ПОИСК 2-ОКСИНДОЛЬНЫХ ИНГИБИТОРОВ АЛЬФА-ГЛЮКОЗИДАЗЫ

**О.С. Киктева¹, И.А. Пешкурова¹, В.Г. Клочков¹, Е.Н. Безсонова²,
Д.Д. Мелехина², М. Дубар²**

¹Кафедра фармакологии и биоинформатики, ФГБОУ ВО ВолгГМУ Минздрава России,
400131, Россия, Волгоград, пл. Павших борцов, 1.

²Кафедра медицинской химии и тонкого органического синтеза химического факультета,
ФГБОУ ВО МГУ, 119991, Москва, Ленинские горы, дом 1, строение 3, ГСП-1.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-350

E-mail: olusha_kik@icloud.com

Изучено влияние 24 новых производных 2-оксиндола на активность альфа-глюкозидазы [1]. Выявлено 6 соединений, оказывающих большее ингибирующее действие на альфа-глюкозидазу в концентрации 100 мкМ, чем препарат сравнения (Акарбоза); 4 исследуемых производных (К-170(1), К-127, К-165 и К-248) превосходят акарбозу по величине показателя IC_{50} . Показано что производные 3-арилиден-2-оксиндолов при наличии в положении C3 (R^1) карбоциклического радикала с заместителем в *para*-положении и в положении C5 амидной группировки возрастает ингибирующая альфа-глюкозидазу активность веществ. Выявлено соединение К-170 ($IC_{50} = 6,78$ мкМ), превосходящее по активности соединения сравнения ($IC_{50} 436,70$ мкМ).

Рис. 1. Структурная формула изученных веществ.

Соединение К-170(1) оказывает достоверный антигипергликемический эффект (п/о, 5 мг/кг) в тестах толерантности к дисахаридам (мальтозе, сахарозе); влияния на уровень постпрандиальной гипергликемии в тесте толерантности к глюкозе выявлено не было, что подтверждает выявленный механизм действия изучаемого соединения.

Литература

1. Лозинская Н.А., Зарянова Е.В., Бабков Д.А., Клочков В.Г., Спасов А.А., Ефремов А.М., Безсонова Е.М. Ц.М.Д. Патент №2734495 Способ лечения сахарного диабета. 2020.