

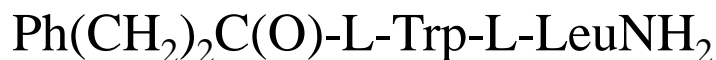
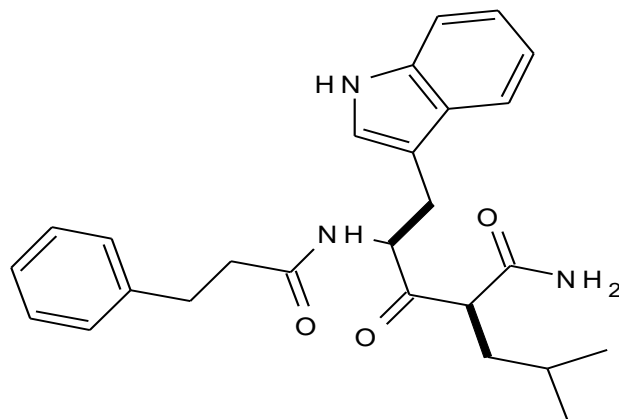
**Изучение седативного и миорелаксантного
действия дипептидного лиганда
транслокаторного белка TSPO - соединения
ГД-102**

**Котельникова С.О., Деева О.А., Крайнева В.А.,
Яркова М.А., Воронина Т.А.**

**ФГБНУ «ФИЦ оригинальных и перспективных биомедицинских и
фармацевтических технологий», Москва, Россия;**

электронная почта: krajevna_va@academpharm.ru

Ранее в НИИ фармакологии имени В.В. Закусова был сконструирован и синтезирован дипептидный лиганд транслокаторного белка (18 kDa, TSPO) – соединение амид N-фенилпропионил-L-триптофанил-L-лейцина (ГД-102), у которого была установлена анксиолитическая и антидепрессивная активность (Патент RU 2 756 772(13) С2).



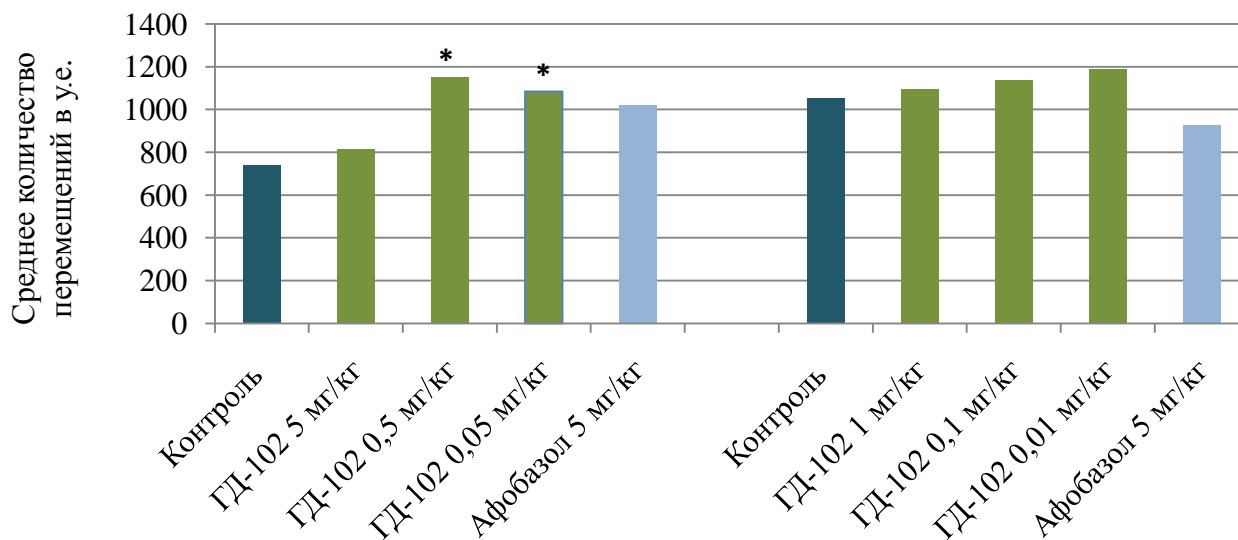
Целью исследования явилось изучение возможных побочных эффектов соединения ГД-102 - седативного и миорелаксантного.

Материалы и методы. Исследование проводили на беспородных мышах самцах (24-26 г). ГД-102 вводили однократно внутрибрюшинно в дозах 0,01; 0,05; 0,1; 0,5; 1,0 и 5,0 мг/кг. Контрольным мышам вводили физиологический раствор.

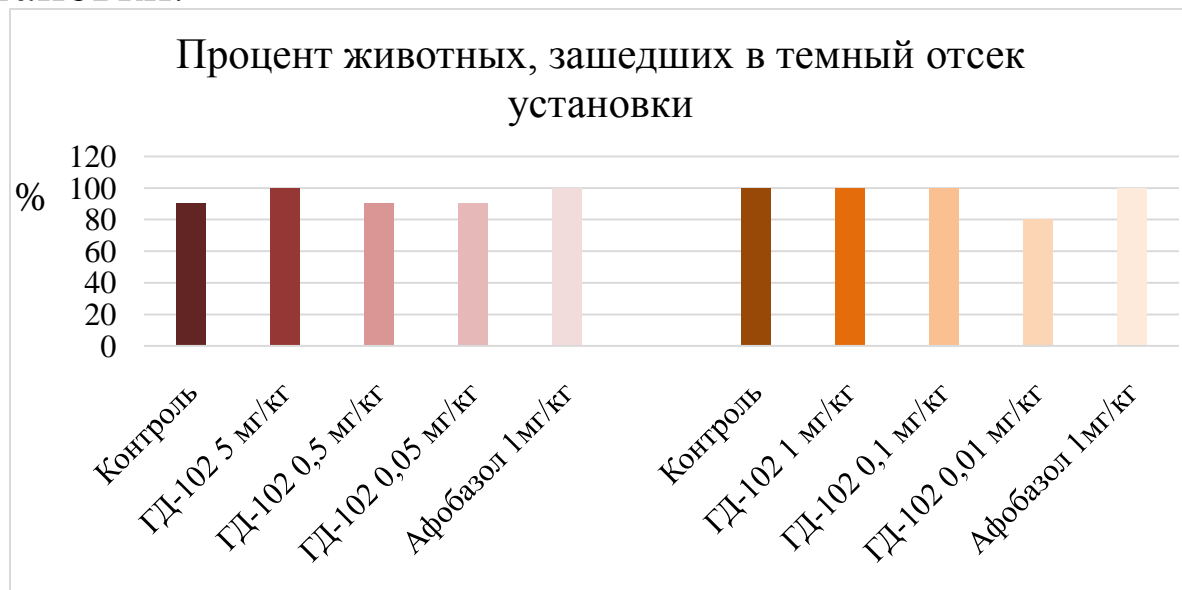
- Для оценки двигательной активности использовали установку "Opto-Varimex",
- для регистрации ориентировочно-исследовательского поведения применяли тест «залезания на сетку»,
- изучение миорелаксантных свойств проводили в тестах "вращающегося стержня" и «горизонтальная перекладина».

Результаты. Установлено, что в условиях методики «Opto-Varimex» ГД-102 в дозах 5,0; 1,0; 0,1 и 0,01 мг/кг не вызывает по сравнению с контролем изменений горизонтальной двигательной активности животных, а в дозах 0,5 и 0,05 мг/кг увеличивает двигательную активность животных по сравнению с контролем соответственно в 1,6 и 1,5 раза.

Влияние соединения ГД-102 на горизонтальную двигательную активность мышей у установке «Opto-Varimex»



В тесте «залезания на сетку» показано, что ГД-102 в диапазоне доз от 0,01 до 5,0 мг/кг, также, как препарат сравнения афобазол, не оказывает влияния на ориентировочно-исследовательское поведение животных: мыши как контрольных, так и опытных групп активно в течение 5 мин исследовали нижнюю освещенную и, особенно, верхнюю затемненную часть установки.



При изучении миорелаксантных свойств установлено, что ГД-102 в диапазоне доз от 0,01 до 5 мг/кг не нарушает координацию движений в тесте вращающегося стержня – мыши удерживались на стержне в течение 2-х мин регистрации, а также не нарушает рефлекс подтягивания на горизонтальной перекладине.

Заключение. Дипептидный лиганд TSPO - соединение ГД-102 в дозах 0,05 и 0,5 мг/кг оказывает активирующий эффект на двигательную активность животных, и в широком диапазоне доз (0,01; 0,05; 0,1; 0,5; 1,0 и 5,0 мг/кг) не проявляет побочного седативного и миорелаксантного действия.