

# Abstrakt

Faschingbauer J.: Cytotoxická a cholinesterasová inhibiční aktivita extraktů z vybraných druhů rodu *Centaurea* L.. Diplomová práce, Univerzita Karlova, Farmaceutická fakulta v Hradci Králové, Katedra farmaceutické botaniky, Hradec Králové 2019.

V rámci screeningu biologicky aktivních sekundárních metabolitů rostlin, prováděné na katedře farmaceutické botaniky FAF UK, byly zkoumány vybrané taxony rodu *Centaurea* (Asteraceae). Tato studie se zabývá základním fytochemickým výzkumem extraktů připravených z nažek druhů *Centaurea cyanus*, *Centaurea jacea*, *Centaurea scabiosa*, *Centaurea pseudophrygia*, *Centaurea stoebe*, *Centaurea solstitialis* a *Centaurea benedicta*. Pro objasnění jednotlivých skupin sekundárních metabolitů byly připravené extrakty podrobené důkazovým reakcím na TLC a MS analýze (EI, ESI). Ethyl-acetátové i sumární ethanolové extrakty byly zkoumány na potenciální inhibiční aktivitu vůči lidské erytrocytární acetylcholinesterase (AChE) a plazmové butyrylcholinesterase (BChE) a cytotoxictě vůči vybraným 9 nádorovým liniím. Zajímavou cholinesterasovou aktivitu vykazoval ethyl-acetátový extrakt *C. cyanus*, který selektivně inhiboval BChE ( $IC_{50}^{BChE} = 22,62 \pm 3,62 \mu\text{g/ml}$ ;  $IC_{50}^{AChE} = 221,50 \pm 44,56 \mu\text{g/ml}$ ). Ostatní ethyl-acetátové a ethanolové extrakty dalších vybraných druhů rodu *Centaurea* byly vůči cholinesterasám neaktivní ( $IC_{50} > 100 \mu\text{g/ml}$ ). Na základě výsledků, se jako perspektivní pro další studium jeví sekundární metabolity *Centaurea cyanus*.

U izolovaných látek arktiinu a matairesinosidu byla měřena inhibiční aktivita proti POP, kde byly použity jako standary fyzostigmin, bajkalin a Z-pro-prolinal. Ani jedna z látek však nevykazovala aktivitu proti POP.

V rámci této diplomové práce byly izolovány látky arktiin a matairesinosid, které se v této diplomové práci jeví jako neaktivní vůči vybraným biologickým testům (inhibice AChE, BChE, POP a cytotoxicitě). Byly však také připraveny jejich aglykony arktigenin a matairesinol, které podle literatury vykazují velice zajímavé cytotoxické účinky.

Cytotoxická aktivita ethyl-acetátových extraktů byla zkoumána v koncentracích 50  $\mu\text{g/ml}$  vůči nádorovým liniím Jurkat, MOLT-4, A549, HT-29, PANC-1, A2780, HeLa, MCF-7, SAOS-2 a jako kontrolní linie byly použity nenádorové buňky MRC-5. Doxorubicin (1  $\mu\text{M}$ ) byl použit jako pozitivní standard. Cytotoxická aktivita extraktů byla vyjádřena jako buněčná viabilita po jejich 48 hodinovém působení a hodnoty byly vyjádřeny v procentech vztažených ke kontrole (100%). Alkaloidní extrakt *C. cyanus* vykazoval nejlepší cytotoxickou aktivitu, byl účinný vůči MOLT-4 ( $16 \pm 7\%$  viabilita). Nicméně, v porovnání se standardem doxorubicinem, cytotoxická aktivita ethyl-acetátových extraktů vůči vybraným nádorovým liniím je nízká.

