

## **Abstrakt**

**Univerzita Karlova**

**Farmaceutická fakulta v Hradci Králové**

**Katedra organickej a bioorganickej chémie**

**Študentka:** Eszter Gyurkovicsová

**Školiteľ:** PharmDr. Karel Palát, CSc.

**Názov diplomovej práce:** Syntéza substituovaných arylguanidínov ako potenciálnych liečiv XVI.

Neustále sa zvyšujúci počet výskytov systémových mykóz a vznik nových ochorení vyvolaných plesňami rezistentnými na už existujúce antifungálne liečiva, je obrovským problémom ochrany zdravia ľudí. Na celom svete trpí približne 1,2 miliardy jednotlivcov plesňovými infekciami. V prvom rade sú ohrozené pacienti s nedostatočnou funkciou imunitného systému [1], ich počet rastie ako výsledok rozšírenia infekcie HIV alebo intenzívnej terapie rakoviny, v stavoch po orgánových transplantáciách alebo trpiace autoimunitnými ochoreniami, ktoré vyžadujú imunosupresívnu terapiu.

Celosvetovo prebieha výskum v oblasti látok odvodených od guanidínu s potenciálnou aktivitou proti mnohým kmeňom plesní aj baktérii. Skúmaním týchto látok sa už niekoľko rokov zaoberá aj Farmaceutická fakulta v Hradci Králové. Cieľom je získať čo najaktívnejšie zlúčeniny substituovaných arylguanidínov so snahou nájsť závislosť medzi štruktúrou a účinkom u týchto látok.

V rámci mojej diplomovej práce boli syntetizované dva rady derivátov arylguanidínu. Produkty boli syntetizované v štvorkrokovej syntéze. V prvom kroku bol vytvorený sulfid reakciou substituovaného 2-chlór-5-nitrotoluénu a tiolov. V nasledujúcom kroku bola nitroskupina redukovaná na aminoskupinu. Anilín bol

prevedený na anilínium-chlorid pomocou plynného chlorovodíka. V poslednom kroku anilínium-chlorid reagoval s kyanamidom za vzniku arylguanidínu.

U syntetizovaných látok boli zmerané infračervené a NMR spektrá. Na Katedre biologických a lekárskeho vied Farmaceutickej fakulty Univerzity Karlovej boli prevedené testy na antifungálnu a antibakteriálnu aktivitu u syntetizovaných látok.