Облікова картка ДіР

I. Загальні відомості

Державний обліковий номер: 0219U102406

Державний реєстраційний номер: 0115U002592

Особливі позначки: відкрита

Дата реєстрації: 28-12-2019

II. Етап виконання ДіР

Номер етапу: 5

Назва етапу: Вивчення фармакологічних власти-востей найбільш ефективних сполук як специфічних інгібіторів фурину та інших серинових протеїназ. Розробка рекомендацій для практичного застосування їх в якості нових терапевтичних засобів.

Початок етапу: 01.2019

Закінчення етапу: 12.2019

Вид звітного документа: Остаточний звіт

III. Відомості про виконавця ДіР

Повне найменування юридичної особи (або ПІБ фізичної особи): Інститут біоорганічної хімії та нафтохімії ім. В.П. Кухаря Національної академії наук України

Код за ЄДРПОУ: 03563790

Місцезнаходження: вул. Мурманська, 1, м. Київ, Київська обл., 02094, Україна

Форма власності:

Сфера управління: Національна академія наук України

Ідентифікатор ROR: Не застосовується

Розмір організації:

Телефон: 380445599800, 380445585388

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, 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.): 668.608

VII. Відомості про ДіР

Назва роботи українською:

Синтез та вивчення низькомолекулярних інгібіторів серинових протеїназ.

Назва роботи англійською:

Synthesis and study of low molecular weight inhibitors of serine proteinases.

Реферат українською:

Вивчено синтетичні інгібітори фурину на основі похідних азолів та азинів, що містять у молекулі позитивно заряджені групи. Встановлено, що 2,5-заміщені 1,3-оксазоли з 4 трифенілфосфонієвим (ТФФ-) угрупуванням є новим класом непептидних інгібіторів ензиму. В залежності від хімічної будови вони інактивують фермент за механізмом конкурентного, неконкурентного або змішаного інгібування. Знайдено, що оксазоли, які одночасно містять, як ТФФ-групу, так і 5-цитизиновий замісник, проявляють високу антифуринову активність і інгібують фурин на 90-100%.

Реферат англійською:

Synthetic furin inhibitors based on azole or azine derivatives which contained positively charged groups in their molecules were studied. The 2,5-substituted 1,3-oxazoles with 4 triphenylphosphonium (TPP-) group were found to be a new class of non-peptide inhibitors of furin. They inactivated the enzyme by a mechanism of competitive, non-competitive or mixed inhibition depending on the their chemical structure. It has been found that oxazoles containing both the TPP-group and the 5-cytisine substituent exhibited the high antifurin activity and inhibited furin by 90-100%

Індекс УДК: 577.1:615;577.1:615.28, 577.151.042; 547.857.7

Коди тематичних рубрик: 31.27.51

Керівники роботи

Власне Прізвище Ім'я По-батькові: Осадчук Тетяна Володимирівна

Науковий ступінь:

Вчене звання:

Ідентифікатор ORCID ID:

Додаткова інформація:

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

Назва НТП українською: 1,3-Оксазол-4-ілфосфонієві солі як нові непептидні інгібітори фурину

Назва НТП англійською: 1,3-Oxazol-4-ylphosphonium salts as new non-peptide inhibitors of furin

НТП, яку передбачалося створити:

Причини, через які НТП не було створено:

Отримані результати: Методи, теорії

Галузь застосування: фундаментальна біоорганічна хімія

Реєстраційний номер картки технології:

Опис НТП: Синтезовано похідні 1,3-оксазолу, які містять позитивно заряджені ТФФ-групи та замісники, що можуть утворювати з фурином додаткові водневі зв'язки та реалізувати гідрофобні взаємодії Вони є новими інгібіторами ензиму, константи інгібування яких знаходяться у мікромолярному діапазоні. Аналіз взаємозв'язку хімічна будова – антифуринова активність цих гетероциклів дозволяє намітити шляхи їх подальших хімічних модифікацій для створення більш активних і специфічних інгібіторів фурину.

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

Вплив НТП на довкілля:

Впровадження НТП: Не впроваджено

Практична реалізація НТП

Початок етапу: 01.2019

Закінчення етапу: 12.2019

Споживачі продукції: НДУ медико-біологічного напрямку

Перспективні ринки: Україна

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 обгрунтування: Ні

Потенціальний обсяг продажу, тис. грн.:

Очікуваний термін окупності (років):

Додаткова інформація:

IX. Бібліографічний опис

1. Кибирев В.К., Осадчук Т.В., Козаченко А.П. Холодович В., Федоряк О.Д., Броварец В.С. Синтез, биологическое тестирование и докинг новых бисамидиногидразонов в качестве непептидных ингибиторов фурина // Укр.біохім.ж. 2015. 87 (1). С. 55-63.

2. Kibirev V.K. Osasdchuk T.V. Rodik R.V. Kalchenko V.I. Furin inhibitors based on the derivatives of calyx[4]aren CX3im // Ukr. Biochem J. 2015. 87, (3). P. 31-36.

3. Osadchuk T.V., Shybyryn O.V., Kibirev V.K. Chemical structure and properties of low-molecular furin inhibitors // Ukr. Biochem J. 2016. 88, (6). P. 5-25.

4. Osadschuk T.V., Shybyryn O.V., Semyroz A.V., Bondarenko O.M., Kibirev V.K. Influence of cations on furin activity // Ukr.Biochem. J. 2017. 89, (5). P. 15-20.

5. Osadchuk T.V., Semyroz A.V., Shybyryn O.V., Kibirev V.K. Synthesis and investigation of the derivatives of amidinohydrazonylated aromatic compounds as furin inhibitors // Ukr. Biochem J. 2017, 89 (6). P. 3-12.

6. Osadchuk T.V., Shybyryn O.V., Semyroz A.V., Kibirev V.K. Influence of organic solvents on the furin activity // Ukr. Biochem J. 2018. 90, (5). P. 28-33.

7. Osadchuk T.V., Kibirev V.K., Shybyryn O.V., Semyroz A.V., Velihina Ye.S., Abdurakhmanova E.R., Brovarets V.S. 1,3-Oxazol-4-ylphosphonium salts as new non-peptide inhibitors of furin // Ukr. Biochem. J. 2019. 91 (4). P. 5-16.

8. Осадчук Т.В., Шибирин О.В., Семироз А.В., Кібірєв В.К. Синтез нових похідних піримідину і тіазолу та дослідження їх інгібіторного ефекту на фурин. // Матеріали II Міжнародної заочної науково-практичної конференції молодих учених «Фундаментальні та прикладні дослідження в сучасній хімії». Ніжин 10 квітня 2015 р. С. 176-181.

9. Осадчук Т.В., Шибирин О.В., Семироз А.В., Кібірєв В.К. Вплив похідних бісамідиногідразонів та середовища на каталітичну активність фурину // Каталіз та нафтохімія. 2016. Матеріали XXX Наукової конференції з біоорганічної хімії та нафтохімії, Київ, ІБОНХ НАНУ, 26-27 березня 2016 р.

10. Осадчук Т.В., Шибирин О.В., Семироз А.В., Кібірєв В.К. Дослідження впливу середовища на ензиматичну активність фурину // Матеріали III Міжнародної заочної науково-практичної конференції молодих учених «Фундаментальні та прикладні дослідження в сучасній хімії». Ніжин, 12 квітня 2016 р. С. 94-98.

11. Семироз А.В., Осадчук Т.В., Шибирин О.В., Кібірєв В.К. Синтез нових бісамідиногідразонів та вивчення їх антифуринової активності // Всеукраїнська наукова конференція. «Актуальні задачі хімії: дослідження та перспективи». Матеріали конференції. Житомир, 17-18 березня 2017. С. 154-156.

12. Осадчук Т.В., Шибирин О.В., Семироз А.В., Кібірєв В.К. Дослідження флавоноїдів у якості непептидних інгібіторів фурину // Матеріали міжнародної науково-практичної конференції «Інноваційний розвиток науки нового тисячоліття», частина III. Ужгород, 21-22 квітня 2017. С. 145-147.

13. Kibirev V.K., Osadchuk T.V., Semyroz A.V., Shybyryn O.V. Synthesis and testing the non-peptide inhibitors of furin and investigation of the effect of reactivity environment components on its activity //Катализ и нефтехимия. 2018. № 27. С. 67

14. Осадчук Т.В., Кібірєв В.К., Шибирин О.В., Велігіна Є.С., Абдурахманова Е.Р., Броварец В.В. Синтез і вивчення трифенілфосфонієвих солей 1,3-оксазолу – нових інгібіторів фурину. III Всеукраїнська наукова конференція «Актуальні задачі хімії: Дослідження та перспективи». Матеріали конференції. Житомир, 17 квітня 2019. С. 286-288.

X. Заключні відомості

Керівник юридичної особи — Вовк Андрій Іванович, д. х. н., 02.00.10

Перелік осіб-виконавців

Кібірєв Володимир Костянтинович
(д. б. н., 02.00.10, 03.00.04)

Семироз Андрій Володимирович

Шибирин Олена Володимирівна
(к.х.н., 02.00.06)

Відповідальний за підготовку облікових документів — Бондаренко О.М.

Телефон — +38 (044) 573-27-01

Реєстратор

Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є відповідальним за реєстрацію наукової діяльності

