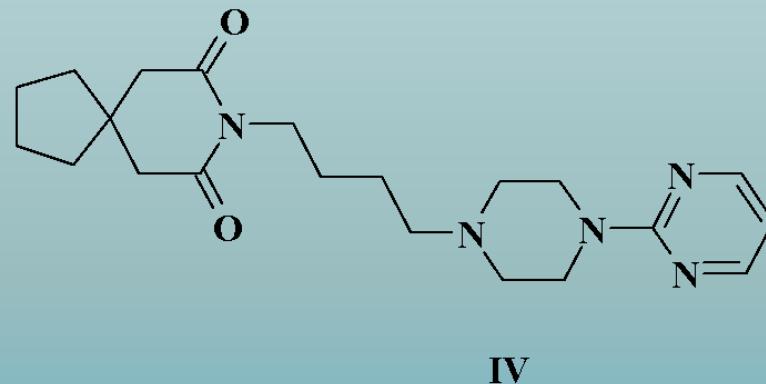
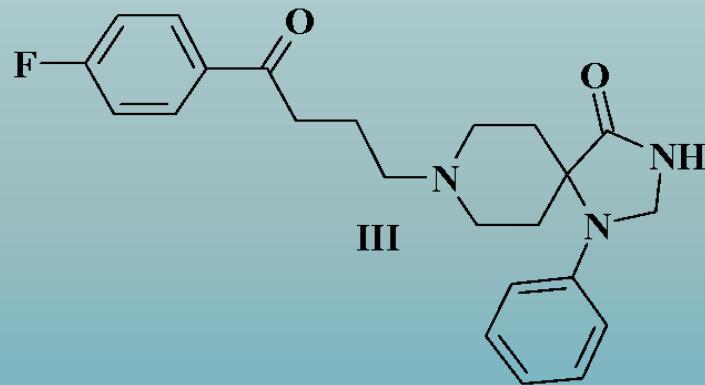
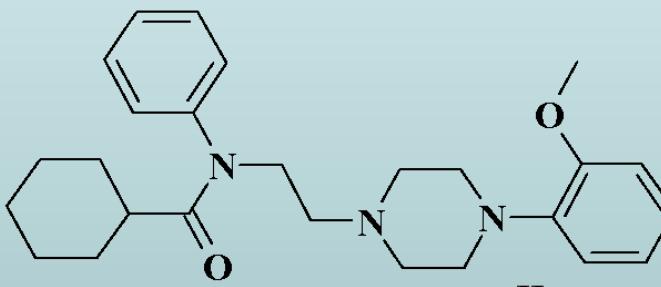
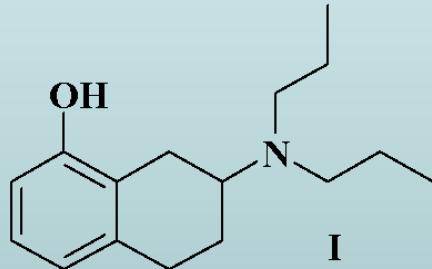


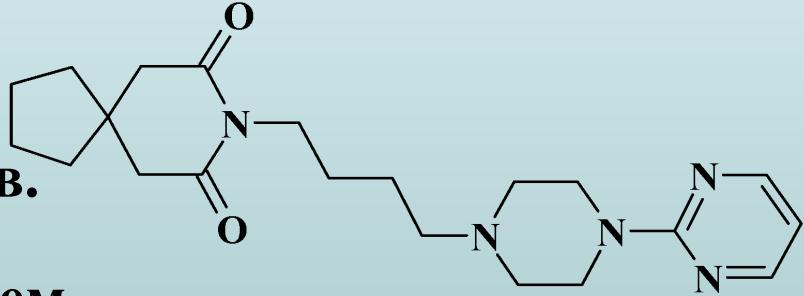
**Изучение анксиолитической активности
в ряду новых производных
арилпиперазина с
3,4,5-триметоксибензоильным
терминальным фрагментом**

Лиганды 5-HT_{1A} - рецепторов.



- I – 8-OH-DPAT (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.**

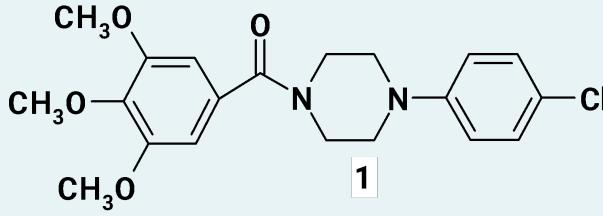
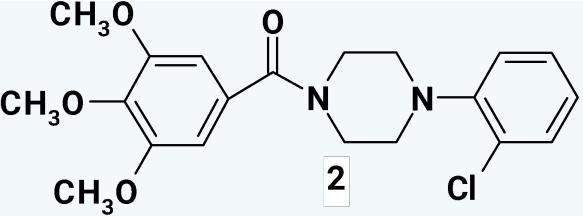
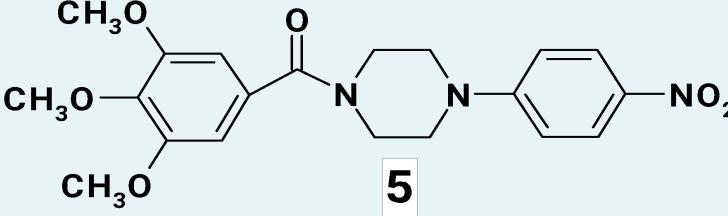
Цель работы:

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

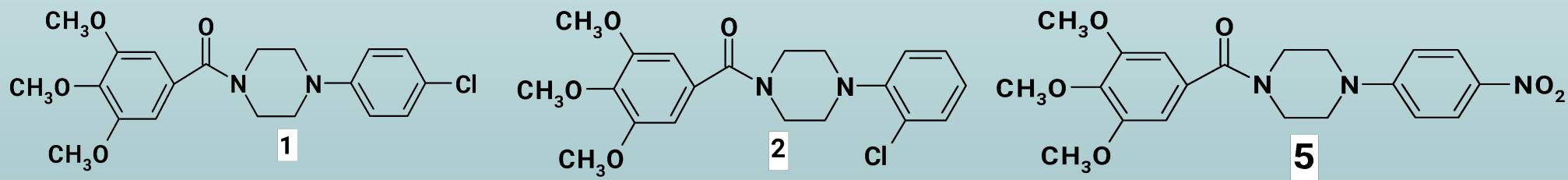
В связи с целью работы были поставлены следующие задачи:

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

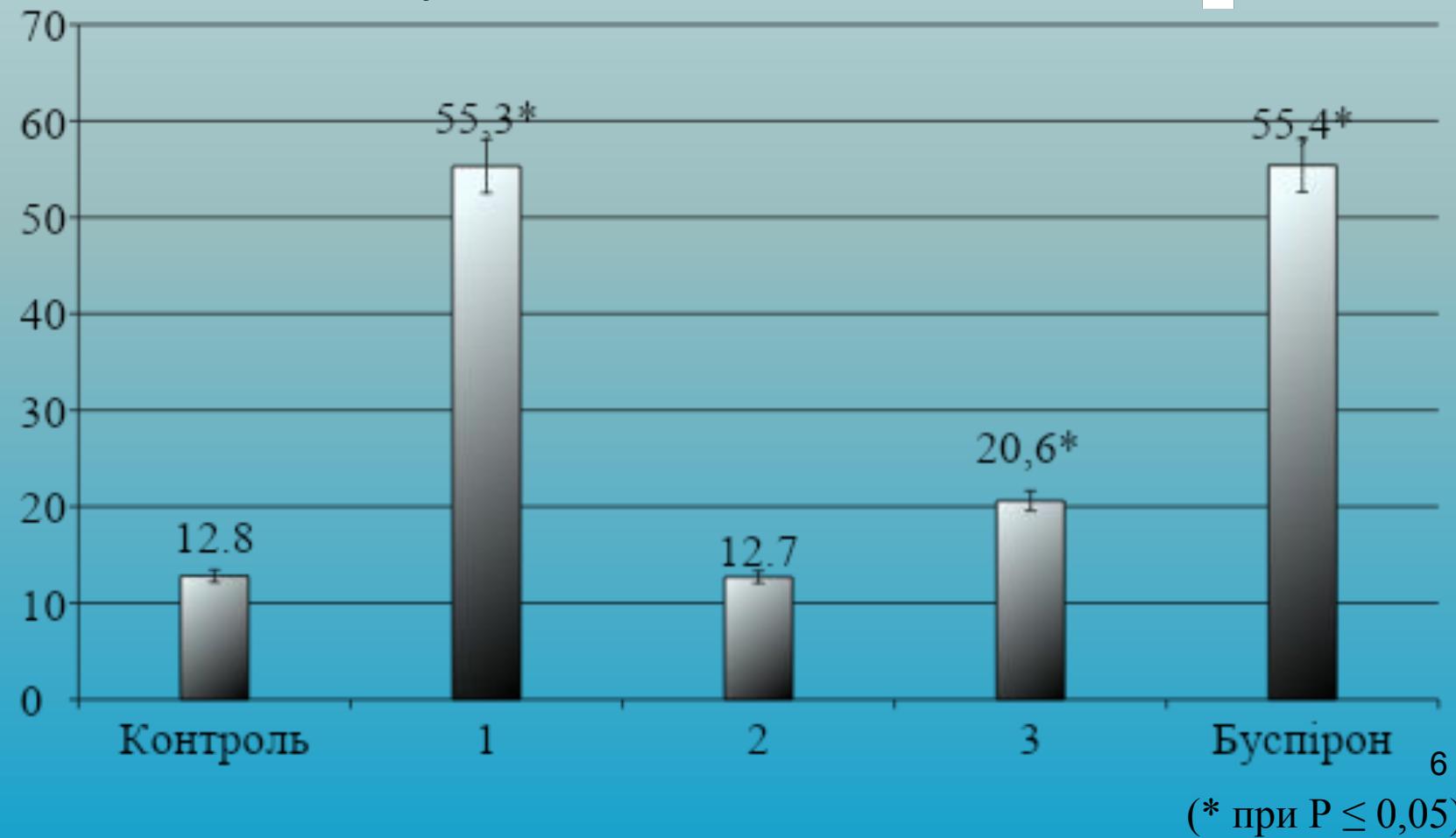
Замещённые производные арилпиперазина, содержащие 3,4,5-триметоксибензоильный терминальный фрагмент

№ соединения	Структура
1	 <p style="text-align: center;">1</p>
2	 <p style="text-align: center;">2</p>
3	 <p style="text-align: center;">5</p>

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

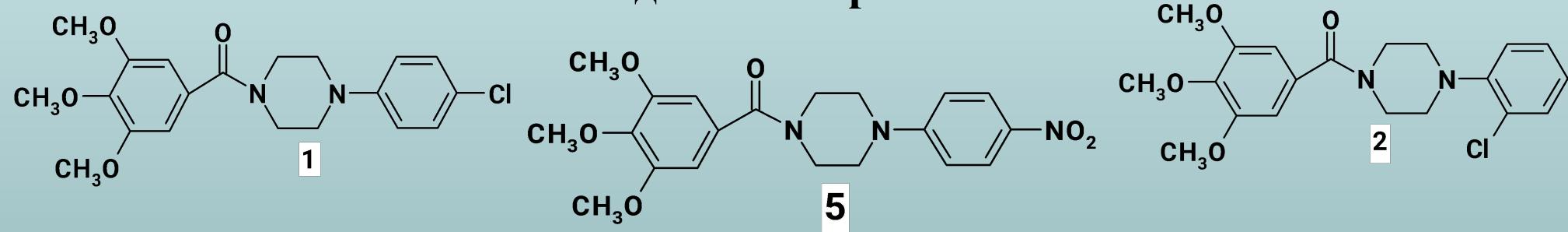


Кількість нонцицептивних
взяття води



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	$29,8 \pm 2,6$
1	$34,7 \pm 1,9^*$
2	$20,4 \pm 1,9^*$
3	$15,6 \pm 0,6^*$
Буспирон	$7,2 \pm 3,07^*$

ВЫВОДЫ:

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 місцерозташування 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 *пара*-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.