

ABSTRAKT

Univerzita Karlova v Praze

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra anorganické a organické chemie

Kandidát: Lucie Flídrová

Konzultant: PharmDr. Marcel Špulák, PhD.

Název diplomové práce: Syntéza anthelminticky aktivních kyanbenzamidů

Cílem této diplomové práce byla příprava čtyř z nejaktivnějších kyanobenzamidů, zástupců nové perspektivní skupiny anthelmintik (aminoacetonitrily – AADs).

Syntéza prvních tří látek byla provedena pomocí alkylace příslušného fenolu s chloracetonem následované Streckerovou reakcí vzniklého ketonu a poté acylací aminu substituovaným benzoylchloridem.

Pro čtvrtý derivát musela být vyvinuta alternativní syntéza. Jako substrát pro Streckerovu reakci byl použit THP-ochráněný hydroxyaceton, poté následovala acylace substituovaným benzoylchloridem a sekvence byla zakončena nukleofilní aromatickou substitucí na příslušném fluorbenzenu.

Všechny deriváty byly připraveny v dobrých výtěžcích. V současné době jsou testovány na Katedře biochemických věd Farmaceutické fakulty UK v Hradci Králové na vztah mezi enzymy metabolizujícími léčiva (DME) a vývojem rezistence.