

Příprava nových antiparasitik na bázi 1,3-cyclohexandionu.

Tato diplomová práce se věnuje syntéze triketonů inspirovaných biologicky účinnými akaricidy, mesotrionem a nitisinonem, odvozených od 1,3 cyklohexandionu. Teoretická část práce se zabývá biologií čmelíka kuřího, mechanismem účinku nitisinonu na metabolismus tyrosinu a na využití nitisinonu u konkrétního příkladu tyrosinémie v humánní medicíně. Dále jsou v teoretické části shrnuty poznatky o syntéze známých triketonů, včetně nitisinonu a mesotrionu. Praktická část je věnována primárně syntéze cílového derivátu odvozeného od mesotrionu, u kterého se předpokládá vyšší biologická dostupnost než u samotného mesotrionu. Dále byla optimalizována esterifikace vedoucí k esterům odvozených od 1,3 cyklohexandionu a následně přesmyk těchto látek, čímž byly připraveny strukturně podobné triketony cílové látky. Tyto deriváty byly následně použity do prvního screeningu ke zjištění biologické aktivity v Biologickém centru AV ČR, v.v.i. v Českých Budějovicích, kde byla zjišťována závislost strukturních prvků na biologické aktivitě na buňkách *E. coli* v přítomnosti enzymů 4 hydroxyfenylpyruvát dioxygenázy, pocházejících z kura domácího a čmelíka kuřího.