

ABSTRAKT

Univerzita Karlova v Praze, Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

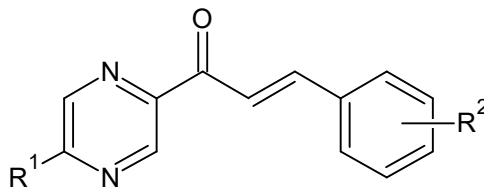
Katedra **farmaceutické chemie a kontroly léčiv**

Kandidát **Mgr. Lenka Richterová**

Konzultant **doc. RNDr. Veronika Opletalová, Ph.D.**

Název rigorózní práce **Chalkony a jejich analogy jako potenciální léčiva X.**

Teoretická část práce je věnována současným poznatkům léčby mykóz. Dále jsou zde uvedeny příklady přírodních chalkonů s antifungálním účinkem a popsány různé možnosti obměny struktury a jejich vliv na antifungální vlastnosti těchto látek. Experimentální část pojednává o syntéze fluorovaných (*2E*)-3-fenyl-1-pyrazin-2-ylprop-2-en-1-onů (Obr. 1).



$R^1 = \text{H, } t\text{-butyl, isobutyl, butyl, propyl}$

$R^2 = 2\text{-F, } 4\text{-F}$

Obr. 1 Struktura studovaných sloučenin

Látky byly získány Claisen-Schmidtovou kondenzací v pyridinu za použití diethylaminu jako kondenzačního činidla. Výsledkem byla jedna již dříve popsaná sloučenina a čtyři nové látky. U produktů byla potvrzena struktura pomocí IČ a NMR spektra a jejich čistota ověřena pomocí teploty tání a elementární analýzy. Antifungální aktivita připravených sloučenin byla hodnocena mikrodiluční bujónovou metodou proti osmi kmenům patogenních hub. Nejvyšší aktivitu měly v obou sériích deriváty, kde $R^1 = \text{H}$. Byly více nebo méně účinné proti kvasinkám rodu *Candida* (MIC = 15.63–125 $\mu\text{mol/l}$) a dermatofytu *Trichophyton mentagrophytes* (MIC = 7.81–15.63 $\mu\text{mol/l}$). Jejich účinnost byla srovnatelná s dříve připravenými (*2E*)-3-fenyl-1-pyrazin-2-ylprop-2-en-1-ony, kde $R^1 = R^2 = \text{H}$.