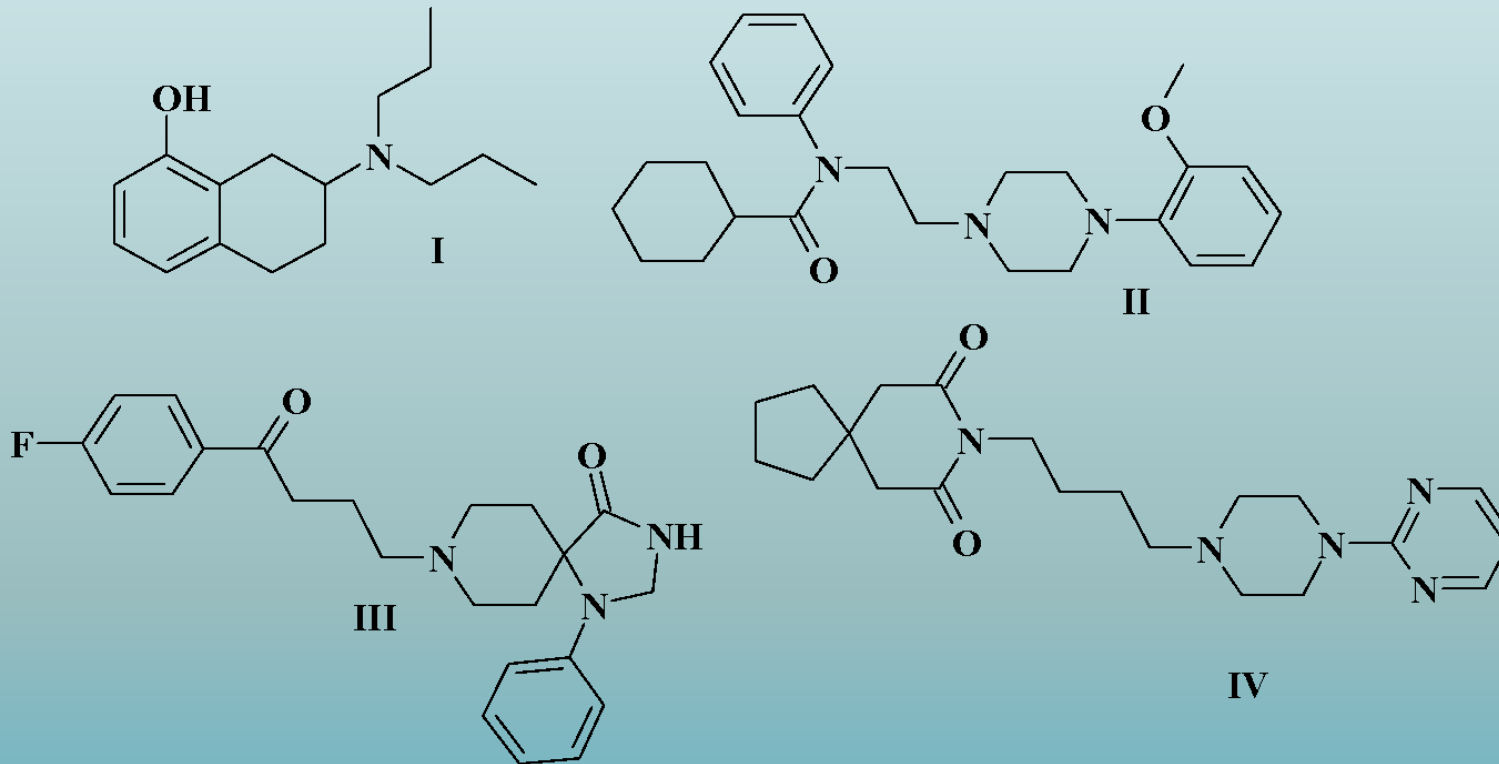


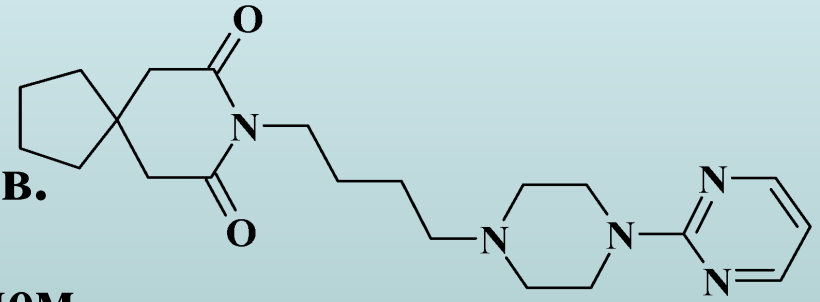
**Изучение анксиолитической активности
в ряду новых производных
арилпиперазина с
3,4,5-триметоксибензильным
терминальным фрагментом**

Лиганды 5-HT_{1A} - рецепторов.



- I – 8-ОН-ДРАТ (полный агонист);
- II – WAY-100635 (высокоселективный антагонист);
- III – Спиперон (обратный агонист);
- IV – **Буспирон** (частичный агонист)

Буспирон



- **Частичный агонист 5-HT_{1A} рецепторов.**
 - **Обладает противотревожным действием.**
 - **Обладает свойствами атипичных нейролептиков.**
- (Н.А. Харин, 1993)
- **Ингибирует апоморфиновую рвоту и стереотипию.**
 - **Угнетает агрессивное поведение.**
 - **Существенно изменяет метаболический оборот дофамина.**
 - **Снижает метаболический оборот серотонина.**
 - **Не обладает миорелаксантным, и снотворным действием.**
 - **Практически отсутствуют седативные свойства.**

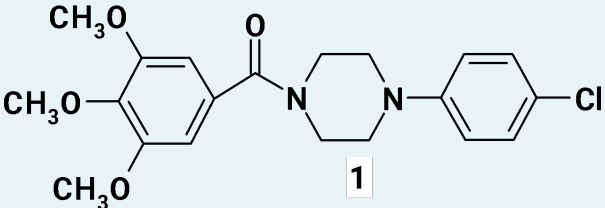
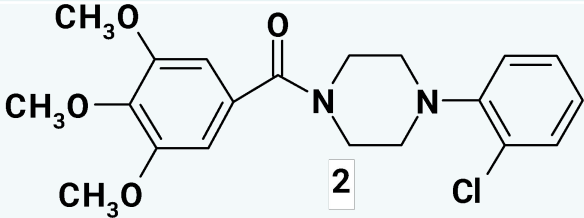
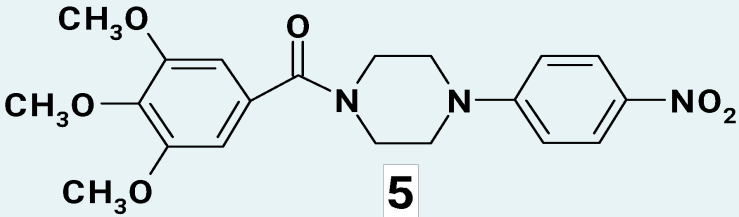
Цель работы:

Изучение анксиолитической активности в ряду новых соединений, с буспироноподобным действием.

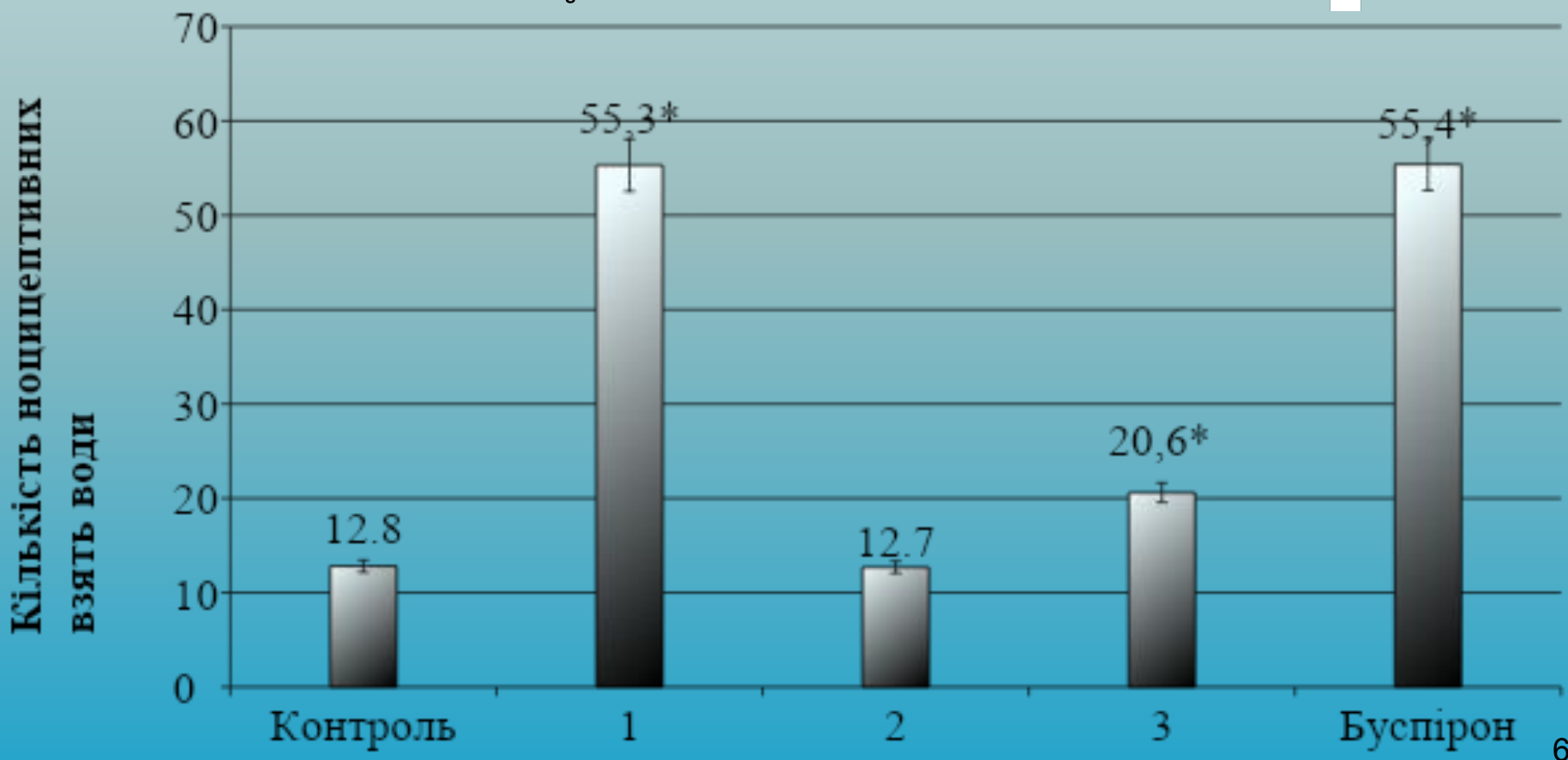
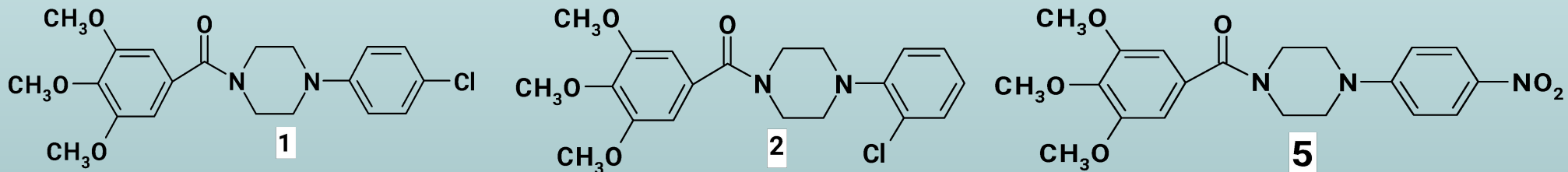
В связи с целью работы были поставлены следующие задачи:

1. Установить анксиолитическую активность в ряду новых попроизводных замещенных арилпиперазинов, содержащих 3,4,5-триметоксибензоильный терминальный фрагмент в опытах *in vivo* на крысах на модели «Конфликтная ситуация».
2. Изучить общую двигательную активность в ряду новых попроизводных замещенных арилпиперазинов, содержащих 3,4,5-триметоксибензоильный терминальный фрагмент в опытах *in vivo* на крысах на модели «Открытое поле».

Замещённые производные арилпиперазина, содержащие 3,4,5-триметоксибензоильный терминальный фрагмент

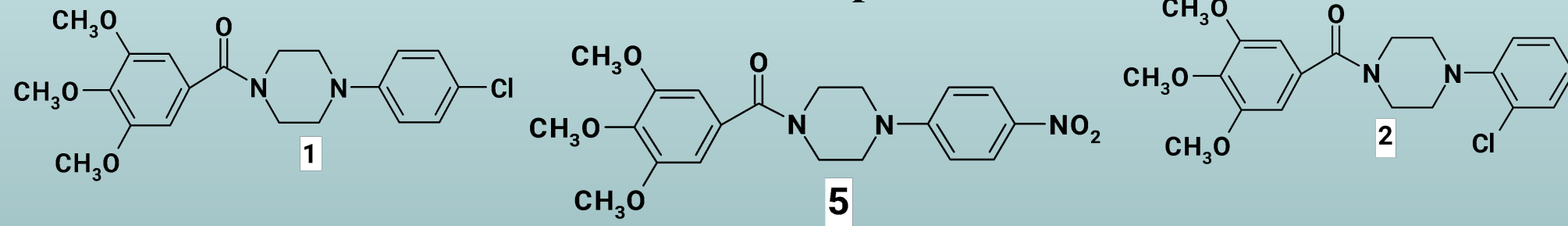
№ соединения	Структура
1	 <chem>COc1cc(OC)c(OC)cc1C(=O)N1CCN(C1)c2ccc(Cl)cc2</chem>
2	 <chem>COc1cc(OC)c(OC)cc1C(=O)N1CCN(C1)c2cccc(Cl)c2</chem>
3	 <chem>COc1cc(OC)c(OC)cc1C(=O)N1CCN(C1)c2ccc([N+](=O)[O-])cc2</chem>

Анксиолитическая активность производных замещённых арилпиперазина содержащих 3,4,5-триметоксибензоильный терминальный фрагмент по методике «Конфликтная ситуация»



(* при $P \leq 0,05$)

**Общая двигательная активность в ряду производных замещённых
арилпиперазины содержащие
3,4,5-триметоксибензиольный терминальный фрагмент
на модели “Открытое поле”**



Соединение	“Открытое поле” (общая двигательная активность)
Контроль	29,8 ± 2,6
1	34,7 ± 1,9*
2	20,4 ± 1,9*
3	15,6 ± 0,6*
Буспирон	7,2 ± 3,07*

ВИВОДИ:

На підставі отриманих даних можна зробити наступні висновки:

1. Виявлено, що вивченому ряді похідних заміщених арилпіперазинів, які містять 3,4,5-триметоксібензоїльний термінальний фрагмент анксиолітична активність залежить від наявності та місцезоташування замісника в арилпіперазиновій частині молекули.
2. Виявлено, що в ряді похідних заміщених арилпіперазинів з 3,4,5-триметоксібензоїльним термінальним фрагментом найвищу анксиолітичну активність проявила сполука **1**, у якої атом хлору у *para*-положенні арилпіперазинової частини молекули. Анксиолітична активність сполуки **1** на рівні буспірону. У решти сполук цього ряду, не залежно від замісника та його положення, анксиолітична активність була значно, або зовсім відсутня.
3. Показано, що загальна рухова активність похідних заміщених арилпіперазинів з 3,4,5-триметоксібензоїльним термінальним фрагментом, сполуки **1** та **2**, на моделі відкритого поля продемонстрували відсутність седативних властивостей. Їх загальна рухова активність на рівні контрольної групи тварин.