

Abstrakt

Univerzita Karlova

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmaceutickej botaniky

Kandidát: Filip PIDANÝ

Školiteľ: doc. Ing. Lucie CAHLÍKOVÁ, Ph.D.

Názov diplomovej práce: Deriváty Amaryllidaceae alkaloidov a ich biologická aktivita: deriváty tazettínu I

V štúdiu realizovanej medzi rokmi 1981 až 2014 bolo zistené, že 65 % liečiv charakteru malých molekúl je vo vzťahu s prírodnými látkami. Rastliny čeľade Amaryllidaceae obsahujú osobitnú a stále nie úplne preskúmanú skupinu alkaloidov nazývaných Amaryllidaceae alkaloidy. Medzi ich významné biologické účinky patria napríklad antivírusové, antibakteriálne, protiplesňové, antiparazitické, cytotoxické a predovšetkým účinky súvisiace s motoricko-neurónovým systémom sprostredkované inhibíciou cholinesteráz.

Široko rozšíreným Amaryllidaceae alkaloidom je tazettín, alkaloid tazettínového štruktúrneho typu, o ktorý vzrástol záujem na počiatku 70. rokov 20. storočia v súvislosti s cytotoxickým pôsobením, avšak v rámci prevedených štúdií sa javí ako látka menej zaujímavá.

Predmetom tejto diplomovej práce bola príprava derivátov alkaloidu tazettínu. Následne bola testovaná inhibičná aktivita voči cholinesterázam. Skrínigovo bola študovaná cytotoxická aktivita na paneli vybraných nádorových a zdravých bunkových líniiach.

Bohužiaľ, žiaden nami pripravený derivát nevykázal zaujímavý inhibičný potenciál voči cholinesterázam a vzhľadom na nízke hodnoty inhibície oboch enzýmov nie sú pripravené deriváty uplatniteľné v terapii neurodegeneratívnych ochorení. Taktiež žiaden z pripravených derivátov nevykázal významnú cytotoxickú aktivitu. Alkaloid tazettín sa v tejto chvíli nejaví ako látka uplatniteľná v terapii.

Kľúčové slová: tazettín, alkaloid, deriváty, cytotoxicita, cholinesterázy