

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

195918
(11) (B3)



GRAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

(22) Přihlášeno 17 01 77
(21) (PV 273-77)

(51) Int. Cl.³
C 07 C 159/00

(40) Zveřejněno 29 06 79

(45) Vydáno 15 06 82

(75)

Autor vynálezu

PROCHÁZKA JIŘÍ dr. ing., PRAHA

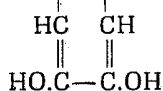
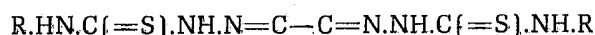
(54) Thiosemikarbazony 4,5-dioxy-o-chinonu a jejich desmotropní p-chinoidní formy a způsob jejich přípravy

1

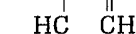
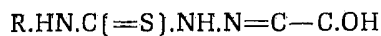
2

Předmětem vynálezu jsou thiosemikarbazony 4,5-dioxy-o-chinonu, popřípadě jeho

desmotropní p-chinonové formy obecného vzorce I



(I)



v němž

R znamená vodík nebo p-nitrofenylskupinu a způsob výroby těchto semikarbazonů, které nalézají použití jako bodové mutageny.

S výhodou lze také použít fenolátů thiosemikarbazonů vzorce I, např. fenolátů amonných, fenolátů alkalických kovů nebo vů alkalických zemin.

Jak je známo, 4,5-dioxy-o-chinon má parthenokarpické působení, které je pravděpodobně dlužno připsat na vrub jeho schopnosti vytvářet komplexní struktury s dusíkatými látkami a asimilovat i vzdušný du-

sík za vzniku polymerních látek obdobných huminovým kyselinám.

Nyní bylo zjištěno, že nové semikarbazony obecného vzorce I nebo jejich fenoláty působí poruchy v přenosu genetické informace, tj. jako sloučeniny označované jako tzv. cytostatika. Bodová mutace je proces, v němž je pouze jedna báze z řetězce desoxydibonukleové kyseliny nahrazena přirozeně se vyskytující nebo uměle připraveným analogem. Bodové mutace obvykle výrazně nemění obsah genetické informace a nemají letální následky. Z chemických mutagenů jsou to např. kyselina dusitá a alkylační

činidla. Další poruchy exprese genetické informace způsobují vedle uvedených cyto-
statik i některá antibiotika, např. strepto-
mycin, který inhibuje reduplikaci molekul
desoxyribonukleové kyseliny.

Kondenzace 4,5-dioxy-o-chinonu na semi-
karbazonový derivát obecného vzorce I se
s výhodou provádí vycházející z alkalického
difenolátu působením hydrochloridu thiose-
mikarbazidu, což ovšem nevylučuje postup
používající volný chinon.

Příklad 1

Příprava semikarbazonu 4,5-dioxy-o-chinonu
(vzorec I, R = H)

K roztoku 10 g dikaliumfenolátu-o-chino-
nu slabě okyselenému ekvivalentem zředěné
kyseliny solné se přidalo 7 g thiosemikar-
bazidu rozpuštěného v mírně ohřátém roz-

toku 45 ml vody. Po rekrystalizaci z vody
měl produkt t. t. 153,5 °C.

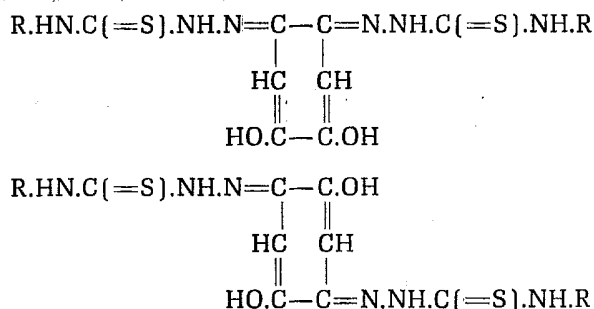
Příklad 2

Sledování změn v makroskopickém obraze
při mitotickém dělení

Průběh mitosy byl sledován z pohybu
chromosomů buněk škrkavky koňské (*Asca-
ris megaloccephala bivalens*) pomocí Feul-
genovy reakce, a to mikroskopicky jednak
ve vodném prostředí, jednak ve vodném pro-
středí obsahujícím thiosemikarbazon (obec-
ného vzorce I, kde R = H) v koncentraci
 3×10^{-1} mikrogramu. Porucha mitosy v
přítomnosti semikarbazonu byla zjištěna již
v profasi, že nedošlo k vytvoření chromati-
nového spiremu a vymizení buněčné blány,
jadérka a vytvoření volných chromosomů.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Thiosemikarbazony 4,5-dioxy-o-chinonu
a jejich desmotropní p-chinoidní formy o-
becného vzorce I



v němž

R znamená vodík nebo p-nitrofenylskupi-
nu, nebo jejich amonné fenoláty, fenoláty
alkalických kovů nebo kovů alkalických ze-
min.

2. Způsob výroby sloučenin obecného
vzorce I nebo jejich fenolátů podle bodu 1

vyznačující se tím, že 4,5-dioxy-o-chinon
reaguje s thiosemikarbazidchloridem nebo
jeho jinou solí s minerální kyselinou u pří-
tomnosti látek vázajících uvolněnou kyseli-
nu s výhodou v přítomnosti octanu sodné-
ho, nebo že reaguje fenolát 4,5-dioxy-o-chi-
nonu se solí thiosemikarbazidu.