

Abstrakt

Univerzita Karlova

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmakologie a toxikologie

Študent: Ondrej Tomáš

Školiteľ: PharmDr. Marie Vopršalová, CSc.

Školiteľ – špecialista: mjr. PharmDr. Vendula Hepnarová, Ph.D.

Názov diplomovej práce: Hodnotenie novo pripravených insekticídov *in vitro*

Malária patrí medzi najnebezpečnejšie infekčné ochorenia prenášané hmyzom. Každoročne ohrozuje milióny životov po celom svete. Preto je nutné hľadať spôsoby ako zabrániť jej prenosu na ľudí. Jednou z metód je regulácia populácie jej najčastejších prenášačov, ktorými sú komáre z rodu *Anopheles*. Nové insekticídy schopné inhibovať komáriu acetylcholinesterázu by mohli byť nástrojom pre riešenie tohto problému.

Cieľom tejto diplomovej práce bola analýza šiestich novo pripravených derivátov sukcinimidu s inekticídny potenciálom. U týchto štruktúr bola meraná schopnosť inhibovať enzým acetylcholinesterázu človeka (*hAChE*) a komára druhu *Anopheles gambiae* (*AgAChE*). Štyri základné štruktúry týchto molekúl boli taktiež podrobené rovnakému meraniu s účelom nájsť vzťah medzi ich štruktúrou a biologickou aktivitou. Hodnoty polovičnej maximálnej inhibičnej koncentrácie (IC_{50}) pre oba enzýmy boli získané s využitím upravenej Ellmanovej metódy.

Testované látky boli schopné inhibovať *hAChE*, ale žiadna nevykázala výraznú aktivitu voči *AgAChE*. Hodnoty IC_{50} pre ľudský enzým u látky LG-488 boli v približnom rozsahu ako u takrínu. Analyzované štruktúry sa síce neosvedčili ako insekticídy, avšak ďalšie modifikácie v štruktúre by mohli viesť k objaveniu látok, ktoré by predstavovali účinnú zbraň v boji proti škodcom.

Kľúčové slová: acetylcholinesteráza, insekticíd, malária, Ellmanova metóda