

ABSTRAKT:

Univerzita Karlova v Praze

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra anorganické a organické chemie

Kandidát: Věra Ježková

Konzultant: PharmDr. Marcel Špulák, Ph.D.

Název diplomové práce: Benzodiaziny jako látky s potenciální bronchodilatační aktivitou

Cílem mé diplomové práce bylo syntetizovat vybrané deriváty (-)vasicinonu a vyhodnotit jejich bronchodilatační aktivity. Nejaktivnější látky z předchozí části projektu obsahující (piperidin-1-yl)propylový fragment vázaný na molekuly chinazolinu nebo chinoxalinu mi posloužily jako modelové struktury pro další syntézy. Snažila jsem se zavést hydroxylovou skupinu na tříuhlíkatý spojovací řetězec umožňující jeho případnou další modifikaci. Při své syntéze jsem vycházela z komerčně dostupného chinazolinonu nebo chinoxalinonu, který při reakci s racemickým epichlorhydrinem vedl k intermediátu, jenž poskytl cílené deriváty. Avšak podobné reakce se s jinými analogy výše zmíněných heterocyklů selhaly.

Všechny mnou syntetizované látky byly testovány pro svůj bronchodilatační efekt. Bronchodilatační aktivity byly srovnatelné s bronchodilatačními aktivitami předlokových struktur s výjimkou cyklohexylaminového fragmentu, u kterého byla naměřená hodnota bronchodilatační aktivity výrazně vyšší.