Облікова картка НДДКР

Державний обліковий номер: 0220U101516

Державний реєстраційний номер: 0115U001404

Відкрита

Дата реєстрації: 12-02-2020

1. Етапи виконання

Номер етапу: 5

Назва етапу: Оптимізація структури сполук та виявлення високоефективних лігандів ДНК. Тестування активних інгібіторів ферментів у культурах пухлинних і бактеріальних клітин

Початок етапу: 01-2019

Закінчення етапу: 12-2019

Вид звітного документа: Остаточний звіт

2. Виконавець

Назва організації: Інститут молекулярної біології і генетики Національної академії наук України

Код ЄДРПОУ/ІПН: 05417101

Підпорядкованість: Національна академія наук України

Адреса: вул. Акад. Заболотного, 150, м. Київ, Київська обл., 03143, Україна

Телефон: 380442000356

Телефон: 380445261169

E-mail: inform@imbg.org.ua

WWW: http://www.imbg.org.ua

3. Власник результатів НДДКР (продукції)

Назва організації: Національна академія наук України

Код ЄДРПОУ/ІПН: 00019270

Адреса: вул. Володимирська, 54, м. Київ, Київська обл., 01030, Україна

Підпорядкованість: Кабінет Міністрів України

Телефон: 380442350981

E-mail: prez@nas.gov.ua

WWW: http://nas.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: 6541030

Напрям фінансування: 2.1 - фундаментальні дослідження

Джерела фінансування

Джерело фінансування: 7713 - кошти держбюджету

Фактичний обсяг фінансування за звітний етап: 53 тис. грн.

5. Науково-технічна робота

Назва роботи (укр)

Створення системи швидкого скринінгу ДНК-зв'язувальних сполук для пошуку інгібіторів ферментів біосинтезу нуклеїнових кислот як потенційних протипухлинних і протимікробних засобів

Назва роботи (англ)

Development of the system of fast screening of DNA-binding compounds for the search of inhibitors of nucleic acids biosynthesis enzymes as potential antitumor and antimicrobial agents

Реферат (укр)

Синтезовано нові ДНК-ліганди й досліджено їхню взаємодію з дуплексною та квадруплексною ДНК. При тестуванні у ферментативних системах на основі топоізомерази I та теломерази знайдено активні інгібітори з IC50 у межах 0,2-5 мкМ. Досліджено взаємодію ряду інгібіторів з різними формами ДНК квантово-хімічними методами, розраховано структури й енергетичні параметри комплексів. При вивченні біологічної активності інгібіторів знайдено сполуки, що виявили антипроліферативну дію в культурі пухлинних клітин HeLa в низьких мікро- і наномолярних концентраціях (EC50 0,4-0,9 мкМ). Досліджено антибактеріальну дію серії інгібіторів топоізомерази I щодо грам-позитивних (Bacillus subtilis) і грам-негативних (Pseudomonas fluorescens) мікроорганізмів. Один з ціанінів у концентрації 10 мкМ продемонстрував високу інгібувальну активність до B.subtilis; крім нього, при 50 мкМ бактеріостатичну дію виявили ще три похідні акридину.

Реферат (англ)

New DNA ligands were synthesized and their interact5ion with duplex and quadruplex DNA was studied. Upon testing in enzymatic test-systems based on topoisomerase I and telomerase active inhibitors were found with IC50 in the range 0,2-5 uM. Interaction of some inhibitors with various foorms of DNA was investigated by quantum-chemical methods, structures and energetic parameters of complexes were calculated. Study of biological activity of inhibitors revealed compounds with antiproliferative activity in HeLa tumor cell culture at low micro- and nanomolar concentrations (EC50 0,4-0,9 uM). Antibacterial activity of a series of topoisomerase I inhibitors against Gram-positive (Bacillus subtilis) and Gram-negative (Pseudomonas fluorescens) microorganisms was investigated. One of cyanines in 10 uM concentration showed high inhibitory activity against B.subtilis; at 50 uM bacteriostatic activity demonstrated also three acridine derivatives.

Індекс УДК: 615.2.03, 577.123+577.151+547.8+615.2

Коди тематичних рубрик НТІ: 76.31.29

6. Науково-технічна продукція (НТП)

НТП 1

Назва продукції (укр): Нові інгібітори ферментів топоізомерази I і теломерази з протипухлинною і антимікробною дією in vitro в мікро- та наномолярних концентраціях

Назва продукції (англ): New inhibitors of topoisomerase I and telomerase enzymes with antitumor and antimicrobial activity in vitro at micro- and nanomolar concentrations

Очікувані результати: Методи, теорії

Галузь застосування: медицина

Опис продукції (укр): Отримано нові ДНК-ліганди різних класів та досліджено їхню взаємодію з дуплексною та квадруплексною ДНК спектроскопічними методами та методами молекулярного моделювання. Серед них знайдено ефективні інгібітори ферментів топоізомерази I та теломерази, активні in vitro в концентраціях 0,2-5 мкМ. Виявлено активні інгібітори, що демонструють антипроліферативну та антимікробну дію в культурах пухлинних і бактеріальних клітин у мікро та наномолярному діапазоні концентрацій.

Соціально-економічна спрямованість НТП: Поліпшення якості життя та здоров'я населення, ефективності діагностики та лікування хворих

Стадія завершеності НТП: Звіт по НДДКР

Впровадження НТП: Не впроваджено

Строки впровадження:

Виробник продукції: ІМБГ

Споживачі продукції:

Перспективні ринки: Україна, світ

Права інтелектуальної власності: Отримано патент, За договорами

Форми та умови передачі продукції: Продаж патента, Спільні НДДКР

7. Бібліографічний опис

Науковий звіт про виконання п’ятого етапу проекту

Патент України на корисну модель №UA133622

8. Звітна документація

Кількість сторінок в звіті: 24

Мова звіту: Українська

Кількість файлів у звіті: 1

9. Заключні відомості

Керівник організації:

Тукало Михайло Арсентійович (д. б. н., професор, акад.)

Керівники роботи:

Дубей Ігор Ярославович (д. х. н., с.н.с.)

Керівник відділу реєстрації наукової діяльності УкрІНТЕІ

Юрченко Т.А.