СИНТЕЗ И ИССЛЕДОВАНИЕ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ ПРОИЗВОДНЫХ 2-ОКСИНДОЛА

Р.О. Еремеев, А.М. Ефремов, Е.Н. Безсонова

Московский государственный университет имени М.В.Ломоносова,
Химический факультет, Москва, Россия

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-402

E – mail: roma.chem.dep@mail.ru

В медицине широко описано такое заболевание как глаукома, приводящее к необратимой слепоте. При глаукоме происходит повреждение зрительного нерва, причиной которого является повышение внутриглазного давления (ВГД). В нашей лаборатории было показано, что производные 2-оксиндола способны понижать ВГД, что позволяет использовать их для терапии глаукомы [1].

В работе [2] описан (5-метоксикарбониламино-2-оксиндол-3-ил)ацетонитрил, показавший наибольшую активность на нормотензивных кроликах (Δ ВГД, % (время макс. эфф., ч) = 41 ± 7). Его эффект превышал как эффект мелатонина, так и эффект стандартного гипотензивного лекарства – тимолола.

Поскольку синтез этого соединения протекал либо с невысоким выходом, либо требовал реализации семи стадий, в данном исследовании разработана методика получения и выделения промежуточных аминов, а также (метоксикарбониламино-2-оксиндол-3-ил)уксусных кислот и (метоксикарбониламино-2-оксиндол-3-ил)ацетонитрилов с хорошими выходами, без использования защитных групп и с меньшим количеством стадий (4 стадии).

Активность всех полученных соединений изучена *in vivo* совместно с НИИ Глазных Болезней им. Гельмгольца.

Работа выполнена при поддержке гранта РФФИ (проект 20-03-00915)

Литература

1. Zaryanova E.V., Lozinskaya N.A., Beznos O.V., Volkova M.S., Chesnokova N.B., Zefirov N.S. Oxindole-based intraocular pressure reducing agents // *Bioorg Med Chem Lett*. 2017; Vol. 27(16), P:3787-3793.
2. Зарянова Е.В. Новые производные 2-оксиндола: синтез и перспективы применения в качестве лекарственных препаратов // Диссертация на соискание ученой степени кандидата химических наук. 2019.