

# Облікова картка дисертації

## I. Загальні відомості

**Державний обліковий номер:** 0519U000240

**Особливі позначки:** відкрита

**Дата реєстрації:** 10-04-2019

**Статус:** Захищена

**Реквізити наказу МОН / наказу закладу:**



## II. Відомості про здобувача

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Пальчиков Віталій Олександрович

2. Palchykov Vitalii O.

**Кваліфікація:** к. х. н., 02.00.03

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Вид дисертації:** доктор наук

**Аспірантура/Докторантура:** ні

**Шифр наукової спеціальності:** 02.00.03

**Назва наукової спеціальності:** Органічна хімія

**Галузь / галузі знань:** Не застосовується

**Освітньо-наукова програма зі спеціальності:** Не застосовується

**Дата захисту:** 04-04-2019

**Спеціальність за освітою:** хімія

**Місце роботи здобувача:** Дніпропетровський національний університет ім. Олеся Гончара

**Код за ЄДРПОУ:** 02066247

**Місцезнаходження:** просп. Гагаріна, буд. 72, м. Дніпро, Дніпропетровський р-н., Дніпропетровська обл., 49010, Україна

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство освіти і науки, молоді та спорту України

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **III. Відомості про організацію, де відбувся захист**

**Шифр спеціалізованої вченої ради (разової спеціалізованої вченої ради):** Д 64.051.14

**Повне найменування юридичної особи:** Харківський національний університет імені В.Н. Каразіна

**Код за ЄДРПОУ:** 02071205

**Місцезнаходження:** майдан Свободи, 4, м. Харків, Харківський р-н., Харківська обл., 61022, Україна

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство освіти і науки України

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **IV. Відомості про підприємство, установу, організацію, в якій було виконано дисертацію**

**Повне найменування юридичної особи:** Дніпропетровський національний університет ім. Олеся Гончара

**Код за ЄДРПОУ:** 02066247

**Місцезнаходження:** просп. Гагаріна, буд. 72, м. Дніпро, Дніпропетровський р-н., Дніпропетровська обл., 49010, Україна

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство освіти і науки, молоді та спорту України

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **V. Відомості про дисертацію**

**Мова дисертації:**

**Коди тематичних рубрик:** 31.21

**Тема дисертації:**

1. Оксазагетероциклічні та відкриті гетероатомні сполуки на основі епоксидних похідних
2. Oxazaheterocycles and opened heteroatomic compounds from epoxy derivatives

**Реферат:**

1. Дисертація присвячена розробці підходів до синтезу нових оксазагетероциклів шляхом встановлення зв'язку між структурою аміноспиртових похідних термінальних і конденсованих епоксидів та напрямками їхньої гетероциклізації. На основі реакцій 3,4-епоксисульфолану розроблено препаративні методи синтезу нових тетрагідротіофен-1,1-діоксидів, анельованих 1,3-оксазоліновим, 1,3-оксазолідиновим, 1,3,5-діоксазепановим, 1,3,5-оксадіазепановим, 1,3-оксазолідин-2-оновим та морфоліноновим фрагментами. Запропоновано синтетичний підход до 2,4,6-тризаміщених морфолінів внутрішньомолекулярною циклізацією за Міцунобу та піперазинів на основі відповідних амінодіолів, похідних гліцидилових етерів. Гетероциклізацією 2-аміно-1-(4-нітрофеніл)етанолу під дією похідних вугільної, щавлевої, ацетилендикарбонової та хлороцтової кислоти, а також моно- і діальдегідів синтезовано нові 1,3-оксазолідин-2-они, морфоліни та 1,3-оксазолідини. Уведення в структуру вихідного аміноспирту

конформаційно обмеженого норборненового фрагмента утруднює синтез морфоліндіонових похідних. Реакції N-заміщених 2-аміноетанолів з циклічними  $\alpha$ - та  $\beta$ -кетосульфонами є методом синтезу двох нових спіроциклічних систем: 1-окса-7-тіа-4-азаспіро[4.5]декан-7,7-діоксидної та 1-окса-8-тіа-4-азаспіро[4.5]декан-8,8-діоксидної. Незаміщений аміноетанол та 2-гідроксиметилпіролідін реагують подібно до первинних амінів і дають відповідні енаміни замість продукту спіроциклізації. Розроблено двостадійний метод синтезу аміноспиртів, які включають тетрагідротіопіран-1,1-діоксидний фрагмент. Розроблено однореакторний метод синтезу каркасних аналогів природного імуностимулятора Цитоксазону та антидепресанта Толоксатону. З використанням стратегії «доміно-амінолізу дієпоксидів» на основі дієпоксиду дициклопентадієну розроблено препаративний мультиграмовий метод синтезу нових білдинг-блоків, які включають 2-азабіцикло[3.3.1]нонановий (2-ABN) фармакофорний фрагмент. Розроблено новий метод синтезу мічених дейтерієм біциклічних метиленазиридинів (MA-d1), які поєднують у своїй структурі азиридиновий та 1,3-оксазолідин-2-оновий. Запропоновано метод синтезу метиленазиридиносечовин, структурно близьких до відомих протиракових агентів. Розроблено препаративні методики синтезу ряду нових оксазагетероциклічних сполук, частина яких в *in vivo* та *in vitro* тестах виявила біологічну активність (анальгетичну, транквілізуючу, протизапальну, протисудомну, антигіпоксичну, протимікробну, протиракову).

2. The thesis is devoted to the development of approaches for the synthesis of new oxazaheterocycles by establishing a correlation between structure of the amino alcohol derivatives of terminal and condensed epoxides and directions of their heterocyclizations. On the basis of the reactions of 3,4-epoxysulfolane, preparative methods for the synthesis of new tetrahydrothiophene-1,1-dioxides, annulated with 1,3-oxazoline, 1,3-oxazolidine, 1,3,5-dioxazepane, 1,3,5-oxadiazepane, 1,3-oxazolidine-2-one and morpholinone moieties were developed. The synthetic approach to 2,4,6-trisubstituted morpholines by intramolecular Mitsunobu cyclization and piperazines from the corresponding derivatives of glycidyl ethers was proposed. The novel 1,3-oxazolidin-2-ones, morpholines and 1,3-oxazolidines were synthesized by the heterocyclicization of 2-amino-1-(4-nitrophenyl)ethanol under the action of carbonic, oxalic, acetylenedicarboxylic and chloroacetic acid derivatives, as well as mono- and di-aldehydes. It was shown, that introduction into the structure of the starting amino alcohol of a conformationally restricted norbornene fragment complicates the synthesis of morpholindione derivatives. Reactions of N-substituted 2-aminoethanols with cyclic  $\alpha$ - and  $\beta$ -ketosulfones lead to the synthesis of a two new spirocyclic systems: 1-oxa-7-thia-4-azaspiro[4.5]decane-7,7-dioxide and 1-oxa-8-thia-4-azaspiro[4.5]decane-8,8-dioxide. Unsubstituted aminoethanol and 2-hydroxymethyl pyrrolidine react similarly to the primary amines to give the corresponding enamines instead of the spirocyclization product. A new two-step method for the synthesis of amino alcohols with tetrahydrothiopyran-1,1-dioxide fragment was developed. One-pot method for the synthesis of cage-like analogues of the natural immunostimulant Cytoxazone and antidepressant Toloxatone was developed. Starting from diepoxide dicyclopentadiene and using the strategy of "domino-aminolysis of diepoxides" a preparative multigram scale method for the synthesis of new building blocks with the 2-azabicyclo[3.3.1]nonane (2-ABN) pharmacophore fragment has been developed. The method for the synthesis of deuterium-labeled bicyclic methyleneaziridines (MA-d1), which combines aziridine and 1,3-oxazolidin-2-one moieties in their structure was proposed. The method for the synthesis of methyleneaziridino ureas structurally similar to known anticancer agents was proposed. Preparative methods for the synthesis of a number of newly oxazaheterocyclic compounds have been developed. Some of the compounds under *in vivo* and *in vitro* tests have shown biological activity (analgesic, tranquilizing, anti-inflammatory, anticonvulsant, antihypoxic, antimicrobial, anticancer).

**Державний реєстраційний номер ДіР:**

**Пріоритетний напрям розвитку науки і техніки:**

**Стратегічний пріоритетний напрям інноваційної діяльності:**

**Підсумки дослідження:**

**Публікації:**

**Наукова (науково-технічна) продукція:**

**Соціально-економічна спрямованість:**

**Охоронні документи на ОПІВ:**

**Впровадження результатів дисертації:**

**Зв'язок з науковими темами:**

## **VI. Відомості про наукового керівника/керівників (консультанта)**

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Чебанов Валентин Анатолійович

2. Chebanov Valentin A.

**Кваліфікація:** д. х. н., 02.00.03

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Чебанов Валентин Анатолійович

2. Chebanov Valentin A.

**Кваліфікація:** д. х. н., 02.00.03

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

## **VII. Відомості про офіційних опонентів та рецензентів**

## **Офіційні опоненти**

### **Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Богза Сергій Леонідович
2. Bogza Sergey L.

**Кваліфікація:** д. х. н., 02.00.03

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Швед Олена Миколаївна
2. Shved Elena M.

**Кваліфікація:** д. х. н., 02.00.03

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Шемчук Леонід Антонович
2. Shemchuk Leonid A.

**Кваліфікація:** д. х. н., 02.00.03

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

**Рецензенти**

## **VIII. Заключні відомості**

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові  
голови ради**

Дорошенко Андрій Олегович

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові  
головуючого на засіданні**

Дорошенко Андрій Олегович

**Відповідальний за підготовку  
облікових документів**

**Реєстратор**

**Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є  
відповідальним за реєстрацію наукової  
діяльності**



Юрченко Т.А.