

Облікова картка ДіР



I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0220U102526

Державний реєстраційний номер: 0118U004370

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 17-03-2020

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 2

Назва етапу: Проведення первинного фармакологічного скринінгу протизапальної дії синтезованих сполук, виявлення перспективних об'єктів для подальших досліджень, встановлення взаємозв'язку "будова-протизапальна дія". Спрямований синтез протизапальних агентів на основі встановлених кореляцій "будова-дія".

Початок етапу: 01.2019

Закінчення етапу: 12.2019

Вид звітнього документа: Проміжний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Запорізький державний медичний університет

Код за ЄДРПОУ: 02010741

Місцезнаходження: пр. Маяковського, 26, м. Запоріжжя, Запорізький р-н., Запорізька обл., 69035, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Міністерство охорони здоров'я України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 061279163838

IV. Відомості про співвиконавців ДіР

V. Відомості про замовника ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Міністерство охорони здоров'я України

Код за ЄДРПОУ: 00012925

Місцезнаходження: вул. Грушевського, 7, м. Київ, Київська обл., 01021, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Кабінет Міністрів України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380442536194

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: 2.2 - прикладні дослідження і розробки

Джерела фінансування

7713 - кошти держбюджету

Код програмної класифікації видатків і кредитування (КПКВК): 2301020

Фактичний обсяг фінансування (тис. грн.): 1305.57
--

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Спрямований пошук протизапальних агентів серед конденсованих та спіро-конденсованих похідних хіназоліну

Назва роботи англійською:

Purposeful search of anti-inflammatory agents among condensed and spiro-condensed quinazoline derivatives

Реферат українською:

Проведено узагальнення та детальний аналіз результатів досліджень про-тизапальної активності синтезованих сполук *in vivo*, що дозволило встановити певні кореляції в ряду «будова – біологічна дія». Серед іншого, встановлено, що критичним для прояву протизапальної дії є наявність триазинового фрагменту та карбоксиетильного залишку. Також встановлено, що модифікація сполук, які містять карбоксильну групу, шляхом утворення їх солей дозволяє змінити фар-мако-технологічні характеристики, але майже не впливає на вираженість проти-запальної дії.

Реферат англійською:

Generalization and detailed analysis of the results of studies on pro-inflammatory activity of synthesized compounds *in vivo* were performed, which allowed to establish certain correlations in the series "structure - biological effect". Among other things, it has been found that the presence of a triazine moiety and a carboxyethyl residue is critical for the manifestation of anti-inflammatory action. It has also been found that the modification of compounds containing a carboxyl group by the formation of their salts makes it possible to change the light-processing characteristics, but has almost no effect on the severity of the anti-inflammatory action.

Індекс УДК: 615.31, 615.276'547.856-047.24

Коди тематичних рубрик: 76.31.35

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові: Коваленко Сергій Іванович

Науковий ступінь: д. фармац. н.

Вчене звання: професор

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

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

Назва НТП українською: Ідентифікація нових високоактивних та безпечних протизапальних агентів серед конденсованих та спіро-конденсованих похідних хіназоліну.

Назва НТП англійською: Identification of novel highly active and safe anti-inflammatory agents among condensed and spiro-fused quinazoline derivatives.

НТП, яку передбачалося створити:

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати: Технології

Галузь застосування: фармація

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: На основі взаємодії 2-азоліланілінів з 5-оксогексановою кислотою розроблено препаративні методи синтезу 4а-метил-2-*R*-4а,5,6,7-тетрагідро-8Н-піридо[1,2-*a*][1,2,4]триазоло[1,5-*c*]хіназолін-8-онів, 4а-метил-4а,5,6,7-тетрагідро-8Н-піридо[1,2-*a*]тетразоло[1,5-*c*]хіназолін-8-ону та 9а-метил-7,8,9,9а-тетрагідро-6Н-бензо[4,5]імідазо-[1,2-*c*]піридо[1,2-*a*]хіназолін-6-ону. З метою покращення фармако-технологічних характеристик перспективних протизапальних агентів одержано натрієві, калієві, морфолінієві, піперидинієві та моноетаноламонієві солі 3-метил-2,8-діоксо-7,8-дигідро-2Н-піроло[1,2-*a*]-[1,2,4]триазино[2,3-*c*]хіназолін-5а(6Н)-карбонових кислот, досліджено їх фізико-хімічні характеристики та протизапальну дію. Проведено прогнозування параметрів токсичності ряду заміщених 3-*R*-2,8-діоксо-7,8-дигідро-2Н-піроло[1,2-*a*][1,2,4]триазино[2,3-*c*]хіназолін-5а(6Н)-карбонових (алкілкарбонових) кислот методами *in silico* та визначення гострої токсичності *in vivo*. За результатами первинного скринінгу та поглиблених фармакологічних досліджень встановлено, що 3-(3-метил-2,8-діоксо-7,8-дигідро-2Н-піроло[1,2-*a*][1,2,4]триазино[2,3-*c*]хіназолін-5а(6Н)-іл)пропанова кислота та 4-(3-метил-2-оксо-2Н-[1,2,4]триазино[2,3-*c*]хіназолін-6-іл)бутаноат виявились найбільш активними протизапальними агентами та водночас характеризувались низькою токсичністю.

Соціально-економічна спрямованість НТП: Створення принципово нової продукції (матеріалів, технологій тощо) для забезпечення експортного потенціалу та заміщенню імпорту

Вплив НТП на довкілля:

Впровадження НТП: Впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: 01.2019

Закінчення етапу: 12.2019

Споживачі продукції:

Перспективні ринки:

Характер співробітництва з інвестором

Потрібний обсяг інвестицій, тис. грн.:

Права, що надаються інвестору після завершення роботи: Права не надаються

Наявність бізнес-плану: Ні

Техніко-економічне обґрунтування: Ні

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.:

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація:

ІХ. Бібліографічний опис

Synthesis, modification and anticonvulsant activity of 3'-R-spiro-[indoline-3,6'-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazolin]-2,2'(7H)-diones derivatives / O. Yu. Voskoboynik, O. S. Kolomoets, I. S. Nosulenko, G. G. Berest, Bilyi A.K., O. V. Karpenko, I. F. Belenichev, S. I. Kovalenko . J. Heterocyclic Chem., 2019, 56(5): 1605-1612.

Directed search of anti-inflammatory agents among (3H-quinazoline-4-ylidene)hydrazides of N-protected amino acids and their heterocyclization products / Yu. Martynenko, O. Antypenko, I. Nosulenko, G. Berest, S. Kovalenko Anti-Inflammatory & Anti-Allergy Agents in Med. Chem. 2019. № 18 (2). P. 1-12.

Directed Search of Biologically Active Compounds among Hydrogenated Isoindolylalkyl(alkylaryl-,aryl-)carboxylic Acids with Quinazoline Fragment that Modify the Carbohydrate Metabolism: Design, Synthesis and Modification / Y. V.Martynenko, O.M.Antypenko, O. A. Brazhko, I. B. Labenska, S. I.Kovalenko Acta Chim. Slov. 2019, 66, 145-154.

Заміщені 7,8-дигідро-2H-піроло[1,2-a][1,2,4]тріазино[2,3-с]хіна-золін-5a(6H)-алкілкарбонові кислоти – перспективний клас низькотоксичних протизапальних агентів. В. В. Ставицький, О. Ю. Воскобойник, І. С. Носуленко, О. О. Клімова, О. А. Бражко, С. І. Коваленко Фармацевтичний часопис, 2019, 3, 5-12.

Х. Заключні відомості

Керівник юридичної особи

Колесник Юрій Михайлович

д. мед. н., 14.03.04

Перелік осіб-виконавців

Антипенко Олена Миколаївна

(к.фарм.н., 15.00.02)

Воскобойнік Олексій Юрійович

(д.фарм.н., 15.00.02)

Красовська Наталія Ігорівна

Мартиненко Юлія Вікторівна

Москаленко Олександра Сергіївна

(к.фарм.н., 15.00.02)

Носуленко Інна Степанівна

(к. фармац. н., к.фарм.н., 15.00.02)

Ставицький Віктор Валерійович

Холодняк Олена Валеріївна

Холодняк Сергій Валерійович

(к.фарм.н., 15.00.02)

Шабельник Костянтин Петрович

(к.фарм.н., 15.00.02)

Відповідальний за підготовку облікових документів

Воскобойнік Олексій Юрійович

Телефон

+38 (061) 224-60-86

Реєстратор

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

