# Облікова картка дисертації

## I. Загальні відомості

**Державний обліковий номер:** 0513U000462

**Особливі позначки:** відкрита

**Дата реєстрації:** 15-05-2013

**Статус:** Захищена

**Реквізити наказу МОН / наказу закладу:**

## II. Відомості про здобувача

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Кур'янов Володимир Олегович
2. Kuryanov Vladimir Olegovich

**Кваліфікація:**

**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:** 25-04-2013

**Спеціальність за освітою:** 7.070301

**Місце роботи здобувача:** Таврійський національний університет імені В.І. Вернадського

**Код за ЄДРПОУ:** 02070967

**Місцезнаходження:** 01042м.,Київ, вул.Івана Кудрі, 33

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство освіти України

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

## III. Відомості про організацію, де відбувся захист

**Шифр спеціалізованої вченої ради (разової спеціалізованої вченої ради):** Д 11.216.01

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

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

**Повне найменування юридичної особи:** Таврійський національний університет імені В.І. Вернадського

**Код за ЄДРПОУ:** 02070967

**Місцезнаходження:** 01042м.,Київ, вул.Івана Кудрі, 33

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство освіти України

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

## V. Відомості про дисертацію

**Мова дисертації:**

**Коди тематичних рубрик:** 31.21

**Тема дисертації:**

1. Глюкозаміниди: синтез, структура, властивості

2. Glucosaminides: synthesis, structure, properties

**Реферат/анотація:**

1. Дисертація присвячена пошуку нових підходів до побудови глікозидного зв'язку в ряду 2-ацетамідо-2-дезоксицукрів. Об'єкт дослідження: 2-ацетамідо-2-дезокси-D-глюкоза та її похідні за глікозидним центром. Мета дослідження: розробка високоефективного і високо стереоселективного способу побудови O-, S- і N-глікозидного зв'язку в 2-ацетамідо-2-дезоксицукрах, вивчення широкого спектру властивостей синтезованих глюкозамінидів. Методи дослідження: органічний синтез, тонкошарова хроматографія, ЯМР1Н та 13С- спектроскопія, високоефективна рідинна хроматографія, рентгеноструктурний аналіз, біологічні дослідження in vitro та in vivo. На підставі експериментальних даних зроблено висновок, що міжфазна каталітична реакція заміщення у глікозидного центру a-D-глюкозамінилхлориду підпорядковується механізму SN2. Вивчення впливу природи N-нуклеофілів на напрямок реакції глюкозамінилоксисукциніміду з первинними і вторинними амінами дозволило запропонувати механізм утворення O-глікозилгідроксиламіну. Розроблено простий спосіб синтезу 1-O-, S- і N-b-похідних 2-ацетамідо-2-дезокси-

D-глюкози. Глюкозаміниди, що виявляють значну антибактеріальну активність відносно до M. luteum і St. aureus, є перспективними антибактеріальними препаратами. Вуглеводо-амінокислотні кон'югати є перспективними нейротропними речовинами, нестероїдними протизапальними засобами та анальгетиками. Запрпановано загальний спосіб одержання глікозидів N-ацетил-D-глюкозаміну глікозилюванням O-, S-, N-нуклеофілів, каталізованою краун-етерами реакцією в міжфазній системі "тверда основа - органічний розчинник". У порівнянні з відомими способами глікозилювання, використання запропонованої міжфазної каталітичної системи виключає застосування надлишку реагенту, дозволяє досягти більш високого ступеня конверсії глікозил-донора і знизити роль побічних процесів. Запропонований підхід легко піддається масштабуванню і дозволяє реалізувати його в промисловості тонкого органічного синтезу, а також у синтезі комбінаторних бібліотек, що робить отримані сполуки доступними для широких досліджень. Виявлено розбіжності в каталітичних властивостях краун-етерів, пов'язані з ліпофільністю, дентатністю та просторовою структурою макроциклів. Встановлено, що ацилгідразони формілфенілглюкозамінидів в умовах окиснювальної циклізації перетворюються в оксадіазоли, що є альтернативним синтетичним шляхом отримання відповідних глюкозамінидів. Здійснено вивчення впливу природи N-нуклеофілів на напрямок реакції глюкозамінилоксисукциніміду з первинними і вторинними амінами, запропоновано простий спосіб отримання повністю ацетильованого O-глюкозамінилгідроксиламіну. Вперше здійснено систематичне вивчення спектру біологічної активності глюкозамінидів, визначено вплив їх структурних параметрів на спрямованість біологічної дії.

2. Dissertation is devoted to development of new approaches of the glycoside bond formation in 2-acetamido-2-deoxy sugars. Research object: 2-acetamido-2-deoxy-D-glucose and its glycosides. The purpose of the study: the development of highly efficient and highly stereoselective method for bulding of O-, S- and N-glycoside bond in the 2-acetamido-2-deoxy sugars, the study of a wide range of properties of the synthesized glucosaminides. Methods: organic synthesis, thin layer chromatography, NMR1H and 13C-H spectroscopy, high performance liquid chromatography, X-ray analysis, biological studies in vitro and in vivo. On the basis of experimental data, it was concluded that the phase transfer catalytic substitution on the anomeric center of a-D-glucosaminyl chloride flows through SN2 reaction. A study of the influence of the nature of N-nucleophiles on the direction of the reaction a-D-glucosaminyl chloride with primary and secondary amines are allowed to offer a mechanism for the formation of O-glucosaminyl hydroxylamine. A simple synthetic method of 1-O-, S- and N-b-derivatives of N-acetyl-D-glucosamine, which allows to obtain different glucosaminides was developed. Several glucosaminides showing significant antibacterial activity against M. luteum and St. aureus, are promising antibacterial drugs. Carbohydrate-amino acid conjugates are promising neurotropici agents, NSAIDs and analgesics. It was proposed a general method for preparing of glycosides of 2-acetamido-2-deoxy-D-glucose, by the crown ethers catalyzed reaction with O-, S-, N-nucleophiles in the "solid base - organic solvent" phase transfer system. As compared with known methods, proposed phase transfer glycosylation except the use of excess of reagent and provides a higher degree of conversion of glycosyl-donor and reduce the role of secondary processes of by-products formation. The proposed approach is easily scalable and allows for industrial of thin organic synthesis and in the synthesis of combinatorial libraries, making the obtained compounds to be available for researches. The differences in the catalytic properties of various crown ethers related to lipophility, dentate and the spatial structure of the macrocycles. It was found that acylhydrazones of formyl phenyl glucosaminides in oxidative cyclization become oxadiazoles, which is an alternative synthetic route to obtaining the corresponding glucosaminides. A study of the influence of the nature of N-nucleophiles in the direction of the reaction glucosaminyloxy succinimide with primary and secondary amines carried out. A simple way to obtaining a per O-acetylated glucosaminyl hydroxylamine was proposed. Spectrum of biological activity of glucosaminides was studied. The effect of structural features on the direction of the biological action was determined.

**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)

## VII. Відомості про офіційних опонентів та рецензентів

**Офіційні опоненти**

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Вовк Михайло Володимирович
2. Вовк Михайло Володимирович

**Кваліфікація:** д.х.н., 02.00.03, 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. Богза Сергій Леонідович
2. Богза Сергій Леонідович

**Кваліфікація:** д.х.н., 02.00.03, 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. Ішков Юрій Васильович
2. Ішков Юрій Васильович

**Кваліфікація:** д.х.н., 02.00.03, 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** Попов Анатолій Федорович

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

**Відповідальний за підготовку облікових документів**

**Реєстратор**

**Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є відповідальним за реєстрацію наукової діяльності** Юрченко Т.А.