

The regulating inotropic activity of 6-substituted-oxy-[1,2,4]triazolo[3,4-*a*]phthalazine

Cheng-Xi WEI ¹ #, Qi CAO ² #, Guo-Hua GONG ^{1,4}, Qing-Hua JIN ³ *, & Zhe-Shan QUAN ⁴ *

¹ Medicinal Chemistry and Pharmacology Institute,

Inner Mongolia University for the Nationalities, Tongliao City, Inner Mongolia, 028000, P.R. China

² Department of Pathology, Yanbian University College of Medicine, Yanbian 133002, Jilin, China

³ Department of Physiology, Yanbian University College of Medicine, Yanji 133002, P.R. China

⁴ College of Pharmacy, Yanbian University, Yanji 133002, P.R. China

SUMMARY. In a previous research, we synthesized and evaluated the anticonvulsant activity of a series of 6-substituted-oxy-[1,2,4]triazolo[3,4-*a*]phthalazine compounds. Reference to other studies, we deduce that the compounds may be useful for regulating inotropic activity by effecting stroke volume, so in this study, we evaluated 20 compounds (**15a-t**) for their changed inotropic activity by measuring the left atrium stroke volume in heart preparations isolated from Wistar rats. Among the 20 compounds, **15j** was the most potent with an increased stroke volume of 27.39 ± 3.16 % at the concentration of 50 μ M, compound **15m** was identified as the most potent with a decreased stroke volume of -95.59 ± 0.50 % at the same concentration which is much more effective than referenced drug Nifedipine (-55.22 ± 1.87 % at the concentration of 1 μ M).

RESUMEN. En una investigación anterior hemos sintetizado y evaluado la actividad anticonvulsiva de una serie de compuestos 6-oxi-sustituidos de [1,2,4]triazolo[3,4-*a*]ftalazina. Al revisar otros estudios se deduce que los compuestos pueden ser útiles para regular la actividad inotrópica, por lo que en este estudio, se evaluó la actividad inotrópica de 20 compuestos (**15a-t**) mediante la medición del volumen sistólico de la aurícula izquierda en el corazón preparaciones aisladas de ratas Wistar. Entre los 20 compuestos, **15j** fue el más potente con un mayor volumen de movimiento de $27,39 \pm 3,16$ % a la concentración de 50 mM; el compuesto **15m** se identificó como el más potente con una disminución del volumen sistólico de $-95,59 \pm 0,50$ % en la misma concentración, que es mucho más eficaz que el fármaco de referencia nifedipina ($-55,22 \pm 1,87$ % a la concentración de 1 μ M).

KEY WORDS: inotropic activity, stroke volume, [1,2,4]triazolo[3,4-*a*] phthalazine.

* Authors to whom correspondence should be addressed. E-mails: zsquan@ybu.edu.cn, yqinghua@ybu.edu.cn

These authors contributed equally to this work.