

Таблиця

Фармакологічна характеристика найбільш перспективних похідних бензойної кислоти та препаратів порівняння

№ п/п	Шифр речовини	Анальгетична активність ED <sub>50</sub> , мг/кг	Антиексудативна активність ED <sub>50</sub> , мг/кг	ЛД <sub>50</sub> , мг/кг	ТІ за анальгезією	ТІ за протизапальною активністю
1	I	0,12 (0,03÷0,32)	0,1 (0,06÷0,14)	2180 (1460÷2900)	18319	21800
2	II	0,36 (0,28÷0,38)	1,65 (1,20÷2,05)	3300 (2720÷3870)	9296	2000
3	III	0,17 (0,15÷0,20)	1,4 (1,21÷1,56)	765 (697÷833)	4500	546
4	IV	0,71 (0,68÷0,74)	0,95 (0,75÷1,23)	2180 (1460÷2900)	3036	2295
5	V	0,55 (0,53÷0,58)	1,25 (1,04÷1,49)	2180 (1460÷2900)	3978	1744
6	VI	0,37 (0,29÷0,44)	1,15 (0,80÷1,56)	4650 (4320÷6130)	12740	4044
7	Анальгін	55,0 (37,0÷83,0)	90,0 (64,0÷126,0)	3300 (2357÷4620)	60	37
8	Вольтарен	5,0 (3,0÷8,0)	8,0 (4,0÷14,0)	370 (247÷555)	74	46

разів відповідно. Отже, перспективними для створення нового ННА та НПЗЗ є сполуки I та II-VI, тому що виявляють виражені протизапальні та анальгетичні властивості;

- антиоксидантною дією володіють усі 17 сполук трьох структурних угруповань похідних бензойної кислоти, вираженість цього ефекту знаходиться на рівні препаратів порівняння і складає близько 100%.

Для створення препарату групи ННА та НПЗЗ необхідно, щоб сполука виявляла виражені анальгетичні та протизапальні властивості. Отже коло пошуку в ряді похідних бензойної кислоти звужується, тому що цим вимогам відповідають тільки речовини I та II-VI (табл.1). Порівняльний аналіз фармакологічної активності 2,4-дихлорбензоату калію (I) та похідних амідів R-(карбоксиме-

тил) антранілової кислоти (II-VI) показав, що значення анальгетичної дії цих сполук знаходяться на одному рівні, за вираженістю протизапального ефекту сполука I має перевагу над речовинами II-VI у 9,5-16,5 разів. Також за широтою анальгетичної та протизапальної дії речовина I перевищує похідні антранілової кислоти у 1,5-6 разів та в 5,4-40 разів відповідно.

#### ВИСНОВКИ

Аналіз одержаних даних дозволив виявити найбільш перспективну та рентабельну у виробництві (простий екологічно чистий синтез та вихід речовини 75%) сполуку — 2,4-дихлорбензоат калію (I), яка одержала назву “Анальбен” і була обрана для проведення поглибленого доклінічного дослідження з метою створення нового препарату, який належить до групи ННА та НПЗЗ.

#### ЛІТЕРАТУРА

1. *Методические рекомендации по экспериментальному (доклиническому) изучению фармакологических веществ, предлагаемых в качестве нестероидных противовоспалительных средств / ФК МЗ Украины. — К., 1994. — 40 с.*
2. *Методические рекомендации по экспериментальному изучению желчегонной, холеспазмолитической, холелитиазной и гепатопротекторной активности новых лекарственных средств (издание официальное) / С.М.Дроговоз, С.И.Сальникова, Н.П.Скакун и др. — К.: ФК МЗ Украины, 1994. — 46 с.*
3. *Пастушенко Т.В., Маруший Л.Б., Жуков А.А. // Гигиена и санитария. — 1985. — №6. — С. 46-49.*
4. *Пошук та експериментальне вивчення фармакологічних речовин, які пропонуються як ненаркотичні анальгетики (Методичні рекомендації) / М.А.Мохорт, Л.В.Яковлева, О.М.Шаповал. — К.: ДФЦ МОЗ України, 2000. — 23 с.*