

# ABSTRAKT

Univerzita Karlova

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmaceutické botaniky

Kandidát: Aneta Ritomská

Školitel: Doc. Ing. Lucie Cahlíková, Ph.D.

Název diplomové práce: Deriváty Amaryllidaceae alkaloidů jako léčiva

Rostliny čeledi Amaryllidaceae patří k široce rozšířeným druhům. Obsahují velké množství Amaryllidaceae alkaloidů (AA), které jsou známé pro svou biologickou aktivitu. AA disponují širokým spektrem biologických aktivit mezi které patří antivirová, antimalarická, protinádorová, inhibiční aktivita vůči cholinesterázám a další.

Zajímavým AA je ambellin, který se vyskytuje především v rostlinách rodu *Crinum* a *Nerine*. Biologická aktivita této sloučeniny byla doposud studována pouze okrajově. V rámci provedených studií se tato látka jeví jako méně zajímavá.

V rámci diplomové práce byla připravena série alifatických a aromatických derivátů ambellinu. Následně byla studována jejich inhibiční aktivita vůči cholinesterázám a inhibiční aktivita vůči GSK-3 $\beta$ . Screeningově byla studována i cytotoxická aktivita na panelu vybraných nádorových a klidových buněčných linií.

Z připravených derivátů, zajímavou biologickou aktivitou disponovala látka označená jako LC-125 (3-methoxybenzoylambellin). Tato látka vykazovala slibnou aktivitu ve všech biologických studiích. Inhibiční aktivita GSK-3 $\beta$  je charakterizována  $IC_{50} = 93,32 \mu M$ . Navíc se LC-125 jeví jako selektivní inhibitor butyrylcholinesterázy s  $IC_{50} = 6,2 \pm 0,4 \mu M$ . Tento derivát také disponoval mírnou cytotoxickou aktivitou.

**Klíčová slova:** ambellin, deriváty, čeleď Amaryllidaceae, alkaloidy, protinádorová aktivita, Alzheimerova choroba