

Облікова картка ДіР



I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0221U106840

Державний реєстраційний номер: 0120U104782

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 21-12-2021

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 2

Назва етапу: Підготовчий етап. Експериментальний етап (синтез неконденсованих похідних 4-тіазолідинону та похідних тіопірано[2,3-d]тіазолу, дослідження їх цитотоксичної дії та антибактеріальної активності та антифунгальної активності відносно полірезистентних штамів). Підбиття підсумків досліджень етапу проекту

Початок етапу: 05.2021

Закінчення етапу: 08.2021

Вид звітнього документа: Проміжний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Львівський національний медичний університет імені Данила Галицького

Код за ЄДРПОУ: 02010793

Місцезнаходження: вул. Пекарська, буд. 69, м. Львів, Львівська обл., 79010, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Міністерство охорони здоров'я України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380322603066, 380322757632

IV. Відомості про співвиконавців ДіР

V. Відомості про замовника ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Національний фонд досліджень України

Код за ЄДРПОУ: 42734019

Місцезнаходження: вул. Бориса Грінченка, 1, м. Київ, 01001, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Кабінет Міністрів України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380442981622, 380442981622

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): 2201300

Фактичний обсяг фінансування (тис. грн.): 3322.500

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Тіазолідинони з поліфармакологічними властивостями: молекулярний дизайн, синтез та механізми дії протиракових, протизапальних та протимікробних засобів

Назва роботи англійською:

Thiazolidinones with polypharmacological properties: molecular design, synthesis and mechanisms of action of anticancer, anti-inflammatory and antimicrobial agents

Реферат українською:

Проведено синтез «лікоподібних молекул» шляхом структурної модифікації тіазолідинонового фрагменту у положенні С-5 включно з його кон'югацією з відомими «біофорними» гетероциклічними системами, зокрема ядром індолу та піразолу. На основі логіко-структурного підходу було обрано оптимальні напрямки структурної модифікації 1-(2-аміно-4-метилтіазол-5-іл)-етанону за умов реакцій альдольної конденсації. З метою диверсифікації бібліотеки ізотіохроменотіазолів проведено алкілювання одержаного в «доміно» реакції Кньюенагеля-гетеро-Дільса-Альдера ізотіохромено[4a,4-d][1,3]тіазолу з хлороацетамідами та синтезовано відповідні N-заміщені похідні. Гібридні молекули на основі ізотіохромено[4a,4-d][1,3]тіазолу з ізатиновим та індолкарбоксильним фрагментами в структурі одержано на основі етилового естеру та гідразиду ізотіохроменотіазолу. Вперше одержано групу неописаних в літературі 3-ариліден(гетириліден)-1-(2-аміно-4-метилтіазол-5-іл)-етанонів на основі реакції Кляйзена-Шмідта з різноманітними альдегідами. Проведені скринінгові дослідження фармакологічної активності синтезованих сполук дозволили виділити ряд перспективних агентів з антинеопластичною та протимікробною активністю, а також встановити деякі закономірності кореляції «структура – дія».

Реферат англійською:

The synthesis of "drug-like molecules" was performed by structural modification of the thiazolidinone moiety at position C-5, including its conjugation with known "biophore" heterocyclic systems, in particular the indole and pyrazole. On the basis of the logic-structural approach, the optimal directions of structural modification of 1-(2-amino-4-methylthiazol-5-yl)-ethanone under the aldol condensation reactions were performed. In order to diversify the library of isothiochromenothiazoles, alkylation of obtained via Knoevenagel-hetero-Diels-Alder-domino reaction isothiochromeno[4a,4-d][1,3]thiazole with chloroacetamides was performed and the corresponding N-substituted derivatives were synthesized. Hybrid molecules based on isothiochromeno[4a,4-d][1,3]thiazole with isatin and indolecarboxylic fragments in the structure were obtained on the basis of ethyl ester and isothiochromenothiazole hydrazide. For the first time, a group of 3-arylidene(heterarylidene)-1-(2-amino-4-methylthiazol-5-yl)ethanones not described in the literature was obtained based on the Kleisen-Schmidt reaction with various aldehydes. Conducted screening studies of the pharmacological activity of the synthesized compounds allowed to identify a number of promising agents with antimicrobial and antitumor activities, as well as to establish some patterns of correlation "structure-activity" relationship.

Індекс УДК: 615.1, 615.012.1:547.79

Коди тематичних рубрик: 76.31.30

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові: Лесик Роман Богданович

Науковий ступінь: д. фармац. н.

Вчене звання: професор

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

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

Назва НТП українською: Нові гетероциклічні сполуки на основі 4-тіазолідинонів та тіазолів як протимікробні та протипухлинні агенти

Назва НТП англійською: New heterocyclic compounds based on 4-thiazolidinone and thiazole cores as antimicrobial and anticancer agents

НТП, яку передбачалося створити:

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати: Створення потенційних біологічно активних сполук

Галузь застосування: Дослідження і розробки в галузі природничих наук, медицина, фармація

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Нові гетероциклічні сполуки на основі 4-тіазолідинонів, а саме 3-ариліден(гетириліден)-1-(2-аміно-4-метилтіазол-5-іл)-етанони, тіопірано[2,3-d]тіазоли

Соціально-економічна спрямованість НТП: Створення нових класів сполук як потенційних лікарських засобів

Вплив НТП на довкілля:

Впровадження НТП: Не впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: 05.2021

Закінчення етапу: 08.2021

Споживачі продукції:

Перспективні ринки:

Характер співробітництва з інвестором

Потрібний обсяг інвестицій, тис. грн.:

Права, що надаються інвестору після завершення роботи:

Наявність бізнес-плану:

Техніко-економічне обґрунтування:

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.:

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація:

IX. Бібліографічний опис

1. Szychowski, K. A., Skóra, B., Kryshchyshyn-Dylevych, A., Kaminskyy, D., Khyluk, D., Lesyk, R. (2021). 4-thiazolidinone-based derivatives rosiglitazone and pioglitazone affect the expression of antioxidant enzymes in different human cell lines. *Biomedicine & Pharmacotherapy*, 139, 111684.
2. Mishchenko, M., Shtrygol, S., Lozynskyi, A., Khomyak, S., Novikov, V., Karpenko, O., Lesyk, R. (2021). Evaluation of Anticonvulsant Activity of Dual COX-2/5-LOX Inhibitor Darbufelon and Its Novel Analogues. *Scientia Pharmaceutica*, 89(2), 22.
3. Holota, S., Yushyn, I., Khyluk, D., Vynnytska, R., & Lesyk, R. (2021). N-(3-Cyano-4,5,6,7-tetrahydrobenzothiophen-2-yl)-2-[[5-[(1, 5-dimethyl-3-oxo-2-phenylpyrazol-4-yl) amino]-1,3,4-thiadiazol-2-yl] sulfanyl] acetamide. *Molbank*, 2, M1211.
4. Konechnyi, Y., Hrushka, O., Pryzyhley, H., Konechna, R., Lozynskyi, A., Korniychuk, O., Lesyk, R. (2021). Cell Immunity of Laboratory Animals Under the Influence of 5-Indolylmethylene Rhodanine-3-Carboxylic/Sulphonic Acid Derivative. *ScienceRise: Pharmaceutical Science*, 1(29), 76–81.
5. Buzun, K., Kryshchyshyn-Dylevych, A., Senkiv, J., Roman, O., Gzella, A., Bielawski, K., Lesyk, R. (2021). Synthesis and Anticancer Activity Evaluation of 5-[2-Chloro-3-(4-nitrophenyl)-2-propenylidene]-4-thiazolidinones. *Molecules*, 26(10), 3057.
6. Lozynskyi, A. V., Derkach, H. O., Zasidko, V. V., Konechnyi, Y. T., Finiuk, N. S., Len, Y. T., Lesyk, R. B. (2021). Antimicrobial and cytotoxic activities of thiazolo[4,5-b]pyridine derivatives. *Biopolymers & Cell*, 37(2), 153–164.
7. Lekhniuk, N., Fesenko, U., Pidhirnyi, Y., Sękowska, A., Korniychuk, O., Konechnyi, Y. (2021). *Raoultella terrigena*: Current state of knowledge, after two recently identified clinical cases in Eastern Europe. *Clinical Case Reports*, 9(5).
8. Konechnyi, Y., Khorkavyi, Y., Ivanchuk, K., Kobza, I., Sękowska, A., & Korniychuk, O. (2021). *Vibrio metschnikovii*: Current state of knowledge and discussion of recently identified clinical case. *Clinical Case Reports*, 9(4), 2236–2244.
9. Konechnyi, Y., Panas, M., Tymchuk, I., Konechna, R., Borysiuk, O., Hubytska, I., Korniychuk, O. (2020). Epidemiological and microbiological aspects of health care-associated infections in Ukraine during the 2009–2019 period. *Przegl Epidemiol*, 75(1), 86–95.

Х. Заключні відомості

Керівник юридичної особи

Зіменковский Борис Семенович
д. фармац. н., 15.00.02

Перелік осіб-виконавців

Конечний Юліан Тарасович

Крищишин-Дилевич Анна Петрівна
(к. фармац. н.)

Лозинський Андрій Володимирович
(к. фармац. н., 15.00.02)

Сеньків Юлія Василівна

Фінюк Наталія Степанівна

Юшин Ігор Михайлович

**Відповідальний за підготовку
облікових документів**

Лозинський А.В.

Телефон

+38 (063) 351-76-37

Реєстратор

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

