

ЗАКЛЮЧЕНИЕ ДИССЕРТАЦИОННОГО СОВЕТА Д047.003.03  
НА БАЗЕ ИНСТИТУТА ХИМИИ ИМ. В.И. НИКИТИНА АКАДЕМИИ НАУК  
РЕСПУБЛИКИ ТАДЖИКИСТАН ПО ДИССЕРТАЦИИ  
НА СОИСКАНИЕ УЧЁНОЙ СТЕПЕНИ ДОКТОРА НАУК

аттестационное дело № \_\_\_\_\_

решение диссертационного совета от 10.10.2018г., протокол № 21

О присуждении Пулатову Элмуроду Холикуловичу, гражданину Республики Таджикистан, ученой степени доктора химических наук.

**Диссертация** «Синтез и свойства 1,3-тиазолидинов и 1,3,4-тиадиазинов на основе ацетиленовых производных» по специальности 02.00.03-Органическая химия принята к защите 13 июня 2018 года протокол № 7 диссертационным советом Д 047.003.02 на базе Института химии им. В.И. Никитина Академии наук Республики Таджикистан, 734063, Таджикистан, г. Душанбе, ул. Айни, 299/2, приказ Минобрнауки РФ №1238/нк, от 19 декабря 2017 года.

Соискатель Пулатов Элмурод Холикулович 1966 года рождения, в 1991 году окончил биолого-химический факультет Душанбинского государственного педагогического института им. Т.Г. Шевченко по специальности «биолог-химик», получив квалификацию преподаватель биологии-химии. Диссертацию на соискание ученой степени кандидата химических наук «Синтез и модификация 2-R-имино-4,4-диалкил-5-метилтиазолидинов» защитил в 1997 году, в диссертационном совете К 013.02.02, созданном на базе Института химии им. В.И. Никитина Академии наук Республики Таджикистан. В настоящее время работает ведущим научным сотрудником лаборатории «Органического синтеза» Института химии им. В.И. Никитина Академии наук Республики Таджикистан.

Диссертация выполнена в лаборатории «Органического синтеза» Института химии им. В.И. Никитина Академии наук Республики Таджикистан.

**Научный консультант:** доктор химических наук, профессор, Исобаев Музафар Джумаевич, заведующий лабораторией «Органического синтеза» Института химии им. В.И. Никитина Академии наук Республики Таджикистан.

**Официальные оппоненты:**

Бабаев Е.В., д.х.н., проф., в.н.с. кафедры органической химии МГУ им. М.В. Ломоносова; Шемякина О.А., д.х.н., с.н.с., руководитель «Группы промышленно – ориентированных исследований и разработок» ФГБУН Иркутский институт химии

им. А.Е. Фаворского СО РАН и Каримов М.Б, д.х.н., проф., директор Душанбинского филиала национального исследовательского технологического университета «Московского института стали и сплавов» (НИТУ «МИСиС») в Республике Таджикистан дали положительные отзывы на диссертацию.

**Ведущая организация.**

Таджикский государственный педагогический университет им. С. Айни, химический факультет, кафедра органической и биологической химии (г. Душанбе) в своём положительном заключении (протокол № 2 от 12.09.2018 г.) подписанным зав. кафедрой органической и биологической химии ТГПУ, к.х.н., доцентом Гуловым Т.Ё., и д.х.н., член корр. АО РТ, проф. кафедры органической и биологической химии ТГПУ Бандаевым С.Г. указали, что результаты работы могут быть внедрены в практику академических учреждений и в учебные программы химических и биологических факультетов вузов г. Душанбе и стран СНГ.

Диссертация Пулатова Э.Х. выполнена на высоком научном уровне, является законченной научно квалификационной работой, в которой представлены результаты полученные автором исследований и разработок, касающихся взаимодействия полифункциональных сера- и азотсодержащих реагентов с различными ацетиленовыми соединениями, позволившие установить направленности и механизмы протекания электрофильных и нуклеофильных реакций, а так же расширения пятичленных гетероциклов до шестичленного тиазинового цикла. Разработаны методики синтеза тиазолидиновых и тиадиазиновых гетероциклов, являющихся потенциально биологически активными. Указанные достижения определяют научную ценность данной диссертационной работы и являются существенным вкладом в органическую химию гетероциклических соединений.

По своей актуальности, научной новизне, объёму выполненных исследований и практической значимости полученных результатов, представленная работа соответствует требованиям пунктов 9-14 «Положения о порядке присуждения ученых степеней», утвержденного Постановлением Правительства Российской Федерации за №1024 от 28.08.2017 года, предъявляемым к диссертациям на соискание ученой степени доктора наук, а её автор достоин присуждения ему ученой степени доктора химических наук по специальности 02.00.03-органическая химия.

**Соискатель имеет** 40 опубликованных работ, в том числе по теме диссертации 28 работ, 11 из которых опубликованы в рецензируемых научных изданиях. Авторский

вклад составляет 86,13%. Общий объем научных изданий 7,75 п.л., в том числе по теме диссертации 5,37 п.л.

Наиболее значительные работы по теме диссертации:

1. Исобаев, М.Д. N-ацильные и N-сульфонильные производные тиазолинов / М.Д. Исобаев, Э.Х. Пулатов // Известия РАН. Серия хим. -1996, №12, с. 2968-2970. Isobaev M.D. N-Acyl and N-sulfonyl derivatives of thiazolidines. M.D. Isobaev, Pulatov E. Kh. / Russ. Chem. Bull., 1996, V. 45, No 12, p. 2820-2822.

2. Safarov, S. Ring-Expansion of 5-Metylenethiazolidine-2-thione with Hydrazine / S. Safarov, E. Pulatov, M.A. Kukaniev, Heinz Kolshorn and Herbert Meier // J. Heterocyclic Chem., 2009, V. 46, p. 552-554.

3. Пулатов, Э.Х. Аминонитрилы в построении тиазолидиновых гетероциклов / Э.Х. Пулатов, М.Д. Исобаев, Б.Г. Мавлонов, И.У. Файзилов // Известия АН Республики Таджикистан. Отд. физ.-мат., хим., геол. и техн. наук, 2014, №1. с. 88-93.

4. Пулатов, Э.Х. Гидроксикетоны в реакциях образования тиадиазинового цикла / Э.Х. Пулатов, М.Д. Исобаев, Б.Г. Мавлонов // Изв. РАН. Серия хим. 2016, № 10, с. 2475-2478. Pulatov E. Kh. Hydroxyketones in the thiadiazine cycle formation. E. Kh. Pulatov, M. J. Isobaev and B.G. Mavlonov / Russ. Chem. Bull., 2016, V. 65, No 11, p. 2475-2478.

5. Пулатов, Э.Х. Сравнительная реакционная способность оксикетонов и их производных с N,S-нуклеофилами Э.Х. Пулатов, М.Д. Исобаев, Б. Г. Мавлонов, Т.Х. Абдуллаев // Изв. РАН. Серия хим. 2018, № 6, с. 1106-1109. Pulatov E. Kh. Comparative reactivity of oxyketones and their derivatives in the reactions with N,S-nucleophiles E. Kh. Pulatov, M. J. Isobaev, B.G. Mavlonov and T. Kh. Abdullaev / Russ. Chem. Bull., 2018, V. 67, No 6, с. 1106-1109.

На автореферат диссертации поступило 5 положительных отзывов:

- от **Кочеткова К.А.**, д.х.н., зав. лаб. гомолитических реакций Института элементарноорганических соединений имени А.Н. Несмеянова (ИНЭОС РАН), г. Москва. Отзыв положительный, имеется замечание:

-можно отметить, что ряд соединений - **12а, 14б, 24б, 25** как и некоторые другие производные, рассмотренные в автореферате, получены в виде рацемата, что необходимо автору в дальнейшем учитывать при изучении физиологических свойств соединений полученного ряда. Это связано с тем, что физиологическая активность (включая токсичность и др.), установленная для некоторых из этих соединений может

существенно отличаться для различных стереомеров этих соединений. Поэтому необходимо предусмотреть расщепление данных рацемических соединений на отдельные энантимеры для их дальнейшего изучения, что, впрочем, вероятно, возможно осуществить известными методами, поскольку полученные автором соединения содержат достаточное количество функциональных групп, обычно используемых в таких процессах. Пояснить причину.;

**-от Новоселова Н.П.**, директора Института прикладной химии и экологии, зав. кафедрой теоретической и прикладной химии федерального государственного бюджетного образовательного учреждения высшего образования «Санкт-Петербургского государственного университета промышленных технологий и дизайна» д.х.н., проф., заслуженного деятеля науки РФ, г. Санкт-Петербург. Отзыв положительный, имеются замечания:

-в автореферате не удалось найти возможности оптимизации получения оксикетонов и их бициклических производных;

-нет результатов обсуждения масс-спектров;

-не в полной мере использованы синтетические возможности тион-тиольной таутомерии, например, при получения S-замещенных производных 1,3-тиазолидинтионов;

**-от Горшковой Р.М.**, в.н.с. лаборатории Гидрофильных полимеров Института высокомолекулярных соединений РАН, д.х.н., доцента, г. Санкт-Петербург. Отзыв положительный, имеются замечания:

-в автореферате относительно численных значений выхода продуктов сказано, что «выход конечного продукта составляет 48-60%» (стр. 12). На стр. 13 соответствующая величина составляет 65-80%, на стр. 15 78-90%. Было бы желательно указать ошибку эксперимента;

-автором изучена реакция нитрования в растворе диоксана в соотношении исследуемых тиазолидинов и нитрующей смеси 1:2 (стр. 14). Почему выбрано именно такое соотношение;

-при обсуждении антимикробной, противораковой и антиагулянтной активности полученных соединений было бы желательно привести данные по их токсичности;

-в автореферате присутствуют орфографические и стилистические ошибки.

**-от Махсумова А.Г.**, д.х.н., проф. кафедры химической технологии переработки нефти и газа Ташкентского химико-технологического института,

г. Ташкент, Республики Узбекистан. Отзыв положительный, имеются замечания:

-необходимо было сократить описание ИК- и ПМР –спектров с выделением основных частот и положений сигналов в спектрах;

-биологическая активность ряда синтезированных соединений изучена не в полной мере, и непонятно по каким причинам исследования ограничена только с выявлением бактерицидных свойств;

-от **Аскарова И.Р.**, д.х.н., проф. кафедры Андижанского государственного университета им. З.М. Бобура, заслуженного изобретателя Республики Узбекистана, г. Андижан. Отзыв положительный, имеются замечания:

-в автореферате не обсуждается получение S-замещенных производных 1,3-тиазолидинов и тион-тиольная таутомерия 1,3,4-тиадиазинтиола;

-не в полной мере указаны оптимизация синтеза оксикетонов и их конденсированных производных.

-изучение биологической активности синтезированных соединений не открывает описанный в автореферате диссертации их возможностей и ограничено только антибактериальной активностью.

**Диссертационный совет отмечает, что на основании выполненных соискателем исследований:**

-**разработаны** способы синтеза 2-гидразонотиазолидина, 5-имино-, 5-дибром, 5-монобромамино и 5-аминотиазолидинов. С использованием  $\alpha$ -гидрооксикетонов путём взаимодействия с бифункциональными реагентами получены тиадиазиновые гетероциклы.

-**показана** возможность трансформирования 5-членных тиазолидинов в 6-членных триазинов с использованием гидразингидрата, а также построения триазиновых гетероциклов на основе аминогидразонов;

**Теоретическая значимость исследования обоснована тем, что:**

-**выявлены** основные направления реакции  $\alpha$ -гидрооксикетонов и их производных, которые могут быть использованы для получения тиазолидиновых, тиадиазиновых и триазиновых гетероциклов;

-исследована зависимость направления реакций от различных факторов;

-установлено, что образование тиадиазинов при взаимодействии  $\alpha$ -гидрооксикетонов с тиосемикарбазидом возможно в присутствии каталитических количеств серной или трифторуксусной кислоты, тогда как тиосемикарбазоны этокси- и нитроэфиров  $\alpha$ -гидрооксикетонов в этих условиях в реакцию не вступают.

**Значение полученных соискателем результатов исследования для практики** подтверждается тем, что:

**-предложенные** методики синтеза тиазолидиновых, тиадiazиновых и триазиновых гетероциклов открывают возможность получения пяти- и шестичленных гетероциклов с различными функциональными группами;

**-разработаны** новые подходы к синтезу пяти- и шестичленных гетероциклов с различными фармакологически ориентированными функциональными группами, которые расширяют набор потенциальных биологически активных веществ и представляют интерес для дальнейших фармакологических исследований. Полученные тиазолидины с N(3) ацильными, сульфанильными и карбамоилными группами обладают бактерицидной активностью, тогда как амиды и толуолсульфамины тиадiazинов ингибируют агглюгацию тромбоцитов;

**-предложенные** результаты исследования представляют практический интерес для теоретической органической химии и могут быть внедрены в исследования академических учреждений и учебных программах вузов стран СНГ.

**Оценка достоверности результатов исследования выявила:**

Достоверность результатов подтверждается ЯМР-, ИК- и УФ-спектрами, данными элементного анализа и физико-химических методов, встречным синтезом, воспроизводимостью экспериментальных данных.

**-методология** исследований построена на основе основных закономерностей и теории строения химии гетероциклических соединений;

- **идея базируется** на обобщении передового опыта отечественных и зарубежных исследований в области органической химии и гетероциклических соединений;

- **использовано** сравнение полученных автором теоретических и экспериментальных результатов и научных выводов с результатами отечественных и зарубежных ученых;

- **установлено**, соответствие авторских результатов по исследованию физико-химических свойств синтезированных гетероциклических соединений результатам, представленными другими авторами по данной тематике;

- **использованы** современные методики сбора и обработки результатов.

**Личный вклад соискателя** заключается в проведении экспериментальных, испытательных, расчетных работ, обсуждении и интерпретации полученных результатов, формулировке научных положений и выводов диссертации.

На заседании 10 октября 2018 г. диссертационный совет Д 047. 003. 03 при Институте химии им. В.И. Никитина АН Республики Таджикистан принял решение присудить Пулатову Элмуроду Холикуловичу, ученую степень доктора химических наук по специальности 02.00.03-органическая химия.

#### РЕШЕНИЕ ДИССЕРТАЦИОННОГО СОВЕТА

На основании публичной защиты диссертации Пулатова Элмурода Холикуловича на тему: «Синтез и свойства 1,3-тиазолидинов и 1,3,4-тиадиазинов на основе ацетиленовых производных», на соискание учёной степени доктора химических наук по специальности 02.00.03 - органическая химия (химические науки), и результатов тайного голосования членов диссертационного совета (за – 17, против – нет, недействительных бюллетеней – 1) считать, что диссертационная работа соответствует требованиям, предъявляемым к диссертациям на соискание ученой степени доктора химических наук по специальности 02.00.03 – органическая химия (химические науки) п.9 «Положения о порядке присуждения ученых степеней».

На заседании 10 октября 2018 г диссертационный совет принял решение присудить Пулатову Элмуроду Холикуловичу ученую степень доктора химических наук по специальности 02.00.03 – органическая химия (химические науки)

Материалы по защите диссертации направить в Министерство образования и науки Российской Федерации на утверждение.

Председатель  
диссертационного совета Д 047.003.03,  
д.х.н., профессор,



Мухидинов З.К.

Учёный секретарь  
диссертационного совета Д 047.003.03,  
к.х.н.

Усманова С.Р.

10 октября 2018 г.

Подписи Мухидинова З.К. и Усмановой С.Р. заверяю  
Ученый секретарь Института химии им. В.И. Никитина  
АН РТ, к.х.н.

Насриддинов А.