



A study of the Antinociceptive, Anti-Inflammatory, and Toxicological Activity of a Promising Thiophene Derivative

Clélia A.X. MOTA ¹, Antônia R.S. PENHA ¹, Alisson M. OLIVEIRA ¹, Diogo V. FONSÊCA ^{*},
Ana K.H.L. MAIA ¹, Aldeide O.B. ROCHA ¹, Ricardo O. MOURA ³,
Francisco J.B. MENDONÇA JUNIOR ³, Liana C.M. PORDEUS ¹,
Reinaldo N. ALMEIDA ¹ & Margareth F.F.M. DINIZ ¹

¹ *Postgraduate Program in Natural Products and Bioactive Synthetics (PgPNSB),
Federal University of Paraíba (UFPB), João Pessoa, PB, Brazil*

² *Department of Medicine, Federal University of San Francisco Valley (UNIVASF),
Paulo Afonso, BA, Brazil*

³ *State University of Paraíba, Biological Science Department,
Laboratory of Synthesis and Drug, João Pessoa, PB, Brazil*

SUMMARY. This study aims to investigate the effects of the thiophene derivative 2-[(4-nitro-3-benzylidene)-amino]-4,5,6,7-tetrahydro-4*H*-benzo[*b*]thiophene-3-carbonitrile (6CN10) in experimental models of nociception and inflammation. Acute treatment with 6CN10 (25, 50, and 100 mg/kg, i.p.) showed antinociceptive activity by a mechanism of action that is most likely to be independent of opioid receptors. Evaluation of anti-inflammatory activity showed an inhibition of neutrophil migration into the intraperitoneal cavity of animals treated with the test substance. In the acute toxicological study of 6CN10 (1000 mg/kg, i.p.), a reduction in food intake and body weight of the treated females were observed. The analyzed hematological parameters were unaffected, but treatment with 6CN10 increased the levels of alanine transaminase and aspartate aminotransferase, corroborating the histopathological findings that showed evidence of hepatotoxicity. The results presented in this study show 6CN10 to have promising analgesic activity; however, the safety of the compound should be better investigated.

RESUMEN. Este estudio tiene como objetivo investigar los efectos del derivado de tiofeno 2-[(4-nitro-3-bencilideno)-amino]-4,5,6,7-tetrahidro-4*H*-benzo[*b*]tiofeno-3-carbonitrilo (6CN10) en modelos experimentales de nocicepción e inflamación. El tratamiento agudo con 6CN10 (25, 50 y 100 mg/kg, i.p.) mostró actividad antinociceptiva por un mecanismo de acción que es más probable que sea independiente de los receptores opioides. La evaluación de la actividad antiinflamatoria mostró una inhibición de la migración de neutrófilos a la cavidad intraperitoneal de los animales tratados con la sustancia de prueba. En el estudio toxicológico agudo de 6CN10 (1000 mg/kg, i.p.), se observó una reducción en la ingesta de alimentos y el peso corporal de las hembras tratadas. Los parámetros hematológicos analizados no se vieron afectados, pero el tratamiento con 6CN10 aumentó los niveles de alanina transaminasa y aspartato aminotransferasa, lo que corrobora los hallazgos histopatológicos que mostraron evidencia de hepatotoxicidad. Los resultados presentados en este estudio muestran que 6CN10 tiene una actividad analgésica prometedora. Sin embargo, la seguridad del compuesto debería investigarse mejor.

KEY WORDS: antinociception, anti-inflammatory, thiophene derivative, toxicity.

* Author to whom correspondence should be addressed. *E-mail:* divilar@hotmail.com