UNIVERZITA KARLOVA V PRAZE
FARMACEUTICKÁ FAKULTA V HRADCI KRÁLOVÉ
Katedra anorganické a organické chemie

Studijní program: Farmacie

Posudek oponenta diplomové práce

Oponent/ka: **doc. PharmDr. Kateřina Vávrová, Ph.D.**

Rok obhajoby: 2011

Autor/ka práce: Lukáš Opálka

Název práce:
Substituované benzoxazoly - syntéza a biologické aktivita

Rozsah práce: počet stran: 46, počet grafů: -, počet obrázků: -,

počet tabulek: 1, počet citací: 42

Práce je: experimentální

a) Cíl práce je: zcela splněn

b) Jazyková a grafická úroveň: velmi dobrá

c) Zpracování teoretické části: výborné

d) Popis metod: výborný

e) Prezentace výsledků: výborná

f) Diskuse, závěry: velmi dobré

g) Teoretický či praktický přínos práce: výborný

Případné poznámky k hodnocení: Lukáš Opálka ve své diplomové práci připravil 7 nových Schiffových bazí reakcí příslušných aldehydů s různě substituovanými aminy a z nich pak cyklizací pomocí octanu olovičitého 7 nových benzoxazolů. Ve své práci také popsal a diskutoval antimykobakteriální aktivity těchto látek a zpracoval přehled biologických aktivit benzoxazolů.

Dotazy a připomínky:
- Syntézy: u některých látek je Rf Schiffovy baze 0.40 a benzoxazolu 0.42 - bylo opravdu dobře poznat, že reakce proběhla? Nebyla by vhodnější jiná mobilní fáze?
- název látky L11 (a analogicky dalších) by měl být spíše: 2-(3-brombenzylidenamino)-4-chloro-6-nitrofenol, tedy jiné pořadí substituentů a bez rozdělovníků po závorkách
- správně by měl být ethyl-acetát
- za jakých podmínek "produkt spontánně cyklizuje za vzniku benzoxazolu"? Nemohlo k tomu dojít i během studia antimykobakteriální aktivity? A proč jsou pak výtěžky benzoxazolů tak nízké (např. 28% u L17), vznikal tam i nějaký jiný produkt?
- byla krystalizace před chromatografií nutná (resp. nemohlo tady dojít ke ztrátám produktu)?
- vzhledem k tomu, že jsou postupy stejné, mohly být uvedeny jen jednou a pak už jen charakterizace jednotlivých látek
- kapitola diskuse a závěr je z velké části metodika a výsledky, diskuse je jen poslední odstavec, uvítala bych širší porovnání s dříve připravenými deriváty a výhledy do budoucna
- přehled biologických aktivit benzoxazolů je zpracován "za posledních několik let" (s. 8) - za kolik let to je a proč (starší data jsou nudná nebo byla zpracována jinde)? Některé věty v této

kapitole mají informační obsah jako výroky našich politiků - s. 15 "Použitím vhodných substituentů R1 a R3 došlo ke zvýšení účinku..."
- s. 11 a dále - vzorce antituberkulotik jsou možná notoricky známé, ale myslím, že by bylo vhodné je zde uvést a navíc kapitola "základní antituberkulotika" nemá uveden žádný zdroj literatury, ze které autor čerpal
- Metodická část je velmi pěkně zpracována, škoda jen, že není doplněna reakčními schematy. Nicméně kapitoly Příprava Schiffových bazí a Příprava benzoxazolů bych v této podobě (tedy konkrétní provedení včetně izolace produktu, bez citací) viděla spíše v úvodu experimentální části.
- s. 8 - Citace by měly začínat od 1
- s. 9 - "Není zatím jasné, zda se tuberkulóza vyvinula z dobytku" - tato evoluční linie by mne vskutku nenapadla...
- zkratka by měla být vysvětlena při prvním použití - např. s. 11, INH a další - a pak důsledně používána
s. 17. - nejsem si jistá, zda byly pokusy opravdu prováděny na krysách ("rat" v kontextu laboratorní zvíře je potkan)

Celkové hodnocení: výborně, k obhajobě: doporučuji

V Hradci Králové dne 27.5. 2011 ……

podpis oponentky / oponenta