

## ОТЗЫВ

официального оппонента на диссертацию

Постнова Владимира Анатольевича

«Синтез новых оксазолсодержащих систем и их сульфопроизводных»,  
представленную на соискание учёной степени кандидата химических наук  
по специальности 02.00.03 — Органическая химия

Представленная диссертация посвящена синтезу сульфамидных и сульфоалкановых производных фенил(тиенил) оксазола и прогнозированию их биологических свойств. Получение новых соединений, содержащих в своей структуре серусодержащие фрагменты, существенно увеличивает шанс нахождения среди них веществ, потенциально обладающих биологической активностью. Это делает постановку задачи получения библиотек указанных соединений весьма современной и актуальной. Указанные аргументы определили цель работы и, таким образом, сделали вполне актуальной поставленную задачу.

Диссертационная работа построена традиционно и состоит из введения, литературного обзора, обсуждения полученных результатов, эксперимента, выводов и списка литературы, насчитывающего 82 наименования.

Литературный обзор (30 стр., ~80 ссылок) написан неплохим языком, содержит незначительное число опечаток, разумно структурирован и представлен в достаточно логичной форме для целей, поставленных в работе. В обзоре обобщены современные представления (1) о методах получения оксазолов, (2) о методах получения сульфопроизводных оксазола и (3) о применении оксазолов. К сожалению, представленный обзор не полон. Заслуживает удивления ссылки на значительное количество патентов и отсутствие ссылок на ряд современных работ. Хотя в обзоре имеется отдельный раздел по синтезу оксазолов трансформацией других гетероциклических систем, в этом разделе не упомянуты методы синтеза оксазолов перегруппировкой Корнфорта, а также расщеплением шестичленного цикла оксазоло-пиримидинов или оксазоло-пиридинов, что подробно отражено в работах оппонента. Также отсутствуют современные методы получения мезоионных соединений оксазолиевого ряда. Отсутствует ссылка на метод сульфохлорирования 2-метил-5-фенилоксазола, на способ ввода серу-содержащей группы через реактив Гриньяра.

МГУДТ  
Входящий № 83-01-134  
Дата 08 ИЮН 2016

Новизна результатов очевидна. Во-первых, реакцией хлорангидрида щавелевой кислоты с альфа-аминокетонами получены 2-этоксикарбонил-производные оксазола, их амиды и продукты удаления сложноэфирной группы. Во-вторых, через стадию сульфохлорирования 5-арил(тиенил) оксазолов получены сульфонамиды и сульфоалкановые кислоты. Все эти соединения составили комбинаторную библиотеку оксазолов. Заметим, что хотя единичные примеры этих синтезов в литературе последних лет (в основном, патентной) имеются, тем не менее, систематическое изучение этих реакций проведено впервые.

Экспериментальная часть выполнена на высоком уровне. Достоверность результатов не вызывает сомнений. Все соединения выделялись препаративно, их структура и чистота убедительно доказаны при помощи ЯМР и масс-спектров, а в ряде случаев – элементарным анализом. К сожалению, автор не приводит литературных констант веществ для тех случаев, когда они известны (бромкетоны, аминокетоны, простейшие производные оксазолов и т.д.), приводя их спектры как если бы это были новые соединения. Это несколько затрудняет анализ новизны полученных веществ.

Практическая значимость диссертации очевидна. В работе приведен синтез огромной библиотеки замещенных оксазолов, полностью охарактеризованной ПМР- и масс-спектрами, пригодной для дальнейшего исследования ее биологической активности; более того, 30 веществ протестированы как ингибиторы угольной ангидразы.

Результаты работы могут быть внедрены в практику академических учреждений и в учебные программы химических и биологических факультетов университетов и вузов Москвы, Екатеринбурга, Санкт-Петербурга, Новосибирска и др., а также на предприятиях страны.

Материал работы полно отражен в автореферате и опубликованных статьях.

Замечаний принципиального характера практически нет. В качестве **замечаний** отметим следующие:

- Как уже отмечалось, литературный обзор не полон.
- Лишь некоторые из полученных веществ охарактеризованы данными элементного анализа, а уже известные вещества никак не отделены ссылками от

НОВЫХ.

– В работе имеется значительное число опечаток и неудачных выражений; так, повсеместно используется термин «ду~~п~~лет» вместо дублета, не соответствуют стехиометрии формулы 1.2 и 1.42, есть ошибка в формуле 1.127 и т.д.

Указанные замечания не влияют на общую высокую оценку работы. Работа имеет принципиальную значимость и является научно-квалификационной. Диссертация Постнова Владимира Анатольевича соответствует критериям, предъявляемым к кандидатским диссертациям в «Положении о порядке присуждения ученых степеней», утвержденном постановлением Правительства Российской Федерации № 842 от 24 сентября 2013 г. (пункты 9-14), а ее автор Постнов Владимир Анатольевич, безусловно, заслуживает присуждения искомой степени кандидата химических наук по специальности 02.00.03 – Органическая химия.

Евгений Вениаминович Бабаев

Е.В. Бабаев

Доктор химических наук по специальности 02.00.03 – органическая химия, профессор, вед.науч.сотр. каф. органической химии хим. ф-та МГУ.

Адрес: 119991, Москва, Ленинские горы, дом 1, строение 3, ГСП-1,

МГУ имени М.В. Ломоносова, химический факультет. Тел. +7(495)939-3020.

E-mail: babaev@org.chem.msu.ru

Подпись Бабаева Е.В. удостоверяю,  
декан Химического факультета МГУ  
имени М.В. Ломоносова,  
академик



В.В. Лунин

16 мая 2016 г.