

Облікова картка ДіР



I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0226U001338

Державний реєстраційний номер: 0122U000657

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 24-01-2026

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 1

Назва етапу: Молекулярний дизайн та синтез нових похідних 2-амінопірідо[1,2-а]піримідин-4-ону. Дослідження антиагрегаційних властивостей цільових сполук за методом Борна. Пошук оптимальних методів синтезу та отримання напівпродуктів для синтезу тетрациклічних систем – потенційних протизапальних та противірусних агентів. Синтез оксимів похідних індола[2,1-b]хіназаліну. Скринінг in vitro раніше синтезованих сполук як потенційних протизапальних агентів. Вивчення афінітету до ДНК та встановлення противірусної активності синтезованих сполук.

Початок етапу: 01.2022

Закінчення етапу: 12.2022

Вид звітнього 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)

Напрямок 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". За розробленою раніше методикою були нароблені та розділені ізомерні 4- та 6-бромізаїтини, а також – 5-бромізаїн та 6- та 7-бромізаїнові ангідриди, з яких отримані відповідні ізомерні 2-, 3-, 7-, 8- та 9-бром триптантрини. Встановлено, що із задовільними виходами заміщення брома на вторинну аміногрупу може бути реалізовано тільки у випадку 7- та 9-бром триптантринів. Серед багатьох синтетичних аналогів у якості прекурсор для синтезу діалкіламіноетилоксіанілінів та діамінобензенів був обраний N-(4-гідроксіфеніл)ацетамід. Розроблена методика його перетворення у проміжні (4-діалкіламіноетилоксі)-1,2-діамінобензени. (5-Діалкіламіно-етилоксі)ізаїн за цією схемою отриманий із незадовільними виходами. Розроблені методи контролю та ізомерного очищення суміші 6(9)-метилінденохіноксалинону та на його основі отриманий ізомерно-чистий 6(9)-(діалкіламіно)метилінденхіноксалинон. Методом флуориметричного титрування вивчено афінитет синтезованих водорозчинних сполук до ДНК. Всі вивчені сполуки відносяться до інтеркаляторів помірної сили. Запропоновано та апробовано схему синтезу похідних піридо[1,2-а]піримідин-4-ону нових лігандів до відкритої форми фібриногенового рецептору. Ключовою стадією цього багато шляхового синтезу є реакція перехресного сполучення Бухвальда-Гартвіга. Підібрано оптимальні умови синтезу та визначено найкращий шлях, що приводить до цільових сполук.

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. Using the previously developed method, isomeric 4- and 6-bromoisatins, as well as 5-bromoisatin and 6- and 7-bromoisate anhydrides were prepared and separated, from which the corresponding isomeric 2-, 3-, 7-, 8- and 9-bromotriptanthrines were obtained. It was established that with satisfactory yields, substitution of bromine on the secondary amino group can be realized only in the case of 7- and 9-bromotriptanthrines. Among many synthetic analogues, N-(4-hydroxyphenyl)acetamide was chosen as a precursor for the synthesis of dialkylaminoethoxyanilines and diaminobenzenes. A method for its conversion into intermediate (4-dialkylaminoethoxy)-1,2-diaminobenzenes was developed. (5-Dialkylaminoethoxy)isatin was obtained in unsatisfactory yields according to this scheme. Methods for control and isomeric purification of a mixture of 6(9)-methylindenoquinoxalinone were developed, and isomerically pure 6(9)-(dialkylamino)methyleneindenoquinoxalinone was obtained on its basis. The affinity of the synthesized water-soluble compounds to DNA was studied by fluorimetric titration. All the studied compounds belong to intercalators of moderate strength. A scheme for the synthesis of pyrido[1,2-a]pyrimidin-4-one derivatives of new ligands to the open form of the fibrinogen receptor has been proposed and tested. The key stage of this multi-path synthesis is the Buchwald-Hartwig cross-coupling reaction. The optimal synthesis conditions have been selected and the best route leading to the target compounds has been determined.

Індекс УДК: 547.7/.8, 547.863.1+547.756+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 7-аміно-індоло[2,1-b]хіназолін-6,12-діону. Похідні 9-аміно-індоло[2,1-b]хіназолін-6,12-діону. Похідні (6)9-диметиламінометил-індено[1,2-b]хіноксалін-11-ону. Похідні 2-амінопірідо[1,2-a]піримідин-4-ону.

Назва НТП англійською: Derivatives of 7-amino-indolo[2,1-b]quinazoline-6,12-dione. Derivatives of 9-amino-indolo[2,1-b]quinazoline-6,12-dione. Derivatives of (6)9-dimethylaminomethyl-indeno[1,2-b]quinoxalin-11-one. Derivatives of 2-aminopyrido[1,2-a]pyrimidin-4-one.

НТП, яку передбачалося створити: Створено

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати: Матеріали, Методи, теорії, гіпотези

Галузь застосування: Медична хімія. Фармацевтична галузь.

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: У звіті представлено методи синтезу та підтвердження структури нових антиагрегаційних, противірусних та протизапальних сполук. Приведено данні фармакологічних властивостей отриманих сполук. Похідні 7-аміно-індоло[2,1-b]хіназолін-6,12-діону є потенційними противірусними та протизапальними засобами. Похідні 9-аміно-індоло[2,1-b]хіназолін-6,12-діону є потенційними противірусними та протизапальними засобами. Похідні (6)9-диметиламінометил-індено[1,2-b]хіноксалін-11-ону є потенційними противірусними та протизапальними засобами. Похідні 2-амінопірідо[1,2-a]піримідин-4-ону є потенційними антиагрегаційними засобами.

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: 01.2022

Закінчення етапу: 12.2022

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 обґрунтування:

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.:

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація:

IX. Бібліографічний опис

1. 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.

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., 02.00.03)

Шибінська Марина Олегівна
(к. х. н., н.с)

Відповідальний за підготовку облікових документів

Ілляшко Наталія Олександрівна

Телефон

+38(067)7243955

Реєстратор

Юрченко Тетяна Анатоліївна

Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є відповідальним за реєстрацію наукової діяльності



Юрченко Тетяна Анатоліївна