

ABSTRAKT

Název diplomové práce: **Deriváty pyrazinu jako potenciální léčiva I.**

Vypracovala: **Petra Plasová**

Tuberkulóza patří mezi nejrozšířenější infekční onemocnění, kterým je nakažena přibližně třetina světové populace. V rámci studia potenciálních pyrazinových antituberkulotik byla na katedře připravena série typu substituovaných arylaminopyrazinů. Výchozí 3-chlorovaný pyrazinový derivát poskytl couplingem (aminodehalogenací) s aromatickými aminy požadované sloučeniny. Modifikace struktury spočívala v obměňování karboxylových funkčních skupin, např. v dehydrogenaci karboxamidu (vznik karbonitrilu) či v adici monosulfanu (vznik karbothioamidů). Osm v chemické literatuře dosud nepopsaných látek bylo charakterizováno teplotou tání, TLC, elementární analýzou, IČ, ^1H a ^{13}C NMR spektry a hodnotami $\log P$. Látky se podrobují *in vitro* hodnocení na účinnost proti *Mycobacterium tuberculosis* H₃₇R_v v rámci mezinárodního programu určeného pro testování nových antituberkulotik TAACF (Tuberculosis Antimicrobial Acquisition and Coordinating Facility, USA), avšak výsledky nejsou dosud známy. Připravené sloučeniny byly otestovány *in vitro* na antifungální aktivitu pomocí mikrodiluční bujónové metody proti vybraným houbovým patogenům na Katedře biologických a lékařských věd a na antimykobakteriální aktivitu na čtyřech kmenech ve Fakultní nemocnici v Hradci Králové.

KLÍČOVÁ SLOVA: Pyrazin; Lipofilita; Antimykobakteriální a antifungální screening.