

SOUHRN:

Rigorózní práce - Asymetricky substituované močoviny jako akceleranty transdermální permeace

Transkarbam 12 [5-(dodecyloxykarbonyl)pentylammonium-5-(dodecyloxykarbonyl)pentylkarbamát, T12] je akcelerační transdermální permeace vykazující vysokou biologickou aktivitu. V této rigorózní práci byly připraveny analogy T12 s močovinnou funkční skupinou místo esterové, a otestovány *in vitro* jako akceleranty transdermální permeace na štěpech excidované prasečí kůže za použití theofilinu jako modelového léčiva. Výsledky byly vyjádřeny akceleračním poměrem a porovnány s biologickou aktivitou T12 a jeho analogů z předešlých studií (alkan, keton, amid, karbamát, karbonát). Stejně jako u analogů z předchozích studií došlo k výraznému poklesu akcelerační schopnosti. Výsledky tedy ukazují, že esterová funkční skupina v molekule T12 má pro jeho mimořádný účinek zásadní význam.

SUMMARY:

Rigorous thesis – Asymmetrically substituted ureas as a skin permeation enhancers

Transkarbam 12 (5-(dodecyloxy carbonyl)pentylammonium-5-(dodecyloxy carbonyl)pentylcarbamate, T12) is a highly effective skin permeation enhancer. In this rigorous thesis, T12 analogs with urea function group replacing the ester one were synthesised, and evaluated *in vitro* as skin permeation enhancers on excised porcine skin, using theophiline as a model drug. The results were expressed by an enhancing ratio and compared with biological activity of T12 and its analogs from previous studies (alkane, ketone, amide, carbamate, and carbonate). Similarly to analogs from previous studies, there was a significant decrease in the enhancing potency. The results thus show that the ester group in the molecule of T12 is essential for its extraordinary effect.