

## ОТЗЫВ

на автореферат диссертационной работы Рахмонова Рахмона Охоновича на тему «Рециклизация 2-амино-1,3,4-тиадиазолов в синтезе полиядерных гетероциклических соединений», представленной на соискание ученой степени доктора химических наук по специальности 1.4.3 – органическая химия.

В последние годы особое внимание уделяется синтезу высокоэффективных препаратов на основе синтетических аналогов природных биологически активных веществ, которые обладают физиологической активностью.

Диссертационная работа представленная Рахмонова Рахмона Охоновича, по результатам автореферата посвящена синтезу и исследованию биологически активных аналогов пурина, включающих производных имидазо[2,1-*b*][1,3,4]-тиадиазолов и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6Н)-она. Синтетический аналог пурина имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазолов и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6Н)-он обладают широким спектром биологической активности. Для изучения биологической, а именно: противомикробной, антиагрегатной по отношению к тромбоцитам и противовирусной активностью синтезированы соединений ряда имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазола и 1,3,4-тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидина и их производных содержащие в положениях 2, 5 и 6 различной природы заместителей. Разработка способов синтеза имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазола и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6Н)-она, позволяющих широко варьировать заместители в положениях 2, 5 и 6 данных гетероциклов, для этой цели является важным. Производные поликонденсированных тиадиазолов и продукты их химических превращений представляют потенциальную ценность не только для фармакологии, но и для получения хиральных лигандов, гербицидов и ценных полициклических синтонов.

Таким образом, синтез производных имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазолов и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6H)-онов, изучение их химических и биологических свойств является актуальным.

Изучая различные методы синтеза производных имидазо[2,1-*b*][1,3,4]-тиадиазольных и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6H)-она автор пришел к выводу, что наиболее распространенной являются реакции циклоприсоединения производных 2-амино-1,3,4-тиадиазолов к *n*-бром-, *n*-йодофенацилбромидамиом и этиловый эфир циклопентан-2-онам в среде *n*-бутанола и полифосфорной кислоты.

В дальнейшем диссертант подробно изучает методы синтеза 2-RNH-6-(*n*-бром/йодофенил)имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазола, 2-бromo-5-CH<sub>2</sub>NH-R-6-(*n*-бромфенил)имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазола, 2-Ph- и 2R-тио-7,8-дигидроциклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6H)-она и их производных. Автор подробно изучает физико-химические свойства, строение и структуру полученных соединений различными методами в частности ЯМР-, Масс-, ИК-спектроскопией и элементным анализом.

Диссертант подробно и последовательно обсуждает полученные экспериментальные результаты по синтезу и биоактивным свойствам различных полифункциональных замещенных в положении 2, 5 и 6 имидазо[2,1-*b*][1,3,4]-тиадиазольного и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6H)-онового цикла. Используя различные методы диссертант впервые синтезировал 2-бром-6-(*n*-бромфенил)имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазола, 2-бром-6-(*n*-йодофенил)имидазо[2,1-*b*][1,3,4]тиадиазола и 2-бром-7,8-дигидроциклопентан[*d*][1,3,4]-тиадиазоло[3,2-*a*]пиримидин-5(6H)-она исходя из 2-амино-5-бром-1,3,4-тиадиазол *n*-бром-, *n*-йодофенацилбромидамиом и этиловый эфир циклопентан-2-она. Им подробно, обсуждены удобства данного метода. Строение полученных соединений подтверждены ИК-, ЯМР-, масс-спектрокопией и элементным анализом. Указано, что полученные данные подтверждаются и литературными данными.

Методом молекулярного докинга с целевым белком глюкозамин-1-фосфат-N-ацетилтрансферазой изучены противотуберкулезные свойства синтезированных соединений. В качестве положительного контроля использовали тиацетазон – противотуберкулезный препарат.

Показано, что среди производных имидазо[2,1-*b*][1,3,4]-тиадиазола и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазола[3,2-*a*]пиримидин-5(6H)-она максимальную величину докинга показало соединение 5-бром-6-(*n*-бромфенил)-N-циклогексилимидазо[2,1-*b*][1,3,4]-тиадиазол-2-амин.

Полученные результаты работы, и в частности разработанные методики синтеза производных имидазо[2,1-*b*][1,3,4]-тиадиазолов и циклопентан[*d*][1,3,4]тиадиазола[3,2-*a*]пиримидин-5(6H)-онов и условия их очистки могут быть, использованы для создания новых высокоэффективных препаратов с высокой биологической активностью.

В целом отмечаю, что представленная Рахмонов Р.О. диссертационная работа по актуальности, научной новизне, практической значимости, результатами выводам отвечает требованиям, предъявляемым к диссертациям на соискании ученой степени доктора химических наук по специальности 1.4.3-органическая химия, а ее автор заслуживает присуждения ученой степени доктора химических наук.

Заведующий микробиологической лабораторией  
Центра технологического превосходства  
«Передовые химические и биотехнологии»  
доктор сельскохозяйственных наук, профессор  
Песцов Георгий Вячеславович



Подпись Песцова Г. В.  
заверяю. Начальник отдела  
делопроизводства и связи

Б. Сид