

RIGORÓZNÍ ŘÍZENÍ

Vědní obor: Farmaceutická chemie
Titul, jméno, příjmení kandidáta: Mgr. Rudolf Bruner
Titul, jméno, příjmení konzultanta: doc. PharmDr. Martin Doležal, Ph.D.

Název rigorózní práce (ČJ): SUBSTITUOVANÉ AMIDY PYRAZIN-2-KARBOXYLOVÉ KYSELINY JAKO POTENCIÁLNÍ LÉČIVA I.

Abstrakt práce v ČJ:

V rámci rigorózní práce byla provedena rešerše zaměřená na současný význam tuberkulózy ve světě a na nejnovější trendy v terapii. V chemické literatuře byly zjištěny metody přípravy substituovaných amidů pyrazinkarboxylové kyseliny. Bylo syntetizováno v chemické literatuře osm dosud nepopsaných látek charakteru substituovaných amidů pyrazinkarboxylové kyseliny. Všechny produkty byly charakterizovány teplotou tání, TLC, elementární analýzou, IČ, ^1H , popř. ^{13}C NMR spektry. Série látek byla podrobena *in vitro* biologickému hodnocení. Práce přináší nové údaje o antimykobakteriální, antifungální aktivitě a výsledky testů herbicidní aktivity (testy inhibice přenosu elektronů v chloroplastech špenátu a testy redukce obsahu chlorofylu v *Chlorella vulgaris*). Tyto výsledky jsou uvedeny v tabelární i grafické podobě. Jsou uvedeny i vypočtené hodnoty $\log P$ nově připravených látek. Autor se pokusil zjistit vztah mezi strukturou, biologickou aktivitou a lipofilitou v sérii připravených látek.

Název rigorózní práce (AJ): Potential drugs derived from substituted pyrazinecarboxamides I.

Abstrakt práce v AJ

Review about actual worldwide problem of tuberculosis and about trends in the tuberculosis treatment and chemical recherche were the parts of this work. Novel pyrazine derivatives connected via -CONH- bridge with substituted anilines were synthesized. The synthetic approach, analytical, spectroscopic, lipophilicity and biological data of eight newly synthesized compounds were presented. All products were characterized and tested against *Mycobacterium tuberculosis* strain H₃₇Rv and against eight fungal pathogen strains. Additionally, the study of inhibition of oxygen evolution rate in spinach chloroplasts and reduction of chlorophyll content in the green algae *Chlorella vulgaris* Beij. in the series of prepared compounds were drawn. Structure-activity relationships among the chemical structure, lipophilicity ($\log P$), and their biological activity of the evaluated compounds were discussed.