PETRA HIRŠOVÁ: Deriváty thiazolu jako potenciální léčiva. Diplomová práce, Katedra farmaceutické chemie a kontroly léčiv, Univerzita Karlova v Praze, Farmaceutická fakulta v Hradci Králové, 2008

Abstrakt

V rámci této diplomové práce byly připraveny kondenzační produkty *N*-substituovaného rhodaninu s arylkarbaldehydy. Kondenzace byla provedena v závislosti na charakteru substituentu rhodaninového kruhu buď ve vodně--alkoholickém roztoku za katalýzy směsí NH_4OH/NH_4Cl nebo v prostředí kyseliny octové a octanu sodného s přídavkem acetanhydridu. U připravených látek byla následně mikrodiluční bujónovou metodou hodnocena antifungální aktivita proti osmi patogenním kmenům hub (*Candida albicans* ATCC 44859, *Candida tropicalis* 156, *Candida krusei* E 28, *Candida glabrata* 20/I, *Trichosporon asahii* 1188, *Aspergillus fumigatus* 231, *Absidia corymbifera* 272 a *Trichophyton mentagrophytes* 445). Silný inhibiční efekt (MIC/IC_{80} = 0,98 – 1,95 $\mu mol.l^{-1}$) na růst non-albicans druhů *Candida* a *Trichosporon asahii* vykázala [4-oxo-5--(pyridin-2-ylmethyliden)-2-thioxothiazolidin-3-yl]octová kyselina.

Dále byla připravena série arylmethylidenhydrazonothiazolidin-4-onů. Prvně byly nasyntetizovány thiosemikarbazony příslušných arylkarbaldehydů, které následně reagovaly s monochloroctovou kyselinou v prostředí ethanolu za vzniku derivátů thiazolin-4-onu. U těchto látek byla obdobně sledována antifungální aktivita. V případě 2-[(pyrazin-2-ylmethyliden)hydrazono]thiazolidin-4-onu byla zaznamenána střední antifungální účinnost (MIC/IC_{80} = 15,62 – 62,5 $\mu mol.l^{-1}$) proti většině testovaných kmenů. 2-[(Pyridin-2-ylmethyliden)hydrazono]--thiazolidin-4-on inhiboval růst všech testovaných kmenů hub (MIC/IC_{80} = 3,9 – 62,5 $\mu mol.l^{-1}$).

Všechny připravené sloučeniny byly charakterizovány pomocí NMR a IČ spekter. Čistota produktů byla hodnocena elementární analýzou a pomocí HPLC.