

Stimulierung der RNS-Polymerase in Rattenleberkernen durch Cortisol in vitro

Von Dr. I. Lukacs und Doz. Dr. C. E. Sekeris

Physiologisch-Chemisches Institut, Universität Marburg

Die Stimulierung der RNS-Polymerase im Zellkern durch Hormone *in vivo* ist bekannt^[1]. Wir haben nun gefunden, daß Cortisol auch *in vitro* die RNS-Polymerase in Zellkernen stimuliert; der Effekt tritt schon nach wenigen Minuten ein. Isolierte, gereinigte Leberzellerne wurden mit Cortisol 1–15 min bei 37 °C inkubiert. Anschließend wurde daraus die DNS-abhängige RNS-Polymerase als Weiss-scher Komplex^[2] isoliert. Die Aktivität der RNS-Polymerase wurde in einem System^[1c] gemessen, das *in vitro* RNS synthetisiert. Das System bestand aus je 0,25 µMol ATP, GTP und CTP; 0,1 µCi ¹⁴C-UTP (spez. Akt. 145 mCi/mMol); 2,5 µMol Kreatinphosphat; 5 µg Kreatin-Phosphokinase; 3 µMol Mercaptoäthanol; 2 µMol MnSO₄ und 12 µMol Tris(hydroxymethyl)-aminomethan; Endvolumen: 0,15 ml; pH = 7,9. Das Enzym-Präparat wurde in Mengen von 50–100 µg DNS zugegeben. Inkubationszeit: 4 min.

	µMol ¹⁴ C-UTP eingebaut in RNS/(mg DNS·min)	
Kontrolle	89,7 ± 7	
Kerne inkubiert mit 20 γ Cortisol/ml, 1 min.	112 ± 10	(p < 0,01) [a]
Kontrolle	136,9 ± 9	
Kerne inkubiert mit 20 γ Cortisol/ml, 5 min	214 ± 26	(p < 0,02)
Kontrolle	67,5 ± 13	
Kerne inkubiert mit 20 γ Cortisol/ml, 10 min	93 ± 8,9	(p < 0,05)
Kerne inkubiert mit 20 γ Pregnandiol/ml, 10 min	69,3 ± 12	

[a] p-Werte nach *Fishers t*-Test basieren auf 4–6 Einzelbestimmungen. Zum t-Test siehe R. A. Fisher u. F. Yates: Statistical Tables for Biological Agriculture and Medical Research. Edinburgh 1949.

Die rasche Steigerung der Enzymaktivität (innerhalb weniger Minuten) erklären wir uns dadurch, daß das Cortisol die Matrizenaktivität der DNS steigert, möglicherweise im Sinne einer Derepression nach Jacob und Monod^[3].

Eingegangen am 31. Mai 1966 [Z 253]

[1] a) J. D. Weill, S. Busch, P. Chambon u. P. Mandel, Biochem. biophys. Res. Commun. 10, 122 (1963); b) C. C. Widnell u. J. R. Tata, Biochem. J. 98, 621 (1966); c) N. Lang u. C. E. Sekeris, Life Sciences 3, 391 (1964).

[2] S. B. Weiss, Proc. nat. Acad. Sci. USA 46, 1020 (1960).

[3] F. Jacob u. J. Monod, J. molecular Biol. 3, 318 (1961).



(1a), R: C₂H₅—; Fp = 65 °C; 5% (2a), R: C₂H₅—; Fp = 118 °C; 10%
(1b), R: n-C₄H₉—; Fp = 71 °C; (2b), R: n-C₄H₉—; Fp = 121 °C; 14% 2%

Alle Verbindungen sind farblose, an der Luft beständige Körper. Die 1,4-Diaza-2,5-diboracyclohexan-Derivate (1a) und (1b)^[1] sind in unpolaren Lösungsmitteln gut, in polaren schwer löslich; die 1,4-Diaza-2-boracyclopentan-Derivate (2a) und (2b) zeigen das entgegengesetzte Verhalten.

Die Struktur von (1b) ergibt sich aus dem Abbau mit Chromyltrichloracetat^[2] zu Di-n-butylketon (52%), Ammoniak (12%) und etwas n-Butanol sowie aus den Spektren: ¹¹B-NMR [in CHCl₃, äußerer Standard: BF₃·(C₂H₅)₂O]: -44 ± 2 ppm^[3]; ¹H-NMR (in CCl₄, innerer Standard: Tetramethylsilan): 6,4 τ (2 NH).

Die Verbindung (2a) löst sich in wässriger Säure unter Abspaltung von 1 Mol HCN. Nach quantitativer Fällung der HCN als AgCN wurde mit alkalischem Wasserstoffperoxid oxidiert und Diäthylketon (47%), Äthanol (32%) sowie Ammoniak (45%) erhalten. Oxidation mit Luft ergab etwas Äthylborsäure. — Die Struktur von (2a) ist auch durch die Spektren gesichert: ¹¹B-NMR [in CH₃OH, äußerer Standard: BF₃·(C₂H₅)₂O]: 6,5 ppm; ¹H-NMR (in CD₃COCD₃, Tetramethylsilan als innerer Standard): Multiplett bei 2,1 bis 2,5 τ (1 NH und 1 CH); 2,6–3,0 τ (1 NH); Multiplett bei 9,4–10,0 τ (B—CH₂—CH₃); IR (in KBr) 3410 und 3300 cm⁻¹, sst (v_{NH}); 2180 cm⁻¹, m (v_{C≡N}); 1618 cm⁻¹, sst (v_{C=N})^[4]; das Molekulargewicht wurde massenspektrometrisch bestätigt, das Hauptfragment hatte die Masse 152 = Molmasse (179) – HCN (27)^[5].

Eingegangen am 2. Juni 1966 [Z 255]

[1] Am Stickstoff substituierte Derivate von (1) erhält man aus Alkylboranen und Isonitrilen: G. Hesse u. H. Witte, Angew. Chem. 75, 791 (1963); Angew. Chem. internat. Edit. 2, 617 (1963); J. Casanova jr., H. R. Kiefer, D. Kuwada u. A. H. Boulton, Tetrahedron Letters 1965, 703.

[*] Auszug aus der Dissertation, Universität Erlangen-Nürnberg 1966.

[2] H. Schildknecht u. W. Föttinger, Liebigs Ann. Chem. 659, 20 (1962).

[3] Für Aufnahme und Deutung der ¹¹B-NMR-Spektren danken wir Prof. H. Nöth und Dipl.-Chem. H. Vahrenkamp, München.

[4] sst = sehr stark; m = mittel.

[5] Dr. D. Henneberg und Dr. P. Binger, Mülheim/Ruhr, danken wir für die Aufnahme des Massenspektrums.

Synthese von Derivaten des 1,4-Diaza-2,5-diboracyclohexans und 1,4-Diaza-2-boracyclopentans durch Umsetzung von Blausäure mit Alkylboranen

Von Prof. Dr. G. Hesse, Dr. H. Witte und
Dipl.-Chem. H. Haußleiter^[*]

Institut für organische Chemie,
Universität Erlangen-Nürnberg

Beim Einleiten von Blausäure in Triäthyl- oder Tri-n-butylboran (Molverhältnis 6:1) bei Raumtemperatur erhält man ein farbloses Öl, das sich im Hochvakuum teilweise destillieren läßt. Aus der tiefer siedenden Fraktion [90–100 °C/0,01 Torr bei (1a), 120–135 °C/0,01 Torr bei (1b)] kristallisiert die Verbindung (1), aus der höher siedenden Fraktion [85–100 °C/10⁻³ Torr bei (2a), 160–180 °C/10⁻³ Torr bei (2b)] nach Anreichen mit Benzol/Chloroform die Verbindung (2).

Von Dr. G. Ottmann und H. Hooks jr.

Olin Mathieson Chemical Corporation, Chemical Division,
New Haven, Connecticut (USA)

Wir fanden, daß die exotherme Reaktion von Dithiophosphorsäure-O,O'-diäthylester (1) mit aliphatischen oder aromatischen Mono- oder Diisocyanaten nur dann ausschließlich zu den N-Alkyl- bzw. N-Arylderivaten^[1] (2) von S-Carbamoyl-dithiophosphorsäure-O,O'-diäthylester führt, wenn die Temperatur unter 40 °C gehalten wird. Bei höheren Temperaturen zerfallen die Verbindungen (2) in Isothiocyanate und in ein Gemisch aus schwefelhaltigen Polyphosphorsäuren, Thiophosphorsäure-O,O',O''-triäthylester, Phosphorsäuretri-