

АФФИНИТЕТ ГИДАЗЕПАМА И ЕГО АНАЛОГОВ К СЕРОТОНИНОВЫМ 5-HT_{1A}- Р ГОЛОВНОГО МОЗГА КРЫС.

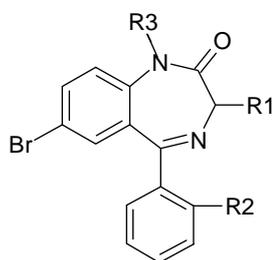
Закордонец Е.В.

Научный руководитель – проф. каф. “Органических и фармацевтических технологий” док.

біол. наук Романовская И.И.

С целью поиска новых анксиолитиков была проведена структурная модификация молекулы гидазепама. Методом радиолигандного анализа был осуществлен скрининг на тропность к серотониновым 5-HT_{1A}-Р головного мозга крыс и определены величины процента вытеснения [³H]8-ОН-ДПАТ (I*, %) из мест его специфического связывания для гидазепама и тестируемых соединений в концентрации 10⁻⁶М класса 3-ариламинобенздиазепинов:

Брутто формула	I*, %	Брутто формула	I*, %	Брутто формула	I*, %
C ₂₄ H ₁₉ BrN ₄ O ₅	15±4	C ₂₆ H ₂₂ BrN ₃ O ₅	50±6	C ₂₂ H ₁₆ BrN ₃ O ₃	44±3
C ₂₄ H ₁₉ BrN ₄ O ₅	0	C ₂₆ H ₂₂ BrN ₃ O ₅	21±2	C ₂₃ H ₁₈ BrN ₃ O ₃	64±3
C ₂₄ H ₁₉ BrN ₄ O ₅	0	C ₂₇ H ₂₄ BrN ₃ O ₅	41±2	C ₂₃ H ₁₈ BrN ₃ O ₃	70±3
C ₂₄ H ₂₀ BrN ₃ O ₃	0	C ₂₄ H ₁₈ BrClN ₄ O ₅	77±3	C ₂₃ H ₁₈ BrN ₃ O ₃	80±3
C ₂₆ H ₂₂ BrN ₃ O ₅	45±4	C ₂₄ H ₁₈ BrClN ₄ O ₅	43±3	C ₂₄ H ₂₀ BrN ₃ O ₃	55±3



Для гизапеама и наиболее активных соединений 1, 2, 3, были определены величины IC_{50} – концентрации полунгибирования специфического связывания радиолиганда [3H]8-ОН-ДПАТ с 5-НТ $_{1A}$ -Р соответственно 51нм, 105нм, 233нм.

Соединение 1 показало высокую аффиность (51нм) к 5-НТ $_{1A}$ -Р, и может бать перспективным для дальнейших исследований.