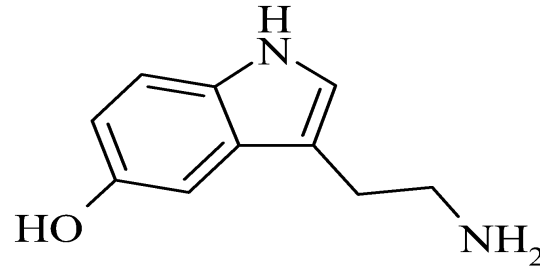


**УСТАНОВЛЕНИЕ ВЛИЯНИЯ
СТРУКТУРЫ НА
ПРОТИВОТРЕВОЖНЫЕ СВОЙСТВА
В РЯДУ ПРОИЗВОДНЫХ
НАФТАЛИЛИДО(АЛКИЛ)ПИПЕРАЗИНА**

Серотонин

(5-гидрокситриптамин).

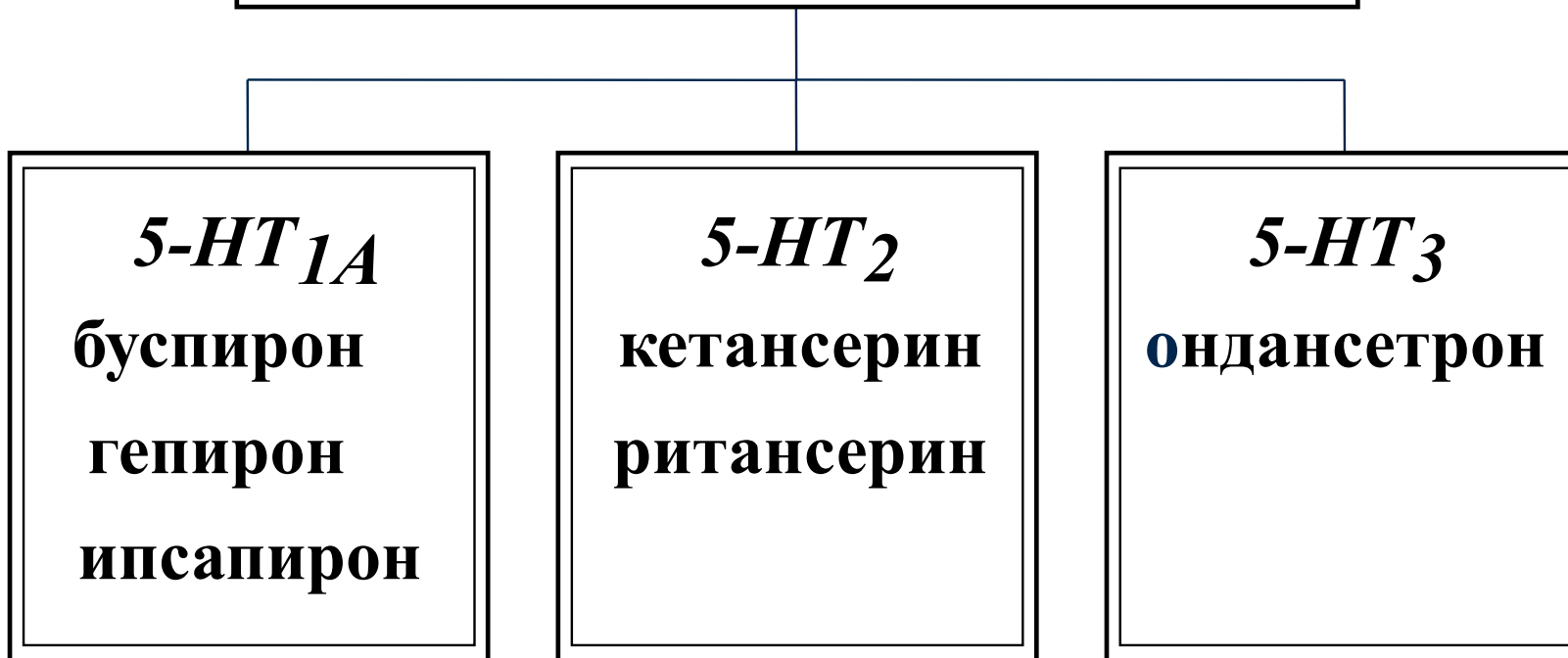


- **Встречается во всем организме, особенно много на тромбоцитах и в слизистой оболочке желудочно-кишечного тракта.**
- **В нервной системе его скопления в верхней части продолговатого мозга и в тканях среднего мозга (шов мозга).**
- **2% всего серотонина содержится в ЦНС.**

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-НТ рецепторы



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

Цель работы:

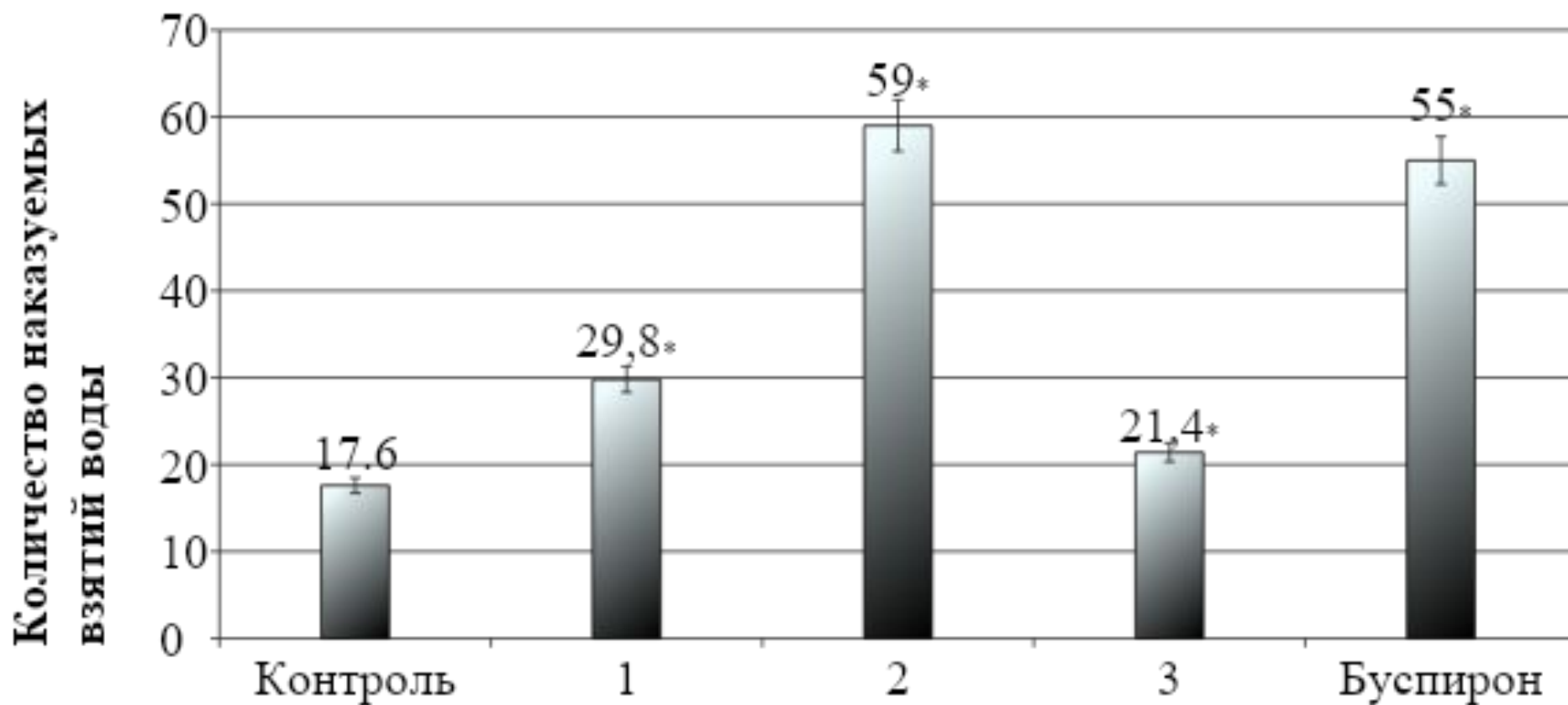
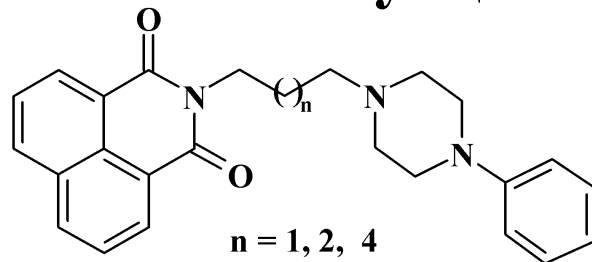
Установить влияние структуры на анксиолитическую активность в ряду новых производных арилпиперазина с нафталимидным терминальным фрагментом

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**

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