

Облікова картка ДіР



I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0217U003648

Державний реєстраційний номер: 0114U000968

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 14-06-2017

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу:

Назва етапу:

Початок етапу:

Закінчення етапу:

Вид звітнього документа:

III. Відомості про виконавця ДіР

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

Код за ЄДРПОУ: 02010741

Місцезнаходження:

Форма власності:

Сфера управління: Міністерство охорони здоров'я України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: (061)2246469

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, Київ, 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.): 39.41
--

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Спрямований пошук біологічно активних сполук серед заміщених триазинохіназолінів та створення кандидатів у лікарські препарати на їх основі

Назва роботи англійською:

Targeted search of biologically active compounds among substituted triazinoquinazolines and development of candidates for drugs based on them.

Реферат українською:

Представлена НДР присвячена спрямованому пошуку біологічно активних сполук серед сполук, що містять фрагмент траазинохіназоліну. Встановлено, що заміщені 3-R-[1,2,4]триазино-[2,3-с]хіназолін-2-они при взаємодії з надлишком гідразину гідрату у пропанолі-2 призводить до утворення відповідних 3-(2-аміно-3-R1-4-R2-5-R3-феніл)-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-онів. Показано, що 3-(2-аміно-3-R1-4-R2-5-R3-феніл)-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-они являють собою класичні бінуклеофільні агенти та можуть виступати зручними вихідними сполуками для формування комбінаторних бібліотек заміщених триазинохіназолінів. Досліджено взаємодію 3-(2-аміно-3-R1-4-R2-5-R3-феніл)-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-они з карбонілвмісними сполуками, ацилюючими сполуками, сірковуглецем, калію ксантогенатом, карбонілдіїмідозолом, нітритною кислотою, ізоціанатами, ізотіоціанатами, сполуками з електронодефіцитним потрійним зв'язком тощо. Встановлено, що продукти модифікації заміщених 6-R-3-(2-амінофеніл)-2H-[1,2,4]-триазин-5-онів виявляють різнобічну біологічну дію, зокрема протиракову, протимікробну, протигрибкову антиоксидантну, антигіпоксичну, актопротекторну та антиішемічну дії. Запропоновано для подальших фармакологічних досліджень натрій 4-(3-метил-2-оксо-2H-[1,2,4]триазино[2,3-с]хіназолін-6-іл)бутаноат для якого встановлено високу антиішемічну дію.

Реферат англійською:

Presented scientific work is devoted to the purposeful search of biologically active agents among substances containing triazinoquinazoline fragment. It is found, that substituted 3-R-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazolin-2-ones while reaction with excess of hydrazine hydrate in propanol-2 yielded the corresponding 3-(2-amino-3-R1-4-R2-5-R3-phenyl)-6-R-1,2,4-triazin-5 (2H)-ones. It is shown, that 3-(2-amino-3-R1-4-R2-5-R3-phenyl)-6-R-1,2,4-triazin-5(2H) -ones are classical binucleophilic agents, and may act as starting compounds for the formation of combinatorial libraries of substituted triazinoquinazolines. The interaction of 3-(2-amino-3-R1-4-R2-5-R3-phenyl)-6-R-1,2,4-triazin-5(2H)-ones with carbonyl compounds, acylating reagents, carbon disulfide, potassium xanthate, carbonyldiimidazole, nitrous acid, isocyanates, isothiocyanates, compounds with activated triple bond, etc. It is established, that products of substituted 3-(2-amino-3-R1-4-R2-5-R3-phenyl)-6-R-1,2,4-triazin-5(2H)-ones modification exhibit versatile biological action in particular anticancer, antimicrobial, antifungal, antioxidant, antihypoxic, anti-ischemic and actoprotective. Sodium 4-(3-methyl-2-oxo-2H-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazolin-6-yl)butanoate is proposed for further pharmacological studies as promising anti-ischemic agent.

Індекс УДК: 547.7/.8, 547.856'872/874-3:615.2]-047.24

Коди тематичних рубрик: 31.21.27

Керівники роботи

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

Науковий ступінь: д. фармацев. н.

Вчене звання: професор

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

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

Назва НТП українською: Біологічно активні сполуки.

Назва НТП англійською: Biologically active compounds.

НТП, яку передбачалося створити:

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати:

Галузь застосування: фармація

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Встановлено, що заміщені 3-R-[1,2,4]триазино-[2,3-с]хіназолін-2-они при взаємодії з надлишком гідразину гідрату у пропанолі-2 призводить до утворення відповідних 3-(2-аміно-3-R1-4-R2-5-R3-феніл)-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-онів. Показано, що 3-(2-аміно-3-R1-4-R2-5-R3-феніл)-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-они являють собою класичні бінуклеофільні агенти та можуть виступати зручними вихідними сполуками для формування комбінаторних бібліотек заміщених триазинохіназолінів. Досліджено взаємодію 3-(2-аміно-3-R1-4-R2-5-R3-феніл)-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-они з карбонільвмісними сполуками, ацилюючими сполуками, сірковуглецем, калію ксантогенатом, карбонілдіїмідозолом, нітритною кислотою, ізоціанатами, ізотіоціанатами, сполуками з електронодефіцитним потрійним зв'язком тощо. Встановлено, що продукти модифікації заміщених 6-R-3-(2-амінофеніл)-2H-[1,2,4]-триазин-5-онів виявляють різнобічну біологічну дію, зокрема протиракову, протимікробну, протигрибкову антиоксидантну, антигіпоксичну, актопротекторну та антиішемічну дії. Зап

Соціально-економічна спрямованість НТП:

Вплив НТП на довкілля:

Впровадження НТП: Впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: 2014-2017

Закінчення етапу:

Споживачі продукції: Фармацевтичні 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. Hydrazinolysis of 3-R-[1,2,4]Triazino[2,3-c]quinazolin-2-ones. Synthetic and Theoretical Aspects [Text] / T. Yu. Sergeieva, O. Yu. Voskoboynik, S. I. Okovytyy, S. I. Kovalenko, Sv. V. Shishkina, O. V. Shishkin, J. Leszczynski // J. Phys. Chem. A. - 2014. - Vol. 118. - P. 1895-1905. (dx.doi.org/10.1021/jp4052616)№; 2. Synthesis 3-R-8-R1-9-R2-10-R3-R-6-thioxo-6,7-dihydro-2H-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazolin-2-ones, its antibacterial and antifungal activity [Text] / I. S. Nosulenko, O. Yu. Voskoboynik, G. G. Berest, S. L. Safronyuk, S. I. Kovalenko, O. M. Kamyshnyi, N. M. Polishchuk, R. S. Sinyak, A. V. Katsev // Sci Pharm. - 2014. - Vol. 82. - P. 483-500; 3. Синтез и противораковая активность N-замещенных фталиламидов с триазиновым фрагментом [Текст] / Д.Ю. Скорина, А.Ю. Воскобойник, С.И. Коваленко // Фармация Казахстана. - 2015 - № 6. - С. 36-42; 4. Interaction of 3-(2-aminophenyl)-6-R-1,2,4-triazin-5-ones with acylating reagents - an efficient method for preparation of 6-substituted 3-R-2H-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazolin-2-ones [Text] / Alexey Yu. Voskoboynik, Dmitriy Yu. Scorina, Tetiana Yu. Sergeieva, Sergiy I. Kovalenko, Sergiy I. Okovytyy, Irina V. Omelchenko, Oleg V. Shishkin // J. Het. Chem. Volume 53, Issue 3, May 2016. - P. 776-783. (doi: 10.1002/jhet.2120); 5. Benzo[e][1,2,4]triazino[2,3-c][1,2,3]triazin-2-ones - novel high electro-deficient heterocyclic compounds with promising anticancer activity [Text] / O.Yu. Voskoboynik, S.I. Kovalenko, S.V. Shishkina // Heterocycl. Commun. - 2016. - Vol. 22 (3). - P. 137-141. (DOI 10.1515/hc-2015-0190); 6. Synthesis and modification of 2-[8-R1-9-R2-10-R3-3-R-2-oxo-2H-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazoline-6-yl]thio]acetic acids aimed to the search of effective substances with antibacterial and antifungal activity [Text] / I.S. Nosulenko, O.Yu. Voskoboynik, G.G. Berest, S. I. Kovalenko, O.M. Kamyshnyi, N.M. Polishchuk // Вісник фармації. - 2015. - №1. - С. 11-20; 7. Voskoboynik O. Yu. Synthesis, physicochemical properties and anticancer activity of 6-(heterocycl-yl-N-ylmethyl)-3-R1-9-R2-2H-[1,2,4]triazino[2,3-c]-quinazolin-2-ones / O. Yu. Voskoboynik [Text] // Вопросы химии и химической технологии. - 2015 - №1. - С. 7-13; 8. Peculiarities of interaction between 3-(2-aminophenyl)-6-R-1,2,4-triazin-5(2H)-ones and cyclic anhydrides of non-symmetric dicarboxylic acids [Text] / O.Yu. Voskoboynik D.Yu. Skorina, S.V. Shishkina, O.V. Shishkin, S.I. Kovalenko, V.V. Ivchuk // Journal of Organic and Pharmaceutical Chemistry. - 2015 - Т.1,3 вип. 1 (49). - С. 25-31; 9. Voskoboynik O.Yu. Synthesis, physicochemical and biological properties of 6-S- and 6-N-substituted 3-R-2H-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazolin-2-ones [Text] / O.Yu. Voskoboynik // Вопросы химии и химической технологи. - 2015 - №4 (102). - С. 9-16; 10. 6-Mono- and 6,6-disubstituted 3-R-6,7-dihydro-2H-[1,2,4]triazino[2,3-c]quinazoline-2-ones - promising class of anticancer agents [Text] / O.Yu. Voskoboynik, I.S. Nosulenko, G.G. Berest, S.I. Kovalenko // Український біофармацевтичний журнал. - 2016. - №2. - С. 71-78; 11. Synthesis, anticancer and FGFR1 inhibitory activity of 2-R1-5-R2-7-R3-8-R4-11-R5-12-R6-3H-isoindolo[2,1-a][1,2,4]triazino[2,3-c]quinazoline-3,10(14bH)-diones [Text] / O.Yu. Voskoboynik, S.A. Starosyla, M.V. Protopopov, G.P. Volynets., S.V. Shishkina, S.M. Yarmoluk, S.I. Kovalenko // Медична та клінічна хімія. - 2016. - Т. 18, № 1. - С. 5-18; 12. Дослідження та характеристика протизапальної активності натрій (3-R-2-оксо-2H-[1,2,4]триазино[2,3-с]хіназолін-6-іл)алкілкарбоксилатів та їх галогеновмісних аналогів [Текст] / В.В. Якубовська, Н.М. Серединська, О.Ю. Воскобойник, Г.І. Степанюк, С.І. Коваленко // Актуальні питання фармацевтичної і медичної науки та практики. - 2016. - №1 (20). - С.60-66.

Х. Заключні відомості

Керівник юридичної особи

Колесник Юрій Михайлович

д. мед. н., 14.01.02

Перелік осіб-виконавців

Берест Галина Григорівна

Воскобойнік Олексій Юрійович

Коломоець Олександра Сергіївна

Кривошей Оксана Вікторівна

Носуленко Інна Степанівна

Синяк Раїса Степанівна

Скорина Дмитро Юрійович

Ставицький Віктор Валерійович.

**Відповідальний за підготовку
облікових документів**

Телефон

Реєстратор

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

