



EFFECTO INHIBITORIO DE COMPUESTOS QUIMICOS SINTETICOS SOBRE LA ACTIVIDAD DE LA ACETILCOLINESTERASA (AChE)

Daniel García¹, R. Zaynullin², José Martínez¹, Anna Iliná¹, Elda Segura^{1*}

¹ Universidad Autónoma de Coahuila, Grupo de Nanobiociencia y Departamento de Investigación en Alimentos, Saltillo, 25280, ² Facultad de Química y Tecnología del Servicio, Depto. de Tecnología Química Especial, Universidad Estatal de Economía y Servicios de Ufa, Chernyshevsky 145, Ufa, Bashkortostan, CP 450078, Rusia.

*E-mail: psegura@uadec.edu.mx

Palabras clave: acetilcolinesterasa, inhibición de la hidrólisis de neurotransmisor.

Introducción. La acetilcolinesterasa (AChE) es una enzima que hidroliza la acetilcolina, con la formación de colina y acetato, de manera que ninguno de ellos tiene efecto transmisor importante (1), por lo que queda anulada la acción del transmisor. Los inhibidores de la enzima acetilcolinesterasa tienen un papel importante en el desarrollo de nuevos insecticidas, así como en el tratamiento de la enfermedad de Alzheimer (2,3). Actualmente el empleo de fármacos son beneficiosos para el tratamiento de algunos síntomas pero pueden causar efectos secundarios adversos. El objetivo del presente trabajo fue evaluar el efecto inhibitorio que presentan los compuestos químicos sintéticos proporcionados por Dr. Zaynullin R. (Rusia).

Metodología. Se evaluó la concentración de DMSO el cual fue el solvente usado para disolver los compuestos químicos sintéticos a diferentes concentraciones de 100%, 50% y 10% se realizó por triplicado. La actividad enzimática se llevó a cabo por el método espectrofotométrico de Ellman a una longitud de onda de 412 nm, que se fundamenta en la reacción química entre el DTNB (ácido 5,5-ditiobis-2-nitrobenzoico) y el grupo sulfhidrilo de la tiocolina (producto de la hidrólisis enzimática de la acetilcolina), se realizaron ensayos probando diferentes tiempos y concentraciones de la enzima con y sin adicionar los compuestos químicos sintéticos (inhibidores) proporcionados por el Dr. Farkhutdinov de UFA en Russia, el compuesto químico sintético seleccionado fue preparado en una solución de DMSO a una concentración de 10%.

Resultados. Los compuestos químicos sintéticos obtenidos para ser evaluados como inhibidores de la actividad enzimática de la acetilcolinesterasa, son solubles en DMSO por lo que uno de los ensayos realizados fue determinar la concentración máxima del solvente a la que no se inhibe la actividad de la enzima. En la figura 1, se puede observar que arriba de 10% de concentración del DMSO la actividad enzimática disminuye drásticamente, eligiendo ésta concentración para preparar los diferentes compuestos químicos sintéticos. Mientras que en la figura 2 se observa que la actividad enzimática en presencia de los compuestos químicos sintéticos seleccionados con posible efecto

inhibitorio, solo 16 de ellos fueron solubles en la concentración seleccionada de DMSO. El porcentaje de inhibición de los compuestos químicos seleccionados varía desde 40 hasta 100%, el compuesto A-202 presenta el 40.7% de inhibición, mientras que A-124, A-63, A-36, A-51 y U-12 presentaron el 100% de inhibición de la actividad enzimática

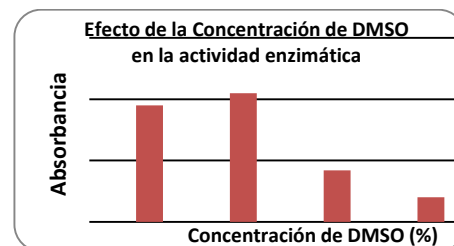


Fig. 1. Efecto de las diferentes concentraciones de DMSO sobre la actividad enzimática de la acetilcolinesterasa

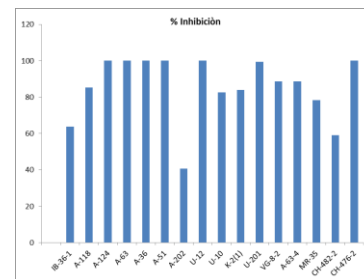


Fig. 2. Efecto de inhibición de los compuestos químicos, sintéticos

Conclusiones. De los 35 compuestos químicos sintéticos proporcionados por el Dr. Zaynullin R. (Rusia), solo 16 fueron solubles en DMSO a la concentración seleccionada (10%), los cuales presentaron un efecto inhibitorio en la actividad enzimática de la acetilcolinesterasa.

Bibliografía.

- Chattipakorn S., Pongpanparadorn A., Pratchayasakul W., Pongchaidacha A., Ingkaninan K., Chattipakorn N. 2006. *Tabernaemontana divaricate* extract inhibits neuronal acetylcholinesterase activity in rats. *J. Ethnopharmacol.* 110(1): 61-68.
- Alzheimer's Association 2008. Alzheimer's disease facts and figures. *J Alzheimer's Dement.* 4 (2): 110-133.
- Jung H.A., Min B.-S., Yokozawa T., Lee J.-H., Kim Y.S., Choi J.S. 2009. Anti-Alzheimer and antioxidant activities of *Coptidis rhizoma* alkaloids. *Biol. Pharm. Bull.* 32(8): 1433 - 1438.