ABSTRAKT

Univerzita Karlova, Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmaceutické chemie a farmaceutické analýzy

Student: Adam Anthony Needle

Vedoucí diplomové práce: PharmDr. Marta Kučerová, Ph.D.

Konzultant: PharmDr. Petr Šlechta

Název diplomové práce: Syntéza a hodnocení derivátů benzoxaborolu jako potenciálních antimikrobiálních sloučenin

Bylo zjištěno, že deriváty benzoxaborolu působí OBORT (oxaborol vychytávající tRNA [oxaborole tRNA trapping]) mechanismem, který vede k přerušení syntézy proteinů v mikroorganismech. Tato práce byla zaměřena na syntézu a primární *in vitro* hodnocení série *N*-(1-hydroxy-1,3-dihydrobenzo[*c*][1,2]oxaborol-6-yl)(hetero)aryl-2-karboxamidů.

Sloučeniny byly připraveny reakcí aktivovaných (hetero)arylkarboxylových kyselin s 6-aminoskupinou benzoxaborolové části molekuly za vzniku amidové vazby. Úspěšně bylo připraveno deset sloučenin a všechny byly otestovány *in vitro* proti klinicky významným kmenům bakterií, hub a mykobakterií. Byla odhalena významná aktivita vůči několika mykobakteriálním kmenům a cytotoxický screening na lidských buňkách prokázal nízkou toxicitu látek. Tato selektivita může být způsobena rozdíly v aktivním místě mykobakteriálního a lidského cílového enzymu. Testovaná série látek prokázala selektivní antimykobakteriální vlastnosti a mohla by nasměrovat výzkum nových léčiv proti tuberkulóze.