Облікова картка НДДКР

Державний обліковий номер: 0219U005013

Державний реєстраційний номер: 0116U006000

Відкрита

Дата реєстрації: 11-04-2019

1. Етапи виконання

Номер етапу: 1

Назва етапу: ПОРІВНЯЛЬНЕ ВИВЧЕННЯ НОВИХ ПОХІДНИХ ХІНАЗОЛІНУ ТА ЕРЛОТИНІБУ ДЛЯ ОЗНАЧЕННЯ СПОЛУКИ-ЛІДЕРА, ПЕРСПЕКТИВНОЇ ДЛЯ ВПРОВАДЖЕННЯ В ОНКОЛОГІЧНУ ПРАКТИКУ (остаточний)

Початок етапу: 01-2016

Закінчення етапу: 12-2018

Вид звітного документа: Остаточний звіт

2. Виконавець

Назва організації: Державна установа "Інститут фармакології та токсикології Національної академії медичних наук України"

Код ЄДРПОУ/ІПН: 02011901

Підпорядкованість: Національна академія медичних наук України

Адреса: 03057, вул. Антона Цедіка, 14, Київ

Телефон: 456-42-56

Телефон: 456-42-56

E-mail: ift@amnu.gov.ua

WWW: www.pharm-tox.org.ua

3. Власник результатів НДДКР (продукції)

Назва організації: Національна академія медичних наук України

Код ЄДРПОУ/ІПН: 00061125

Адреса: вул. Герцена, 12, м. Київ, Київська обл., 04050, Україна

Підпорядкованість: Кабінет міністрів

Телефон: 380444893981

E-mail: amn1@ukr.net

WWW: http://www.amnu.gov.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: 6561040

Напрям фінансування: 2.2 - прикладні дослідження і розробки

Джерела фінансування

Джерело фінансування: 7713 - кошти держбюджету

Фактичний обсяг фінансування за звітний етап: 2537.6 тис. грн.

5. Науково-технічна робота

Назва роботи (укр)

ПОРІВНЯЛЬНЕ ВИВЧЕННЯ НОВИХ ПОХІДНИХ ХІНАЗОЛІНУ ТА ЕРЛОТИНІБУ ДЛЯ ОЗНАЧЕННЯ СПОЛУКИ-ЛІДЕРА, ПЕРСПЕКТИВНОЇ ДЛЯ ВПРОВАДЖЕННЯ В ОНКОЛОГІЧНУ ПРАКТИКУ

Назва роботи (англ)

COMPARATIVE STUDY OF NEW DERIVATIVES OF CHINASOLINE AND ERROLOTINBUS FOR THE DEFINITION OF A COMPOUND-LEADER PROVISION FOR INTRODUCTION IN ONCOLOGICAL PRACTICE (final)

Реферат (укр)

Проведено порівняльне вивчення 31 нового похідного хіназоліну та Ерлотинібу. В якості сполуки-лідера відібрана сполука 3105, яка перевищує Ерлотиніб за активністю на клітинній культурі недрібноклітинного раку легень людини (A549), має антиметастатичну дію, відноситься до малотоксичних речовин, що обумовлює доцільність подальшого доклінічного вивчення для можливого впровадження в онкологічну практику при недрібноклітинному раку легень людини. Показана висока протипухлинна дія відомого препарату-похідного хіназоліну, альфа1-адреноблокатора з гіпотензивною дією Доксазозину на лінії недрібноклітинного раку легень людини (A549), що обумовлює доцільність його подальшого вивчення з метою поширення клінічних показань. Відмічено, що основний механізм дії сполуки 3105 - блокада активності рецептора епідермального фактора росту (EGFR) за рахунок пригнічення фосфорилювання тирозину рецептора, який поєднується з блокадою трансактивації EGFR під впливом рецепторів GPCR. Підтверджено доцільність пошуку таргетних протипухлинних засобів серед конденсованих нітрогенвмісних гетероциклів. який поєднується з блокадою трансактивації EGFR під впливом рецепторів GPCR. Підтверджено доцільність подальшого пошуку таргетних протипухлинних засобів серед конденсованих нітрогенвмісних гетероциклів.

Реферат (англ)

A comparative study of 31 new derivatives of quinazoline and Erlotinib was conducted. As a leader compound was selected compound 3105 that is superior to Erlotinib with activity in the cell culture of non-small cell lung cancer in humans (A549), has an antimetastatic effect, is related to low-toxicity substances, which makes it resonable for further preclinical studies and possible introduction into cancer practice non-small cell lung cancer. The high antitumor activity of the known drug-derivative quinazoline, alfa1-adrenoblockator with hypotensive action of doxazosin on the line of non-small cell lung cancer of the human (A549) is shown, which causes of its further study in order to spread clinical indications. It has been noted that the main mechanism of action of compound 3105 is the blockade of the activity of the epidermal growth factor receptor (EGFR) by inhibiting the tyrosine receptor phosphorylation, which is coupled with an EGFR transactivation blocking under the influence of the GPCR receptors. It was confirmed reasonable finding targeted antitumor agenents among condensed nitrogen-containing heterocycles.

Індекс УДК: 615.03; 615.1/.3, 615.5+661.12+616.006.4+615.7

Коди тематичних рубрик НТІ: 76.31

6. Науково-технічна продукція (НТП)

НТП 1

Назва продукції (укр): Сполука 3105 - потенційний протипухлинний препарат

Назва продукції (англ): Compound 3105 is a potent antitumor drug

Очікувані результати: Поліпшення ефективності лікування хворих

Галузь застосування: Медицина

Опис продукції (укр): Серед похідних хіназоліну сучасна сполука 3105, яка виявляє вмсоку активність при недрібноклітинному раку легенів людини (лінії А549)

Соціально-економічна спрямованість НТП:

Стадія завершеності НТП: Експериментальний (макетний зразок)

Впровадження НТП: Не впроваджено

Строки впровадження: не визначені

Виробник продукції: ДУ "ІФТ НАМН України"

Споживачі продукції: лікувальні заклади

Перспективні ринки: Україна

Права інтелектуальної власності: Отримано патент

Форми та умови передачі продукції: Продаж патента

7. Бібліографічний опис

1. Пат. 128071 UA, МПК (2018.01) A61K 31/381 (2006.01), A61K 31/498 (2006.01), C07D 409/12 (2006.01), A61P 35/00. Етил-2-(хіназолін-4-іл-аміно)-4,5,6,7-тетрагідро-1-бензотіофен-3-карбоксилат гідрохлорид, що має протипухлинну дію на недрібноклітинному раку легенів людини./ Шарикіна Н.І., Демченко А.М., Мєшкова Н.О., Бобкова Л.С., ХайрулінА.Р., Міщенко О.В., Рогозін В.В., Червіовський Д.О., Пенделюк С.І., Максюта С.В., Бухтіарова Т.А. ДУ "Інститут фармакології та токсикології НАМН України" - № u 2018 04303; заявл. 19.04.2018; опубл. 27.08.2018, бюл. №16. 2. Дослідження цитостатичної дії похідних хіназоліну / Н.О. Мєшкова, Н.І. Шарикіна [та ін.] // Фармакологія та лікарська токсикологія. - 2016. - №1 (47)- С.87-90. 3. Клітинні сигнальні системи, пухлинний ріст і похідні хіназоліну / Н.І. Шарикіна, А.М. Демченко [та ін.] // Матеріали V Національного з'їзду фармакологів України. 18-20 жовтня 2017, м. Запоріжжя - с. 136-137. 4. Цитостатична дія похідних хіназоліну на лінії остеосаркоми людини (MG 63) / Н.О. Мєшкова, М.А. Мунько, Н.І. Шарикіна // Матеріали V Національного з'їзду фармакологів України.18-20 жовтня 2017, м. Запоріжжя - с. 93. 5. Цитостатична дія похідних хіназоліну на лінії недрібноклітинного раку легенів людини (А-549) порівняно з тамсулозином / Н,О. Мєшкова, А.Г. Родівоєвич, Н.І. Шарикіна // Матеріали V Національного з'їзду фармакологів України.18-20 жовтня 2017, м. Запоріжжя - с. 93. 6. Протипухлинна активність похідних хіназоліну на не дрібноклітинному раку легенів людини (підкапсульний тест) / Н.О. Мєшкова, О.О. Хавич [та ін.] // Матеріали V Національного з'їзду фармакологів України.18-20 жовтня 2017, м. Запоріжжя - с. 94-95. 7. Антиметастатична дія похідних хіназоліну / Т.А. Карацуба, Н.І. Шарикіна [та ін.] // Матеріали V Національного з'їзду фармакологів України.18-20 жовтня 2017, м. Запоріжжя - с. 58. 8. Порівняльне вивчення цитостатичної активності та механізмів дії похідних хіназоліну (Ерлотиніб , Доксазозин, Прозозин) / Н.І. Шарикіна, О.О. Хавич [та ін.] // Одеський медичний журнал, 2018, № - (в друці). 9. Активність похідного хіназоліну (сполука 3105) на гетеротрансплантатах раку легенів людини (підкапсульний тест) / Н.І. Шарикіна, О.О. Хавич [та ін.] // "Фармакологія та лікарська токсикологія", 2018, № - (в друці).

8. Звітна документація

Кількість сторінок в звіті: 199

Мова звіту: Українська

Кількість файлів у звіті: 1

9. Заключні відомості

Перелік осіб-виконавців

Акімова Н.

Баглай О.

Бакал Л.

Бобкова Л.

Борець А.

Гладиш Ю.

Голубов М.

Дабіжа Н.

Делян Є.

Демченко С.

Дніпрова Т.

Зоценко Л.

Карацуба Т.

Колядич О.

Максюта С.

Матвієнко А.

Паршиков О.

Рогозін В.

Середенко О.

Старікова О.

Хавич О.

Червіовський Д.

Шелест Д.

Керівник організації:

Бухтіарова Тетяна Анатоліївна (д. мед. н., член-кор.)

Керівники роботи:

Шарикіна Надія Іванівна, Демченко Анатолій Михайлович

Керівник відділу реєстрації наукової діяльності УкрІНТЕІ

Юрченко Т.А.