЕТИЧНА АКТИВНІСТЬ НОВОЇ ОРИГІНАЛЬНОЇ СПОЛУКИ, ПОХІДНОГО КАРБОНОВОЇ КИСЛОТИ

Кошова О.Ю., Яковлева Л.В., Гращенкова С.А., Єрємін О.П.

ЦНДЛ Національного фармацевтичного університету, Харків, Україна

Нестероїдні протизапальні засоби (НПЗЗ) належать до числа найбільш важливих «симптоматичних» лікарських препаратів, які застосовуються при захворюваннях запального генезу. Це пояснюється унікальним поєднанням протизапальних, аналгетичних, жарознижуючих і антитромботичних властивостей, що відповідають майже повному спектру основних симптомів, характерних для цих захворювань. За виразністю аналгетичної активності сучасні НПЗЗ істотно перевершують «прості» аналгетики. Поряд з цим, препарати цієї фармакологічної групи займають одне з перших місць за кількістю та важкістю побічних ефектів. Отже пошук нових НПЗЗ з потужним протизапальним та аналгетичним потенціалом з відсутністю побічної дії, залишається актуальною проблемою сучасної фармакології.

На кафедрі управління якістю НФаУ під керівництвом д.х.н., проф. С.М. Коваленка була синтезована оригінальна сполука, похідне карбонкової кислоти: 5-метил-4-алкілтієно[2,3-d]піримідин-6-карбонкової кислоти. У попередніх дослідженнях було встановлено, що нова речовина виявляє аналгетичну та антиексудативну активність. Результати карагенінового тесту дозволили припустити, що механізм дії нової речовини реалізується через пригнічення біосинтезу простагландинів (ПГ), медіаторів запалення та болю, які утворюються в процесі метаболізму арахідонової кислоти.

Метою роботи стало уточнення механізму аналгетичної дії похідного карбонкової кислоти на моделі ацетилхолінових корчей у мишей. Відомо, що ацетилхолін діє на периферичну ноцицептивну систему і специфічно стимулює виділення ПГ.

Досліди проведені на мишах самцях масою 18-20 г. Досліджувану речовину вводили однократно за 1 годину до введення альгогену у дозах 1 і 10 мг/кг. Ацетилхолін вводили у вигляді 0,7% розчину у дозі 0,2 мл на тварину внутрішньоочеревинно. Як препарати порівняння використовували таблетки аналгіну (50 мг/кг) та цитрамону (100 мг/кг). Протягом 10 хв. підраховували кількість корчів кожної тварини. Аналгетичну активність (АА) оцінювали за здатністю речовини зменшувати кількість корчів у дослідній групі тварин порівняно з контрольною.

Відповідно до отриманих даних, нова речовина виявила виразну аналгетичну дію, активність якої у дозі 1 мг/кг склала 72 %, збільшення дози речовини сприяло підвищенню АА до 84 %, що свідчить про дозозалежний ефект речовини. За виразністю дії нова речовина переважала препарати порівняння таблетки аналгіну (АА 72 %).

Таким чином, на моделі «корчів» у мишей, викликаних ацетилхоліном, нова речовина, похідне карбонкової кислоти виявила аналгетичну дію, у механізмі дії якої провідну роль відіграє пригнічення утворення простагландинів.