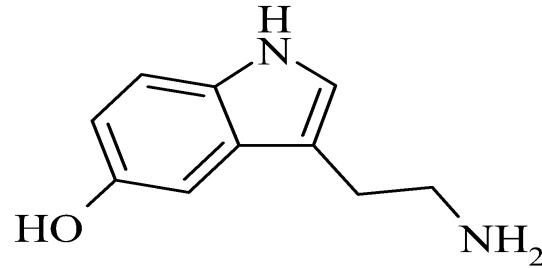


**УСТАНОВЛЕНИЕ ВЛИЯНИЯ  
СТРУКТУРЫ НА  
ПРОТИВОТРЕВОЖНЫЕ СВОЙСТВА  
В РЯДУ ПРОИЗВОДНЫХ  
НАФТАЛИЛИДО(АЛКИЛ)ПИПЕРАЗИНА**

# Серотонин

(5-гидрокситриптамин).



- **Встречается во всем организме, особенно много на тромбоцитах и в слизистой оболочке желудочно-кишечного тракта.**
- **В нервной системе его скопления в верхней части продолговатого мозга и в тканях среднего мозга (шов мозга).**
- **2% всего серотонина содержится в ЦНС.**

# Функции серотонина.

- Цикл сна и бодрствования;
- Психические функции;
- Настроение;
- Память;
- Аппетит;
- Сексуальное возбуждение;
- Возбудимость мотонейронов;
- Регуляция проведения сенсорных стимулов;
- Центральная терморегуляция;
- Продукция гипофизарных гормонов (АКТГ).

## Серотониновые 5-HT рецепторы

```
graph TD; A[Серотониновые 5-HT рецепторы] --> B[5-HT1A]; A --> C[5-HT2]; A --> D[5-HT3]; B --- B1[буспирон]; B --- B2[гепирон]; B --- B3[ипсапирон]; C --- C1[кетансерин]; C --- C2[ритансерин]; D --- D1[ондансетрон];
```

***5-HT<sub>1A</sub>***

**буспирон**

**гепирон**

**ипсапирон**

***5-HT<sub>2</sub>***

**кетансерин**

**ритансерин**

***5-HT<sub>3</sub>***

**ондансетрон**

*Chopin, 1987; Moser, 1989; Soderpalm, 1989.*

# Цель работы:

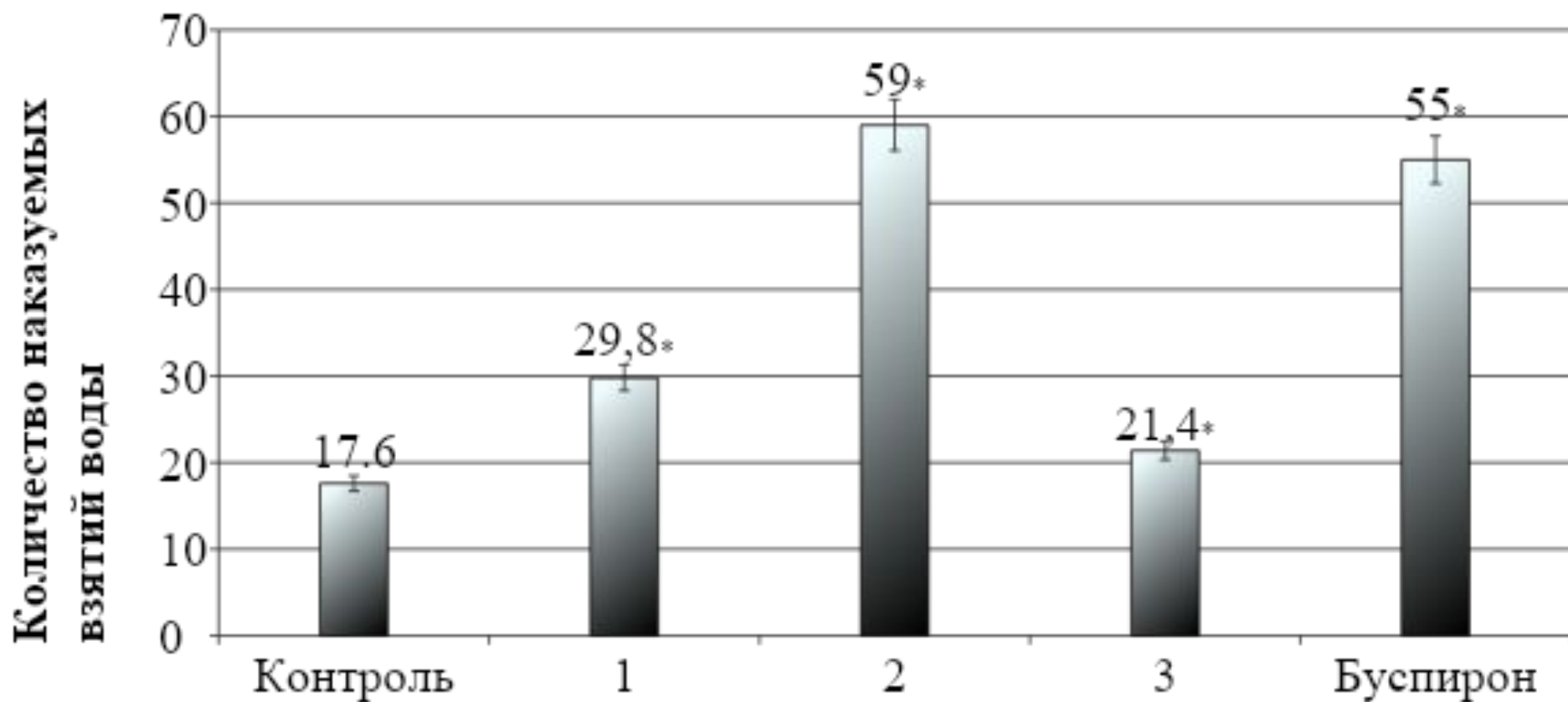
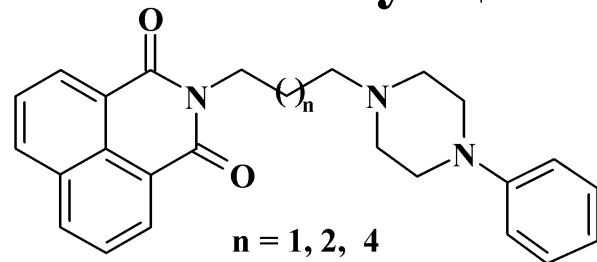
**Установить влияние структуры на анксиолитическую активность в ряду новых производных арилпиперазина с нафталимидным терминальным фрагментом**

## Задачи:

1. Установить анксиолитическую активность в ряду новых производных нафталимидо(алкил)пиперазина в зависимости от положения атома хлора арилпиперазиновой части молекулы в опытах *in vivo* на крысах на модели “Конфликтная ситуация” в сравнении с буспироном.
2. Изучить общую двигательную активность новых синтезированных соединений производных нафталимидо(алкил)пиперазина на модели “Открытое поле” в опытах *in vivo* на крысах.

Замещённые производные  
арил(гетарил)пиперазина, содержащие  
нафталимидный терминальный фрагмент

# Анксиолитическая активность производных Замещённых арилпиперазинов содержащих 3,4,5-триметоксибензоильный фрагмент по методике конфликтной ситуации



**Общая двигательная активность в ряду новых производных  
нафталимидо(алкил)пиперазина  
на модели “Открытое поле” в опытах in vivo на щурах**

<b>Соединение</b>	<b>“Открытое поле” (общая двигательная активность)</b>
<b>Контроль</b>	26,5 ± 3,1
<b>1</b>	1,6 ± 0,5*
<b>2</b>	17,4 ± 1,6*
<b>3</b>	21,4 ± 1,9
<b>Буспирон</b>	19,6 ± 1,1*

(\* при  $P \leq 0,05$ )



# ВЫВОДЫ:

- Таким образом, на основании полученных экспериментальных данных по изучению влияния структуры на анксиолитические свойства в ряду новых производных нафталимидо(алкил)пиперазина можно сделать следующие выводы.
1. Встановлено, що у ряді похідних нафталімідо(алкіл)піперазину анксиолітична активність залежить від наявності замісника у арилпіперазиновій частині молекули та довжини вуглеводневого лінкеру. Найбільш оптимальна довжина вуглеводневого лінкеру, для вивчених нафталімідо(алкіл)піперазинів, складає  $n = 4$ .
  2. Показано, що наявність та положення атома хлору молекулі впливає на анксиолітичну активність похідних нафталімідо(алкіл)піперазину. Сполука, що містять атом хлору в *орто*- положенні з довжиною метиленового лінкера  $n = 4$  (сполука **2**) проявляє найбільш виражену анксиолітичну активність на рівні препарату порівняння буспірону.
  3. Виявлено, що атом хлору у арилпіперазиновій частині нафталімідний фрагмент (у якості імідної частини) у молекули можуть бути використані, для отримання сполук з високою анксиолітичною активністю.