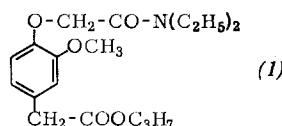


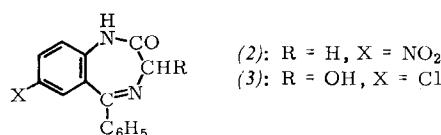
Therapiewoche und Heilmittelausstellung

Die Siebzehnte Deutsche Therapiewoche, in Karlsruhe vom 29. August bis 4. September 1965, wurde von rund 6000 in- und ausländischen Teilnehmern besucht. Von den neuen Therapeutika werden einige derjenigen besprochen, die neue Verbindungen oder Wirkstoffe enthalten, die zum ersten Mal in Deutschland auf den Markt kommen.

Epontol®[®], ein intravenös zu applizierendes Kurznarkotikum, wurde von den Farbenfabriken Bayer eingeführt. Wirkstoff des Präparats ist der 3-Methoxy-4-(N,N-diäthylcarbamoylmethoxy)-phenylessigsäure-n-propylester (1) (chemische Kurzbezeichnung: Propanidid), ein in Wasser unlösliches, farbloses bis schwach gelbliches Öl. Epontol zeichnet sich durch schnelles Eintreten und besonders rasches Abklingen der narkotischen Wirkung aus. Schon 20 bis 30 Minuten nach einer Epontol-Narkose, die etwa 3 bis 4 Minuten dauert, können die Patienten aus der klinischen Aufsicht entlassen werden.



Mit dem Mogadan® von Hoffmann-La Roche kam ein neues Schlafmittel auf den Markt, das in Struktur und Eigenschaften den Tranquilitern Librium und Valium nahesteht und sich besonders zur Behebung von Schlafstörungen, die durch Reizbarkeit, Überbeanspruchung, Angst usw. verursacht werden, eignet. Wirksubstanz ist das 2,3-Dihydro-7-nitro-5-phenyl-1H-benzo-1,4-diazepin-2-on (2).

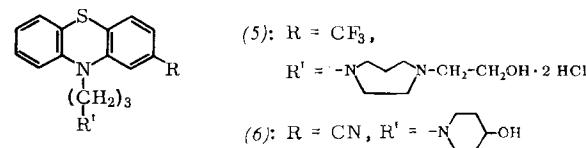


Ein Psychopharmakon, das sich strukturell ebenfalls eng an die Präparate Librium und Valium anschließt, ist das Praxiten®, das von den Wyeth Laboratories in den USA entwickelt und von der Wyeth-Pharma GmbH., Münster, herausgebracht wurde. Es besteht aus 7-Chlor-2,3-dihydro-3-hydroxy-5-phenyl-1H-benzo-1,4-diazepin-2-on (3) (chem. Kurzbezeichnung: Oxazepam), einer weißen, kristallinen, in Wasser wenig löslichen Substanz. Praxiten, das in den USA unter der Bezeichnung „Serax“ in den Handel kommt, eignet sich zur Behebung von Angst- und Spannungszuständen, von Agitiertheit, Reizbarkeit und Schlaflosigkeit.

Zu einer neueren Gruppe psychotrop wirkender Pharmaka, den Dibenzodiazepinen, gehört das Noveril®, das von der Dr. A. Wander GmbH., Frankfurt/M., vorgestellt wurde. Dieses ist als ein intensiv wirkendes Breitband-Antidepressivum zu bezeichnen, dessen Wirkungsschwerpunkt bei endogen bestimmten Depressionen liegt. Noveril enthält das 5-Methyl-10-(β-N,N-dimethylaminoäthyl)-10,11-dihydro-(1H)-dibenzo-[1,4]-diazepin-11-on-hydrochlorid (4), eine gut wasserlösliche Verbindung.

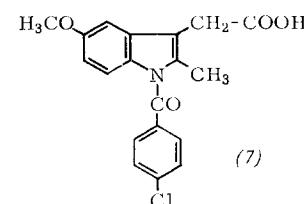


Außerdem wurden zwei weitere neue Psychopharmaka aus der Gruppe der Phenothiazine eingeführt. Das Psychosedativum Pasaden® vom Chemiewerk Homburg enthält das 10-[γ-(4-(β-Hydroxyäthyl)-hexahydro-1,4-diazepin-1-yl)-propyl]-2-trifluormethylphenothiazin-dihydrochlorid (5), ein weißes, kristallines Pulver (Fp = 210 °C). Es eignet sich zur Behandlung neurovegetativer Regulationsstörungen, wie vegetative Dystonie, Neurasthenie, Nervosität, Unruhe usw.

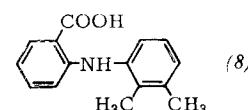


Das Neuroleptikum Aolept® der Farbenfabriken Bayer besteht aus 2-Cyan-10-[γ-(4-hydroxypiperidino)-propyl]-phenothiazin (6) (chem. Kurzbezeichnung: Propericazin) und eignet sich besonders zur Dauertherapie aller Psychosen des schizophrenen Formenkreises.

Ein neues Antirheumatisches, das bereits seit einigen Monaten in den USA unter der Bezeichnung „Indocin“ eingeführt ist, kam mit dem Amuno® der Sharp & Dohme GmbH., München, einer Tochtergesellschaft der Merck & Co., Inc., Rahway, USA, in den Handel. Es enthält die antiphlogistisch, analgetisch und antipyretisch wirkende 1-(p-Chlorbenzoyl)-5-methoxy-2-methylindol-3-essigsäure (7) (chem. Kurzbezeichnung: Indometacin), die keiner der bisher bekannten Antiphlogistika-Gruppen angehört. Indometacin ist ein gelblichweißes Pulver (Fp = 156–160 °C), das sich in Alkohol, Aceton, Äthylendichlorid und Acetonitril löst, aber unlöslich in Wasser und Kohlenwasserstoffen ist.

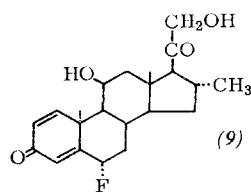


Ein Analgetikum mit antiphlogistischen Eigenschaften, das ebenfalls einer neuen Gruppe von Analgetika, den N-Phenyl-anthraniolsäure-Derivaten, angehört, liegt im Parkemed von Parke Davis & Co., München, vor. Wirksubstanz ist die N-(2,3-Xylyl)-anthraniolsäure (8) (chem. Kurzbezeichnung: Mefenaminsäure), eine pulvrige Substanz, deren Löslichkeit in Wasser stark vom pH-Wert abhängt. Das Präparat kommt in den USA unter der Bezeichnung „Ponstan“ in den Handel.



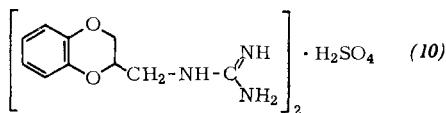
Ein neues Corticoid, das 6α-Fluor-11β,21-dihydroxy-16α-methyl-Δ^{1,4}-pregnadien-3,20-dion (9) (chem. Kurzbezeichnung: Fluocortolon) ist in der Ultralan®-Salbe enthalten, die von der Schering AG., Berlin, herausgebracht wurde und die sich zur Behandlung entzündlicher und allergischer Hauterkrankungen eignet. Während die bisher bekannten entzünd-

dungshemmenden Steroide den Gruppen der Hydrocortisone und 21-Desoxyhydrocortisone" angehören, ist das Fluocortolon ein Derivat des Corticosterons.

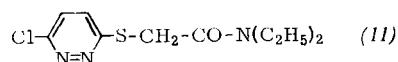


Bemerkenswert war, daß von fünf Firmen analgetisch und antiphlogistisch wirkende Präparate mit Dimethylsulfoxid herausgebracht oder angekündigt wurden (Dolicur von der Schering AG., Berlin; DMS-70 und DMS-90 von der Sharp & Dohme GmbH, München; Hyadur von der Chemie Grünenthal, Stolberg; Infiltrina von der Chemischen Fabrik von Heyden AG., München; Somipront von H. Mack Nachf., Illertissen). Die schmerzlindernde und entzündungshemmende Wirkung des Dimethylsulfoxids war erst vor wenigen Monaten beobachtet worden und sollte noch längere Zeit klinisch erprobt werden [1*].

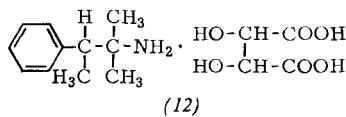
Mit dem Envacar® der Pfizer GmbH, Karlsruhe, kam eine neue, in den Pfizer Forschungslaboreien entwickelte blutdrucksenkende Substanz, 2-Guanidinomethyl-1,4-benzodioxan (chemische Kurzbezeichnung: Guanoxan) auf den Markt, die sich zur Behandlung aller leichten bis schweren Fälle von essentieller und renaler Hypertonie eignet. Im Envacar liegt das Guanoxan in Form des Sulfats (10), einer weißen, kristallinen Substanz ($F_p = 204\text{--}208^\circ\text{C}$), vor.



Ein neues Choleretikum, (6-Chlorpyridazin-3-ylthio)-essigsäurediäthylamid (11) ($F_p = 97\text{--}98^\circ\text{C}$), ist neben verschiedenen Enzymen im Oraffic®*, einem Verdauungsregulans der Byk-Golden-Lomberg GmbH, Konstanz, enthalten. Der Wirkstoff steigert den Gallefluß im Sinne einer echten Cholerese und hat selbst in Dosen von 400 mg/kg weder eine dämpfende noch eine erregende Wirkung auf das Zentralnervensystem. Die choleretische Wirkung soll schon 10 min nach der Applikation eintreten und etwa 1 Std. anhalten.

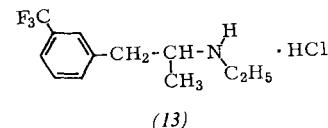


Modatrop, ein Appetitzügler mit lipolytischer Aktivität, wurde von der Nordmark-Werke GmbH, Hamburg, herausgebracht. Wirksame Substanz ist das (1,1-Dimethyl-2-phenylpropyl)ammonium-hydrogentartrat (12) ($F_p = 159\text{--}162^\circ\text{C}$), das über eine Beeinflussung der im Hypothalamus gelegenen Regulationszentren Hungergefühl und Appetit drosselt sowie Magensekretion und Magenmotilität reguliert. Gleichzeitig mobilisiert Modatrop das Körperfett und fördert dessen Abbau.



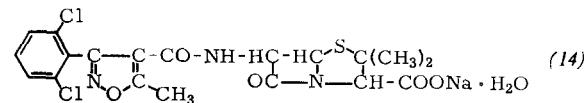
[*] Anmerkung bei der Korrektur: Die Präparate sind inzwischen wieder zurückgezogen worden.

Ein weiterer Appetitzügler wurde von der Byk-Gulden-Lomberg GmbH, Konstanz, mit dem Ganal® eingeführt. Dieses enthält als neue appetithemmende Substanz das Äthyl-(α -methyl- β -3-trifluormethylphenyl-äthyl)ammoniumchlorid (13), eine weiße, kristalline, in Wasser und Äther lösliche Verbindung ($F_p = 166\text{--}168^\circ\text{C}$). Ganal wirkt nicht zentral erregend und zeichnet sich durch starke und lange Wirkung aus.

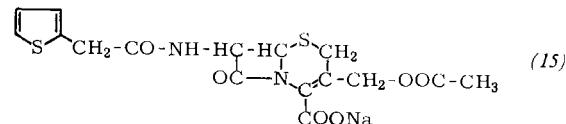


Es seien noch einige Präparate genannt, die neue halbsynthetische Antibiotika enthalten:

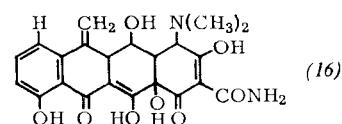
Ein gegen Penicillinase stabiles und säurefestes Penicillin-Derivat, das Natriumsalz des 3-(2,6-Dichlorphenyl)-5-methylisoxazol-4-yl-penicillins (14) (chem. Kurzbezeichnung: Dicloxacillin) wird unter der Bezeichnung Staphen® von der Deutschen Beecham GmbH, Biberach/Riß, sowie unter der Bezeichnung Dichlorstapen® von den Farbenfabriken Bayer in den Handel gebracht. Dicloxacillin ist ein farbloses, mikrokristallines, in Wasser und Methanol gut lösliches Pulver, das sich bei $222\text{--}225^\circ\text{C}$ zersetzt. Die Präparate eignen sich zur Bekämpfung aller Arten von Staphylokokken-Infektionen.



Cefalotin, das von der Eli Lilly GmbH, Gießen, eingeführt wurde, ist ein halbsynthetisches Antibiotikum, das sich vom Cephalosporin C ableitet. Es besteht aus dem Natriumsalz der 7-(Thien-2-ylacetylarnino)-cephalosporansäure (15), einer cremefarbigen, kristallinen Substanz. Cefalotin muß parenteral verabfolgt werden. Es soll sich besonders bei schweren Infektionen, die auf Penicillin und andere Antibiotika nicht ansprechen, bewähren.



Randomycin® ist ein neues Breitspektrum-Antibiotikum, das aus dem Oxytetracyclin entwickelt wurde und das als halbsynthetisches Derivat zur Tetracyclin-Reihe gehört. Die Substanz, 5-Hydroxy-6-methylen-tetracyclin (16) (chem. Kurzbezeichnung: Methacyclin), liegt als Hydrochlorid vor.



Randomycin wird rasch aus dem Magen-Darmtrakt aufgenommen, aber nur langsam durch die Nieren ausgeschieden. Die antimikrobielle Aktivität von Randomycin richtet sich sowohl gegen grampositive als auch gegen gramnegative Mikroorganismen. Besonders ausgeprägt ist die Wirkung gegen Staphylokokken, Streptokokken, Hämophilus-Arten und Coli-Bakterien.

[VB 969]