

Posudek vedoucího diplomové práce

Název práce: **Stanovení inhibičních aktivit vybraných Schiffových bazí vůči enzymům**

Autor diplomové práce: **Bc. Renato Alejandro Lizaraburo Ancajima**

Vedoucí diplomové práce: **doc. Ing. Vladimír Pejchal, Ph.D.**

Diplomant Bc. Renato Alejandro Lizaraburo Ancajima se ve své diplomové práci věnoval syntéze biologicky aktivních Schiffových bazí obsahujících benzthiazolový blok a jejich redukovaných forem s následným stanovením inhibičních aktivit vůči enzymům acetylcholinesteráze z paúhoře elektrického a butyrylcholinesteráze z koňské plazmy.

Diplomová práce je logicky členěna na teoretickou a experimentální část. V teoretické části diplomant shrnul získané poznatky z oblasti cholinerního systému. V této části popsal charakteristiky obou cholinesteráz, jejich struktura a funkce a také přehled známých inhibitorů cholinesteráz používaných v praxi. V teoretické části diplomant také popisuje metody stanovení inhibičních aktivit vůči cholinesterázám. V samotném závěru teoretické části diplomant shrnul známé poznatky o Schiffových bázích, včetně jejich popsání anticholinerních aktivit.

Diplomant v experimentální části provedl syntézu 5 vybraných Schiffových bazí a 4 jejich redukované formy. Všechny připravené sloučeniny byly charakterizovány pomocí bodu tání, multinukleární NMR spektroskopie, elementární analýzou a v případě opticky aktivních sloučenin i optickou otáčivostí. Dále byly v experimentální části u připravených derivátů Ellmanovou metodou stanoveny hodnoty 50% inhibiční koncentrace (IC_{50}). Dále bylo z důvodu ověření možnosti přestupu přes hematoencefalickou bariéru pro všechny studované deriváty provedeno experimentální stanovení rozdělovacího koeficientu a to bylo porovnáno s vypočtenými hodnotami. Stanovení inhibiční aktivity byly porovnány a diskutovány s výsledky získanými pro známě standarty a s výsledky již publikovaných podobných sloučenin.


Diplomant se po celou dobu potýkal se studijními problémy, celá diplomová práce je psaná „narychlo“, čímž značně utrpěla její kvalita a to hlavně v oblasti stylizace. V práci je řada nedostatků. V celé práci není zřejmé, jaké označení (např. SF 1) které sloučenině odpovídá, a tím pádem není zřejmé, pro jakou sloučeninu bylo stanovení inhibičních aktivit prováděno. V diskuzi asi chybí větší srovnání s výsledky studií podobných látek.

Diplomant při sepisování diplomové práce příliš nespolupracoval, připomínky vedoucího nebyly vždy jednoznačně akceptovány. I přes uvedené nedostatky lze konstatovat, že

diplomant splnil zadané úkoly v požadovaném čase, a proto ji doporučuji k obhajobě a hodnotím známkou

D

V Pardubicích 16. 5. 2019


doc. Ing. Vladimír Pejchal, Ph.D.

Ústav organické chemie a technologie
Fakulta chemicko-technologická
Univerzita Pardubice