Облікова картка ДіР

I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0226U003584

Державний реєстраційний номер: 0122U000657

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 20-04-2026

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 2

Назва етапу: Молекулярний дизайн та синтез нових похідних 2-аміно-3H-хіназолін-4-ону, що містять у другому положенні хіназолінового гетероциклу піперазиновий, гомопіперазиновий або 2,5-діазабіцикло[2.2.1]гептановий фрагменти. Вивчання антиагрегаційної активності. Синтез похідних нафталіміду, що містять замісники у ароматичному ядрі, як потенційних противірусних агентів. Синтез оксимів інденохіноксалінону. Вивчення противірусної активності та афінітету до ДНК цільових сполук.

Початок етапу: 01.2023

Закінчення етапу: 12.2023

Вид звітного документа: Проміжний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Фізико-хімічний інститут ім. О. В. Богатського Національної академії наук України

Код за ЄДРПОУ: 03534535

Місцезнаходження: Люстдорфська дорога, буд. 86, м. Одеса, Одеська обл., 65080, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Національна академія наук України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380487662044

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, буд. 54, м. Київ, 01601, Україна

Форма власності:

Сфера управління:

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380442343243

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)

Напрям фінансування: 2.1 - фундаментальні дослідження

Джерела фінансування

7713 - кошти держбюджету

Код програмної класифікації видатків і кредитування (КПКВК): 6541030

Фактичний обсяг фінансування (тис. грн.): 2112.600

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Дизайн, синтез і структурно-функціональне дослідження нових антиагрегаційних засобів та тетрациклічних систем як противірусних, протизапальних агентів

Назва роботи англійською:

Design, synthesis and structural-functional research of new antiplatelet agents and tetracyclic systems as antiviral, anti-inflammatory agents

Реферат українською:

Мета дослідження: Спрямований дизайн та синтез потенційних антагоністів фібриногенових рецепторів, лігандів ДНК та інгібіторів JNK, вивчення функціональної біологічної активності цільових сполук та встановлення зв'язку "структура - властивості - молекулярний механізм дії". Здійснено направлений синтез похідних 2-(піперазин-1-іл)хіназолін-4-ону, 2-(гомопіперазин-1-іл)хіназолін-4-ону та 2-(2,5-діазабіцикло[2.2.1]гептан-2-іл)хіназолін-4-ону. Показано, що досліджені похідні 2,6-заміщених хіназолін-4-ону інгібують зв'язування фібриногену з □IIb□3 з показниками IC50 від 33 мкМ до 0.1 мкМ. Також вивчено антиагрегаційні властивості синтезованих похідних 3H-хіназолін-4-ону та встановлено, що показники IC50 знаходяться у діапазоні від 62 мкМ до 0.04 мкМ. За розробленою раніше методикою були нароблені 7- та 9-(діалкіламіноалкіл)аміно триптантрини - потенційні інтеркалятори ДНК та противірусні агенти, та водночас – прекурсори для синтезу потенційних протизапальних препаратів. Оптимізовано методики синтезу 8-гідрокси та 8-амінотриптантрину – зручних попередників для синтезу водорозчинних похідних триптантрину – потенційних терапевтичних засобів. Виходячи з N-(4-гідроксіфеніл)ацетаміду синтезовані 7(8)-(діалкіламаноетокси)інденохіноксалінони у вигляді регіозомерної суміші. розділення суміші та встановлення абсолютної конфігурації продуктів триває. Методом флуориметричного титрування вивчено афінітет синтезованих сполук до ДНК. Всі вивчені сполуки відносяться до інтеркаляторів помірної сили.

Реферат англійською:

The purpose of the research: Directed design and synthesis of potential fibrinogen receptor antagonists, DNA ligands and JNK inhibitors, study of functional biological activity of target compounds and establishment of the "structure - properties - molecular mechanism of action" relationship. The directed synthesis of 2-(piperazin-1-yl)quinazolin-4-one, 2-(homopiperazin-1-yl)quinazolin-4-one and 2-(2,5-diazabicyclo[2.2.1]heptan-2-yl)quinazolin-4-one derivatives was carried out. It was shown that the studied 2,6-substituted quinazolin-4-one derivatives inhibit the binding of fibrinogen to □IIb□3 with IC50 values from 33 μM to 0.1 μM. The antiaggregatory properties of the synthesized 3H-quinazolin-4-one derivatives were also studied and it was found that the IC50 values are in the range from 62 μM to 0.04 μM. According to the previously developed method, 7- and 9-(dialkylaminoalkyl)amino triptanthrines were prepared - potential DNA intercalators and antiviral agents, and at the same time - precursors for the synthesis of potential anti-inflammatory drugs. The methods for the synthesis of 8-hydroxy and 8-aminotriptanthrine - convenient precursors for the synthesis of water-soluble triptanthrine derivatives - potential therapeutic agents - were optimized. Starting from N-(4-hydroxyphenyl)acetamide, 7(8)-(dialkylaminoethoxy)indenoquinoxalinones were synthesized in the form of a regioisomeric mixture. Separation of the mixture and establishment of the absolute configuration of the products are ongoing. The affinity of the synthesized compounds to DNA was studied by fluorimetric titration. All the studied compounds belong to intercalators of moderate strength.

Індекс УДК: 547.7/.8, 547.863.1+547 .7 56+547 .836+547.68+615.281 -8+615.276

Коди тематичних рубрик: 31.21.27

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові:Кузьмін Віктор Євгенович

Науковий ступінь: д. х. н.

Вчене звання: професор, член-кор.

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

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

Назва НТП українською: Похідні індоло[2,1-b]хіназолін-6,12-діону, індено[1,2-b]хіноксалін-11-ону та бензо[e]ізоіндол-1,3-діону.

Назва НТП англійською: Derivatives of indolo[2,1-b]quinazoline-6,12-dione, indeno[1,2-b]quinoxalin-11-one and benzo[e]isoindole-1,3-dione.

НТП, яку передбачалося створити: Створено

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати: Матеріали

Галузь застосування: Дослідження й експериментальні розробки у сфері інших природничих і технічних наук, медицина

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Похідні індоло[2,1-b]хіназолін-6,12-діону, індено[1,2-b]хіноксалін-11-ону та бензо[e]ізоіндол-1,3-діону є потенційні противірусні та протизапальні агенти засоби.

Соціально-економічна спрямованість НТП: Створення принципово нової продукції (матеріалів, технологій тощо) для забезпечення експортного потенціалу та заміщенню імпорту, Поліпшення якості життя та здоров'я населення, ефективності діагностики та лікування хворих

Вплив НТП на довкілля: Не впливає

Впровадження НТП: Не впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: 01.2023

Закінчення етапу: 12.2023

Споживачі продукції: Фармацевтичні підприємства. Вищі навчальні заклади.

Перспективні ринки: Україна

Характер співробітництва з інвестором

Потрібний обсяг інвестицій, тис. грн.:

Права, що надаються інвестору після завершення роботи:

Наявність бізнес-плану:

Техніко-економічне обгрунтування:

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.:

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація:

Назва НТП українською: Похідні 2-(піперазин-1-іл)хіназолін-4-ону, 2-(гомопіперазин-1-іл)хіназолін-4-ону та 2-(2,5-діазабіцикло[2.2.1]гептан-2-іл)хіназолін-4-ону.

Назва НТП англійською: Derivatives of 2-(piperazin-1-yl)quinazolin-4-one, 2-(homopiperazin-1-yl)quinazolin-4-one and 2-(2,5-diazabicyclo[2.2.1]heptan-2-yl)quinazolin-4-one.

НТП, яку передбачалося створити: Створено

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати: Матеріали

Галузь застосування: Дослідження й експериментальні розробки у сфері інших природничих і технічних наук, медицина.

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Похідні 2-(піперазин-1-іл)хіназолін-4-ону, 2-(гомопіперазин-1-іл)хіназолін-4-ону та 2-(2,5-діазабіцикло[2.2.1]гептан-2-іл)хіназолін-4-ону є потенційні антиагрегаційні лікарські засоби.

Соціально-економічна спрямованість НТП: Створення принципово нової продукції (матеріалів, технологій тощо) для забезпечення експортного потенціалу та заміщенню імпорту, Поліпшення якості життя та здоров'я населення, ефективності діагностики та лікування хворих

Вплив НТП на довкілля: Не впливає

Впровадження НТП: Не впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: 01.2023

Закінчення етапу: 12.2023

Споживачі продукції: Фармацевтичні підприємства. Вищі навчальні заклади

Перспективні ринки: Україна

Характер співробітництва з інвестором

Потрібний обсяг інвестицій, тис. грн.:

Права, що надаються інвестору після завершення роботи:

Наявність бізнес-плану:

Техніко-економічне обгрунтування:

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.:

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація:

IX. Бібліографічний опис

1) Карпенко О.С., Шибінська М.О., Ляхов С.А., Огніченко Л.М., Щепьоткін І.О., Кузьмін В.Є. 6Н-Індоло[2,3-b]хіноксаліни: синтез, активація лейкоцитів, QSAR аналіз. Біоактивні сполуки, нові речовини і матеріали / за загальною ред. А.І. Вовка. Київ: Інтерсервіс, 2023. С. 97–103.

2) Igor A. Schepetkin, Olexander S. Karpenko, Anastasia R. Kovrizhina, Liliya N. Kirpotina, Andrei I. Khlebnikov, Stepan I. Chekal, Alevtyna V. Radudik, Marina O. Shibinskaya, Mark T. Quinn Novel Tryptanthrin Derivatives with Selectivity as c-Jun N-terminal Kinase (JNK) 3 Inhibitors //Molecules.-2023.-Vol.28.-№12.-P 4806-4829. doi: 10.3390/molecules28124806

3) Igor Shchepetkin, Olexander Karpenko, Liliya Kirpotina, Mark Plotnikov, Andrei Khlebnikov, Mark Quinn Development of oxime derivatives as c-Jun n-terminal kinase inhibitors (JNK) and their therapeutic efficacy in models of rheumatoid arthritis and cerebral ischemia-reperfusion//5th International Conference on PharmScience Research & Development at Las Vegas, NV, USA during February 21-23, 2023

4) Шестеренко Ю.А., Карпенко О.С., Романовська І.І., Шевчук В.С. Сумісне застосування інгібіторів тирозинази //Тези доповідей V Міжнародної наукової конференції «Актуальні проблеми фундаментальних наук» (АПФН-2023) Луцьк червень 2023.

5) Радудік А.В., Чекал С.І., Щепьоткін І.О. Синтез похідних триптантрину – потенційних протизападьних засобів //Тези доповідей XXII Наукової молодіжної конференції «Проблеми та досягнення сучасної хімії» Одеса Вересень 14-15, 2023, с.22.

X. Заключні відомості

Керівник юридичної особи — Кузьмін Віктор Євгенович, д. х. н., 05.14.06

Перелік осіб-виконавців

Дума Ганна Іванівна

Карпенко Олександр Сергійович
(к. х. н., старший науковий співробітник)

Корнілов Олександр Юрійович
(молодший науковий співробітник)

Крисько Андрій Арнольдович
(к. х. н., с.н.с.)

Відповідальний за підготовку облікових документів — Іллюшко Наталія Олександрівна

Телефон — +38(067)7243955

Реєстратор — Юрченко Тетяна Анатоліївна

Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є відповідальним за реєстрацію наукової діяльності — Юрченко Тетяна Анатоліївна