

Abstrakt

Univerzita Karlova

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmaceutické chemie a farmaceutické analýzy

Řešitel: Pavlína Niklová

Vedoucí diplomové práce: prof. PharmDr. Martin Doležal, Ph.D.

Název diplomové práce: Deriváty pyrazinu jako potenciální léčiva I.

Tuberkulóza je celosvětovým závažným problémem, a to především z důvodu rychle se rozvíjející rezistence na aktuálně používaná léčiva. V terapii se proto používají zásadně v kombinacích, aby se předešlo možným komplikacím z důvodu selhání léčby. Také se rozvíjí snaha o výzkum nových potenciálně úspěšných léčiv, která budou mít dostatečnou aktivitu proti *Mycobacterium tuberculosis*, nejčastějšímu původci tohoto onemocnění, a zároveň budou dostatečně bezpečná a tedy vhodná pro použití při terapii tuberkulózy.

Na Katedře farmaceutické chemie a farmaceutické analýzy Farmaceutické fakulty v Hradci Králové Univerzity Karlovy je výzkum již dlouhodobě zaměřen na syntézu nových potenciálních antituberkulotik, především derivátů pyrazinu.

V rámci této diplomové práce bylo za využití mikrovlnné syntézy připraveno celkem pět derivátů aminopyrazinu reakcí s isokyanáty s různě dlouhými alkylovými řetězci. Všechny získané látky byly charakterizovány pomocí teplot tání, elementární analýzy, IR spekter a NMR spekter a poté testovány *in vitro* na antimykobakteriální, antibakteriální a antimykotickou aktivitu. Žádná z látek nevykazovala antibakteriální ani antimykotickou aktivitu. Také při testování na antimykobakteriální aktivitu se u většiny látek aktivita neprokázala, kromě *N*-oktyl-*N'*-(pyrazin-2-yl)močoviny, u které byla minimální inhibiční koncentrace proti *M. tuberculosis* a *M. kansasii* 25 µg/ml.