

Облікова картка ДіР



I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0213U002333

Державний реєстраційний номер: 0112U003750

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 23-01-2013

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 1

Назва етапу: Дизайн структур та розробка методів синтезу нових потенційних інгібіторів топоізомерази I. Дослідження їхнього впливу на активність фермента в системі релаксації ДНК in vitro. Вивчення взаємодії сполук з ДНК і топоізомеразним комплексом біохімічними та фізико-хімічними методами.

Початок етапу: 05.2012

Закінчення етапу: 12.2012

Вид звітнього документа: Проміжний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Інститут молекулярної біології і генетики НАН України

Код за ЄДРПОУ: 05417101

Місцезнаходження:

Форма власності:

Сфера управління: Національна академія наук України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: (044) 526-11-69

IV. Відомості про співвиконавців ДіР

V. Відомості про замовника ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Національна академія наук України

Код за ЄДРПОУ: 00019270

Місцезнаходження: вул. Володимирська, 54, м. Київ, Київська обл., 01030, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Національна академія наук України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380442396594

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): 6541030

Фактичний обсяг фінансування (тис. грн.): 60

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Дизайн, синтез і біологічне тестування нових гетероциклічних інгібіторів топоізомерази I як потенційних протипухлинних препаратів

Назва роботи англійською:

Design, synthesis and biological testing of new heterocyclic inhibitors of topoisomerase I as potential antitumoral agents

Реферат українською:

Отримано серію нових гетероциклічних сполук кількох класів – похідних бензімідазолу, феназину, хіноліну, ціанінів та ін. Досліджено біологічну активність цих речовин *in vitro* в ферментативній системі релаксації ДНК плазмиди pTZ19R топоізомеразою I *E.coli*. Арил-заміщені похідні бензімідазолу в концентрації 50-100 мкМ виявляють інгібуючий вплив на фермент. Похідні ціанінів є високоактивними інгібіторами топоізомерази I: ряд сполук кількісно пригнічує активність фермента в концентрації 2-10 мкМ, а для найактивнішого ціаніну величина IC₉₀ становить 1 мкМ. Показано, що ціаніни ефективно зв'язуються з ДНК, утворюючи стійкі комплекси, що й визначає їх біологічну активність. Для інших сполук таке зв'язування слабке чи відсутнє. Інгібуюча дія похідної бензімідазолу CL5 може ґрунтуватися на її зв'язуванні з топоізомеразою.

Реферат англійською:

The series of new heterocyclic compounds of several classes, derivatives of benzimidazole, phenazine, quinoline, cyanines etc., were obtained. Their biological activity was studied *in vitro* in the enzymatic system of pTZ19R plasmid DNA relaxation by topoisomerase I *E.coli*. Aryl-substituted benzimidazole derivatives reveal inhibitory effect on the enzyme at 50-100 uM concentration. Cyanine derivatives are highly active topoisomerase inhibitors: a number of compounds quantitatively suppress enzyme activity at 2-10 uM concentration, and for the most active cyanine the IC₉₀ value is equal to 1 uM. It was shown that cyanines efficiently bind to DNA forming stable complexes that determines their biological activity. For the other compounds this binding was found to be weak or absent. Inhibition activity of benzimidazole derivative CL5 may be based on its binding to topoisomerase.

Індекс УДК: 615.2.03, 615.277.3+577.151+547.8

Коди тематичних рубрик: 76.31.29

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові: Дубей Югр Ярославович

Науковий ступінь: д. х. н.

Вчене звання: с.н.с.

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

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

IX. Бібліографічний опис

Звіт про виконання першого етапу проекту

Х. Заключні відомості

Керівник юридичної особи

Єльська Ганна Валентинівна

д. б. н.

Перелік осіб-виконавців

Ільченко М.М.

Дубей Л.В.

Костенко О.М.

Криворотенко Д.В.

Кузів Я.Б.

Негруцька В.В.

**Відповідальний за підготовку
облікових документів**

Телефон

Реєстратор

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

