

## ОТЗЫВ

официального оппонента на диссертацию

Ефимова Ильи Вагизовича

«Реакции  $\beta$ -азолиленаминов с азидами и гидроксамоилхлоридами.

Синтез 4-азолил-1,2,3-триазолов и 4-азолилзоксазолов»,

представленную на соискание учёной степени кандидата химических наук

по специальности 02.00.03 — Органическая химия

Представленная диссертация посвящена изучению реакционной способности  $\beta$ -азолиленаминов в реакциях [3+2] циклоприсоединения с азидами и гидроксамоилхлоридами с образованием 4-азолил-азолов имидазольного, оксадиазольного, изоксазольного, изотиазольного, 1,2,3-триазольного и тиadiaзольного ряда. В результате обнаружены новые химические реакции и трансформации азолил-енаминов, приводящие к библиотекам новых веществ, потенциально обладающих биологической активностью. Указанные аргументы определили цель работы и, таким образом, сделали весьма современной и **актуальной** поставленную задачу.

Диссертационная работа (138 с.) построена традиционно и состоит из введения, литературного обзора, обсуждения полученных результатов, эксперимента, выводов, списка литературы, насчитывающего 122 наименования, и приложения.

**Литературный обзор** (48 стр., ~74 ссылки) 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 о реакциях 1,3-диполярного циклоприсоединения  $\beta$ -азолиленаминов к азидам и нитрилоксидам, причем отмечены различия между ациклическими, экзо- и эндоциклическими енаминами. В обзоре также рассмотрены основные пути стабилизации образующихся неароматических циклов. Из обзора следуют два вывода — о синтетической эквивалентности енаминов и ацетиленов (что позволяет автору привлечь данные современной click-химии) и об иных возможностях этих

реакций енаминов (что открывает возможность синтеза амидинов, диаминоалкенов и т.д.)

Новизна результатов очевидна. Во-первых, обнаружены новые химические реакции и трансформации  $\beta$ -азолиленаминов в реакциях с азидами и гидроксамоилхлоридами. Во-вторых, в результате исследования реакций с сульфонлазидами показано, что в зависимости от природы енамина и условий реакции образуются либо 1,2,3-триазолы, либо производные гетарил-диаминоалкенов.

Экспериментальная часть выполнена на высоком уровне. Достоверность результатов не вызывает сомнений. Все соединения выделялись препаративно, их структура и чистота убедительно доказаны при помощи ИК-, ЯМР  $^1\text{H}$  и  $^{13}\text{C}$  спектров, масс-спектров, данных элементного и рентгено-структурного анализа.

Практическая значимость диссертации очевидна. В работе осуществлен препаративно удобный синтез новых 4-азолил-замещенных 1,2,3-триазолов и изоксазолов, представляющих интерес для медицинской химии. Более того, ряд соединений протестирован на противоопухолевую активность.

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:

- В Литературном обзоре содержащее пятичленный цикл соединение E125 ошибочно названо 2-изопропилидентетрагидрохинолином (с.28), а содержащее шестичленный цикл соединение E130 – иминотетрагидротетразолом (с.29).

- Вряд ли корректно называть раздел 2.2.3. «Получение 4-азолил- $\text{NH}$ -сульфонил-1,2,3-триазолов», поскольку  $\text{NH}$ -триазолов там нет.

- Вызывает вопросы выбранная нумерация азолил-триазолов с

использованием русского алфавита (соединения бы, баа-ав).

Указанные замечания не влияют на общую высокую оценку работы. Работа имеет принципиальную значимость и является научно-квалификационной. Диссертация Ефимова Ильи Вагизовича соответствует критериям, предъявляемым к кандидатским диссертациям, установленным ВАК в п.9 «Положения о порядке присуждения ученых степеней» утвержденного постановлением Правительства РФ от 30 января 2002 г., №74, с учетом изменений, внесенных постановлением Правительством РФ №227 от 20 апреля 2006 г., а ее автор – Ефимов Илья Вагизович – безусловно, заслуживает присуждения ученой степени кандидата химических наук по специальности 02.00.03 — органическая химия.

Ведущий научный сотрудник Химического факультета  
МГУ имени М.В. Ломоносова, доктор химических наук  
(02.00.03 – органическая химия), профессор,  
Евгений Вениаминович Бабаев

Е.В. Бабаев

119991, Москва, Ленинские горы, дом 1, строение 3, ГСП-1,  
МГУ, химический факультет.

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



 В.В. Лунин

26 февраля 2015 г.