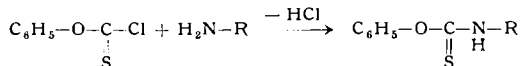


Carbothialdine mit zwei verschiedenen Resten R und R₁ an den Stickstoffatomen konnten aus dithiocarbaminsauren Alkalisalzen durch Umsatz mit Aldehyd und einem zweiten Amin gewonnen werden. Der Rest R (I) ist maßgeblich für die Wirksamkeit, R₁ bestimmt im wesentlichen die physikalischen Eigenschaften, wie die Löslichkeit. Verbindungen mit C=O statt C=S, die aus Aminen, Formaldehyd und Kohlenoxysulfid gewonnen wurden, sind unwirksam. Carbothialdine mit R = Benzyl-, Phenyläthyl- und ganz besonders mit Allyl- erwiesen sich im Plattenverdünnungstest als sehr gut wirksame Bakterizide und Fungizide von überraschender Wirkungsbreite und zeigten auch in klinischen Versuchen (Prof. Piper und Mitarb.) gute Wirkung gegen Hautpilze, so daß ihre praktische Anwendung in Aussicht genommen ist.

Als noch stärker wirksame Fungizide erwiesen sich bestimmte Thiourethane (II). Sie wurden über die Monothiokohlensäure-O-arylester (erhalten aus Thiophosgen und Phenolen) hergestellt:



Es besteht eine sehr starke Abhängigkeit der bakteriziden und fungiziden Wirkung von der Natur des Restes R. Während z. B. bei R=C₆H₅ das Wachstum von Hefen und Pilzen schon bei einer Konzentration von 1:5000 beginnt, wirken Thiourethane mit R=C₆H₅—CH₂— und C₆H₅—CH₂—CH₂— bis 1:500 000. Auch die Natur des O-Aryl-Restes hat einen gewissen Einfluß auf die Wirksamkeit.

Bestimmte Thiourethane hemmen sehr stark das Wachstum von Influenza-Virus, wie Dr. Sprössig bei in vitro-Versuchen am embryonierten Hühnerei fand. Die Wirkung des Kressensamenöls und der Senföle wird in diesem Test durch die Thiourethane erreicht. Bei den wirksamsten Verbindungen tritt bereits bei 2,5 γ/1 ml Nährlösung deutliche, bei 5 γ starke und 10 γ vollständige Wachstumshemmung auf. Die Zellatmung wird dabei nur in geringem Grade beeinflusst. Eine „viruzide“ Wirkung liegt aber nicht vor; denn mit Thiourethanen vorbehandeltes Virus wird in seinem Wachstum nicht gehemmt. Wird aber die Eihautzelle mit den Substanzen vorbehandelt, so tritt auch nach völliger Entfernung des Wirkstoffes nach Überimpfung von Influenza-Virus kein Wachstum mehr ein. Die Zelle erleidet also eine Umstimmung, so daß sie für die Virussynthese unbrauchbar geworden ist. Auch zur bereits laufenden Virussynthese zugesetzt, wirken die Stoffe sofort hemmend. Ist die Virussynthese schon länger als 8–10 h in Gang, so vermögen die Thiourethane diese nicht mehr zu hemmen.

G. DREFAHL, Jena: *Synthesen und Stereochemie polycyclischer Aminoalkohole*.

Als Modell für Untersuchungen über die Stereochemie polycyclischer 1.2-Aminoalkohole wurde das 9-Hydroxy-10-amino-1.2.3.4.9.10.11.12-octahydro-phenanthren in seinen möglichen Isomeren dargestellt. Die stereospezifischen Synthesen gehen über das cis- bzw. trans-9-Keto-octahydrophenanthren, deren α-Oximierungsprodukte in Übereinstimmung mit der Bartonschen Regel über die α-Aminoketone zu den vier diastereomeren Aminoalkoholen sterisch einheitlich reduziert wurden.

Zur Konstitutionsfestlegung wurde neben der Acyl-Wanderung die unterschiedliche Komplexbildungstendenz der Aminoale herangezogen, die zugleich Hinweise auf die Konstellationsverhältnisse gibt.

Die Konstellationsfragen wurden geklärt durch Diskussion der IR-Spektren im 3 μ Bereich sowie durch Vergleich der Dipolmomente der Diastereomeren unter Zugrundelegung von Untersuchungen an 1.2-Aminolen einfacher Ringverbindungen.

Für das trans-9-Hydroxy-10-amino-trans-1.2.3.4.9.10.11.12-octahydro-phenanthren ergibt sich so eine Halbwannenform des mittleren Ringes.

E. PROFFT, Merseburg: *Ketobasen von nicht kondensierten Benzolkernen und solche kondensierter Systeme und ihre pharmazeutischen Eigenschaften*.

Bei Ketobasen des Typus Ar·CO·CH₂·CH₂·N< (HCl-Salz) von nicht kondensierten Benzolkernen, worin Ar = Rest des Diphenyls, Diphenylmethans und Dibenzyls ist, zeigte sich, daß bereits die nicht alkoxylierten Grundgerüste Mannich-Verbindungen von hoher Anästhesie, gemessen als Oberflächenanästhesie im Zungen-test am Menschen, sind. Im Gegensatz zu nicht alkoxylierten Benzolen, die praktisch keine Anästhesie erzeugen, sind Abkömmlinge des Diphenyls, besonders des Diphenylmethans, gegenüber Cocain noch sehr stark wirksam (3- bis 8-mal so stark). Sie reichen in 0,5-proz. Lösung z. T. an die ⁶Falicain-Wirkung heran. Für medizinische Zwecke sind Lösungen unter 0,1 % angezeigt. Der Dibenzyl-Abkömmling ist überraschenderweise fast wirkungslos.

Eingeführte Alkoxy-Gruppen bringen, in obigen Fällen, ebenfalls unerwarteterweise keine Steigerung, sondern eine Abschwächung der anästhetischen Wirksamkeit mit sich; die Wirkungs-dauer kann allerdings verlängert sein.

Ketobasen kondensierter Systeme, vor allem des Naphthalins, ähneln in ihrem Verhalten den entspr. Benzol-Abkömmlingen. Die nicht durch Alkoxy-Gruppen substituierte Ketobase des Naphthalins ist allerdings ganz wesentlich wirksamer als diejenige des Benzols und übertrifft das Cocain noch um das 5 1/2-fache, bei etwa 55 % der Wirkung des Falicains (1-proz. Lösung). Die höheren Alkoxy-Verbindungen hiervon verhalten sich wie die entspr. Falicaine, wie wir bereits 1948 feststellen konnten, sind also sehr wirkungsvoll. Eine Ketobase aus 1-Acetoanthracen, Piperidin und Formaldehyd ist darstellbar, aber sehr schwer wasserlöslich. Die herstellbare 0,1-proz. Lösung zeigt bei schwachem Brennen fast keine Anästhesie mehr.

W. FÜRST, Jena: *Untersuchungen über die Herstellung quecksilber-organischer Verbindungen*.

Quecksilberorganische Verbindungen werden als starke Desinfektionsmittel verwendet. Es wurden u. a. die direkte Merkurierung von Benzol, Toluol und Phenol sowie die Einführung des Quecksilbers über die entspr. Sulfinsäuren und die Herstellung aus Diaryl-quecksilber-Verbindungen untersucht. Beim Phenol konnte die Bildung einer dreifach merkuriierten Verbindung beobachtet werden. Es wurden verschiedene Salze des dreifach merkuriierten Phenols hergestellt, wobei das Triscyanmerkuriphenol von Bedeutung ist, da es ein wasserlösliches Kaliumsalz bildet. [VB 269]

Deutsche Gesellschaft für Arzneipflanzen-Forschung Münster/Westf., 22. bis 25. Oktober 1959

Die wissenschaftliche Leitung der 7. Vortrags-tagung lag in Händen von Prof. Dr. E. Schratz, Münster. Im Rahmen der Eröffnungssitzung wurde Prof. Dr. Dr. med. h. c. Friedrich von Bruchhausen die Ehrenmitgliedschaft verliehen.

Aus der Forschung über Anthrachinon-Drogen

R. Hegnauer, Leiden, zeigte die Verbreitung der Anthrachinone im Pflanzenreich von den Talophyten (Schimmelpilze) bis zu dem wegen seines Anthrachinon-Gehaltes termiten-resistenten Teakholz. B. Becker, Basel, gab einen Rückblick auf die Isolierung und Konstitutionsaufklärung der Senna-Inhaltsstoffe Sennosid A (D(+)-Form) und Sennosid B (opt. inaktive Meso-Form). Bemerkenswerterweise ist es bis heute nicht gelungen, die L-Form oder das Racemate zu finden.

Nach J. W. Fairbairn und Mitarbeitern, London, enthalten die Sennesblätter ein drittes Glykosid, das als Primärglykosid eine zuckerreichere Vorstufe der Sennoside darstellt. Seine Aktivität = 1,52 (Sennosid = 1). Die Sennoside selbst sind an der Gesamtwirkung der Sennes-Schoten zu 58 %, an der der Sennes-Blätter zu 35 % verantwortlich. Das Primärglykosid ist in Schoten und Blättern in ungleicher Menge vorhanden. Neben seiner eigenen laxierenden Wirkung aktiviert es jedoch auch die Sennosid-Wirkung. Die neuesten Untersuchungen an *Cascara sagrada* zeigten, daß drei Komponenten vorliegen, die sich von Aloe-Emodin, Chrysophanol und Emodin ableiten, wobei alle sowohl als normale Glykoside als auch mit Aloinstruktur (Hydrolyse nur durch FeCl₃-Oxydation möglich) vorkommen. Nach einer Diskussionsbemerkung von H. Aulerhoff, Braunschweig, konnten insgesamt 11 verschiedene Verbindungen nachgewiesen werden.

E. Schratz, Münster, konnte zeigen, daß von 276 Herkunft von Rheum-Arten aus europäischen botanischen Gärten kaum 10 % (meist *Rheum palmat.*) bei der Nachzucht mit der angegebenen Bezeichnung übereinstimmen. Etwa 90 % aller Samenproben gaben ein Gemisch von Bastarden. Mit dem Nachweis von Rhaponticin im Verein mit der qualitativen Zusammensetzung der Anthrachinone ist eine gewisse Einteilung nach Sektionen möglich.

	Rhaponticin	Chrys.	Rheum-emodin	Aloe-emodin	Rhein
<i>R. palmat.</i>	—	+	+	+	+
88 % der übrigen Arten	+	+	+	—	—
10 % der übrigen Arten	+	+	+	+	—
2 % der übrigen Arten	+	+	+	+	+

Außer *Rheum palmat.* enthalten alle anderen untersuchten Arten Rhaponticin.

Über die Biosynthese der Anthrachinone berichtete *H. Friedrich*, Gatersleben, und erläuterte die Versuche von *Gatenbeck* 1958 an *Penicillium islandicum* Sopp. mit $\text{CH}_3\text{-}^{14}\text{COONa}$. Das von den Pilzkulturen aufgebaute radioaktive Emodin deutete auf eine fortlaufende „Kopf-Schwanz“-Kondensation des Essigsäure-Bausteins hin. *J. H. Birkinshaw*, London, nannte weitere Beispiele, welche mit dieser Acetat-Hypothese übereinstimmen. Weiterhin gab er eine Übersicht über die Chinone, welche als Stoffwechselprodukte von Mikroorganismen gebildet werden.

Die Pharmakologie der Anthrachinone wurde von *L. Schmidt*, Freiburg, *Walter Schmid*, Marburg/L., und *H. Ippen*, Düsseldorf, umrissen. Für die Dickdarmwirkung sind nur die Aglykone in der reduzierten Form verantwortlich. Sie entstehen im Dickdarm durch bakterielle und fermentative Spaltung von Anthronglykosiden und durch bakterielle Reduktion der Anthrachinone. Ein Teil der oral zugeführten Anthrachinone gelangt direkt in den Dickdarm, ein anderer Teil wird nach vorangegangener Resorption in den Dickdarm ausgeschieden. Sämtliche dickdarm-wirksamen Abführmittel wirken geringfügig auch auf den Dünnarm. Die Wirkung erfolgt durch direkten Kontakt mit dem Darm, durch geförderte Schleimproduktion, nicht jedoch reflektorisch. Eine LD 50 läßt sich mit Anthrachinonen nicht feststellen. Diejenige Dosis, die pro kg Ratte wirksam ist, ist auch für den normalen Menschen wirksam.

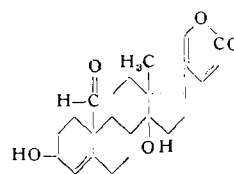
In der Diskussion wurde auf die neuesten Arbeiten über Rhabarber hingewiesen, bei denen *L. Hörhammer* und *H. Wagner*, München, ein Dirhein (Dianthron-Struktur) nachweisen konnten. Monorhein war mit Sicherheit nicht nachweisbar.

Einzelthemen

D. Gröger, Halle/S., berichtete über die Alkaloide der Steppenraute, *Pegamum harmala* L. (*Zygophyllaceae*), welche vier Harman-Alkaloide (Harmin, Harmalin und die entspr. phenolischen Basen Harmol und Harmalol) enthält. Die papierchromatographische Trennung und quantitative fluorometrische Bestimmung zeigte, daß die Wurzel und die Samen Hauptbildungsstätten der Harman-Alkaloide sind.

K. Schreiber und *G. Sembdner*, Mühlhausen, untersuchten die spezifische Wirkung einiger Solanaceen-Alkaloide auf den Kartoffelnematoden, *Heterodera rostochiensis*, welcher neben der Kartoffel auch andere Solanaceen-Vertreter befällt. Während durch sog. „Schlupfstoffe“ (γ -Lacton, Mol.-Gew. 300) das Schlüpfen der Larven und das Verlassen der Zysten durch diese gefördert wird, konnten Votr. kürzlich auch sog. „Antischlupfstoffe“ (organische Säure mit Wuchsstoffcharakter) nachweisen. Daraufhin wurden mehrere Solanaceen-Alkaloide in dieser Richtung geprüft. Nicotin 200–300 mg/l verhindert reversibel (auswaschbar) das Schlüpfen der Larven. Atropin und besonders Tropin (2,5 mg/l) wirken bereits in geringeren Konzentrationen, in höheren Konzentrationen (500 mg/l) sogar irreversibel. Die drei genannten Alkaloide wirken außerdem nematizid auf geschlüpfte Larven. Scopolamin ist unwirksam.

H. Lichti, A. von *Wartburg* und *J. Renz*, Basel, konnten aus Zwiebeln der afrikanischen *Urginea* (= *Scilla*) *altissima* (*Liliaceae*) zwei neue herzaktive Glykoside isolieren und eines davon, das Altosid, kristallin darstellen. Der Gehalt der frischen, 2 bis 3 kg schweren Zwiebeln beträgt ca. 0,001 % (bez. auf das Frischgewicht). Letale



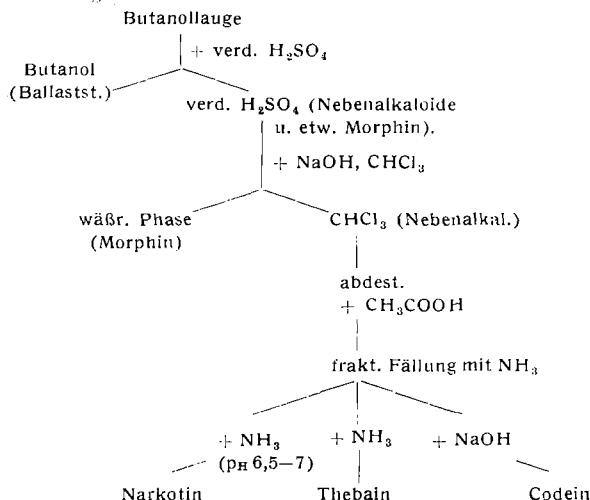
Dosis 0,007 mg/kg Katze; Summenformel $\text{C}_{30}\text{H}_{40}\text{O}_{10}$. Die Hydrolyse gelang nur mit einem Pilzenzym und führte zu dem Aglykon Scilliglaucosidin, das *Stoll* und Mitarbeiter bereits als Aglykon des Scilliglaucosids (Bufadienolid-glykosid) der weißen Meerzwiebel gefunden hatten. Die saure Hydrolyse war nur unter drastischen Bedingungen möglich und lieferte neben D-Glucose ein Anhydroaglykon. Das Altosid ist demnach ein Isomeres des Scilliglaucosids. Die schwere Hydrolysierbarkeit und die optische Drehung sprechen dafür, daß das Altosid die normale β -D-Glucopyranosid-Struktur besitzt und daß dem Scilliglaucosid α -D-Glucopyranosid- oder α -D-Glucufuranosid-Struktur zukommt.

C. H. Trubert, Karlsruhe, erläuterte technische Verbesserungen bei der Säulenchromatographie mit Cellulose-Pulver: 1. Kontinuierliches Imprägnieren von bereits eingeschlammten Cellulose-Säulen mit Formamid. 2. Verwendung von Cellophanschläuchen als Säulenmantel. 3. Abgrenzung der Säule durch Rundfilter in regelmäßigem Abstand. 4. Verwendung geschlitzter Säulen. 5. Benutzung von übereinander gesetzten, plangeschliffenen Ringen (Segmentsäulen).

Während über die diuretische Wirkung von Flavon-Reinsubstanzen verschiedene Arbeiten vorliegen, untersuchte *B. Borkowski*, Posen, erstmals die diuretische Wirkung flavon-haltiger Drogen am Hund. Am stärksten wirkten *Flores Crataegi* und

Flores Robiniae, schwach wirkten *Herba Hyperici* und *Folia Betulae*, *Folia Uvae Ursi*, *Herba Solidaginis* und *Herba Herniariae* wirkten in kleinen Dosen sogar diurese-hemmend.

W. Poethke und *E. Peckmann*, Jena, beschrieben die Gewinnung der Nebenalkaloide (Codein, Thebain, Narkotin) des Mohns bei der industriellen Morphin-Gewinnung aus Mohnkapseln. Das Morphin wird aus dem angesäuerten Mohnkapselextrakt in Gegenwart von Butanol gefällt. Letzteres enthält die Nebenalkaloide.



Während die Thebain-Ausbeute gering war, konnten aus 1 kg Butanollauge 5 g Narkotin und 10 g Codeinsulfat isoliert werden. [VB 266]

Deutsche Keramische Gesellschaft

Berlin, 4. bis 7. Oktober 1959

Aus den Vorträgen:

A. ZWETSCH, Mettlach/Saar: Über die Texturbildung in keramischen Erzeugnissen.

Über die quantitative Erfassung der Textur in keramischen Erzeugnissen ist wenig bekannt, obwohl die Textur sich z. B. bei den Erzeugnissen der Ziegelindustrie stark auf die Qualität der Fertigerzeugnisse auswirkt. Votr. zeigte, daß die dilatometrische Meßmethode in der Lage ist, die Texturverhältnisse sowohl in Massen, wie an einem aus einer Vakuumpresse gezogenen Strang, als auch in Fertigerzeugnissen zahlenmäßig zu erfassen.

Texturen wurden festgestellt und beschrieben bei einer freigeordneten Vase, gegossenen Sanitärstücken aus Steingut, Sanitärporzellan, Feuerton, gegossenen Laboratoriumsplättchen aus Steingut und Sanitärporzellan sowie einer gepreßten Steingut-Wandfliese. Stets können die Rissebilder der Erzeugnisse (Glasurrisse, Spannrisse) in Beziehung zu den Texturercheinungen gebracht werden. Das Dünnschliffbild vermag ergänzend Orientierungen im Scherben aufzuzeigen.

W. MANN, Bonn-Beuel/Rhein: Einfluß von organischen Verbindungen auf keramische Massen.

Die bislang bekannt gewordenen Methoden zur Herstellung von keramischen porösen Waren werden eingeteilt in: Ausbrennverfahren, Lösungsverfahren, Sublimationsverfahren, Verdampfungsverfahren, Quellungsverfahren und Schaumverfahren. Eine kritische Betrachtung zeigt, daß die klassische Ausbrennmethode und das moderne Schaumverfahren derzeit die zweckmäßigsten Arbeitsmethoden darstellen.

Deshalb wurde mit Hilfe des zuverlässigsten Ausbrennstoffes, des Petrolkokes, der in steigender Menge in eine keramische Masse eingeführt wurde, versucht, gewisse Richtwerte wie Porosität, Raumgewicht und Bruchfestigkeit als Vergleichswerte zu ermitteln. Dann wurde eine Reihe von organischen Verbindungen wie Fettalkohole, Fettalkoholsulfonate, Alkylsulfonate, Alkylarylsulfonate, äthoxylierte Fettalkohole, Fettsäurealkylolamide, Sorbitan-Produkte, Fettsäurealkylolamide und Gallenprodukte in keramischen Schlicker eingeführt. Nach Zugabe von 1 % der organischen Verbindungen (bezogen auf trockene Masse) wurden sie schaumig geschlagen, in Formen gegossen und nach dem Trocknen bei SK 11 gebrannt. Dabei stellte sich heraus, daß das Bemessen des Anmachewassers gewisse Schwierigkeiten bereitet, da einige Stoffe verflüssigend, andere ansteifend wirken. Auch hier wurden dieselben Werte bestimmt wie bei den Massen, die nach dem Ausbrennverfahren hergestellt wurden und zum Vergleich Tabellen, Kurven und photographische Aufnahmen der Anschliffe mitgeteilt.