

ABSTRAKT

Vasicin je chinazolinový alkaloid obsažený v rostlině *Justicia adhatoda* (syn. *Adhatoda vasica*, Acanthaceae). Tato indická rostlina je už po tisíciletí používána v tradiční indické medicíně zejména k léčení astmatu (4). Cílem předkládané práce bylo stanovit bronchodilatační účinky nových derivátů 4-hydroxychinazolinu, a to VN-011 (4-[2-(1-methylpyrrolidin-2-yl)ethoxy]chinazolin) a VN-013 (4-[2-(1-methylpyrrolidin-2-yl)ethylsulfanyl]chinazolin). K zjišťování relaxační aktivity testovaných látek jsme použili metodiku izolované průdušnice potkana, kterou jsme kontrahovali karbacholem v koncentraci 10^{-5} M a maximální relaxaci na konci experimentu navodili teofylinem o koncentraci 10^{-2} M. Pomocí programu GraphPad jsme z DRC křivek prověřovaných látek vypočítali hodnoty EC_{50} ($149 \pm 4,0$ $\mu\text{mol/l}$ pro VN-011 a $69 \pm 2,0$ $\mu\text{mol/l}$ pro VN-013). Námi získané výsledky jsme porovnávali se standardním bronchodilatačním léčivem teofylinem - hodnota EC_{50} 1888 ± 72 $\mu\text{mol/l}$ byla převzata z diplomové práce (27). Oba testované deriváty (s etoxy- a etylsulfanylovým fragmentem) vykazaly na základě srovnání hodnot EC_{50} signifikantně vyšší dilatační účinky na hladký sval průdušnice u potkana než teofylin.