Облікова картка ДіР

I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0217U003015

Державний реєстраційний номер: 0114U003550

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 13-01-2017

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 1

Назва етапу: Скринінг in silico нових піразолвмісних аміногідроксибісфосфонатів на зв'язування з протеїном - фарнезилпірофосфатсинтазою, розробка методів синтезу та напрацювання найбільш перспективних препаратів; дослідження механізмів інгібування отриманими бісфосфонатами активності маркерних ензимів резорбції кісткової тканини та їх біологічної ефективності у регуляції мінерального обміну на моделі експериментального остеопорозу.

Початок етапу: 04.2014

Закінчення етапу: 12.2016

Вид звітного документа: Остаточний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Інститут біохімії ім. О.В.Палладіна НАН України

Код за ЄДРПОУ: 05417288

Місцезнаходження:

Форма власності:

Сфера управління: Національна академія наук України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 234-59-74 , 279-63-65

IV. Відомості про співвиконавців ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Інститут органічної хімії НАН України

Код за ЄДРПОУ: 05417325

Місцезнаходження:

Форма власності:

Сфера управління:

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон:

Внесок співвиконавця у звітний етап:

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)

Напрям фінансування: 2.1 - фундаментальні дослідження

Джерела фінансування

7713 - кошти держбюджету

Код програмної класифікації видатків і кредитування (КПКВК): 6541030

Фактичний обсяг фінансування (тис. грн.): 201

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Піразолілвмісні бісфосфонати - перспективні субстанції лікарських засобів для лікування захворювань кісткової тканини.

Назва роботи англійською:

Pyrazole-containing bisphosphonates - promising substances of drugs for the treatment of bone tissue diseases.

Реферат українською:

Проведено дизайн та in silico скринінг ряду патентоспроможних піразолвмісних бісфосфонатів. Здійснено розробку, оптимізацію методів синтезу та напрацьовано ряд перспективних аміногідроксибісфосфонатів (аміно-піразолових аналогів). Продемонстровано здатність синтезованих піразолвмісних бісфосфонатів гальмувати резорбцію кісткової тканини та ефективно посилювати мінеральний обмін за експериментального аліментарного остеопорозу. Встановлено дозозалежне інгібування маркерних ензимів (лужна фосфатаза, пірофосфатаза), пригнічення життєздатності та функціональної активності моноцитарно/макрофагальних клітинних ліній J774 A1 та RAW264.7 (попередників остеокластів) за дії синтезованих бісфосфонатів у модельних системах in vitro.

Реферат англійською:

It was conducted in silico design and screening of a number of patentable pyrazole containing bisphosphonates. The development and optimization of synthesis techniques as well as obtaining of several promising aminohydroxybisphosphonates (pyrazole-containing analogues) were carried out. It was demonstrated the ability of synthesized pyrazole-containing bisphosphonates to inhibit bone resorption and effectively enhance mineral metabolism in experimental nutritional osteoporosis. In vitro model systems synthesized bisphosphonates dose-dependently inhibited marker enzymes (alkaline phosphatase, pyrophosphatase), decreased cell viability and functional activity of monocyte/macrophage cell lines J774 A1 and RAW264.7 (osteoclast precursors).

Індекс УДК: 547, 547.771+577.161.2+616.71-007.234

Коди тематичних рубрик: 31.21

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові: Комісаренко Сергій Васильович

Науковий ступінь: д. б. н.

Вчене звання: акад.

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

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

Назва НТП українською: Піразолілвмісні бісфосфонати - перспективні субстанції лікарських засобів для лікування захворювань кісткової тканини.

Назва НТП англійською: Pyrazole-containing bisphosphonates - promising substances of drugs for the treatment of bone tissue diseases.

НТП, яку передбачалося створити:

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати:

Галузь застосування: 24.42.0 Виробництво фармацевтичних препаратів і матеріалів

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Перспективні аміногідроксибісфосфонати (аміно-піразолових аналогів) з різною довжиною лінкера, що зв'язують бісфосфонатний фрагмент з піразольним ядром та способом приєднанням лінкера до атома нітрогену або карбону піразолу. Здатність синтезованих піразолвмісних бісфосфонатів гальмувати резорбцію кісткової тканини та ефективно посилювати мінеральний обмін за експериментального аліментарного остеопорозу. Дозозалежне інгібування маркерних ензимів (лужна фосфатаза, пірофосфатаза), пригнічення життєздатності та функціональної активності моноцитарно/макрофагальних клітинних ліній J774 A1 та RAW264.7 (попередників остеокластів) за дії синтезованих бісфосфонатів у модельних системах in vitro.

Соціально-економічна спрямованість НТП:

Вплив НТП на довкілля:

Впровадження НТП: Не впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: не встановлені

Закінчення етапу:

Споживачі продукції: науково-дослідні установи

Перспективні ринки: ринки України і зарубіжжя

Характер співробітництва з інвестором

Потрібний обсяг інвестицій, тис. грн.: 0

Права, що надаються інвестору після завершення роботи:

Наявність бізнес-плану: Ні

Техніко-економічне обгрунтування: Ні

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.: 0

Очікуваний термін окупності (років): не встановлено

Додаткова інформація: не встановлені

IX. Бібліографічний опис

1.Komisarenko S.V., Volochnyuk D.M., Shymanskyy I.O., Ivonin S.P., Veliky M.M. Effectiveness of nitrogen-containing bisphosphonates in regulation of mineral metabolism in alimentary osteoporosis in rats // Biotechnologia Acta. - 2015. - Vol. 8, N 4. - P. 53-62 . 2.Ivonin S.P., Kurpil' B.B., Bezdudny A.V., Grygorenko O.O., Volochnyuk D.M. An approach to (4-fluoroalkyl-1-alkyl-1H-pyrazol-3-yl)methylamines // J. Fluor. Chem. - 2015. - Vol. 176 - P. 78-81. 3.Ivonin S.P., Kurpil' B.B., Grygorenko O.O., Volochnyuk D.M. Regioselective synthesis of pyrazoles fused with heteroaliphatic amines at the [3,4-c] edges // Tetrahedron Letters. - 2015. - Vol. 56 - P. 6248-6250. 4.Ivonin S.P., Kurpil' B.B., Rusanov E.B., Grygorenko O.O., Volochnyuk D M. // Tetrahedron Lett. - 2014 - Vol. 55. - P. 2187-2189. 5.Комисаренко С.В., Волочнюк Д.М., Шиманский И.А., Курпиль Б.Б., Карпов П.А., Ивонин С.П., Великий Н.Н. Дизайн и синтез пиразолсодержащих бисфосфонатов - перспективных субстанций для лечения заболеваний костной ткани // Фундаментальные проблемы создания нових веществ и материалов химического производства (Коллективная монография) / НАН Украины. - К.; Академпериодика, 2016. - С. 236-246. 6.Komisarenko S. V., Volochnyuk D. M., Shymanskyy I. O., Ivonin S. P., Grygorenko O. O., Veliky M. M. Synthesis of novel pyrazole-derived bisphosphonates and their biological evaluation in vitro and in rats // Abstracts of the XXIV EFMC International Symposium on Medicinal Chemistry, Manchester, UK, Aug. 28 - Sep. 01. - 2016. -P. 303.

X. Заключні відомості

Керівник юридичної особи Костерін Сергій Олексійович

Перелік осіб-виконавців

Великий М.М.

Лабудзинський Д.О.

Лісаковська О.О.

Мазанова А.О.

Шиманський І.О.

Відповідальний за підготовку облікових документів

Телефон

Реєстратор

Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є відповідальним за реєстрацію наукової діяльності

