

МИНОБРНАУКИ РОССИИ
Федеральное государственное
бюджетное учреждение науки
Новосибирский институт органической
химии им. Н.Н. Ворожцова
Сибирского отделения
Российской академии наук
(НИОХ СО РАН)

просп. Академика Лаврентьева, д. 9, г. Новосибирск,
630090, Российская Федерация
Тел.: (383) 330-88-50, факс: (383) 330-97-52
E-mail: benzol@nioch.nsc.ru <http://www.nioch.nsc.ru>
ОКПО 03533903, ОГРН 1025403651921
ИНН/КПП 5408100191/540801001

19.09.2025 № 15326-45-12/706
На № _____ от _____

Председателю Диссертационного
совета Д 24.1.092.01, созданного на
базе Федерального государственного
бюджетного учреждения науки
«Институт органической химии им.
НД. Зелинского РАН», доктору
химических наук, академику РАН
М.П. Егорову

Глубокоуважаемый Михаил Петрович!

Федеральное государственное бюджетное учреждение науки Новосибирский институт органической химии им. Н.Н. Ворожцова Сибирского отделения Российской академии наук выражает согласие выступить в качестве ведущей организации по диссертационной работе Антропова Сергея Михайловича «Синтез новых типов *пери*-аннелированных индолов на основе превращений 2-(3-формилиндол-4-ил)циклопропан-1,1-диэфиров», представленной на соискание ученой степени кандидата химических наук по специальности 1.4.3 - органическая химия. Отзыв будет подготовлен в соответствии с требованиями и направлен в диссертационный совет в установленное время.

Руководитель организации,
Директор НИОХ СО РАН
д.ф.-м.н., профессор



/ Е.Г. Багрянская

Сведения о ведущей организации

по диссертационной работе Антропова Сергея Михайловича
«Синтез новых типов *пери*-аннелированных индолов на основе превращений 2-(3-
формилиндол-4-ил)циклопропан-1,1-диэфиров»,
представленной на соискание ученой степени кандидата химических наук по
специальности 1.4.3. – органическая химия.

Полное наименование организации в соответствии с уставом	Федеральное государственное бюджетное учреждение науки Новосибирский институт органической химии им. Н.Н. Ворожцова Сибирского отделения Российской академии
Сокращенное наименование организации в соответствии с уставом	НИОХ СО РАН
Ведомственная принадлежность	Министерство науки и высшего образования Российской Федерации
Адрес организации	630090, Новосибирская обл., г. Новосибирск, пр. Академика Лаврентьева, 9
Сайт организации	http://web3.nioch.nsc.ru/nioch/index.php/ru/
Телефон	+7 (383) 330-88-50
Эл.почта	benzol@nioch.nsc.ru
Сведения о составителе отзыва из ведущей организации	Политанская Лариса Владимировна, д.х.н., заведующая Лабораторией изучения нуклеофильных и ион-радикальных реакций

Список публикаций работников по теме диссертации за последние 5 лет:

1. N. Troshkova, L. Politanskaya, J. Wang, M. Niukalova, Sh. Khasanov, Ia. Esaulkova, V. Zarubaev, N. Boltneva, E. Rudakova, N. Kovaleva, O. Serebryakova, G. Makhaeva, N. Valuiskey, U. Ibragimova, R. Litvinov, D. Babkov, K. Usenov, M. Chertenkov, M. Pokrovsky, S. Cheresiz, A. Pokrovsky. Efficient synthesis and evaluation of therapeutic potential of fluorine containing 2-arylchromen-4-ones. *Mol. Divers.*, **2025**, V. 29, 1427-1452.
2. L. Politanskaya, B. Khasanov, I. Bagryanskaya, M. Niukalova, S. Aksakov, I. Balashova, V. Zarubaev. Efficient synthesis, structure and anti-influenza virus activity of fluorinated pyrido[4,3-b][1,4]thiazine 1,1-dioxide derivatives. *J. Fluor. Chem.*, **2025**, V. 283-284, 110430.
3. L. Politanskaya, J. Wang, Yu. Meshkova, M. Marenina, T. Tolstikova, M. Niukalova, I. Esaulkova, A. Volobueva, V. Zarubaev. Synthesis of fluorinated 4*H*-chromen-4-ones from 2-hydroxyacetophenones and in vitro evaluation of their anticancer and antiviral activity. *J. Fluor. Chem.*, **2025**, V. 283-284, 110421.
4. N. Troshkova, L. Politanskaya, I. Bagryanskaya, I. Chuikov, J. Wang, P. Ilyina, M. Mikhalski, Ia. Esaulkova, A. Volobueva, V. Zarubaev. Fluorinated 2-arylchroman-4-ones and their derivatives: synthesis, structure and antiviral activity. *Mol. Divers.*, **2024**, V. 28, 3635-3660.

5. J. Wang, L. Politanskaya, B. Selivanov, I. Esaulkova, A. Volobueva, V. Zarubaev. $\text{FeCl}_3 \times 6\text{H}_2\text{O}$ -mediated cyclization of fluorinated 2'-hydroxychalcones in alcohol medium into flavanones with antiviral activity. *J. Fluor. Chem.*, **2024**, V. 280, 110371.
6. L. Gurskaya, L. Politanskaya, J. Wang, P. Ilyina, A. Volobueva, V. Zarubaev. Efficient synthesis of novel fluorinated phenanthridin-6(5*H*)-one derivatives and in vitro evaluation of their antiviral activity. *J. Fluor. Chem.*, **2024**, V. 274, 110240.
7. L. Politanskaya, B. Khasanov, A. Potapov. Synthetic approaches to fluorinated derivatives of 4-(vinylthio)pyridine. *J. Fluor. Chem.*, **2022**, V. 264, 110063.
8. L. Politanskaya, J. Wang, N. Troshkova, I. Chuikov, I. Bagryanskaya. One-pot synthesis of fluorinated 2-arylchroman-4-one derivatives from 2-(triisopropylsilyl)ethynylphenols and aromatic aldehydes. *J. Fluor. Chem.*, **2022**, V. 263, 110045.
9. L. Politanskaya, E. Tretyakov, Chanjuan. Xi. Synthesis of polyfluorinated 4-hydroxyquinolin-2(1*H*)-ones based on the cyclization of 2-alkynylanilines with carbon dioxide. *J. Fluor. Chem.*, **2021**, V. 242, 109720.

Ученый секретарь НИОХ СО РАН

К.Х.Н.,



Р.А. Бредихин

МИНОБРНАУКИ РОССИИ
Федеральное государственное
бюджетное учреждение науки
Новосибирский институт органической
химии им. Н.Н. Ворожцова
Сибирского отделения
Российской академии наук
(НИОХ СО РАН)

просп. Академика Лаврентьева, д. 9, г. Новосибирск,
630090, Российская Федерация

Тел.: (383) 330-88-50, факс: (383) 330-97-52

E-mail: benzol@nioch.nsc.ru <http://www.nioch.nsc.ru>

ОКПО 03533903, ОГРН 1025403651921

ИНН/КПП 5408100191/540801001

26.09.2025 № 15326- 45-12/725
На № 12104-15/б.н.-уч. от 15.08.2025

УТВЕРЖДАЮ

Директор Федерального
государственного бюджетного
учреждения науки Новосибирский
институт органической химии им.
Н.Н. Ворожцова Сибирского
отделения Российской академии наук
(НИОХ СО РАН)

д.ф.-м.н., профессор

Е.Г. Багрянская

« 26 » сентября 2025 г.



ОТЗЫВ ВЕДУЩЕЙ ОРГАНИЗАЦИИ

на диссертационную работу Антропова Сергея Михайловича

«Синтез новых типов *пери*-аннелированных индолов на основе превращений 2-(3-формилиндол-4-ил)циклопропан-1,1-диэфиров»,

представленную на соискание ученой степени кандидата химических наук
по специальности 1.4.3 – «Органическая химия»

Ядро индола является одним из важнейших молекулярных остовов как природных, так и синтетических биологически активных соединений, в том числе и действующих веществ лекарственных препаратов. Успехи целенаправленного поиска новых биоактивных соединений в рядах индола позволяют рассматривать этот гетероцикл как фармакофорную группировку. Более того, в медицинской и комбинаторной химии индол отнесен к так называемым привилегированным структурам, дериватизация и включение которых в более сложные полициклические системы с большой вероятностью приводят к соединениям с выраженным и направленным биологическим действием. В этой связи актуальность диссертационной работы Антропова Сергея Михайловича не вызывает сомнений, поскольку целью исследований соискателя была разработка общей стратегии синтеза различных типов *пери*-аннелированных индолов. Используемые для функционализации данных гетероциклических объектов трансформации индол-замещенных ДА циклопропанов можно отнести к новым малоизученным реакциям, таким образом, тема рецензируемой работы является высоко актуальной и заслуживает одобрения. Неудивительно, что это направление исследований лаборатории было поддержано Российским научным фондом.

Диссертационная работа С. М. Антропова построена традиционно. Она состоит из введения, обзора литературы, обсуждения собственных результатов автора, экспериментальной части, выводов и списка цитируемой литературы (91 наименование). К сожалению, в диссертации отсутствует перечень используемых аббревиатур и сокращений, что отчасти затрудняет знакомство с работой.

Во введении раскрыты актуальность темы и степень её разработанности, обрисованы объекты исследования, лаконично и чётко сформулированы его цели и задачи, а также основные положения, обладающие научной новизной и выносимые на защиту, однако, не оценён личный вклад соискателя в общий результат.

Обзор литературы «Внутримолекулярные реакции донорно–акцепторных циклопропанов» знакомит читателя с объектами исследования и основными типами превращений ДА циклопропанов в реакциях с электрофильными и нуклеофильными реагентами. Обзор четко и логично выстроен, написан красивым литературным языком и представляет собой продуманный анализ полученных предшественниками результатов, что облегчает осмысление данных, полученных соискателем учёной степени.

Вторая глава диссертации – обсуждение собственных результатов. Диссертантом выполнен большой объем высококвалифицированной экспериментальной работы, что, в частности, иллюстрируется высокими выходами получаемых соединений, учитывая многоступенчатость осуществленных превращений. Строение всех впервые полученных соединений безупречно доказано с использованием совокупности современных спектральных методов, а в необходимых случаях – и рентгеноструктурного анализа. Помимо высокого экспериментального мастерства диссертантом продемонстрировано профессиональное использование данных физических методов исследования и понимание механистической сути исследованных превращений. Описание результатов структурировано, сопровождается необходимыми схемами, рисунками и количественными данными. Проведен анализ не только синтетического потенциала предлагаемых подходов к *пери*-аннелированным индолам, но и охарактеризовано влияние электронных и структурных факторов в субстратах и реагентах на направление и селективность реакций.

Основные результаты проведённого исследования можно сформулировать следующим образом:

С использованием полученных впервые предшественников – индолов, функционализированных фрагментом ДА циклопропана в положении 4 и альдегидной группой в положении 3, синтезированы производные тропан-индолов. Реакции осуществлялись при взаимодействии субстратов с широким кругом первичных аминов в присутствии кислот Льюиса. Исследована возможность модификации целевых *пери*-аннелированных индолов путем декарбоксилирования.

Выявлены закономерности протекания реакций индола **1b** с бензиламинами в зависимости от природы катализатора.

Исследованы домино-реакции индолов, содержащих фрагмент ДА циклопропана и альдегидную группу с гидразинами.

Продемонстрирован высокий синтетический потенциал полученных из индола **1a** гидразонов в качестве предшественников *пери*-аннелированных индолов различных типов.

Осуществлены дальнейшие трансформации синтезированных *пери*-аннелированных индолов с целью получения потенциально биологически активных полициклических каркасов.

Поводов для серьёзной научной критики представленная работа не даёт. И это неудивительно, поскольку она прошла полноценное рецензирование в ведущих мировых

журналах. Но всё-таки некоторые **замечания и вопросы**, возникшие при ознакомлении с данной научно-квалификационной работой, следует отметить.

1. Отсутствует языковое единообразие при использовании сокращенных названий растворителей в тексте обзора литературы: ДХМ и DCM (стр. 12 и стр. 23); ДМСО и DMSO (стр. 45 и 35); ТГФ, DCE, DMF, ...
2. Чем, по мнению соискателя, может быть вызвана столь высокая реакционная активность соединения **1a** при взаимодействии с гидразинами в этиловом спирте в отсутствие кислоты Льюиса (метод А)? Возможно ли использование аналогичных условий реакции при взаимодействии этого субстрата с первичными аминами (Схема 2.2)?
3. По каким параметрам осуществлялся подбор катализатора? Были ли обнаружены закономерности эффективности, проявляемой кислотами Льюиса в синтезе *перинаннелированных* индолов, в зависимости от структурных особенностей реагентов или условий проведения реакций? В частности, каким образом природа кислоты Льюиса повлияла на реализацию конкурирующих направлений реакции соединения **1a** с бензиламинами (Схема 2.7)?
4. Вызывает сомнение уместность вывода №4 в научно-квалификационной работе по специальности «Органическая химия», поскольку биологические исследования не были выполнены соискателем, а анализ структура – активность не проводился. Таким образом, невозможно сделать вывод о наиболее перспективных направлениях химических трансформаций для дизайна этих потенциально биоактивных веществ.
5. Опечатки и небольшие ошибки: «стереоинфомации» – стр. 9; «протекающее *in situ* (3+2)-кросс-циклоприсоединение полученной карбонильной группы» вместо «полученной *in situ* карбонильной группы» – стр. 20; «придукта» – стр. 35; «свежего Pd(dba)₂» вместо «свежеприготовленного» – стр. 46.

Вопросы и замечания по автореферату:

1. Схема 2. В чем отличие структур **12a,b** от **13a,b**?
2. Личный вклад автора «состоял в ... осуществлении описанных в работе экспериментов». Виду отсутствия раздела «Благодарности» эту формулировку можно трактовать как указание на то, что помимо химических экспериментов соискатель осуществлял эксперименты на клетках, регистрировал спектры ЯМР, выполнял РСА-исследования и т. д.

Все эти замечания ни в коей мере не затрагивают существа работы, а значит, не дают пищу для сомнений в достоверности основных выводов этого в целом очень стройного и красивого исследования. Автореферат и публикации соискателя в полной мере отражают наиболее существенные положения и выводы диссертации.

Заключение: на основании вышеизложенного можно заключить, что диссертационная работа Сергея Михайловича Антропова «Синтез новых типов *перинаннелированных* индолов на основе превращений 2-(3-формилиндол-4-ил)циклопропан-1,1-диэфиро» является законченной научно-квалификационной работой, в которой решены задачи, имеющие важное значение для развития органической химии, и прежде всего химии гетероциклических конденсированных систем. По актуальности, новизне,

уровню поставленных и успешно решённых задач она полностью соответствует критериям, предъявляемым ВАК РФ к кандидатским диссертациям, а также пп. 9-14 Положения о присуждении учёных степеней, утверждённого Постановлением Правительства Российской Федерации от 24.09.2013 года №842, а ее автор Сергей Михайлович Антропов заслуживает присуждения ученой степени кандидата химических наук по специальности 1.4.3. – Органическая химия (химические науки).

Отзыв составлен доктором химических наук (специальность «Органическая химия»), заведующей Лабораторией изучения нуклеофильных и ион-радикальных реакций Новосибирского института органической химии им. Н.Н. Ворожцова Сибирского отделения Российской академии наук Политанской Ларисой Владимировной (e-mail: plv@nioch.nsc.ru, телефон +7 (913) 785-90-65), обсужден и одобрен на заседании Объединенного научного семинара НИОХ СО РАН (протокол №7 от 26.09.2025).

ФГБУН «Новосибирский институт органической химии им. Н.Н. Ворожцова Сибирского отделения Российской академии»

Почтовый адрес: 630090, Новосибирская обл., г. Новосибирск, пр. Академика Лаврентьева, 9

Телефон: +7 (383) 330-88-50; e-mail: benzol@nioch.nsc.ru

Я, Политанская Лариса Владимировна, согласна на включение моих персональных данных, связанных с работой диссертационного совета 24.1.092.01, и их дальнейшей обработкой.

« 26 » сентября 2025 г.

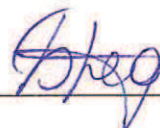


Л.В. Политанская

Подпись Политанской Л.В. заверяю.

Ученый секретарь НИОХ СО РАН

К.Х.Н.,



Р.А. Бредихин