



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

(11) **264 505**

(13) B1

(21) PV 1902-84
(22) Přihlášeno 16 03 84

(51) Int. Cl.⁴
A 61 K 31/60,
C 07 C 65/10

(40) Zveřejněno 16 09 88
(45) Vydáno 14 12 90

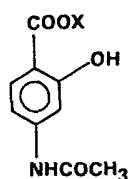
(75)
Autor vynálezu

KALINA ČESTMÍR MUDr. CSc., PONERT JIŘÍ prom. biol. ing. DrSc.,
POTÁČOVÁ MILOSLAVA, JARÝ JIŘÍ prof. ing. DrSc., PRAHA

(54)

Prostředek inhibující xanthinreduktázy

(57) Prostředek inhibující xanthin-reduktázy
je tvořen sloučeninou kyseliny N-acetyl-p-ami-
nosalicylové vzorce



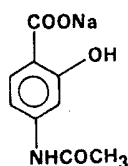
kde X je anorganický nebo organický kation.
Prostředek může být využit v lékařské diagno-
stice, onkologii a biotechnologii a v genovém
inženýrství.

Vynález se týká prostředku inhibujícího xanthinreduktázy.

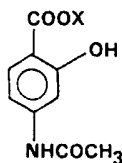
Xanthin- O_2 -reduktáza (známá též pod starším názvem xanthin-oxidáza) se vyskytuje ve sliznici lidského střeva a v lidských játrech. Metoda stanovení její aktivity je popsána v knize Jakoby W. B. (ed.): *Enzyme Purification and Related Techniques*, vol. 22, p. 150–152, Academic Press New York and London 1971.

Sodná sůl kyseliny N-acetyl-para-aminosalicylové získala státní registraci SSSR No. 388 281 (chemické sloučeniny s biologickým účinkem).

Jak vyplývá z následujícího příkladu, použití sloučeniny vzorce

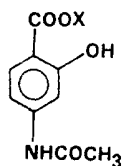


je založeno na objevení její nové vlastnosti, a to jejího inhibičního účinku na xanthin-reduktázy, při současné její netoxičnosti. Podstatou vynálezu je prostředek inhibující xanthin-reduktázu, který je tvořen sloučeninou vzorce



PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Prostředek inhibující xanthin — reduktázy, vyznačený tím, že je tvořen sloučeninou kyseliny N-acetyl-p-aminosalicylové vzorce



kde X je anorganický nebo organický kation.

Vynález může být využit v lékařské diagnostice a v onkologii. Rovněž je perspektivní v oblasti biotechnologie a genovém inženýrství.

Prostředek podle vynálezu se objasňuje v dále uvedeném příkladu:

U sodné soli kyseliny N-acetyl-para-aminosalicylové byl autory vynálezu objeven inhibující účinek na xanthin reduktázy. Ke stanovení byla užita standardní metodika Ústavu pro biologické zkoušení chemických sloučenin SSSR.

50% inhibice xanthin- O_2 reduktázy je působena $0,8 \cdot 10^{-4}$ M roztokem sodné soli N-acetyl-para-aminosalicylové. 50% inhibice (I_{50}) xanthin-DChFIF-reduktázy je dosahováno $0,8 \cdot 10^{-4}$ roztokem sodné soli kyseliny N-acetyl-para-aminosalicylové (Vědecko-výzkumný ústav pro biologické zkoušení chemických sloučenin).

Přitom je Na-sůl kyseliny N-acetyl-para-aminosalicylové netoxická, o čemž svědčí následující údaje. Akutní toxicita sloučeniny ve fyziologickém roztoku byla testována intravenózně na myších — je nižší než 0,5 g/kg tělesné hmotnosti. Chronická toxicita byla testována perorálně na krysách při denních dávkách 0,5 g/kg tělesné hmotnosti podávaných po dobu 10 dnů a při denních dávkách 1 g/kg tělesné hmotnosti podávaných po dobu 10 dnů. Proti kontrolní skupině, jak v případě samic, tak v případě samců, nebyly zjištěny rozdíly, což svědčí o netoxičnosti i při vysokých denních dávkách opakovaně podávaných.

kde X je anorganický nebo organický kation, například Na.