

## **Příprava a *in vitro* screening kvarterních inhibitorů acetylcholinesterasy**

### **Abstrakt**

Reversibilní inhibitory acetylcholinesterasy (AChE) našly široké uplatnění v lidské farmakoterapii. Jednou z oblastí jejich využití je profylaxe otravy organofosforovými sloučeninami (OF). K tomuto účelu jsou v současné době používány karbamátové inhibitory (např. pyridostigmin-chlorid). Karbamátový inhibitor se naváže na aktivní místo enzymu, a tím ho ochrání před ireversibilní inhibicí způsobenou OF. Vzhledem k mnoha nežádoucím účinkům těchto látek je snaha nalézt mezi inhibitory AChE vhodnější alternativu.

V rámci této diplomové práce bylo připraveno 19 potenciálních inhibitorů AChE a *in vitro* byla stanovena jejich účinnost vůči AChE a butyrylcholinesterase. Výsledky byly porovnány se selektivními standardními inhibitory cholinesteras BW284c51 a ethopropazinem. Žádná z připravených sloučenin nevykázala vyšší účinnost nebo selektivitu než použité standardy. Na základě získaných dat byly stanoveny vztahy mezi strukturou a účinkem připravených sloučenin.