

CHALKONY A JEJICH ANALOGY JAKO POTENCIÁLNÍ LÉČIVA VII

Lucie Švédová

Katedra farmaceutické chemie a kontroly léčiv, Univerzita Karlova v Praze, Farmaceutická fakulta v Hradci Králové, Heyrovského 1203, 500 05 Hradec Králové

Abstrakt rigorózní práce:

Tato práce syntetického charakteru je zaměřena na hledání potenciálních léčiv ze skupiny derivátů chalkonu a navazuje na problematiku dlouhodobě studovanou na katedře. Zkoumanou biologickou aktivitou je především antimykobakteriální a antifungální účinek.

V teoretické části práce jsou aktuálně a přehledně zpracovány jednotlivé mechanismy antineoplastického působení přirozeně se vyskytujících i syntetických derivátů chalkonu. Tato rešerše zahrnuje převážně podklady z poslední dekády. Byly shrnuty možné zásahy do regulačních dějů, proteosyntézy a tvorby nukleových kyselin, vlivy na mitózu, apoptózu a P-glykoprotein a potenciální inhibiční působení na procesy angiogeneze a invazivity. Vedle chemoterapeutických možností byla uvedena také antioxidační aktivita a další mechanismy chemoprevence. Součástí byl popis několika metod syntézy derivátů chalkonu.

V rámci experimentální části práce byly kondenzační reakcí připraveny substituované deriváty chalkonu a dále heterocyklické analogy chalkonu. Všechny produkty byly charakterizovány teplotou tání, IČ a NMR spektry. Jejich čistota byla ověřena tenkovrstvou chromatografií a elementární analýzou.

V dílčích výsledcích hodnocení biologické aktivity byla zaznamenána inhibiční aktivita proti *Mycobacterium tuberculosis* H₃₇Rv (ATCC 27294) v rozmezí 13 – 71 % a slabá antifungální aktivita na 8 kmenech testovaných hub.