

## Abstrakt

Antibiotická rezistence představuje globální problém a ke zmírnění následků by měl přispět mimo jiné i vývoj nových léčiv. Všechny nově připravené sloučeniny vychází z molekuly 4,6-dimethylpyrimidin-2-aminu, v některých syntézách byl jako výchozí sloučenina použit jeho derivát sulfamethazin. Výchozí molekula byla zvolena na základě antimikrobní aktivity derivátů 4,6-dimethylpyrimidin-2-aminu. Cílem tří jednokrokových syntéz byla příprava jednotlivých sulfonamidů reakcí 4,6-dimethylpyrimidin-2-aminu s příslušným sulfonylchloridem. Ostatních deset také jednokrokových reakcí vedlo k přípravě Schiffových bazí, které vycházejí většinou z derivátů salicylaldehydu a benzaldehydů. Byly použity různé metody, výtěžky se pohybovaly v rozmezí od 13 % do 48 % u sulfonamidů a od 13 % až po 96 % u Schiffových bazí. U všech třinácti sloučenin byla otestována antibakteriální (proti vybraným  $G^+$  i  $G^-$  kmenům) a antifungální aktivita pomocí mikrodiluční bujónové metody. Obecně byly látky neúčinné na  $G^-$  bakterie, naopak největší aktivitu (tj. nejnižší hodnoty minimální inhibiční koncentrace, MIC) projevily při testování proti houbám. Sulfonamidy byly neúčinné. Nejnižší MIC u hub ( $3,9 \mu\text{mol/l}$ ) i bakterií ( $15,62 \mu\text{mol/l}$ ) dosáhl 2-[[4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)imino]methyl]-4,6-dijodfenol. Mezi nadějně antifungální látky, které měly dostatečně nízké MIC, patří například i 4-[(3,5-dibrom-2-hydroxybenzyliden)amino]-*N*-(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)benzensulfonamid či 4-chlor-2-[[4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)imino]methyl]-6-jodfenol. Výchozí molekula (sulfamethazin nebo 4,6-dimethylpyrimidin-2-amin) pro antifungální aktivitu nehrála zásadní roli, malý rozdíl můžeme vidět na hodnotách MIC při testování těchto látek proti některým  $G^+$  kmenům, kdy jsou sloučeniny s výchozí molekulou sulfamethazinem účinnější. Výhodnou pro antifungální aktivitu se také zdá být přítomnost jodu ve sloučenině, navíc s rostoucím počtem atomů jodu klesá hodnota MIC.