

Doc. RNDr. Jiří Hartl, CSc.: Oponentský posudek rigorózní práce Mgr. Radovana Deriváty pyrazinu jako potenciální léčiva. Hejského:

Rigorózní práce Mgr. Radovana Hejského nazvaná „Deriváty pyrazinu jako potenciální léčiva“ řeší problematiku, která je součástí dlouhodobého výzkumného záměru Katedry farmaceutické chemie a kontroly léčiv. Zabývá se syntézou dvanácti nových v literatuře nepopsaných na jádře substituovaných anilidů kyseliny 5-, resp. 6-mono- nebo disubstituované pyrazin-2-karboxylové. Monosubstituované deriváty obsahují v poloze 5- terc butylovou skupinu nebo v poloze 6- chlor, disubstituované sloučeniny pak oba uvedené substituenty. Všechny anilidy byly připraveny několikastupňovou syntézou, která vycházela z pyrazinkarboxamidu. Čistota získaných látek byla kontrolována chromatograficky a všechny jsou dostatečně charakterizovány teplotami tání, elementární analýzou, IČ a NMR spektry a též vypočtenou hodnotou log P. Součástí předložené práce jsou též výsledky testů *in vitro* na účinek antimykotický a účinek herbicidní. Žádná z látek však nevykázala významnější aktivitu. Zajímavější výsledky byly získány při orientačním prověřování antituberkulotické aktivity při kterém byla zjištěna relativně vysoká aktivita vůči *Mcb.tuberculosis H37Rv*.

Rigorózní práce, včetně seznamu literatury s 23 citacemi, má rozsah 52 stran a je členěna obvyklým způsobem na Uvodní část, Cíl práce, Teoretickou část, Biologické hodnocení, Experimentální část, Výsledky, Diskusi a Závěr. Je sepsána bez podstatných věcných chyb. V práci se však nachází drobné nedostatky formálního rázu. Nesprávným způsobem je používán progresivní pravopis i ve slovech, kde to není vhodné. Příkladem jsou odborné názvoslovné termíny jako izoniazid, tioamidy, etionamid, polymeráza, amidáza aj. Z dalších formálních nedostatků možno uvést rozdílný přístup ke zpracování výsledků do tabulek (srovnej rozdílnou koncepci tabulky čís.1 versu tabulky čís. 2 a 3).

Závěrem možno konstatovat, že rigorózní práce Mgr. Hejského řeší aktuální problematiku a přináší nové užitečné poznatky v dané oblasti farmaceuticko-chemického výzkumu. Z výsledků práce vyplývá potřebná teoretická i experimentální vyspělost autora a proto doporučuji předloženou práci pro další řízení.

V Hradci Králové 17. ledna 2007-01-17



Doc. RNDr. Jiří Hartl, CSc.
Baarova 1377/9
Hradec Králové