

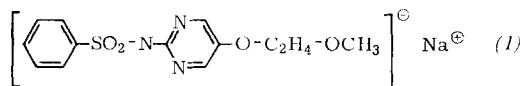
Therapiewoche und Heilmittelausstellung

in Karlsruhe vom 30. August bis 5. September 1964

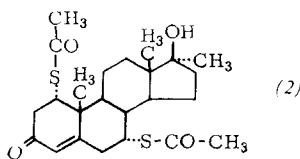
Die Vorträge der 16. Deutschen Therapiewoche befaßten sich u. a. mit der Therapie der Leber- und Gallenwegserkrankungen, der Praxis der Schilddrüsenerkrankungen, der Anwendung von Organpräparaten, der Behandlung von Herz- und Kreislaufkrankheiten, der Therapie und Prophylaxe thromboembolischer Erkrankungen sowie mit der physikalischen Therapie in der Kurbehandlung. – Ein mehr-tägiges Elektrolyt-Seminar behandelte die Störungen des Wasser-Elektrolyt-Haushaltes als Störfaktoren der Therapie.

Die Heilmittelausstellung wurde von rund 250 Firmen besucht. Von den zahlreichen neu eingeführten Präparaten werden im folgenden einige derjenigen aufgeführt, die bisher unbekannte chemische Verbindungen enthalten oder neuere Substanzen, die zum ersten Mal in Deutschland auf dem Markt kommen.

Ein neues orales Antidiabeticum, Redul®, wurde gemeinsam von den Farbenfabriken Bayer und der Schering AG. entwickelt. Dieses Präparat gehört nicht zur Gruppe der Sulfonylharnstoffe, sondern ist ein Vertreter einer für die Diabetes-Therapie neu erschlossenen Stoffklasse, der Sulfapyrimidin-Abkömmlinge. Redul enthält das Natriumsalz des 2-Benzol-sulfonamido-5-methoxyäthoxypyrimidins (1) (chem. Kurzbezeichnung: Glycodiazin), eine in Wasser und Methanol leicht lösliche Substanz, $M = 331$, $Fp = 221\text{--}226^\circ\text{C}$. Redul bewirkt durch Stimulierung der β -Zellen der Langerhansschen Inseln eine Steigerung der physiologischen Insulin-Inkretion und führt zu einer zuverlässigen Blutzuckersenkung; es wird besonders rasch und vollständig im Organismus abgebaut, wobei es in der ersten Abbaustufe seine volle blutzucker-senkende Wirkung behält.

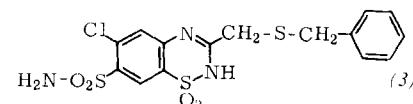


Ein gut verträgliches, oral wirksames Hormonpräparat zur Förderung des Eiweißaufbaus ist das Emdabol®, das von der E. Merck AG., Darmstadt, herausgebracht wurde. Dieses Anabolicum besteht aus $1\alpha,7\alpha$ -Diacetylthio- 17β -hydroxy- 17α -methyl-4-androsten-3-on (2), einer neu entwickelten Substanz, $F_p = 205-206^\circ C$, $[\alpha]_D = -66^\circ$ (Dioxan), die doppelt so stark anabol wirksam ist wie 17α -Methyltestosteron, einen besonders günstigen anabol/androgenen Index besitzen und keine gestagenen oder mineralocorticoiden Nebenwirkungen zeigen soll. Emdabol ist bei allen konsumierenden Erkrankungen, kachektischen Zuständen usw. indiziert.

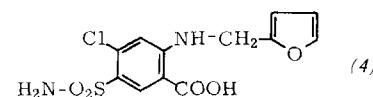


Neue Saluretica wurden von mehreren Firmen eingeführt: Das Exosalt® der Farbenfabriken Bayer ist ein neues Präparat aus der Gruppe der Benzothiadiazine und besteht aus 3-Benzylthiomethyl-6-chlor-7-sulfamyl-1,2,4-benzothiadiazin-1,1-dioxyd (3) (chem. Kurzbezeichnung: Benzthiazid), einer weißen kristallinen Substanz, $F_p = 238-239^{\circ}\text{C}$, $M = 432$. Es bewirkt eine hohe Ausscheidung von Natrium- und Chlor-Ionen in äquivalenten Mengen und zeichnet sich durch be-

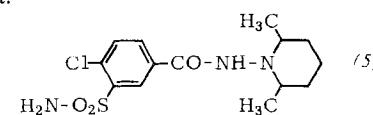
reits zwei Stunden nach der Einnahme einsetzende Diurese aus. Im Tierexperiment weist Exosalt etwa die zehnfache Wirkung des Chlorothiazids auf.



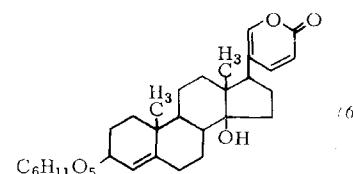
Das von den Farbwerken Hoechst entwickelte Lasix® ist zwar ebenfalls ein Sulfonamid-Derivat, weicht jedoch in seiner Struktur von den häufig verwendeten Benzothiadiazinen ab. Es besteht aus 4-Chlor-N-(2-furylmethyl)-5-sulfamyl-anthransäure (4) (chem. Kurzbezeichnung: Fursemid). Lasix führt auch in solchen Fällen, bei denen anders keine diuretische Wirkung zu erzielen ist, zu einer vermehrten Wasser- und Natrium-Ausscheidung; man nimmt daher an, daß sich (4) in seinem Wirkungsmechanismus von den bisher gebräuchlichen Diuretica unterscheidet.



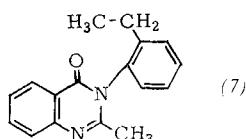
Auch das Brinaldix® der Sandoz AG, Nürnberg, ist ein neues Sulfonamid-Diureticum. Es gehört chemisch zu den 3-Sulfamyl-4-chlorbenzoësäure-Derivaten und besteht aus N-(cis-2,6-Dimethyl-1-piperidy)-3-sulfamyl-4-chlor-benzoësäureamid (5), einer festen Substanz vom $F_p = 244-45^\circ C$. Brinaldix zeichnet sich durch zuverlässige und rasche Natrium- und Chlorionen-Ausscheidung sowie insbesondere durch große therapeutische Breite aus. Im Tierversuch werden selbst bei 100 000-fach erhöhter Dosis keine toxischen Symptome beobachtet.



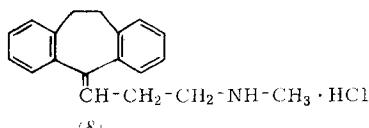
Ein schon länger bekanntes Glykosid aus *Scilla maritima* var. *alba*, Proscillarin, hat neuerdings nach klinischer Prüfung Eingang in die Praxis gefunden und wird als Talusin® von der Knoll AG., Ludwigshafen, und als Caradrin® von den Asta-Werken, Brackwede, auf den Markt gebracht. Proscillarin, 3β -Rhamnosido- 14β -hydroxy- $\Delta 4,20,22$ -bufatrienolid (6), Fp = 219–222 °C, $[\alpha]_D^{20} = -92^\circ$ (Methanol), wirkt ebenso rasch wie Strophanthin, kann jedoch oral gegeben werden. Dank fehlender Kumulation und wegen seiner großen therapeutischen Breite ist das Präparat gut dosierbar.



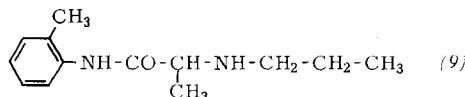
Ein neues Tagessedativum und mildes Einschlafmittel ist das Aolan®, das von der P. Beierdorf & Co. AG., Hamburg, eingeführt wurde und zur Normalisierung gestörter Funktionen des überreizten zentralen und vegetativen Nervensystems empfohlen wird. Es besteht aus 2-Methyl-3-(o-äthyl-phenyl)-4-chinazolon (7) (chem. Kurzbezeichnung: Äthinazon).



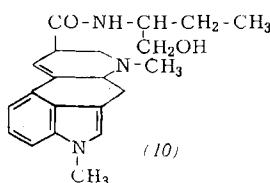
Zur Behandlung von Depressionen, psychosomatischen Störungen usw. eignet sich ein neues Psychopharmakon, das als Nortriptilin® von den Troponwerken, Köln-Mülheim, und als Acetexa® von der Eli Lilly GmbH., Gießen, eingeführt wurde. Es besteht aus 5-(3-Methylaminopropylidene)-dibenzo-[a,d][1,4]cycloheptadien-hydrochlorid (8) (chem. Kurzbezeichnung: Nortriptylin), einer weißen pulverigen, in Wasser, Chloroform und Alkohol löslichen, in anderen organischen Lösungsmitteln unlöslichen Substanz, $F_p = 216\text{--}219^\circ\text{C}$, $M = 299,86$. Nortriptylin unterscheidet sich von dem schon länger bekannten Amitriptylin nur durch das Fehlen einer Methylgruppe.



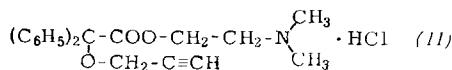
Unter der Bezeichnung Xylonest® wurde ein neues Lokalanästhetikum von der Pharma-Stern AG., Wedel/Holstein, in den Handel gebracht, das bereits im Ausland erprobt wurde und dort als Citanest auf dem Markt ist. Xylonest weist eine enge Verwandtschaft zum Xylocain auf. Xylonest besteht aus dem racemischen Gemisch des α -Propylamino-2-methylpropionanilids (9), einer in Wasser nur wenig, in Alkohol, Äther und Aceton gut löslichen Base, die als wasserlösliches Hydrochlorid, $M = 256,8$, $F_p = 167\text{--}168^\circ\text{C}$, angewendet wird. Xylonest soll ebenso gute anaesthetische Wirkung wie Xylocain haben und bei Leitungsanaesthesien länger wirken.



Ein Mittel zur Migräne-Prophylaxe ist das Deseril®, das von der Sandoz AG., Nürnberg, eingeführt wurde. Es enthält als wirksame Substanz das 1-Methyl-D-lysergsäure-(+)-2'-butan-1'-olamid (10) (chem. Kurzbezeichnung: Methysergid), das sich als bisher stärkster Serotonin-Antagonist erwiesen hat. Deseril liegt in den sogenannten Retard-Tabletten als Bimaleinat vor. Deseril eignet sich zur Behandlung von Krankheiten, an deren Entstehung Serotonin beteiligt ist, kann also bei Migräne-Kopfschmerzen, Allergien und Carcinoid-Syndrom angewendet werden.

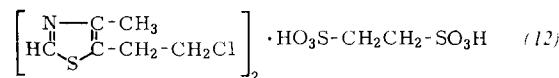


Ventrinerval®, ein Magentherapeuticum der Rhein-Pharma GmbH., Heidelberg, enthält neben Aluminiumglycinat einen neuen spasmolytisch wirksamen Benzilsäureester, den α,α -Diphenyl- α -propargoxy-essigsäure-(β -dimethylaminoäthyl)-ester in Form des Hydrochlorids (11), eine weiße kristalline Substanz, $M = 373,89$, $F_p = 162\text{--}163^\circ\text{C}$. (11) bewirkt neben neurotroper und muskulotroper Spasmolyse, zentrale Analgesie, Schleimhautanaesthesia, Sekretionshemmung und Motilitätsdämpfung.

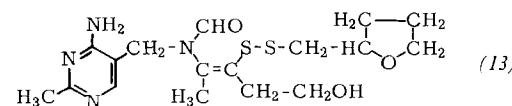


Als Antikonvulsivum, Hypnoticum und Sedativum eignet sich ein schon länger im Ausland als Hemineurin bekanntes

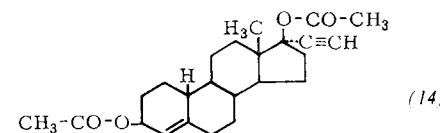
Präparat, das nun in Deutschland unter der Bezeichnung Distraneurin® von der Pharma-Stern AG., Wedel/Holstein, in den Handel gebracht wird. Es besteht aus dem Thiazol-Bestandteil des Thiamins (Vitamin B₁), in dem die Hydroxylgruppe durch ein Chloratom ersetzt ist. Das 4-Methyl-5-(β -chloräthyl)-thiazol wird als Salz (12) der Äthandisulfonsäure, einer kristallinen, relativ beständigen, in Wasser gut löslichen Substanz angewendet. Als zuverlässiges Beruhigungsmittel ist Distraneurin insbesondere bei psychomotorischen Erregungszuständen nach akuter Alkohol-Intoxikation, nach plötzlichem Alkoholentzug bei Delirium tremens, bei cerebralsklerotisch bedingten Verwirrtheitszuständen usw. geeignet.



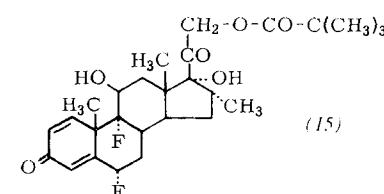
Ein weiteres interessantes Derivat des Thiamins (Vitamin B₁) wurde von der Takeda Chemical Industries Ltd., Osaka/Japan, entwickelt und wird von der Fa. M. Woelm, Eschwege, unter der Bezeichnung Judolor® eingeführt. Es besteht aus dem ringoffenen Thiamin-tetrahydrofuryl-disulfid, TTFD, (13), das beim Suchen nach einer besser resorbierbaren Form des Thiamins entdeckt wurde. Während Vitamin B₁ auch bei größten Dosen nur zu maximal 5 mg vom Organismus aufgenommen wird, ist das im Judolor vorliegende Präparat oral voll wirksam. Es gelingt daher auf oralem Wege, die Gewebe-Konzentration der stoffwechselaktiven Cocarboxylase um etwa 100 % zu steigern. Judolor besitzt analgetische, antiphlogistische und spasmolytische Wirkung und wird zur Behandlung von Neuralgien, Neuritiden, Myalgien, Rheumatismus, Myocardschäden und Hepatopathien empfohlen.



Ovulen®, ein neues Konzeptionsverhütungsmittel, enthält neben Mestranol als östrogene Komponente eine neue von Searle, USA, entwickelte und zusammen mit der C. F. Boehringer GmbH., Mannheim, in der Praxis geprüfte, gestagene Wirksubstanz, das 17 α -Äthiny-4-oestren-3 β ,17 β -diol-diacetat (14) (chem. Kurzbezeichnung: Ethynodiolidacetat), eine weiße und geruchlose kristalline Verbindung, die in Wasser unlöslich, in Öl jedoch löslich ist. (14) erwies sich als eines der wirksamsten und am besten verträglichen Gestagene und gewährleistet mit einer Dosis von nur 1 mg eine sichere Konzeptionsverhütung.



Ein neues Spezialcorticoid für die Haut ist das Locacorten® der Ciba AG., Wehr/Baden, das als wirksame Substanz das neu entwickelte Flumethason, 6 α ,9 α -Difluor-11 β ,17 α -dihydroxy-16 α -methyl-21-trimethylacetoxyl-1,4-pregnadien-3,20-dion (15) (als Pivalat) enthält. Dieses soll bei entzünd-



lichen Dermatosen, insbesondere Ekzemen, eine rasch einsetzende entzündungshemmende, antiallergische, antiexsudative und antipruriginöse Wirkung entfalten. [VB 872]