

چکیده

سننز و ارزیابی اثر فارماکولوژیک مشتقات جدید دی‌هیدروپیریدین حاوی استخلاف اتری در موقعیت ۲ حلقه به عنوان مسدد کانال کلسیم

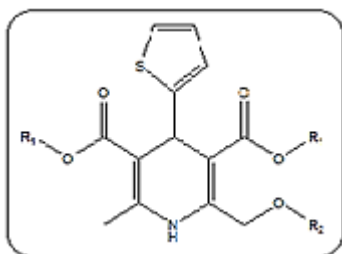
حسین صادقی‌پور، رامین میری، کتایون جاویدنیا، حکیمه هاشمی

دانشگاه علوم پزشکی شیراز، دانشکده داروسازی، گروه شیمی دارویی

یون کلسیم کاتیونی حایز اهمیت است که به عنوان یک پیامبر داخل سلولی تحریک غشا را به پاسخ سلولی ارتباط می‌دهد و در بسیاری از پروسه‌های اصلی سلولی درگیر است. تبادل Ca^{2+} از فضای خارج سلولی از طریق کانال‌های کلسیمی جهت تنظیم غلظت Ca^{2+} درون سلولی مهم است. به دلیل نقش مهم کانال‌های کلسیمی وابسته به ولتاژ در بسیاری از عملکردهای سلولی، این کانال‌ها هدف تعدادی زیادی از عوامل فارماکولوژیک محسوب می‌شوند. در میان تنظیم‌کننده‌های این کانال‌های کلسیمی، ترکیبات ۴,۱-دی‌هیدروپیریدینی به واسطه گستردگی فعالیت و استفاده کلینیکی مورد توجه ویژه قرار گرفته است. در این مطالعه مشتقات جدید ۴,۱-دی‌هیدروپیریدین طراحی شده است که دارای استرهای متیل یا اتیل در ناحیه ۵,۳ و استخلاف‌های متفاوت اتری در ناحیه C_2 حلقه دی‌هیدروپیریدین هستند. این ترکیبات با روش کروماتوگرافی لایه نازک، جداسازی و خالص شدند و با روش‌های IR، Mass و 1H NMR مورد تایید قرار گرفتند.

اثر فارماکولوژیک این ترکیبات به عنوان آنتاگونیست کانال کلسیم بر انقباض ناشی از (40mM)KCl در ماهیچه‌های صاف ایلتوم کوچک هندی مورد ارزیابی قرار گرفت. نتایج به دست آمده نشان داد که این ترکیبات همگی دارای فعالیتی کمتر از نیفیدپین می‌باشند.

لغات کلیدی: ۴,۱-دی‌هیدروپیریدین، مسددهای کانال کلسیم، ماهیچه صاف ایلتوم کوچک هندی



	R ₁	R ₂		R ₁	R ₂
3a	Et	Me	3e	Me	Me
3b	Et	Et	3f	Me	Et
3c	Et	i-Pro	3g	Me	n-Pro
3d	Et	n-Pro	3h	Me	Phenyl