

ABSTRAKT

Univerzita Karlova v Praze
Farmaceutická fakulta v Hradci Králové
Katedra farmakologie a toxikologie

Kandidát: Mgr. Hana Štěpánová

Školitel: PharmDr. Marie Vopršalová, CSc.

Název rigorózní práce: Účinky nových derivátů chinazolinu na respirační systém

Onemocnění dýchacích cest představují závažný zdravotní, sociální a ekonomický problém.

K léčbě astmatu se v některých zemích tradičně využívá asijská rostlina *Justicia adhatoda*, *Acanthaceae*. Za její terapeutické účinky jsou zodpovědné chinazolinové alkaloidy vasicin a vasicinon.

Cílem předkládané práce bylo stanovit bronchodilatační potenciál derivátů chinazolinových alkaloidů, a to VN-027 (4-[3-(piperidin-1-yl)propyloxy]pyrimidin) a VN-033 (2-[3-(piperidin-1-yl)propylsulfanyl]chinoxalin). K hodnocení jejich relaxačního účinku na hladkou svalovinu dýchacích cest jsme použili metodu izolované průdušnice potkana.

Jednotlivé preparáty hladké svaloviny průdušnice jsme po prekontrakci karbacholem (10^{-5} M) kumulativně relaxovali vzrůstajícími koncentracemi testovaných látek (10^{-7} až 10^{-2} M), maximální relaxaci jsme na konci pokusu navodili theofylinem (10^{-2} M). Ze získaných hodnot jsme pomocí programu *GraphPad* sestavili DRC křivky a vypočítali hodnoty EC_{50} ($1,115 \cdot 10^{-3}$ pro VN-027 a $6,404 \cdot 10^{-6}$ pro VN-033). Výsledky byly porovnány se standardním léčivem theofylinem ($EC_{50} = 2,090 \cdot 10^{-3}$). Obě testované látky vykazaly na základě hodnot EC_{50} vyšší relaxační účinky na hladkou svalovinu potkana než standardní léčivo theofylin.