

Perkembangan Pengembangan Inhibitor Selektif COX-2 dengan Metode Hubungan Struktur-Aktivitas: Ulasan Artikel = Progress of COX-2 Selective Inhibitor Development by Structure-Activity Relationship Method: Article Review

Hanifah Sakinatun Khalidah, author

Deskripsi Lengkap: <https://lib.ui.ac.id/detail?id=20506895&lokasi=lokal>

Abstrak

Obat Antiinflamasi Nonsteroid (AINS) merupakan salah satu obat anti-inflamasi yang dipakai secara luas oleh pasien tertentu. Mekanisme kerja AINS umumnya adalah menghambat sintesis prostaglandin dengan menghambat aktivitas COX secara tidak selektif. Adanya inhibisi COX-1 dapat menyebabkan timbulnya efek samping pada saluran gastrointestinal. Walaupun begitu, AINS masih tetap menjadi obat pilihan untuk terapi inflamasi. Karena itu, sampai saat ini pengembangan baru obat AINS masih dilakukan, khususnya untuk memperoleh inhibitor selektif COX-2 dengan profil keamanan yang baik, terlebih dengan munculnya fakta bahwa inhibitor selektif COX-2 dapat menyebabkan risiko kardiovaskular. Beberapa penelitian pengembangan inhibitor selektif COX-2 telah dilakukan menggunakan derivat-derivat tertentu dengan memperhatikan hubungan antara struktur dan aktivitas. Dari hasil penelitian-penelitian tersebut diketahui bahwa gugus aminosulfonil dan metansulfonil merupakan bagian terpenting dalam menghasilkan selektivitas terhadap COX-2 dan efikasinya. Ulasan ini membahas lebih lanjut perkembangan pengembangan inhibitor selektif COX-2 berdasarkan pengaruh modifikasi struktur terhadap tingkat selektivitasnya sehingga dapat menghasilkan senyawa dengan risiko kardiovaskular yang rendah.

.....

Nonsteroidal Anti-inflammation Drugs (NSAID) is one of anti-inflammation drug that is used extensively by certain patients. The mechanism of action of NSAID is by inhibiting prostaglandins synthesis by inhibiting COX activity. Inhibition of COX-1 activity can lead to some side effects in the gastrointestinal tract. However, NSAID is still a drug of choice. Therefore, until now, new drug NSAID development is still being carried out, primarily to obtain COX-2 selective inhibitors with a good safety profile, especially with the emergence of the fact that COX-2 selective inhibitors can cause cardiovascular risk. Some research for developing COX-2 selective inhibitor has been done using certain derivatives by considering the relationship between its structure and activity. The results of these studies are known that the aminosulfonyl and methanesulfonyl groups are the most important part of producing selectivity to COX-2 and its efficacy. This review further discusses the development of COX-2 selective inhibitors based on the effect of structural modification on its level of selectivity to produce compounds with low cardiovascular risk.