ABSTRAKT

Univerzita Karlova

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmaceutické chemie a farmaceutické analýzy

Název diplomové práce: Syntéza derivátu thiazolidinu jako potenciálních léčiv

Student: Kateřina Makovská

Školitel: PharmDr. Marta Kučerová, Ph.D.

Teoretická část byla zaměřena na rešerši biologické aktivity derivátů 2-thioxothiazolidin-4-onu (rhodaninu) a jeho kyslíkatého izosteru thiazolidin-2,4-dionu. Byla uvedena především antibakteriální, antimykobakteriální a antifungální aktivita řady různě substituovaných rhodaninových i thiazolidin-2,4-dionových derivátů. Tyto deriváty se zdají být vhodnými kandidáty na nová léčiva.

V rámci experimentální části byla provedena *in silico* studie molekulového dokování širší série derivátů rhodaninu a thiazolidin-2,4-dionu připravených v rámci této práce i dříve do MurD ligázy *E. coli* jako potenciálního bakteriálního cíle.

V laboratoři bylo provedeno celkem sedmnáct syntéz, devět syntéz pro získání derivátů thiazolidin-2,4-dionu a osm syntéz k získání derivátů rhodaninu, za využití Knoevenagelovy kondenzace thiazolidin-2,4-dionu nebo rhodaninu s různými aldehydy. Podařilo se syntetizovat celkem jedenáct sloučenin, šest derivátů thiazolidin-2,4-dionu a pět derivátů rhodaninu. Každý produkt byl charakterizován teplotou tání, NMR, IČ a MS spektrem. Čistota látek byla ověřena pomocí elementární analýzy a u dvou produktů pomocí metody HPLC.

Syntetizované látky byly podrobeny *in vitro* biologickému testování na antibakteriální aktivitu, antimykobakteriální a antifungální aktivitu proti klinicky významným patogenům. Všechny testované sloučeniny vykazovaly antimykobakteriální aktivitu. Žádná z látek nevykazovala aktivitu proti G- bakteriím, celkem osm látek vykázalo určitou aktivitu proti G+ bakteriím. Antifungální aktivitu vykazovaly pouze tři látky.