

## ЕКСПЕРИМЕНТАЛЬНА ОЦІНКА ФАРМАКОДИНАМІКИ ДЕЯКИХ СПОЛУК У РЯДУ ПОХІДНИХ 1-R-1H-2,1-БЕНЗОТІАЗИН 2,2-ДІОКСИДУ ТА 1,2-БЕНЗОКСАТІЇН 2,2-ДІОКСИДУ

*Чопенко В.В., Шебеко С.К.*

**Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна**

**Вступ.** Нестероїдні протизапальні препарати (НПЗП) – є однією з найуживаніших груп лікарських засобів, що застосовуються у багатьох областях медицини. Дана фармакологічна група характеризується високим ризиком розвитку побічної дії, особливо за умов безконтрольного застосування. Використання НПЗП у чверті випадків призводить у тому чи іншому ступені до розвитку побічних реакцій, що значно обмежує можливості їх застосування. У зв'язку з цим нашу увагу привернули деякі нові сполуки у ряду похідних 1-R-1H-2,1-бензотіазин 2,2-діоксиду та 1,2-бензоксатіїн 2,2-діоксиду, що є структурними аналогами відомого НПЗП піроксикаму. У попередніх дослідженнях нами було визначено високий рівень безпеки даних об'єктів. У зв'язку з цим наочною є необхідність експериментальної оцінки їх фармакодинамічного потенціалу.

**Мета дослідження.** Проведення експериментальної оцінки фармакодинамічних властивостей нових сполук серед похідних 1-R-1H-2,1-бензотіазин 2,2-діоксиду та 1,2-бензоксатіїн 2,2-діоксиду.

**Методи дослідження.** У експерименті вивчено анальгетичні та протизапальні властивості 22 нових похідних 1-R-1H-2,1-бензотіазин 2,2-діоксиду та 1,2-бензоксатіїн 2,2-діоксиду, що було синтезовано на кафедрі органічної хімії НФаУ під керівництвом проф. Шемчука Л.А. Дослідження проведено на моделі карагенінового запалення кінцівки у білих щурів вагою 180-200 г. Анальгетичну активність (АА) визначали за Рендаллом-Селітто з використанням анальгезиметру Ugo Basile 37215 (Італія), протизапальну активність (ПЗА) оцінювали за допомогою цифрового плетизмометру ПТС Life Science (США). Всі об'єкти порівнювали з піроксикамом у дозі 2 мг/кг (ЕД<sub>50</sub> за протизапальною дією) та вводили внутрішньошлунково одноразово у еквімолярних дозах.

**Основні результати.** У ході дослідження було визначено, що всі досліджувані сполуки виявляють АА в інтервалі 24-65%. Також найактивніші субстанції цього ряду показали високий рівень ПЗА, що склав 26-57%. Піроксикам навпаки виявив більший рівень ПЗА (52%), ніж АА (49%). При зіставленні ступеню виразності анальгетичного та протизапального ефектів спостерігалась наочна кореляція, яка проявлялась у відповідності рівня активності тієї чи іншої субстанції за обома дослідженими ефектами. Проте у більшості речовин анальгетичний ефект було виражено сильніше. Окрім того було визначено 2 об'єкти, що за АА вірогідно перевершували піроксикам, а за ПЗА не поступались йому.

**Висновки.** За результатами експерименту визначено, що досліджені сполуки у ряду похідних 1-R-1H-2,1-бензотіазин 2,2-діоксиду та 1,2-бензоксатіїн 2,2-діоксиду виявляють переважно анальгетичний та у дещо меншому ступені протизапальний ефекти, і при цьому деякі їх представники не тільки не поступаються, але й перевершують препарат порівняння піроксикам. Це дозволяє їх розглядати як перспективні субстанції для розробки нових НПЗП.