

Синтезированные меркаптоэтанольные производные бициклических моно-терпеноидов борнанового и пинанового типов обладают уникальным сочетанием биологических свойств. Помимо высокой противогрибковой и антибактериальной активности, они оказывают противовоспалительный эффект, антиоксидантную и антигемблиотическую активность. Ввиду отсутствия токсических свойств у данных соединений они перспективны для проведения доклинических и клинических испытаний.

▶ Публикации

1. L.E. Nikitina, P.S. Bocharov, A.A. Ksenofontov, E.A. Antina, I.R. Gilfanov, R.S. Pavelyev, O.V. Ostolopovskaya, I.V. Fedyunina, Z.R. Azizova, S.V. Pestova, E.S. Izmet'ev, S.A. Rubtsova, S.V. Boichuk, A.R. Galembikova, E.A. Smolyarchuk, I.G. Mustafin, A.R. Kayumov, A.V. Samorodov. Unraveling the mechanism of platelet aggregationsuppression by thioterpenoids: molecular docking and in vivo antiaggregant activity // *Biomimetics*. – 2023. – V. 8. – P. 570.

2. L.E. Nikitina, S.A. Lisovskaya, I.R. Gilfanov, R.S. Pavelyev, O.V. Ostolopovskaya, I.V. Fedyunina, S.V. Kiselev, Z.R. Azizova, S.V. Pestova, E.S. Izmet'ev, S.A. Rubtsova, R.F. Akhverdiev, A.V. Gerasimov, E.A. Sarbazyan, O.T. Shipina, S.V. Boichuk, A.G. Izmailov. Thioterpenoids of the bornane series with potent activity against opportunistic micromycetes // *BioNanoScience*. – 2023. – V. 13. – P. 26–35.

▶ Контакты

ФИЦ Коми НЦ УрО РАН

📍 167982, Республика Коми, г. Сыктывкар, ул. Коммунистическая, д. 24

☎ 8 (8212) 24-53-78
Факс: 8 (8212) 24-22-64

✉ info@frc.komisc.ru



Институт химии
ФИЦ Коми НЦ УрО РАН

📍 167982, Республика Коми, г. Сыктывкар, ул. Первомайская, д. 48

☎ 8 (8212) 24-10-45 / доб. 26
Факс: 8 (8212) 21-84-77

✉ info@chemi.komisc.ru



▶ Авторы

РУБЦОВА Светлана Альбертовна

д-р хим. наук, директор Института химии
ФИЦ Коми НЦ УрО РАН, зав. лаб. медицинской химии
rubtsova-sa@chemi.komisc.ru

НИКИТИНА Лилия Евгеньевна

д-р хим. наук, проф., зав. кафедрой общей
и органической химии КГМУ
nikitl@mail.ru

ИЗМЕСТЬЕВ Евгений Сергеевич

канд. хим. наук, ст. науч. сотр.
evgeniyizmetev@rambler.ru

ПЕСТОВА Светлана Валерьевна

канд. хим. наук, науч. сотр.
pestova-svetlana89@mail.ru

ШЕВЧЕНКО Оксана Георгиевна

ст. науч. сотр. ИБ ФИЦ Коми НЦ УрО РАН

САМОРОДОВ Александр Владимирович

д-р хим. наук, зав. кафедрой фармакологии с курсом
клинической фармакологии БГМУ

ОСТОЛОПОВСКАЯ Ольга Вячеславовна

канд. хим. наук, ст. науч. сотр. КФУ

ФЕДЮНИНА Инна Витальевна

канд. хим. наук, КГМУ

ГИЛЬФАНОВ Ильмир Рафисович

аспирант, КГМУ



Федеральное государственное бюджетное учреждение науки
Федеральный исследовательский центр
«Коми научный центр Уральского отделения
Российской академии наук»



Институт химии Коми научного центра
Уральского отделения
Российской академии наук



ФГБОУ ВО «Казанский
государственный
медицинский университет»
Министерства здравоохранения
Российской Федерации

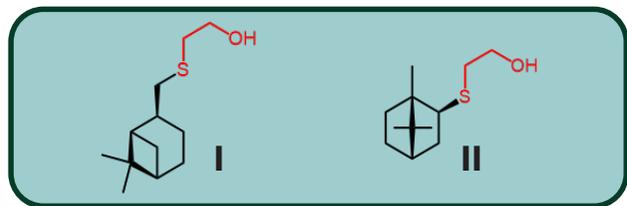
**СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ
ГРИБКОВЫХ
ВОСПАЛИТЕЛЬНЫХ
ЗАБОЛЕВАНИЙ КОЖИ,
ЕЁ ПРИДАТКОВ
И СОПУТСТВУЮЩИХ ИМ
ТРОМБОЗОВ**

▶ Патенты на изобретение RU:
№ 2808474, № 2819387;

▶ Заявка на изобретение EA:
№ 202391140.

Описание разработки

Получены новые хиральные производные монотерпеноидов пинановой и изоборнановой структур с тиоэтанольным фрагментом, обладающие широким спектром биологической активности



Противогрибковые средства

Антибактериальные средства

Противовоспалительные средства

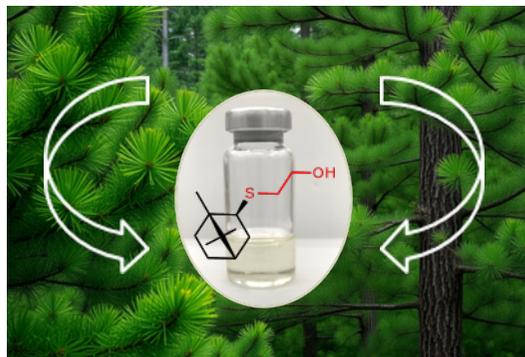
Антиагреганты для лечения тромбозов

Кардиопротекторы

Антикоагулянты

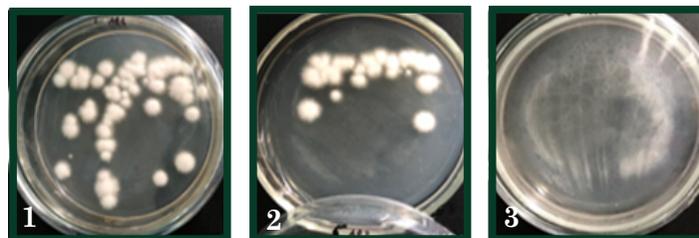
Антиоксиданты

Изобретение направлено на расширение арсенала средств, которые могут быть использованы для лечения грибковых воспалительных заболеваний кожи, её придатков, профилактики и лечения тромбозов.



Противогрибковая активность соединения II

Соединение	МПК мкг/мл				
	<i>C. albicans</i> РКПГУ-401/ NCTS- 885-653	<i>C. albicans</i> C- 417-20 (кл. уз.)	<i>R. rubra</i> 3964-15	<i>A. niger</i> ВКМ F-1119	<i>F. Solani</i> F- 417-20 (кл. уз.)
Соединение II	11.2	22.5	22.5	90	90
Мирамистин	45	90	45	90	90
Бензалкония хлорид	11.2	11.2	11.2	11.2	22.5
Флуконазол	45	90	90	360	180
Тербинафин	11.2	90	22.5	5.6	45



Подавление *Fusarium solani* соединением II (КОЕ/мл) / сутки (1 – первые сутки; 2 – пятые сутки; 3 – седьмые сутки).

Для создания эффективных лечебных средств разработаны новые способы получения соединений: 2-((1S,2R,5S)-6,6-диметилбицикло[3.1.1]гепт-2-ил)метилсульфанилэтанола (соединение I) и 2-((1S,2S,4S)-1,7,7-триметилбицикло[2.2.1]гепт-2-ил)сульфанилэтанола (соединение II).

Оба способа обеспечивают выход конечных продуктов с чистотой 95 и 97 % без образования примесей в виде стереоизомерных продуктов.

Противовоспалительная активность соединения II



1 – начало заражения;
2 – через 6 дней при лечении соединением II;
3 – через 6 дней после лечения Пимафуцином.

Потенциальная область применения

Пациенты группы риска, а именно с системными микозами, трофическими язвами, экземами, хроническими заболеваниями бронхолегочной, желудочно-кишечной, мочевыделительной и других систем, пожилые люди, пациенты с заболеваниями эндокринной системы, особенно сахарным диабетом, треть которых страдают микозами кожи туловища, стоп и ногтей пластинок.