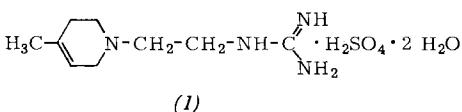


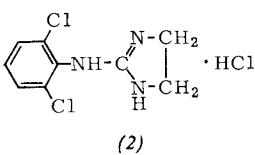
Therapiewoche und Heilmittelausstellung

Die 18. Deutsche Therapiewoche fand vom 27. August bis 3. September 1966 in Karlsruhe statt. An der mit ihr verbundenen Heilmittelausstellung beteiligten sich 285 Firmen. Aus der Vielzahl der Therapeutica seien einige derjenigen angeführt, die neue synthetische Wirkstoffe oder Wirkstoffe, die erstmals in Deutschland in den Handel kommen, enthalten; neue Kombinationspräparate schon bekannter Substanzen werden dagegen nicht berücksichtigt.

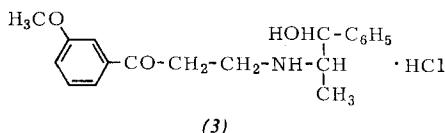
Neue Antihypertonica wurden von den Farbenfabriken Bayer, Leverkusen, sowie von der Firma C. H. Boehringer, Ingelheim, eingeführt. Das Leron® der Farbenfabriken Bayer enthält als Wirkstoff das 1-(β -Guanidinoäthyl)-4-methyl-1,2,3,6-tetrahydropyridinsulfat-dihydrat (1) (chem. Kurzbezeichnung: Cyclazentin), eine farblose kristalline, in Wasser mit neutraler Reaktion lösliche Substanz ($F_p = 231\text{--}233^\circ\text{C}$, Zers.). Leron eignet sich insbesondere zur Therapie mittelschwerer bis schwerer Hypertonien, bei denen mit den bisher gebräuchlichen Antihypertonica – auch in Kombination mit Salidiuretica – keine ausreichende Blutdrucksenkung erreicht werden konnte.



Das Catapresan® der Firma C. H. Boehringer enthält einen neuen Wirkstoff aus der Gruppe der Imidazoline, das 2-(2,6-Dichlorphenyl)amino- Δ^2 -imidazolin-hydrochlorid (2), eine in Wasser und Alkohol gut lösliche Verbindung. Catapresan unterscheidet sich von allen bisher bekannten Imidazolin-Derivaten, die entweder schleimhautabschwellend (vasokonstriktorisch) oder stark gefäßerweiternd wirken, sowohl in seiner Wirkungsweise als auch in seiner chemischen Struktur. Es eignet sich zur Behandlung des krankhaft erhöhten Blutdrucks, auch bei schweren und fortgeschrittenen Fällen.

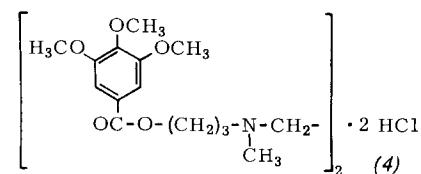


Ein Mittel zur Behandlung von Coronarinsuffizienz, Angina pectoris und Myocardinfarkt, vor allem, wenn gleichzeitig die Symptome einer Herzleistungsschwäche oder beginnender Herzensuffizienz vorliegen und eine Verbesserung der Herzkräft angestrebt wird, ist das Ildamen®, das vom Chemiewerk Homburg, Frankfurt/M., eingeführt wurde. Der Wirkstoff dieses Präparates ist das ω -(2-Hydroxy-2-phenyl-1-methyläthyl)amino-m-methoxy-propiophenon - hydrochlorid (3) (chem. Kurzbezeichnung: Oxyedrin) ($F_p = 192$ bis 194°C).

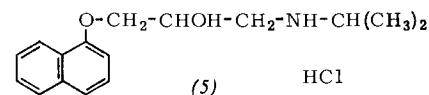


Ein Herzmuskel-Energeticum zur Behandlung coronarer Krankheiten ist das Ustimon®, das von den Österreichischen Stickstoffwerken, Linz, entwickelt und von der Byk Gulden Lomberg GmbH, Konstanz, vorgestellt wurde. Es

enthält *N,N'*-Dimethyl-*N,N'*-bis-[3-(3,4,5-trimethoxybenzoyloxy)-propyl]-äthylendiamin-dihydrochlorid (4) (chem. Kurzbezeichnung: Hexobindin), eine weiße kristalline, wasserlösliche, bitter schmeckende Substanz ($F_p = 180^\circ\text{C}$). Ustimon eignet sich zur Behandlung von Durchblutungsstörungen der Herzkrankgefäß und des Herzmuskels, zur Prophylaxe und Therapie des Herzinfarktes, zur Behandlung der Postinfarkt-zustände und zur Grundbehandlung organischer Coronarerkrankungen.

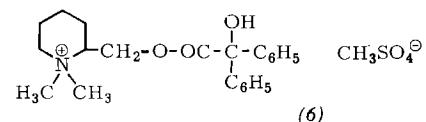


Ein neuartiges Präparat zur Behandlung von Angina pectoris steht mit dem Dociton® zur Verfügung, das von der Imperial Chemical Ind. Ltd., England, hergestellt wurde und das in Deutschland von der Rhein-Pharma Arzneimittel GmbH., Heidelberg, in den Handel gebracht wird. Wirkstoff ist das 1-Isopropylamino-3-(1-naphthoxy)propan-2-ol-hydrochlorid (5) (chem. Kurzbezeichnung: Propanol-Hydrochlorid), eine farblose, in Wasser und Äthanol leicht lösliche

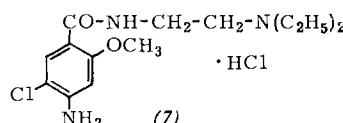


Substanz ($F_p = 163\text{--}164^\circ\text{C}$). Dociton wirkt durch selektive und reversible Blockierung der im Herzen gelegenen β -Rezeptoren. Dadurch wird das Herz vor Folgen unerwünschter Sympathicusreize (Adrenalin und adrenalin-ähnliche Substanzen) geschützt; es kommt zur Ökonomisierung der Herzfunktion durch Beeinflussung der Herzfrequenz, des Myocardtonus und des Sauerstoffverbrauchs.

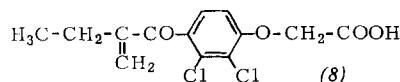
Das Acabel® der Chemie Grünenthal GmbH., Stolberg/Rheinl., ist ein neues Spasmolyticum aus der Reihe der Benzilsäureester. Es besteht aus 2-(Diphenylglycoloyloxy)methyl-1,1-dimethylpiperidinium-methylsulfat (6) (chem. Kurzbezeichnung: Piribenzil-Methylsulfat). Acabel ist ein Parasympatholyticum mit ausgewogenen muskulotropen und neurotropen Eigenschaften und zeichnet sich durch starke, schnell eintretende, lang anhaltende Spasmolyse und Schmerzlinderung bei guter Verträglichkeit und niedriger Dosierung aus.



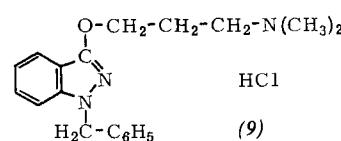
Ein neuartiges Regulans der motorischen Funktion des Verdauungstrakts mit gleichzeitig antiemetischer Wirkung kam mit dem Paspertin®, der Kali-Chemie AG., Hannover, in den Handel. Der Wirkstoff, 4-Amino-5-chlor-2-methoxybenzoësäure-*N*-(β -diäthylaminoäthyl)amid-hydrochlorid (7) (chem. Kurzbezeichnung: Metoclopramid) hat keine chemische Verwandtschaft zu Substanzen, die bisher zur Behandlung funktioneller Magen-Darm-Störungen und des Erbrechens verwendet werden, sondern ist ein Derivat des Procainamids. Indikationen für Paspertin sind Nausea, Erbrechen, Völlegefühl, Magendruck, epigastrische Schmerzen, usw.



Hydromedin®, das von der Sharp und Dohme GmbH., München, eingeführt wurde, ist ein neues sulfonamid-freies Diureticum, das sich zur Behandlung von Ödemen in allen Stadien und verschiedenster Genese eignet. Es enthält [2,3-Dichlor-4-(2-methylenbutyryl)phenoxy]essigsäure (8) (chem. Kurzbezeichnung: Etacrynsäure), eine weiße kristalline, in Wasser wenig lösliche Substanz (F_p etwa 122 °C).

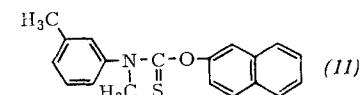
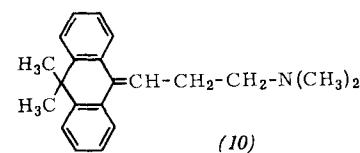


Gemeinsam von der Kali-Chemie AG., Hannover, und den Troponwerken, Köln, wurde das Antiphlogisticum tantum® herausgebracht. Das Präparat enthält 1-Benzyl-3-(3-dimethylamino - propyloxy) - 1*H* - indazol - hydrochlorid (9) (chem. Kurzbezeichnung: Benzydamin-Hydrochlorid). tantum entfaltet in entzündetem Gewebe antiphlogistische, abschwellende und analgetische Wirkungen und eignet sich z.B. zur Behandlung postoperativer und posttraumatischer Entzündungen und Schwellungen, entzündlicher Affektionen des Stütz- und Bewegungsapparates, unspezifischer Entzündungen der oberen Luftwege.



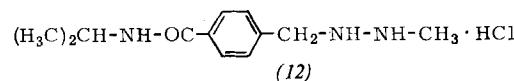
Mit dem Trausabun® der Byk-Gulden Lomberg GmbH., Konstanz, gelangte ein neues Thymolepticum in den Handel, das sowohl psychomotorisch stimulierende als auch sedie-

rende Komponenten aufweist. Es besteht aus 10,10-Dimethyl-9-(3-dimethylamino-propyliden)-9,10-dihydroanthracen (10) (chem. Kurzbezeichnung: Melitracen).



Ein neues Antimykoticum, Tonoftal®, wurde von der Byk-Essex Pharmazeutische GmbH., München, eingeführt. Es besteht aus einer 1-proz. Lösung von 2-Naphthyl-*N*-methyl-*N*-(3-tolyl)-thiocarbamat (11), einer farb- und geruchlosen fettfreien Flüssigkeit, die sich zur lokalen Anwendung bei Infektionen durch *Trichophyton rubrum*, *Tr. mentagrophytes*, *Tr. tonsurans*, *Microsporon canis*, *M. audouini*, *Epidermophyton floccosum* und *Malassezia furfur* eignet; gegen *Candida albicans* ist das Präparat unwirksam.

Zu einer neuen Klasse von Cytostatica, den Methylhydrazin-Derivaten, gehört das Natulan®, *p*-(2-Methylhydrazino-methyl)-*N*-isopropyl-benzoësäureamid-hydrochlorid (12), das

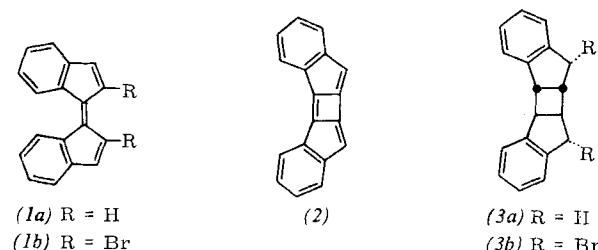


von der Hoffmann-La Roche AG., Grenzach/Baden, eingeführt wurde. Natulan eignet sich speziell zur Behandlung der Lymphogranulomatose, jedoch wurden auch bei anderen malignen Neoplasien Behandlungserfolge beobachtet.

[VB 44]

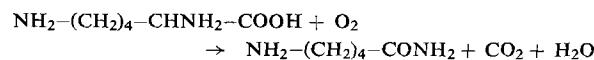
RUNDSCHEAUF

Ein symmetrisches Dibenzofulvalen (1a) erhielten A. G. Anastassiou, F. L. Setliff und G. W. Griffin beim (vergeblichen) Versuch, (2) herzustellen: Inden wurde durch 24-stündige Bestrahlung mit langwelligem UV-Licht in *syn,trans*-Tuxan (3a) übergeführt, das mit N-Bromsuccinimid (3b) ergab. Die Behandlung von (3b) mit Kaliumamid in flüssigem Ammoniak lieferte neben 27 % Biindenyl etwa 2 % (1a), dessen Struktur durch Analyse, NMR-Spektrum und Vergleich des UV-Spektrums mit dem vom bekannten (1b) bewiesen wurde. (1a) ist im Gegensatz zum Grundkörper Fulvalen sehr stabil.



(Berechnete Delokalisierungsenergie 6,73 β ; F_p der goldgelben Blättchen > 300 °C). / J. org. Chemistry 31, 2705 (1966) / -Bu.
[Rd 565]

L-Lysin-Oxygenase aus *Pseudomonas fluorescens* haben H. Takeda und O. Hayashi kristallisiert. Das Enzym, das die Decarboxylierung von Lysin unter Oxidation durch Luftsauerstoff zu δ -Aminovaleriansäureamid katalysiert, hat ein



Molekulargewicht von 191000 und enthält pro Molekül 2 Moleküle Flavin-adenin-dinucleotid (FAD), das mit Ammoniumhydrogensulfat leicht zu entfernen ist. Das Apoenzym kann mit 10^{-6} M FAD zu 50–80 % reaktiviert werden. Eisen und Kupfer konnten im Enzym nicht nachgewiesen werden; die Erfassungsgrenze betrug 0,05 bzw. 0,01 mol pro mol FAD. / J. biol. Chemistry 241, 2733 (1966) / -Hö. [Rd 567]

3-Methylpurin (1), das einzige bisher nicht beschriebene *N*-Methylisomere des Purins, synthetisierten B. Townsend und R. K. Robins. 3-Methylpurin ist als Modellsubstanz für eine Reihe natürlich vorkommender 3-substituierter Purine von

