

**ПОШУК НЕНАРКОТИЧНИХ АНАЛГЕТИЧНИХ
ТА ПРОТИЗАПАЛЬНИХ ЗАСОБІВ В РЯДІ ПОХІДНИХ
8-(3-МЕТИЛПІРАЗОЛІЛ-1)КСАНТИНУ**

Д.Г. Іванченко, М.І. Романенко, Т.М. Шарапова,

В.І. Корнієнко, Б.А. Самура, С.В. Стрибайло

Запорізький державний медичний університет,

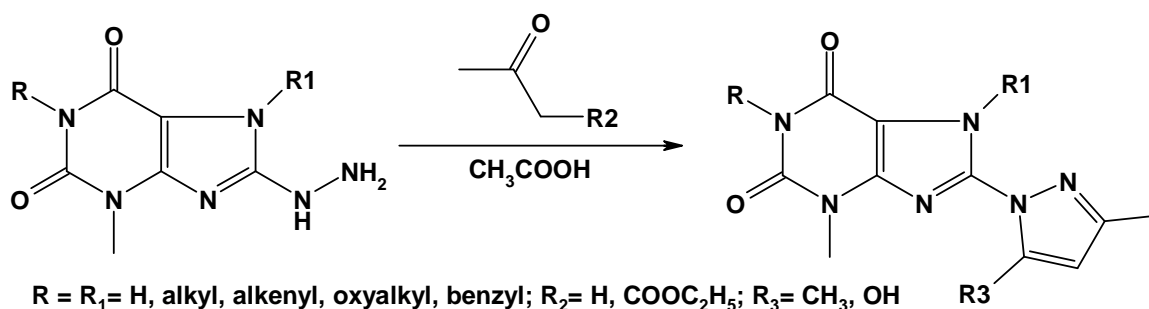
Україна, 69035, м. Запоріжжя, проспект Маяковського, 26

E-mail: ivanchenkodima@yandex.ru

Широке застосування в останні роки отримав цілий ряд препаратів, що виявляють аналгетичну активність разом з вираженою протизапальною дією. До препаратів даної групи відносяться похідні фенілпропіонової, фенілоцтової, кислот (ібупрофен, диклофенак натрію), сполуки, що містять індольний гетероцикл (індометацин), а також похідні піразолону (анальгін). Але наявність великої кількості побічних ефектів (диклофенак натрію) та відносно високої токсичності (анальгін) зменшує можливість застосування даних препаратів в педіатричній та геронтологічній практиках. Найновіші протизапальні препарати з групи оксикамів та дифенільних похідних п'ятичленних гетероциклів практично не мають побічних ефектів, є малотоксичними, але досить складні схеми синтезу та дуже велика ціна стають на перешкоді застосування вказаних препаратів в Україні.

Метою даної роботи є пошук ненаркотичних аналгетичних та протизапальних засобів в ряді ксантину, які містять залишок піразолу в положенні 8 ксантинової молекули.

Як показано на схемі, реакцією N-заміщених 8-гідразиноксантину із ацетилацетоном або ацетооцтовим естером в середовищі льодяної оцтової кислоти був синтезований значний ряд неописаних в літературі похідних 8-(піразоліл-1)ксантину:



Слід зазначити, що в реакції з ацетооцтовим естером утворюються не похідні піразолону-5, а тільки 5-гідрокси-3-метилпіразоли про що однозначно свідчать дані ІЧ- та ПМР-спектроскопії.

Гостра токсичність вивчалась за методом Кербера. Біологічний скринінг показав, що синтезовані сполуки є помірно та малотоксичними. Аналгетична дія синтезованих ксантинів вивчена на моделі «оцтових корчів», а протизапальна дія – на моделі гострого асептичного набряку. Встановлено, що ряд отриманих речовин виявляє знеболюючу та протизапальну дії значно вищі за анальгін та диклофенак натрію. Встановлені деякі закономірності в ряді «будова – дія».