

ВИВЧЕННЯ ПРОТИЗАПАЛЬНОЇ АКТИВНОСТІ ПОХІДНИХ N-R-АНТРАНІЛОВИХ КИСЛОТ

Жегунова Г.П., Деримедвідь Л.В.

Національний фармацевтичний університет, Харків, Україна

Вступ. Запалення є головним патогенетичним компонентом багатьох захворювань різної етіології. Незважаючи на те, що воно є захисною реакцією організму, у багатьох випадках потрібна його адекватна фармакологічна корекція.

З цією метою застосовують досить широкий арсенал протизапальних засобів, в тому числі нестероїдні протизапальні засоби (НПЗЗ). Пошук нових НПЗЗ, які володіють високою протизапальною активністю і низькою токсичністю є актуальним. У цьому аспекті заслуговують увагу похідні N-R-антранілових кислот.

Мета дослідження: скринінгові дослідження протизапальних властивостей похідних N-R-антранілових кислот, отриманих на кафедрі медичної хімії НФаУ.

Матеріали і методи. Вивчення протизапальної активності похідних N-R-антранілових кислот проводили на білих мишах обох статей масою 18-30 г. на моделі карагенінового набряку.

Результати і висновки. Були проведені скринінгові дослідження похідних N-R-антранілових кислот на моделі карагенінового набряку у мишей для визначення найбільш перспективної речовини. Серед вивчених похідних N-R-антранілових кислот було виявлено найбільш високу протизапальну активність у двох похідних, які належать до хімічної групи – заміщені 5 – бром – N –(2'- карбоксифеніл) антранілової кислоти.

Висока протизапальна активність цієї залежить від введення другої карбоксигрупи в 2' положення в структуру похідних даного ряду. Слід також відзначити, що введення галогенів у фенільний радикал неантранілового фрагменту кислоти приводить до підвищення активності і зниження токсичності, а введення нітро- або двох нітрогруп у той же фрагмент сполук виявляє помірну протизапальну дію.

Аналіз отриманих даних показав, що за широтою терапевтичної дії сполуки що вивчались, перевищують ефекти диклофенаку натрію та мефенамової кислоти.

Поглиблене вивчення цих нових похідних N-R-антранілових кислот приводили на моделі ватної гранульоми у щурів.

Встановили, що 5 – бром – N –(2'- карбокси - 5' – хлорфеніл) антранілова кислота показала виражену антипроліферативну дію, що перевищувала ефекти мефенамової кислоти та диклофенака натрію.

Таким чином, аналіз отриманих результатів досліджень з пошуку НПЗЗ серед похідних N-R-антранілових кислот показав, що найбільш стабільна фармакологічна активність вивчених сполук характерна для хімічної групи 5 – бром – N –(2'- карбокси - 5' – хлорфеніл) антранілової кислоти.