

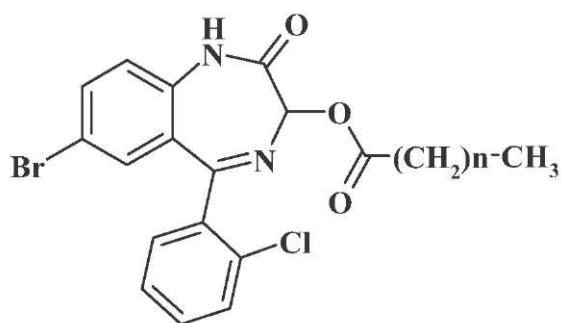
**Е. А СЕМЕНИШИНА¹, О. В. ОНУФРИЕНКО²,
М. С. БОЙКО³**

*Физико-химический институт НАН Украины
¹ ведущий инженер отдела медицинской химии, ² аспирант
³ студентка 5 курса (магистр)*

СНОТВОРНАЯ АКТИВНОСТЬ НОВЫХ 3-ЗАМЕЩЁНЫХ 1,2-ДИГИДРО-3Н-1,4- БЕНЗДИАЗЕПИН-2-ОНОВ

На сегодняшний день расстройства ночного сна - инсомнии встречаются у 28-45% населения, и являются наиболее распространенными и неспецифическими симптомами при разнообразных психических и соматических заболеваниях. Однако большинство снотворных средств, которые используются для лечения разнообразных расстройств сна, изменяют физиологическую структуру природного сна, и при их отмене проявляется так называемый «синдром отдачи» (Воронина и др., 1982).

Поэтому, целью нашей работы явился синтез и изучение снотворной активности новых 3-замещенных 1,2-дигидро-3Н-1,4-бензодиазепинов-2-онов в опытах на мышах по методу потенцирования снотворного действия барбитуратов.



Соед.1 n=0; R= Cl; Соед.2
n=1; R= Cl; Соед.3 n=4; R= Cl;
Соед.4 n=4; R= H.

Опыты проводились на самцах белых беспородных мышей, массой 18-20 г. Исследуемые соединения вводили внутривентриально в суспензии с Tween-80. Животным контрольных групп вводили физиологический раствор. Снотворную активность изучали по методу потенцирования снотворного действия барбитуратов.

Показано, что исследуемые соединения (1-4) проявляют высокую снотворную активность в интервале доз 0,22 - 0,38 мг/кг. Следует отметить, ЧТО ED₅₀ по снотворному действию для циназепама и 3-гидрокси-БД составляет 0,37 и 0,25 мг/кг, соответственно. В результате полученных нами данных было установлено, что с удлинением длины цепи активность синтезируемых соединений снижается с 0,22 мг/кг до 0,38 мг/кг. Так, наиболее высокую снотворную активность проявляет соединение (1), содержащее атом хлора в орто-положении фенильного кольца с ED₅₀ 0,22 мг/кг. Эфир капроновой кислоты, не содержащий атома хлора в орто-положении фенильного кольца и с длиной углеродной цепи n=4 проявляет самую низкую снотворную активность (ED₅₀ 0,38 мг/кг). Исследуемые соединения мало токсичны, их LD₅₀ > 500 мг/кг.

Рекомендована до друку на Засіданні Наукового товариства студентів, аспірантів і молодих вчених, протокол № 2 от 25.11.2010 р.