

ОТЗЫВ

на автореферат кандидатской диссертации Вакарова С.А.
«Кинетическое разделение рацемических аминов при ацилировании
хлорангидридами *N*-сульфонил-(*S*)-пролинов и 2-оксикислот»,
представленной на соискание ученой степени кандидата химических наук
по специальности «02.00.03 – органическая химия»

Одной из актуальных задач современной органической химии является поиск рациональных методов получения новых практически полезных соединений, полученных с определенной регио- и стереоселективностью, в том числе и оптически чистых, поскольку широко известно, что индивидуальные энантиомеры могут обладать в сотни и даже тысячи раз более высокой фармакологической активностью, чем их рацемические смеси. Создание новых физиологически активных, в том числе и энантиомерно чистых, препаратов, изучение возможных механизмов их образования, а также методы их разделения относятся к числу весьма актуальных проблем органической и медицинской химии.

Диссертационная работа Вакарова С.А. посвящена изучению методов получения энантиочистых аминов с помощью кинетического разделения, основанного на ацилировании рацемических аминов хиральными агентами: производными (*S*)-пролина, 2-окси- и 2-тиокарбоновых кислот, установлению закономерностей, факторов и оптимальных условий, определяющих стереоселективность каждого процесса.

Диссертантом проведено изучение кинетического разделения широкого ряда рацемических гетероциклических аминов методом ацилирования хлорангидридами хиральных кислот (*N*-сульфонил-(*S*)-пролинов и их структурных аналогов, 2-фенокси-, 2-метокси- и 2-фенилтиоокислот). Найден оптимальный метод кинетического разделения широкого круга рацемических гетероциклических аминов (в том числе и не содержащих в структуре ароматических групп) при помощи хлорангидрида *N*-тозил-(*S*)-пролина. Выявлены также и другие перспективные разделяющие агенты, например, хлорангидриды 2-феноксикислот. Автором разработано несколько эффективных способов получения оптически чистых (*R*)-2-феноксипропионовой кислоты и (*S*)-энантиомера 3,4-дигидро-3-метил-2*H*-[1,4]бензотиазина.

Выводы о стереоселективности и строении продуктов реакции были сделаны с использованием методов ВЭЖХ, ГЖХ-масс-спектрометрии, спектроскопии ЯМР, поляриметрии и с помощью рентгеноструктурного анализа. Исследование реакции ацилирования аминов хлорангидридами 2-арилпропионовых кислот подтверждены квантово-химическими методами. Результаты проведенной работы в достаточной мере освещены в соответствующих публикациях.

По автореферату имеются несколько незначительных замечаний, не умоляющих высокую практическую значимость работы:

1. Автор не указывает основную причину выбора в качестве объектов исследования для кинетического разделения указанных рацемических аминов и возможные конкретные области применения полученных энантиочистых аминов.

2. По тексту имеются несколько неудачных выражений.

В целом диссертантом выполнена очень большая по объему, трудоемкая и кропотливая работа по изучению кинетического разделения широкого ряда рацемических гетероциклических аминов методом их ацилирования хлорангидридами хиральных кислот, последующему выделению продуктов реакций, всесторонней обработке, доказательству строения, установлению энантиомерной чистоты и анализу полученных результатов, включая методы квантово-химических расчетов.

Считаем, что диссертационная работа Вакарова С.А. как по объему, так и по значимости полученных результатов соответствует п.9 «Положения о присуждении ученых степеней», предъявляемым к кандидатским диссертациям и является научно-квалификационной работой, в которой содержится решение одной из задач в области стереоселективного синтеза, имеющей теоретическое значение для развития стереохимии и прикладное для медицинской и фармацевтической химии, а ее автор заслуживает присуждения искомой ученой степени кандидата химических наук.

**Зав. кафедрой органической химии
ФГБОУ ВПО «ОмГУ им. Ф.М. Достоевского»,
д.х.н. (02.00.03 – органическая химия),
профессор**

Александр Семенович Фисюк

**Профессор кафедры органической химии
ФГБОУ ВПО «ОмГУ им. Ф.М. Достоевского»,
д.х.н. (02.00.03 – органическая химия),
доцент**

Иван Вячеславович Кулаков

Телефон: +7

e-mail: fisyuk@chemomsu.ru

644077 Россия, г. Омск, проспект Мира, 55а

Подписи зав. кафедрой и профессора кафедры органической химии
д.х.н. Фисюка А.С. и Кулакова И.В. удостоверяю

Ученый секретарь
Ученого Совета ОмГУ им.Ф.М. Достоевского

Л.И.Ковалевская

15.01.2016 г.

