

Облікова картка НДДКР

Державний обліковий номер: 0218U006890

Державний реєстраційний номер: 0116U008067

Відкрита

Дата реєстрації: 08-10-2018



1. Етапи виконання

Номер етапу: 1

Назва етапу: Нітрогеновмісні анельовані системи тіофену: розробка високоефективних, екологічно дружніх методів синтезу та пошук протиракових препаратів на їх основі

Початок етапу: 08-2016

Закінчення етапу: 07-2018

Вид звітнього документа: Остаточний звіт

2. Виконавець

Назва організації: Львівський національний університет імені Івана Франка

Код ЄДРПОУ/ІПН: 02070987

Підпорядкованість: Міністерство освіти і науки України

Адреса: 79000, м. Львів, вул. Університетська, 1

Телефон: 032-2554100

Телефон: 032-2616903

E-mail: research.development@lnu.edu.ua

3. Власник результатів НДДКР (продукції)

Назва організації: Львівський національний університет імені Івана Франка

Код ЄДРПОУ/ІПН: 02070987

Адреса: вул. Університетська 1, м. Львів, Львівська обл., 79000, Україна

Підпорядкованість: Міністерство освіти і науки України

Телефон: 380322616048

E-mail: zag_kan@lnu.edu.ua

WWW: <http://www.lnu.edu.ua>

4. Джерела та напрями фінансування

Підстава для проведення робіт: 34 - договір (замовлення) з центральним органом виконавчої влади, академією наук (головними розпорядниками бюджетних коштів на проведення НДДКР)

КПКВК: 2201040

Напрямок фінансування: 2.1 - фундаментальні дослідження

Джерела фінансування

Джерело фінансування: 7713 - кошти держбюджету

Фактичний обсяг фінансування за звітний етап: 754.249 тис. грн.

5. Науково-технічна робота

Назва роботи (укр)

Нітрогеновмісні анелювані системи тіофену: розробка високоефективних, екологічно дружніх методів синтезу та пошук протиракових препаратів на їх основі

Назва роботи (англ)

Nitrogen-containing fused systems of thiophene: the development of highly effective, environmentally friendly methods of synthesis and the search for anticancer drugs.

Реферат (укр)

Розроблено ефективні, хемоселективних методи синтезу різних класів гетероциклічних тіеновмісних сполук на основі 2- та 3-амінотіофенів, що відповідають критеріям "зеленої хімії" та за допомогою яких можна конструювати складні молекулярні гетероциклічні системи з простих доступних реагентів за допомогою малостадійних синтетичних підходів. Зокрема, одержано низку нових похідних тіено[2,3-d]піримідинів, триазоло[3,4-b][1,3,4]тіадіазинів, тіено[2,3-f]ізоіндолів, тіено[2,3-e][1,2,4]триазоло[1,5-c]піримідинів, тіено[2,3-d][1,2,4] триазоло[1,5-a]піримідинів, тіено[3,2-d][1,2,3]тріазинонів. Розроблено нову стратегію анелювання піримідинового циклу застосуванням 1-заміщених тетразолів. Досліджено особливості доміно-реакцій азидів в синтезі нових гетероциклічних сполук. Проведено дослідження протиракової активності у рамках співпраці з Національним інститутом раку (США) і знайдено такі, що виявили досить хорошу протипухлинну активність.

Реферат (англ)

Effective, chemoselective methods of synthesis of different classes of heterocyclic thieno-containing compounds based on 2- and 3-aminothiophenes accordingly to the criteria of "green chemistry" and allowing to construct complex molecular heterocyclic systems from simple accessible reagents by means of low-cost synthetic approaches were developed. In particular, a number of new derivatives of thieno [2,3-d] pyrimidines, triazolo [3,4-b] [1,3,4] thiadiazines, thieno [2,3-f] isoindoles, thieno [2,3-e] [1,2,4] triazolo [1,5-c] pyrimidines, thieno [2,3-d] [1,2,4] triazolo [1,5-a] pyrimidines, thieno [3,2-d] [1,2,3] triazinones were obtained. A new strategy for annulation of the pyrimidine cycle was developed using 1-substituted tetrazoles. The peculiarities of the domino-reaction of azides in the synthesis of new heterocyclic compounds were investigated. Aticancer activity evaluation was conducted in collaboration with the National Cancer Institute (USA) and it was found that some compounds possess a good antitumor activity.

Індекс УДК: 547.7/.8, 547

Коди тематичних рубрик НТІ: 31.21.27

6. Науково-технічна продукція (НТП)

НТП 1

Назва продукції (укр): Нові матеріали - реагенти для синтезу гетероциклів, що виявляють біологічну активність

Назва продукції (англ): New reagents for the synthesis of heterocyclic compounds with biological activity

Очікувані результати:

Галузь застосування: 73.10.1 Дослідження і розробки в галузі природничих наук

Опис продукції (укр): Розроблено ефективні підходи до синтезу різних класів гетероциклічних тіеновмісних сполук на основі 2- та 3-амінотіофенів. Синтезовано нові реагенти для гетероциклізацій та гетероциклів різних класів, які раніше не були відомі. Створено конкурентоспроможні методики для синтезу препаратів, що мають практичне застосування,

зокрема виявляють біологічну активність.

Соціально-економічна спрямованість НТП:

Стадія завершеності НТП: Звіт по НДДКР

Впровадження НТП: Не впроваджено

Строки впровадження: 2018

Виробник продукції: Львівський національний університет імені Івана Франка

Споживачі продукції: Вищі навчальні заклади України, фармацевтичні підприємства

Перспективні ринки: Україна

Права інтелектуальної власності: Отримано патент

Форми та умови передачі продукції: Спільні НДДКР

7. Бібліографічний опис

Shyyka O.Ya. Anticancer activity evaluation of new thieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-ones and thieno[3,2-d]pyrimidin-4(3H)-ones derivatives / O. Shyyka, N. Pokhodylo, N. Finiuk, V. Matychuk, R. Stoika, M. Obushak // Sci. Pharm. - 2018. Vol 86(3). pii: E28. doi: 10.3390/scipharm86030028. Shyyka O.Ya. Understanding the tetrazole ring cleavage reaction with hydrazines: Structural determination and mechanistic insight / O.Ya. Shyyka, N.T. Pokhodylo, Yu.I. Slyvka, E.A. Goreschnik, M.D. Obushak // Tetrahedron Lett. - 2018. - Vol. 59, Is. 12. - P. 1112-1115. <https://doi.org/10.1016/j.tetlet.2018.02.016> Pokhodylo N.T. Selectivity in domino-reaction of ortho-carbonyl azides with malononitrile dimer leading to [1,2,3]triazolo[1,5-a]pyrimidines / N.T. Pokhodylo, O.Ya. Shyyka, M.A. Tupychak, M.D. Obushak // Chem. Heterocycl. Compd. - 2018. - Vol. 54, Is. 2. - P. 209-212. <https://doi.org/10.1007/s10593-018-2256-4> Pokhodylo N.T. A Novel Base-Solvent Controlled Chemoselective Azide Attack on an Ester Group versus Keto in Alkyl 3-Substituted 3-Oxopropanoates: Mechanistic Insights / N.T. Pokhodylo, O. Ya. Shyyka, V.S. Matychuk, M.D. Obushak, V.V. Pavlyuk // ChemistrySelect. - 2017. - Vol. 2. - P. 5871-5876. <http://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1002/slct.201700577/abstract> Pokhodylo N.T. New cascade reaction of azides with malononitrile dimer to polyfunctional[1,2,3]triazolo[4,5-b]pyridine / N.T. Pokhodylo, O. Ya. Shyyka // Synth. Comm. - 2017. - Vol. 47, Is. 11. - P. 1096-1101. <http://dx.doi.org/10.1080/00397911.2017.1313427> Horak Y.I. The intramolecular Diels-Alder vinylthiophen (IMDAV) reaction: An easy approach to thieno[2,3-f]isoindole-4-carboxylic acids / Y.I. Horak, R.Z. Lytvyn, Y.-O.V. Laba, Y.V. Homza, V.P. Zaytsev, M.A. Nadirova, T.V. Nikanorova, F.I. Zubkov, A.V. Varlamov, M.D. Obushak, // Tet. Lett. - 2017. - Vol. 58, Is. 43. - P. 4103-4106. <https://doi.org/10.1016/j.tetlet.2017.09.038> Shyyka O.Ya. Facile synthetic route to benzo[c]chromenones and thieno[2,3-c]chromenones / O.Ya. Shyyka, R.L. Martyak, M.A. Tupychak, N.T. Pokhodylo, M.D. Obushak // Synth. Comm. - 2017. Vol. 47, Is. 24. - P. 2399-2405. <https://doi.org/10.1080/00397911.2017.1380833> Slyvka Y. Two Related Copper(I) π -Complexes Based on 2-Allyl-5-(2-pyridyl)-2H-tetrazole Ligand: Synthesis and Structure of [Cu(2-apyt)NO₃] and [Cu(2-apyt)(H₂O)](BF₄) Compounds. / Y. Slyvka, E. Goreschnik, N. Pokhodylo, O. Pavlyuk, M. Mys'kiv // Acta Chim. Slov. - 2016. - Vol. 63, № 2. - P. 399-405. DOI: <http://dx.doi.org/10.17344/acs.2016.2486> Pokhodylo N.T. Convenient synthetic path to ethyl 1-aryl-5-formyl-1H-1,2,3-triazole-4-carboxylates and 1-aryl-1H-[1,2,3]triazolo[4,5-d]pyridazin-4(5H)-ones / N.T. Pokhodylo, O.Ya. Shyyka, M.D. Obushak // Chem. Heterocycl. Compd. - 2018. Vol. 54, Is. 7. In press Шийка О.Я. Методи синтезу азоланельованих тіофенів // Вісник Львів. ун-ту. Сер. хім. - 2018. Вип. 59. Ч. 2. С. 239-253 DOI: <https://doi.org/10.30970/vch.5902.239> Тупичак М. Синтез нових похідних тіофену з 1,2,4-триазольним фрагментом / М. Тупичак, О. Шийка, Н. Походило, М. Обушак // Вісник Львів. ун-ту. Сер. хім. - 2018. Вип. 59. Ч. 2. С. 294-299 DOI: <https://doi.org/10.30970/vch.5902.294> Шийка О.Я. Тієніламіногідрозони: синтез та дослідження реакцій циклізацій на їх основі / О.Я. Шийка, Н.Т. Походило, М.А. Тупичак, М.Д. Обушак // Вісник Львів. ун-ту. Сер. хім. - 2017. - Вип. 58, ч. 2. - С. 253-260. <http://publications.lnu.edu.ua/bulletins/index.php/chemisrty/article/view/7441> Шерєдин М. 3-феніл-6-(R-феніл)тієно[3,2-d][1,2,3]тріазіно-4(3H)-онів / М. Шерєдин, М. Кравець, Ю. Остап'юк // Вісник Львів. ун-ту. Сер. хім. - 2017. - Вип. 58, ч. 2. - С. 308-312. <http://publications.lnu.edu.ua/bulletins/index.php/chemisrty/article/view/7450> Тупичак М. Синтез 3-Н-2-амінотіофенів реакцією декарбоксилювання похідних амінотіофенів Гевальда / М. Тупичак, Н. Походило, О. Шийка, М. Обушак // Вісник Львів. ун-ту. Сер. хім. - 2016. - Вип. 57, ч. 2. - С. 367-372. <http://publications.lnu.edu.ua/bulletins/index.php/chemisrty/article/view/6175> Остап'юк Ю. Синтез 2-(R-феніл)тієно[3,2-b]піридин-5,7(4H,6H)-діонів / Ю. Остап'юк, М. Кравець, М. Шерєдин, Л. Остап'юк // Вісник Львів. ун-ту. Сер. хім. - 2016. - Вип. 57, ч. 2. - С. 379-382. <http://publications.lnu.edu.ua/bulletins/index.php/chemisrty/article/view/6177> Shyyka O.Ya. Anticancer activity evaluation of new thienopyrimidine derivatives / O.Ya. Shyyka, N.T. Pokhodylo, M.A. Tupychak, V.S. Matychuk, M.D. Obushak // IX International Conference in chemistry Kyiv-Toulouse (ICKT-9). - Kyiv. 4-9 June, 2017. - P. 106

Тупичак М.А. Synthesis of new heterocyclic compounds with both thiophene and 1,2,4-triazole scaffolds / М.А. Тупичак, О.Я. Шийка, Н.Т. Pokhodylo, М.Д. Obushak // 7th International Youth Science Forum "Litteris et artibus". - Lviv. 23-25 November, 2017. - Р. 56-57. Пат. 123902 Україна, МПК6 C07D 249/16, C07D 471/04 Спосіб одержання 3-арил-5,7-діаміно-3Н-[1,2,3]триазоло[4,5-*b*]піридин-6-карбонітрилів / Походило Н. Т., Шийка О. Я. Обушак М. Д., Тупичак М.А.; заявник і власник Львівський національний університет імені Івана Франка. - № у 2017 09943; заявл. 13.10.2017; опубл. 12.03.2018, Бюл. № 5. Пат. 127984 Україна, МПК (2018.01), C07D 513/00 A61P 7/00 Спосіб одержання анельованих [1,2,3]триазоло-[1,5-*a*]піримідин-3-іл)метил)малононітрилів / Походило Н. Т., Шийка О. Я., Тупичак М.А.; Обушак М. Д. заявник і власник Львівський національний університет імені Івана Франка. - № у 2018 03402; заявл. 02.04.2018; опубл. 27.08.2018, Бюл. № 16. Пат. Україна, МПК C07D 311/00 Спосіб одержання арил-/гетарил- анельованих 6-гідрокси-2Н-хромен-2-онів / О.Я. Шийка, Р.Л. Мартяк, М.А. Тупичак, Н.Т. Походило, М.Д. Обушак; заявник і власник Львівський національний університет імені Івана Франка (заявка на патент)

8. Звітна документація

Кількість сторінок в звіті: 90

Мова звіту: Українська

Кількість файлів у звіті: 1

9. Заключні відомості

Перелік осіб-виконавців

Вахула Андрій Романович

Литвин Роман Зіновійович

Піткович Христина Євгенівна

Походило Назарій Тарасович

Тупис Андрій Миколайович

Керівник організації:

Мельник Володимир Петрович

Керівники роботи:

Шийка Ольга Ярославівна

**Керівник відділу реєстрації наукової діяльності
УкрІНТЕІ**



Юрченко Т.А.