ABSTRAKT

AMIDOXIMY JAKO SYNTETICKÉ INTERMEDIÁTY A POTENCIÁLNÍ LÉČIVA I.

Michaela Horká

Univerzita Karlova v Praze, Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmaceutické chemie a kontroly léčiv

V teoretické části diplomové práce jsou shrnuté biologické účinky amidoximů. Jsou studovány hlavně jako proléčiva, která se redukcí mění na aktivní látky – amidiny. Některé amidoximy se dostaly do klinických studií, ale pro jejich závažné nežádoucí účinky byl další výzkum ukončen.

V metodické části jsou popsány možnosti přípravy amidoximů různými syntetickými postupy.

V rámci experimentální části byly připraveny nejdříve čtyři 5-alkyl-pyrazin-2-karbonitrily a z nich reakcí s hydroxylamin-hydrochloridem byly získány příslušné amidoximy:

- *N*´-hydroxy-5-propylpyrazin-2-karboximidamid
- *N*´-hydroxy-5-isopropylpyrazin-2-karboximidamid
- *N*´-hydroxy-5-pentylpyrazin-2-karboximidamid
- *N*´-hydroxy-5-hexylpyrazin-2-karboximidamid

Žádný ze získaných produktů nebyl dosud popsán v literatuře. Všechny připravené amidoximy byly charakterizovány teplotou tání, IČ a NMR spektry. Čistota byla ověřena elementární analýzou.

Tyto látky byly testovány na antifungální a antibakteriální účinnost, ale byly neaktivní. To je patrně dáno skutečností, že v testech *in vitro* nedochází k jejich aktivaci na odpovídající amidiny.