

Název diplomové práce:

DERIVÁTY RHODANINU JAKO POTENCIÁLNÍ LÉČIVA I.

Jméno diplomanta: Diana Kešetovičová

ABSTRAKT

S ohledem na vzrůstající rezistenci mikrobiálních kmenů k dosud používaným antimikrobním látkám stoupá potřeba vývoje strukturně nových léčiv s jinými mechanismy účinku. Příkladem struktury, která zatím nebyla uplatněna v žádných známých antimikrobních léčivech, je rhodanin (2-thioxo-1,3-thiazolidin-4-on). Deriváty rhodaninu byly již v literatuře popsány jako potenciální léčiva s širokým spektrem biologických účinků.

V rámci této diplomové práce byly připraveny kondenzační produkty rhodaninu a 3-(2-hydroxyethyl)rhodaninu s *ortho*-, *meta*- a *para*-substituovanými nitrobenzaldehydy. Reakce byla provedena ve vodně-alkoholickém roztoku za katalýzy směsí NH₄OH/NH₄Cl. U připravených látek byla následně hodnocena antifungální, antimykobakteriální aktivita a jejich inhibiční vliv na fotosyntézu.

Střední antifungální účinnost vůči *C. albicans*, *T. asahii*, *T. mentagrophytes* a *A. fumigatus* byla zaznamenána u *N*-nesubstituovaných derivátů. *N*-substituované deriváty byly prakticky neúčinné. Při testování antimykobakteriální aktivity nesplnila žádná z hodnocených látek podmínky pro postup do druhé fáze testování (inhibiční účinek v primárním testu min. 90 %). Výsledky antimykobakteriální účinnosti *N*-substituovaných derivátů nejsou zatím k dispozici. *N*-nesubstituované deriváty vykazaly vysoké procento inhibice tvorby chlorofylu v *Chlorella vulgaris*, inhibice vývoje kyslíku v chloroplastech (OER) byla naopak vyšší u 3-(2-hydroxyethyl)-5-(2-nitrobenzyliden)-2-thioxo-1,3-thiazolidin-4-onu než u odpovídajícího *N*-nesubstituovaného derivátu. U ostatních 3-(2-hydroxyethyl)-substituovaných rhodaninů se bohužel nepodařilo výsledky odečíst.