

Облікова картка ДіР



I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0215U004237

Державний реєстраційний номер: 0112U001742

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 17-02-2015

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 1

Назва етапу: Структурні закономірності функціонування нових похідних гетеро- та макрогетероциклів як потенційних біологічно активних сполук

Початок етапу: 01.2012

Закінчення етапу: 12.2014

Вид звітнього документа: Остаточний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Одеський національний університет ім. І. І. Мечникова. Наукова частина

Код за ЄДРПОУ: 02071091

Місцезнаходження:

Форма власності:

Сфера управління: Міністерство освіти і науки України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: (048)7317151 , 7317151

IV. Відомості про співвиконавців ДіР

V. Відомості про замовника ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Інститут енергозбереження та енергоменеджменту Національного технічного університету України "Київський Політехнічний Інститут"

Код за ЄДРПОУ: 00027677

Місцезнаходження: пр. Перемоги 37, м. Київ, Київ, 03056, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Міністерство освіти і науки України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 0442048428

VI. Джерела, напрями та обсяги фінансування ДіР

Підстава для проведення ДіР: 34 - договір (замовлення) з центральним органом виконавчої влади, академією наук (головними розпорядниками бюджетних коштів на проведення НДДКР)

Напрямок фінансування: 2.1 - фундаментальні дослідження

Джерела фінансування

7713 - кошти держбюджету

Код програмної класифікації видатків і кредитування (КПКВК): 2201020

Фактичний обсяг фінансування (тис. грн.): 933.709
--

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Структурні закономірності функціонування нових похідних гетеро- та макрогетероциклів як потенційних біологічно активних сполук

Назва роботи англійською:

Structural patterns of functioning of novel hetero- and macroheterocycles as potential biologically active compounds

Реферат українською:

Об'єкт дослідження- похідні дигідро- та тетрагідропіримідинів, синтетичні порфірини з гетероциклічними мезо-замісниками, кватернізовані галоген- та тозилоексалькілсульфокислотами з різною довжиною алкільного ланцюга. Мета роботи - створення концепції цілеспрямованого пошуку ефективних та безпечних ноотропів та актопротекторів на основі вивчення залежності фармакологічної активності від структури похідних піримідину та перевірка гіпотези про вирішальний вплив природи цвітер-іонних замісників на поведінку порфіринових сполук у біологічних системах. Основні гіпотези проекту - знання про механізми дії речовин, які мають ноотропну та актопротекторну активність, а також про зв'язок між їх структурою та властивостями можуть слугувати підставою ціле-спрямованого створення високоефективних та безпечних ноотропів та актопротекторів. Антимікробна активність порфіринів значною мірою визначається природою цвітер-іонних замісників в макроциклі. Синтезовані потенційні актопротектори і антигіпоксанти на основі 4,5-заміщених піримідинів, тіопіримідинів, 5-алкіл-2-тіобарбітурової ки-слоти, хіназолінтіонів та 1,4-бензодіазепін-2-тіонів з аміноалкільними та арилпіперазинілбутильними замісниками. Їх фармакологічна активність вивчена на моделях нормобаричної та гемічної гіпоксії, нормо-, гіпо- та гіпертермії. Показано, що похідні 2-меркаптопіримідину мають виражену актопротекторну та антигіпоксичну активність, стимулюють високу працездатність в умовах екстремальних навантажень та по активності перевищують препарат порівняння бемітил. Ці сполуки мали також високу анксиолітичну активність. Усе вищезгадане робить ці речовини дуже привабливими у якості потенційних ліків - актопротекторів, антигіпоксантів та анксиолітиків. Цвітер-іонні порфірини з ізомерними хінолінільними замісниками кватернізовані біфункціональними кватернізуючими агентами показали значну антимікробну активність щодо тест-штамів умовно патогенних мікроорганізмів при помірній токсичності до клітинних культур.

Реферат англійською:

The objects of investigations - the derivatives of dihydro- and tetrahydropyrimidine, the synthetic porphyrins with heterocyclic meso-substituents quaternized by halogen- and tosyloxyalkylsulfonic acids with different alkyl chain length. The goal of the work - to establish of the concept of targeted search for effective and safe nootropics and actoprotectors based on the study of pharmacological activity, depending on the structure of pyrimidine derivatives and decisive influence of the nature of zwitterionic substituents on the behavior of porphyrin compounds in biological systems. The main hypothesis of the project - knowledge of the mechanisms of action of substances that have nootropic and actoprotective activity, as well as the relationship between their structure and biological activity can serve as a basis for the purposeful creation of highly effective and safe and nootropics and actoprotectors. Antimicrobial activity of porphyrins is largely determined by the nature zwitterionic substituents in the macrocycle. A potential actoprotectors and antihypoxants have been synthesized based on 4,5-substituted pyrimidines, thiopyrimidine, 5-alkyl-2-thiobarbituric acid, quinazolinethiones and 1,4-benzodiazepin-2-thiones with aminoalkyl and arylpiperazinylbutyl substituents. Their pharmacological activity were studied in models of normobaric hypoxia, hemic hypoxia, normothermia, hypothermia and hyperthermia. It is shown that derivatives of 2-mercaptopyrimidine have expressed actoprotective and antihypoxic activity, stimulate high performance under extreme loads and to exceed the reference drug activity bemithyl. These compounds also have high anxiolytic

activity. All of the above mentioned makes these materials very attractive as potential drugs – actoprotector, antihypoxants and anxiolytics. Zwitterionic porphyrins isomeric quinolinyl substituents, quaternized difunctional quaternizing agents showed significant antimicrobial activity against the test strains of pathogenic microorganisms suspended in moderate toxicity to the cell cultures.

Індекс УДК: 547.8, 547.861:615.213: 577.379: 547.979.732

Коди тематичних рубрик: 31.21.27.07

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові: Галкін Борис Миколайович

Науковий ступінь:

Вчене звання:

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

VIII. Наукова (науково-технічна) продукція (НТП)

Назва НТП українською: Концепція цілеспрямованого пошуку ефективних та безпечних ноотропів та актопротекторів на основі вивчення залежності фармакологічної активності від структури похідних піримідину. Підтверджена гіпотеза про вирішальний вплив природи цвітер-іонних замісників на поведінку порфіринових сполук у біологічних системах.

Назва НТП англійською: The concept of a targeted search of effective and safe nootropics and actoprotectors based on the study of pharmacological activity, depending on the structure of pyrimidine derivatives. Confirmed the hypothesis about decisive influence of nature of zwitterionic substituents on the behavior of porphyrin compounds in biological systems.

НТП, яку передбачалося створити:

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати:

Галузь застосування: 73.10.1

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Синтезовані потенційні актопротектори і антигіпоксанти на основі 4,5-заміщених піримідинів, тіопіримідинів, 5-алкіл-2-тіобарбітурової кислоти, хіназолінтіонів та 1,4-бензодіазепін-2-тіонів з аміноалкільними та арилпіперазинілбутильними замісниками. Цвітер-іонні порфірини з ізомерними хінолінільними замісниками кватернізовані біфункціональними кватернізуючими агентами показали значну антимікробну активність щодо тест-штамів умовно патогенних мікроорганізмів при помірній токсичності до клітинних культур.

Соціально-економічна спрямованість НТП:

Вплив НТП на довкілля:

Впровадження НТП: Не впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: ----

Закінчення етапу:

Споживачі продукції: ВНЗ

Перспективні ринки: -----

Характер співробітництва з інвестором

Потрібний обсяг інвестицій, тис. грн.: 500

Права, що надаються інвестору після завершення роботи:

Наявність бізнес-плану: Ні

Техніко-економічне обґрунтування: Ні

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.: 0

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація: за договором

ІХ. Бібліографічний опис

Ішков Ю.В., Галкін Б.М., Кириченко Г.М., Водзінський С.В. Мазепа О.В., Кісель Є.С. Синтез водорозчинного 5,10,15,20-тетра(Н-метил-6-хінолініл)бактеріохлорину // Вісник ОНУ, серія Хімія. - 2012. - Т.16, № 13-14. - С.102-105. Джамбек А.А., Джамбек О.И., Блайда И.А., Ишков Ю.В. Кислородный электрод на основе некоторых порфиринов и их производных // Вісник ОНУ, серія Хімія. - 2012. - Т.17, № 1. - С.58-63. Ішков Ю.В., Кириченко Г.М., Ганевич В.М., Водзінський С.В., Мазепа О.В. Синтез та властивості стерично утрудненого водорозчинного порфірину // Вісник ОНУ, серія Хімія. - 2012. - Т.17, №4. - С.52-55. Кириченко А.М., Галкин Б.Н., Ишков Ю.В., Водзинский С.В. Порфирины с 8-ами-нохинолинильными заместителями // Тез. докл. Международной молодежной науч-ной школы "Химия порфиринов и родственных соединений", Россия, Иваново, 23-28 сент. 2012. -- С.53-54. Соболева С.Г., Андронати С.А., Карасева Т.Л., Костенко Е.А. Синтез и акто-протекторные свойства производных 2-(?-морфолино)этилмеркапто-1,6-дигидро-пиримидина // Доповіді Національної академії наук України. - 2013. - № 2. - С. 119-124. Смульский С.П., Соболева С.Г., Андронати С.А., Павловский В.И., Гаврилович Я.В., Бойко И.А., Полищук П.Г. Термодинамические аспекты комплексообразования 1-фенил-4-[2-(N-фталимидо)бутил]пиперазина и 1-(3-хлорфенил)-4-[2-(N-фталимидо)бутил]пиперазина с 5-HT_{1A} серотониновыми рецепторами // Матеріали ХХІІІ Української конференції з органічної хімії, присвяченої 95-річчю Національ-ної Академії наук України, 16-20 вересня 2013 р, м. Чернівці, С.251. Ішков Ю.В., Галкін Б.М., Кириченко Г.М., Водзінський С.В. Спосіб отримання чи-стих ізомерних 5- та 7-метил-8-нітрохінолінів // Патент на корисну модель № 84756, МПК C07D 215/18, зареєстровано 25.10.2013 р. Березовский В.В., Ишков Ю.В., Мазепа А.В. Производные тетрафенилпорфирина с терминальным стирильным фрагментом на полиметиленовом спейсере // Макрогетероциклы. - 2013. - Т.6, № 3. - С.251-256. Водзінська Н.С, Семенець А.С., Ішков Ю.В., Кириченко Г.М. Інгібування фагової активності асиметрично-заміщеними піридилпорфіринами // Збірник тез доповідей ХІІІ з'їзду Товариства мікробіологів України ім. С.М. Виноградського (ТМУ). - 1-6 жовтня 2013 р., м. Ялта. - С. 444. Водзінська Н.С., Галкін Б.М., Водзінський С.В., Філіпова Т.О. Антифагова актив-ність асиметрично-заміщених піридилпорфіринів // Мікробіологія і біотехнологія. - 2013. - № 3. - С. 94-103. 11. Tereshchenko A., Viter R., Konup I., Ivanitsa V., Geveliuk S., Ishkov Yu., Smyntyna V. TiO₂ optical sensor for amino acid detection // Proc. SPIE 9032, Biophotonics-Riga 2013, 90320T (November 18, 2013) Tereshchenko A., Viter R., Konup I., Ivanitsa V., Geveliuk S., Ishkov Yu., Smyntyna V. TiO₂ porphyrin nanostructures for amino acid detections // Photoelectronics. - 2013. - № 22. - P.8-14. Андронати С.А., Карасева Т.Л., Замковая А.В., Соболева С.Г., Бойко И.А., Касьян Л.И., Цимбал Д.И. Лиганды 5-HT₁ и D₂ рецепторов - N-(арилпиперазинил)бутил-имиды бицикло[2.2.1]гепт-5-ен-эндо-эндо-2,3-дикарбоновой кислоты и их нейротропные свойства // Журнал Органич. и Фарм. Химии. - 2013. - Т.11, № 4 (44). - С.72-76. Ішков Ю.В., Галкін Б.М. Хімія формілпорфіринів, Одеса, різнограф - 2014. - 89с. Ішков Ю.В., Галкін Б.М., Кириченко Г.М., Водзінський С.В. Спосіб отримання меланіну з виноградних вичавок, заявка № u201408994 від 11.08.2014, позитивне рі-шення про видачу патенту на корисну модель від 02.12.2014. Карасева Т.Л., Битенский В.С., Соболева С.Г., Цапенко Ж.Н., Муратова Т.Н., Полясный В.А., Годлевский Л.С. Нейротропные свойства лептина и его влияние на фармакологическую активность агонистов бенздиазепиновых и серотониновых (5-HT_{1A}) рецепторов // Вісник психіатрії та психофармакотерапії: - 2014, № 2(26). - С.38-44.

Х. Заключні відомості

Керівник юридичної особи

Коваль Ігор Миколайович

Перелік осіб-виконавців

Ішков Юрій Васильович

Водзінський Сергій Валентинович

Ганевич Віктор Миколайович

Кириченко Ганна Михайлівна

Соболева Світлана Григорівна

**Відповідальний за підготовку
облікових документів**

Телефон

Реєстратор

**Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є
відповідальним за реєстрацію наукової
діяльності**

