

# Облікова картка дисертації

## I. Загальні відомості

**Державний обліковий номер:** 0409U003141

**Особливі позначки:** відкрита

**Дата реєстрації:** 16-06-2009

**Статус:** Захищена

**Реквізити наказу МОН / наказу закладу:**



## II. Відомості про здобувача

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Коваленко Світлана Сергіївна

2. Kovalenko Svitlana Sergiyivna

**Кваліфікація:**

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Вид дисертації:** кандидат 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:** 15-05-2009

**Спеціальність за освітою:** 7.070301

**Місце роботи здобувача:** Національний фармацевтичний університет

**Код за ЄДРПОУ:** 02010936

**Місцезнаходження:** 61002, м.Харків, вул.Пушкінська, 53

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство охорони здоров'я

**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:** Національний фармацевтичний університет

**Код за ЄДРПОУ:** 02010936

**Місцезнаходження:** 61002, м.Харків, вул.Пушкінська, 53

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство охорони здоров'я

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **V. Відомості про дисертацію**

**Мова дисертації:**

**Коди тематичних рубрик:** 31.21.19

**Тема дисертації:**

1. Синтез, будова та властивості 3,4,5,6 тетрагідропохідних 2Н-2,6-метано-1,3-бензоксазоцину, 2Н-2,6-метано-1,3,5-бензоксадіазоцину, 2Н-2,6-епіміно-1,5-бензоксазоцину
2. Synthesis, structure and properties of derivatives of 3,4,5,6 tetrahydro-2H-2,6-methano-1,3-benzoxazocine, 2H-2,6-methano-1,3,5-benzoxadiazocine, 2H-2,6-epimino-1,5-benzoxazocine

**Реферат:**

1. Здійснено синтез не описаних раніше 5-бензоїл-, 5-цинамоїл-, 5-арилсульфоніл-, 5-сульфамідо-, 5-(1,3-бензотіазол-2-іл)-2,6-метано-3,4,5,6-тетрагідро-2Н-1,3-бензоксазоцин-4-онів, а також розроблено однореакторний метод синтезу 5-незаміщених 2,6-метано-3,4,5,6-тетрагідро-2Н-1,3-бензоксазоцин-4-тіонів. Проведено синтез похідних 2,6-метано-1,3,5-бензоксадіазоцину в умовах реакції Біджинеллі та розширено межі застосування даної реакції. Проведено синтез амідів м- та -(2-метил-2,6-метано-4-оксо-3,4,5,6-тетрагідро-2Н-1,3,5-бензоксадіазоцин-3-іл)-бензойних кислот. Здійснено реакцію ацилювання 3-арил-2-метил-4-тіоксо-3,4,5,6-тетрагідро-2Н-2,6-метано-1,3,5-бензоксадіазоцинів та їх 4-оксоаналогів. Досліджено мультикомпонентну конденсацію салі-цилового альдегіду, N-метилпіперидону в надлишку метиламіну та за його відсутності. Проведено профілювання мішень-специфічної активності отриманих класів сполук з метою виявлення найбільш перспективного напрямку експериментального дослідження активності. Методом

високопродуктивного біологічного скринінгу синтезованих сполук виявлена сполука з високою інгібуючою активністю відносно ABL-кінази (IC<sub>50</sub> = 12,9 мкМ) та показана перспективність даного класу речовин як інгібіторів тирозинових кіназ. Вивченню біологічну активність синтезованих сполук проти збудників тропічних хвороб.

2. The synthesis of novel 5-benzoyl-, 5 cinnamoyl-, 5 arylsulfonyl-, 5 sulfamido-, 5-(1,3-benzothiazol-2-yl)-2,6-methano-3,4,5,6-tetrahydro-2H-1,3-benzoxazocine-4-ones was conducted. The new approach to 5-unsubstituted 2,6-methano-3,4,5,6-tetrahydro-2H-1,3-benzoxazocine-4-thione has been developed. The derivatives of 2,6-methano-1,3,5-benzoxadiazocine were obtained in Biginelli reaction conditions. The methodology for synthesis of combinatorial libraries was obtained. The synthesis of amides of m- and p-(2-methyl-2,6-methano-4-oxo-3,4,5,6-tetrahydro-2H-1,3,5-benzoxadiazocine-3-yl)-benzoic acids has been performed. The reaction of acylation of -aryl-2-methyl-4-thioxo-3,4,5,6-tetrahydro-2H-2,6-methano-1,3,5-benzoxadiazocines and their 4 oxoanalogues was conducted. The multicomponent condensation of salicylic aldehyde, N-methylpiperidone in the excess of methylamine and in its absence has been studied. The revealing of area of biological activity of synthesized compounds based on self-organizing Kohonen maps has been described. High-throughput screening allowed to identify 7,8-benzo-5-(1,3-benzothiazol-2-yl)-2,6-methano-3,4,5,6-tetrahydro-2H-1,3-benzoxazocine-4-one as potent inhibitor of ABL-kinase (IC<sub>50</sub> = 12,9 μM). The activity of synthesized compounds against agents of different tropical diseases was studied.

**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 ОПВ:**

**Впровадження результатів дисертації:**

**Зв'язок з науковими темами:**

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

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. ЧЕРНИХ Валентин Петрович
2. ChERNYKh Valentyn Petrovych

**Кваліфікація:** д.х.н., 15.00.02

**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. ДЕСЕНКО Сергій Михайлович
2. ДЕСЕНКО Сергій Михайлович

**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. КОВТУН Юрій Петрович
2. КОВТУН Юрій Петрович

**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**

Орлов Валерій Дмитрович

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

Орлов Валерій Дмитрович

**Відповідальний за підготовку  
облікових документів**

**Реєстратор**

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



Юрченко Т.А.