

## Zusammenfassung

Der Aufbau einer Mikrotiterplatten-gestützten kinetischen Meßmethode zur Bestimmung der  $\alpha$ -Amylase Aktivität erlaubte das rasche Screening von Pflanzenextrakten und Reinstoffen. Es konnte gezeigt werden, dass Pflanzenextrakte die Aktivität der  $\alpha$ -Amylase hemmen können. Als besonders aktiv erwiesen sich Extrakte von *Cynara cardunculus* L. ssp. *flavescens* Wikl., *Melissa officinalis* L., *Pyrus communis* L., *Vaccinium myrtillus* L., *Malus domestica* Borkh., *Balanites aegyptiaca* (L.) Del. und *Tamarindus indica* L.. Eine fraktionierte Extraktion von *Cynarae herba* und anschließende Testung der biologischen Aktivität der Einzelfractionen zeigte, dass die aktiven Komponenten, die für die  $\alpha$ -Amylase Hemmung verantwortlich sind, in der ethanolischen bzw. der wässrigen Fraktion anzutreffen sind und somit eine ausgeprägte Hydrophilie aufweisen müssen. Versuche mit einem lipophilen und einem hydrophilen Trockenextrakt sowie einem Presssaft und einem wasserlöslichen Spezialextrakt bestätigten diese Ergebnisse. Der Nachweis der Inhaltsstoffe der Artischockenzubereitungen erfolgte mittels HPLC und DC. Diverse Kaffeesäurederivate und verschiedene Flavonoide, die bereits als Inhaltsstoffe der Droge identifiziert worden sind, konnten nachgewiesen werden. Die Untersuchung der einzelnen Inhaltsstoffe und verwandter Verbindungen hinsichtlich ihrer Beeinflussung der  $\alpha$ -Amylase Aktivität zeigte, dass die biologische Aktivität mit der Zahl freier OH-Gruppen und der Kettenlänge der Seitengruppen korreliert. Computergestützte Untersuchungen hinsichtlich des möglichen Angriffs aktiver Verbindungen am Enzym gaben Hinweise auf eine Bindung an der Disaccharidbindungsstelle. Die Vermutung konnte durch Kombinationsversuche der Versuchssubstanzen Isochlorogensäure und Maltose bestätigt werden. Scheinbar führt die Bindung der Substanzen in der Disaccharidbindungsstelle, die zwischen Domäne A und C des Enzyms lokalisiert ist, zu einer sterischen Umstrukturierung innerhalb von Domäne A, die Einfluss auf die Bindungsstellen im aktiven Zentrum hat, welche in Domäne A liegen. Der hemmende Einfluss des Königsartischockenextraktes auf die  $\alpha$ -Amylase Aktivität konnte durch *in vivo* Versuche bestätigt werden. Die Einnahme von 200 mg Königsartischockenextrakt vor dem Essen führte zu einer signifikanten Absenkung der postprandialen Blutzuckerspitze. Die Reduktion der postprandialen Blutzuckerspitze lag mit durchschnittlich 36,7% in einer ähnlichen Größenordnung wie die durch Einnahme von 50 mg Acarbose (Mittelwert 52,3%) bewirkte Senkung.

## Summary

The creation of a microplate-reader-based kinetic assay led to a rapid screening of plant extracts and pure compounds. Plant extracts were found to be able to inhibit the  $\alpha$ -amylase activity. *Cynara cardunculus* L. ssp. *flavescens* Wikl., *Melissa officinalis* L., *Pyrus communis* L., *Vaccinium myrtillus* L., *Malus domestica* Borkh., *Balanites aegyptiaca* (L.) Del., *Tamarindus indica* L. were found to be active in the used *in vitro* test model. A performed bioguided extraction showed that the active constituents of *Cynarae herba* were of hydrophilic character. Further investigations with a hydrophilic and a lipophilic extract confirmed these results. The qualitative detection of *Cynarae herba* constituents was performed by TLC and HPLC. The investigation of isolated compounds with regard to their ability to inhibit the  $\alpha$ -amylase activity showed that the biologic activity correlates with the number of OH-groups in the molecules. Additionally performed computer-based investigations led to the assumption that the active compounds interact with disaccharide binding site of  $\alpha$ -amylase. *In vivo* investigations showed a significant decrease of post-prandial hyperglycaemia after oral intake of *Cynarae herba* dry extract.