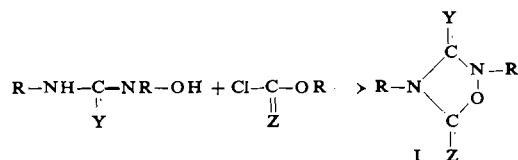


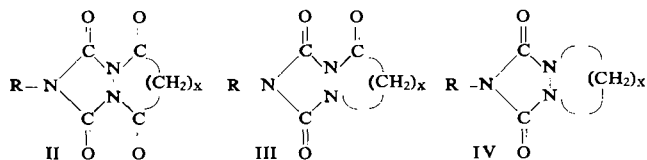
## Cyclische Hydroxylamin- und Hydrazin-Verbindungen

G. Zinner, Marburg/Lahn

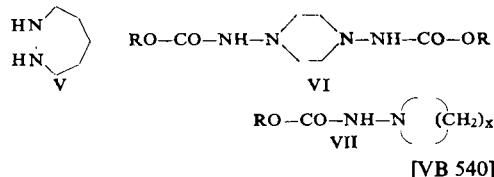
Durch Umsetzung von Hydroxyl(thio)harnstoffen mit Chlor(thio)ameisensäure-estern wurden erstmals 3.5-Dioxo-, 3-Oxo-5-thiono-, 3-Thiono-5-oxo- und 3.5-Dithiono-1.2.4-oxadiazolidine (I: Y, Z = O,S) erhalten, die sich im IR-Spektrum durch besonders kurzwellige Lage der „Urethan“- und Harnstoff-Carbonyl-Bande auszeichnen (5,50 bzw. 5,72  $\mu$ ).



Mit W. Deucker wurden von den entspr. Hydrazin-Derivaten die 3.5-Dioxo-1.2.4-triazolidine („Urazole“) am Hydrazin-Stickstoff cyclisch acyliert (II: x = 1,2), alkacyliert (III: x = 3) und alkyliert (IV: x = 3, 4, 5).



Durch cyclische Alkylierung von Bis-alkoxycarbonylhydrazinen und anschließende Hydrolyse wurde erstmals „Homopiperidazin“ (1.2-Diaza-cycloheptan, V) erhalten Kp<sub>17</sub> 59 °C, Dibenzoyl-Verb. Fp 157,5 °C, Bis-anilinoformyl-Verb. Fp 254–255 °C). (Mono-)Alkoxycarbonylhydrazine wurden am nicht acylierten Stickstoff cyclisch alkyliert zum Piperazin-(VI), Pyrrolidin-(VII: x=4), Piperidin-(VII: x=5) und Hexahydroazepin-Derivat (VII: x=6).



## Deutscher Therapiekongreß und Heilmittelausstellung

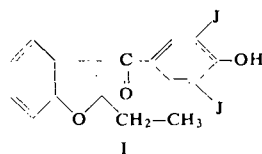
Karlsruhe, 27. August bis 2. September 1961

Die Themen der 13. Therapiewoche behandelten u. a. die Psychotherapie im höheren Lebensalter, die Therapie der Erkrankungen von Leber und Galle, von Herz und Kreislauf, die Bedeutung der Fokaltumoren, die aktive Schutzimpfung, Probleme der Sozialmedizin, der Arbeitsmedizin (Berufskrankheiten), der physikalischen Therapie und der Verkehrssicherheit.

In das Programm waren Fortbildungsvorlesungen über das gesamte Gebiet der klinischen Chemie und Diagnostik sowie über die Physik und ihre Nutzenanwendung in Diagnostik und Therapie aufgenommen worden. Man konnte als Ergänzung ein klinisch-chemisches Laboratoriumspraktikum belegen.

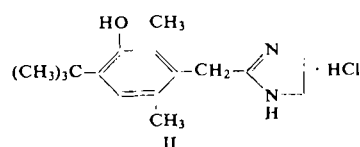
Etwa 230 pharmazeutische Firmen beteiligten sich an der Heilmittelausstellung. Hier sollen nur einige neue Naturstoffe sowie besonders interessante synthetische Verbindungen behandelt werden. Die Fülle der Kombinationspräparate, so wertvoll sie für die Therapie sein mögen, bleibt unberücksichtigt.

Störungen in der Blutversorgung des Herzmuskels, die Koronarerkrankungen, gehören zu den häufigsten Todesursachen unserer Zeit. Die Woelm-Labaz GmbH. entwickelten Amplivix®, 2-Äthyl-3-(3',5'-dijod-4'-hydroxy-benzoyl)-benzofuran (I)



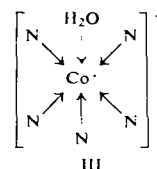
Wie zahlreiche pharmakologische und klinische Tests zeigen, erweitert die Substanz selektiv die Koronargefäße und steigert dadurch die Sauerstoff-Zufuhr zum Herzmuskel. Als besonderer Vorteil wird die gegenüber den Nitriten langanhaltende Wirkung hervorgehoben.

Zur Abschwellung der entzündeten Schleimhäute von Nase und Nasennebenhöhlen sowie zur lokalen Behandlung der Bindehautentzündung empfiehlt E. Merck Nasivin, 2-(4'-tert.-Butyl-2',6'-dimethyl-3'-hydroxybenzyl)-imidazoliniumhydrochlorid (II).



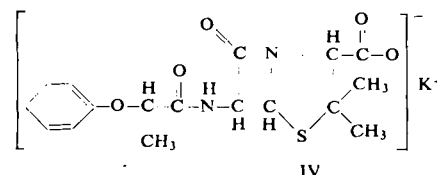
Die fast weißen Kristalle schmelzen bei 300 °C und sind in Wasser und Alkohol gut löslich. Das stark vasokonstriktorisch wirkende Präparat ruft keine unerwünschten Nebenerscheinungen hervor.

Die langjährige Suche nach einer vollaktiven, physiologischen Depotform des Vitamin B<sub>12</sub> schloß E. Merck jetzt mit der Einführung von Aquo-Cytobion® ab. Es handelt sich um das in der Literatur als Vitamin B<sub>12a</sub> bzw. B<sub>12b</sub> bezeichnete Aquocobalaminacetat (III), das intravenös oder intra-



muskulär injiziert wird. Das bisher therapeutisch verwendete neutrale Cyanocobalamin hat den Nachteil, aus dem Körper wieder relativ rasch ausgeschieden zu werden. Die Depotwirkung des neuen Präparats soll auf einer stärkeren Bindung an die negativ geladenen Serum- und Gewebsproteine beruhen, was eine verzögerte Ausscheidung zur Folge hat.

Unter der Bezeichnung „Pen-200“ bringt die Pfizer GmbH. jetzt in Deutschland ein synthetisch verändertes Penicillin auf den Markt, dessen besonderer Vorteil in der oralen Anwendbarkeit liegt. IV wird durch N-Acylierung von 6-



Amino-Penicillansäure mit Phenoxypionsäure dargestellt und ist praktisch untoxisch. Therapeutisch verwendet wird das Kaliumsalz in Form von Tabletten. Gute Wasserlöslichkeit und hohe Stabilität gegen Säure gewährleisten die Resorption im Darmtrakt. Das Wirkungsspektrum entspricht dem der älteren Penicilline.

Ein neues Medikament von Pfizer GmbH. für die Augenheilkunde ist Yxin®, das als Wirkstoff 2-(1.2.3.4-tetrahydro-1-naphthyl)-imidazolinhydrochlorid (V) in 5-proz.