

## ABSTRAKT

Univerzita Karlova

Farmaceutická fakulta v Hradci Králové

Katedra farmakognozie a farmaceutické botaniky

Kandidát: Jitka Babcová

Školitel: prof. Ing. Lucie Cahlíková, Ph.D.

Název diplomové práce: Strukturální obměny haemanthaminu

Předmětem této diplomové práce bylo připravit další sérii semisyntetických derivátů haemanthaminu. Bylo připraveno 12 aromatických esterových derivátů haemanthaminu a dva ethery. Látky byly následně identifikovány pomocí MS, NMR analýzy, optické otáčivosti a následně podrobeny screeningu biologické aktivity. Deset připravených derivátů bylo testováno na *in vitro* inhibiční aktivitu vůči *hAChE* a *hBuChE*. Všechny deriváty byly vyhodnoceny jako neaktivní ( $IC_{50} > 10 \mu M$ ). U 12 derivátů haemanthaminu byla testována antimykobakteriální aktivita. Nejzajímavější antimykobakteriální potenciál proti kmenu *Mtb* H37Ra vykázal derivát 11-*O*-(4-pentylbenzoyl)haemanthamin ( $MIC = 3,91 \mu g/ml$ ), proti kmenu *M. aurum*: 11-*O*-(4-*tert*butyllbenzoyl)haemanthamin, 11-*O*-(1-naftoyl)haemanthamin a 11-*O*-(4-butylbenzoyl)haemanthamin ( $MICs = 7,81 \mu g/ml$ ), proti kmenu *M. avium*: 11-*O*-(4-pentylbenzoyl)haemanthamin, 11-*O*-(4-hexylbenzoyl)haemanthamin ( $MICs = 1,25 \mu g/ml$ ), proti kmenu *M. kansasii*: 11-*O*-(4-pentylbenzoyl)haemanthamin ( $MIC = 3,91 \mu g/ml$ ), 11-*O*-(4-hexylbenzoyl)haemanthamin ( $MIC = 7,81 \mu g/ml$ ), proti kmenu *M. smegmatis*: 11-*O*-(1-naftoyl)haemanthamin ( $MIC = 7,81 \mu g/ml$ ). U sedmi derivátů byla testována antimikrobiální aktivita vůči různým kmenům mikroorganismů. Všechny látky byly vyhodnoceny jako neaktivní ( $MICs > 125 \mu M/l$ ). V současné době jsou deriváty s nezajímavější antimykobakteriální aktivitou testovány na jejich toxicitu vůči HepG2 buňkám.

Klíčová slova: haemanthamin, syntéza, analoga, biologická aktivita