

Abstrakt

Kostelník J.: Studium biologické aktivity alkaloidů izolovaných z *Fumaria officinalis* L. (Fumariaceae) I. Diplomová práce, Univerzita Karlova v Praze, Farmaceutická fakulta v Hradci Králové, Katedra farmaceutické botaniky a ekologie, Hradec Králové 2014, 63 s.

Cílem diplomové práce bylo izolační zpracování spojené frakce č. 55-67 (A₂) získané ze sumárního alkaloidního extraktu rostliny *Fumaria officinalis* L. (Fumariaceae). Za pomoci chromatografických metod byly izolovány tři alkaloidy, které byly dále identifikovány pomocí strukturní analýzy (GC-MS, NMR). Tyto tři alkaloidy byly určeny běžnými chromatografickými metodami a poté byly identifikovány na základě strukturní analýzy, optické otáčivosti a teploty tání jako (-)-*O*-methylfumarofycin, (-)-sinaktin a (-)-stylopin.

U izolovaných látek byla stanovena inhibiční aktivita vůči lidské erytrocytární acetylcholinesterase, lidské sérové butyrylcholinesterase a prolyl oligopeptidase. Naměřené hodnoty byly vyjádřeny jako hodnoty IC₅₀ ((-)-stylopin: IC₅₀ AChE a IC₅₀ BuChE > 1000 μM, IC₅₀ POP > 1000 mM; (-)-*O*-methylfumarofycin: IC₅₀ AChE = 963,10 ± 135,98 μM, IC₅₀ BuChE = 1771,0 ± 380,94 μM, IC₅₀ POP – neměřena; (-)-sinaktin IC₅₀ AChE = 632,0 ± 68,12 μM, IC₅₀ BuChE = 8154,3 ± 981,42 μM, IC₅₀ POP = 52,9 ± 1,8 μM). Žádný z izolovaných alkaloidů nevykazoval lepší inhibiční aktivitu oproti cholinesterasám v porovnání s galanhtaminem (IC₅₀ AChE = 1,71 ± 0,07 μM, IC₅₀ BuChE = 42,03 ± 1,30 μM), huperzinem A (IC₅₀ AChE = 0,033 ± 0,001 μM, IC₅₀ BuChE > 1000 μM) a fyzostigminem (IC₅₀ AChE = 0,063 ± 0,001 μM, IC₅₀ BuChE = 0,130 ± 0,004 μM). A je zřejmé, že nejsou zodpovědné za inhibiční aktivitu sumárního alkaloidního výtřepku (IC₅₀ AChE = 39,2 ± 1,96 μg/ml, IC₅₀ BuChE = 40,32 ± 1,9 μg/ml). Ve studii zaměřené na inhibici POP se (-)-sinaktin (IC₅₀ POP = 52,9 ± 1,8 μM) jeví jako velmi aktivní látka, která vykazovala mnohem větší inhibiční aktivitu než použitý standard bajkalin (IC₅₀ POP = 0,610 ± 0,021 mM), ale menší aktivitu než Z-pro-prolinal (IC₅₀ POP = 3,27 ± 0,02 nM).

Klíčová slova: acetylcholinesterasa, Alzheimerova choroba, butyrylcholinesterasa, *Fumaria officinalis* L, prolyl oligopeptidasa.