

Z. BUDĚŠÍNSKÝ / M. PROTIVA

SYNTHETISCHE ARZNEIMITTEL

AKADEMIE-VERLAG · BERLIN

Z. BUDĚŠÍNSKÝ · M. PROTIVA

SYNTHETISCHE ARZNEIMITTEL

Nach einer Neubearbeitung durch die Autoren
in deutscher Sprache herausgegeben

von

Dr. W. KNOBLOCH

Mit 14 Tabellen im Text



AKADEMIE-VERLAG · BERLIN

1961

VORWORT DES DEUTSCHEN HERAUSGEBERS

Das vorliegende Werk wendet sich, wie die tschechischen Autoren in ihrer Einführung gesagt haben, an alle, die sich mit der praktischen Arzneimittelsynthese beschäftigen. Es soll nicht nur ein Lehrbuch über dieses Arbeitsgebiet sein, sondern auch ein Nachschlagewerk für die Praktiker aus Forschung und Industrie. Die Zusammenstellung der Präparate und ihre oftmals bis in die Einzelheiten gehende Beschreibung verschiedener Synthesewege geben zusammen mit der sehr umfangreichen Literaturzusammenfassung einen guten Einblick in die Entwicklungsgeschichte der Arzneimittelsynthese. Die Literatur wurde in dieser Übersetzung der ergänzten I. tschechischen Auflage einschließlich der *Ergänzung*, die von den Autoren angefügt wurde, bis zum Jahre 1960 nahezu vollständig erfaßt, so daß auch hier eine gute Orientierung möglich ist.

Durch die reichhaltige und übersichtliche Ausstattung mit Formelbildern der Synthesewege wird dieses Werk gleichzeitig zu einem Lehrbuch und Nachschlagewerk für alle diejenigen, die sich für industrielle und technische Arbeitsmethoden interessieren. Es wird sowohl dem Chemiker als auch dem Pharmazeuten und Mediziner ein nützliches Werk sein.

Ich möchte an dieser Stelle nicht versäumen, den Übersetzern, Herrn H. Hedenetz und Herrn Dr. Künzel, für ihre sorgfältige Arbeit zu danken.

März 1961

W. Knobloch

VORWORT ZUR DEUTSCHEN AUSGABE

Bei der Bearbeitung dieses Buches war es unser Ziel, dem Leser einen kurzen und bündigen Überblick über die synthetisch erzeugten pharmazeutischen Präparate, vor allem im Hinblick auf ihre chemische Herstellung, zu geben. Bei der Einteilung des Stoffes entschlossen wir uns für die Ordnung nach Kapiteln mit annähernd gleichen pharmakologischen Grundsätzen, da wir eine Gliederung nach dem chemischen System im Interesse der Übersichtlichkeit in diesem Falle nicht für zweckmäßig hielten. Das angewandte Verfahren ermöglichte uns, dem Leser in der Einleitung zu jedem Kapitel eine kurze Darstellung der therapeutischen Bedeutung jeder Heilmittelgruppe zu geben und eine Übersicht über deren Entwicklung zu vermitteln. Darüber hinaus konnten auf diese Weise auch die Beziehungen zwischen der pharmakodynamischen Wirkung und der chemischen Konstitution Erläuterung finden. Mit Rücksicht auf den begrenzten Umfang des Buches mußten die einführenden Abhandlungen allerdings sehr kurz gehalten werden. Bei der Auswahl der einzelnen Präparate sowie ihrer Schilderung wurde zwangsläufig vom gleichen Gesichtspunkt ausgegangen. Dennoch versuchten wir, soweit wie möglich eine kritische Einschätzung der einzelnen Heilmittel zu geben, was infolge der schnellen Entwicklung der pharmazeutischen Chemie und Pharmakologie, in der die neuen Präparate und ihre therapeutische Indikation gleichsam unter der Hand wachsen, mitunter sehr schwierig war.

Da von der Herausgabe dieses Buches bis zu seinem Erscheinen in deutscher Sprache Jahre vergangen sind, bemühten wir uns, das Original zumindest durch eine Darlegung der bedeutendsten Fortschritte auf dem Gebiet der Heilmittelsynthese und ihrer therapeutischen Verwendung zu ergänzen. Außerdem wurden in einem Nachtrag, der die Jahre von 1957 bis 1960 umfaßt, die wichtigsten der in dieser Zeit entwickelten pharmazeutischen Präparate kurzgefaßt dargestellt.

Dieses Buch ist vor allem für Chemiker in der pharmazeutischen Forschung und in der Fabrikation bestimmt, denen es eine grundlegende Information über die Synthese und die Eigenschaften der wichtigsten Heilmittel ermöglichen soll. Es wird darüber hinaus all denen, die sich für dieses Fach interessieren, beim Studium der pharmazeutischen Chemie nützlich sein.

Prag

Die Verfasser

INHALTSVERZEICHNIS

Vorwort des deutschen Herausgebers		X
Vorwort zur deutschen Ausgabe		XI
I. SYMPATHOMIMETIKA		1
Noradrenalin	9	Veritol 21
Adrenalin	11	Suprifen 23
Corbasil	13	Ephedrin 24
Euspiran	15	Amphedrin 27
Oxedrin	17	Desoxyephedrin 30
Adrianol	18	Tuamin 31
Pedrolon	20	Sanorin 32
II. PARASYMPATHOMIMETIKA		36
Cholin	43	Physostigmin 49
Acetylcholin	44	Prostigmin 52
Mecholyl	45	Pyridostigmin 53
Carbamylcholin	46	Diisopropylfluorophosphat 54
Pilocarpin	47	Mintacol 56
III. SYMPATHOLYTIKA UND STOFFE, DIE DIE SYMPATHISCHEN GANGLIEN BLOCKIEREN		60
Ergobasin	66	Salze des Tetra- äthylammoniumhydroxyds 74
Methylergobasin	70	Pentamethoniumjodid 75
Prosympal	70	Hexamethoniumjodid 75
Priscol	71	Pendiomid 76
Regitin	72	Pentoliniumtartrat 76
Dibenamin	73	
IV. PARASYMPATHOLYTIKA UND SPASMOLYTIKA		79
Papaverin	87	Trasentin H 99
Perparin	92	Thiospasmin 100
Eupaverin	93	Pavatrin 101
Atropin	95	Banthin 102
Scopolamin	95	Parpanit 103
Homatropin	96	Tifen 104
Propivan	96	Aspasan 105
Trasentin	98	Artan 106

V. ANTIHISTAMINIKA	110		
Histamin	118	Alfadryl	131
Antergan	120	Decapryn	132
Pyribenzamin	122	Antadryl	133
Neoantergan	123	Perazil	134
Synopen	124	Diparcol	135
Thenylen	125	Phenergan	136
Antistin	126	Chlorpromazin	137
Benadryl	127	Trimeton	139
Rigidyl	129	Chlortrimeton	141
Antihistamin	129	Thephorin	142
Toladryl	130		
VI. CURARESTOFFE	148		
Flaxedil	150	Laudolissin	152
Dekamethoniumjodid	150	Myanesin	153
Succinylcholinjodid	151	Resyl	154
Mytolon	152	Glyketal	154
VII. LOKALANÄSTHETIKA	156		
Cocain	166	Procainamid	173
Stovain	168	Diäthoxin	174
Metycain	169	Tetracain	175
Benzocain	170	Cinchocain	176
Butesin	171	Xylocain	178
Cycloform	172	Falicain	179
Procain	172		
VIII. ANALGETIKA DER MORPHINREIHE	183		
Morphin	185	Dihydrocodeinon	194
Codein	190	Acetyldihydrocodeinon	195
Dihydrocodein	192	Dihydrohydroxycodeinon	195
Äthylmorphin	192	5-Methyldihydromorphinon	196
Dihydromorphinon	193	N-Allylnormorphin	198
IX. SYNTHETISCHE ANALGETIKA VOM MORPHINTYP	202		
Dolantin	205	N-Methylmorphinan	213
Ketobemidon	208	Dromoran	218
Nisentil	210	Romilar	221
Amidon	211	Levallorphan	221
Heptazon	213		
X. SEDATIVA, HYPNOTIKA UND ANTIPILEPTIKA	225		
Antiepileptika	231	Bromisoval	236
Paraldehyd	234	Bromadal	237
Avertin	234	Barbital	238
Chlorobutanol	235	Allobarbital	240
Chloralhydrat	236	Aprobarbital	241

Noctal	242	Thiopental	253
Narcamon	243	Kemithal	255
Pentobarbital	244	Glutethimid	257
Amytal	246	Persedon, Sedulon u. Methypylon	258
Eudan	247	Phenytoin	260
Phenobarbital	248	Mephenytoin	262
Mephobarbital	251	Thiohydantoin	263
Dormiphen	251	Trimethadion	264
Hexobarbital	252	Phensuximid	265
XI. INHALATIONSANÄSTHETIKA	271		
Äthyläther	272	Vinyläther	273
Chloroform	272	Metopryl	274
Trichloräthylen	273	Cyclopropan	274
XII. ANALEPTIKA	276		
Purinalkaloide	277	Pentazol	284
Nikethamid	282	Lobelin	286
Coretonin	283		
XIII. GEFÄSSERWEITERNDE UND BLUTDRUCKSENKENDE STOFFE	291		
Nicotinsäure	299	Salsolin	308
Trafuril	302	Apresolin	310
Ronicol	302	Nepresol	311
Khellin	304	Reserpin	312
XIV. DIURETIKA	320		
Salyrgan	324	Mercaptomerin	327
Esidron	326	Merkuhydrin	327
Novurit	326		
XV. STOFFE MIT WIRKUNG AUF DIE SCHILDDRÜSE	330		
Thyroxin	333	2-Thiouracile	337
3,5-Dijodtyrosin	336	2-Mercaptoimidazole	338
XVI. ÖSTROGENE	342		
Equilenin	346	7-Methyl- α -bisdehydrodoisynol-	
Östron	351	säure	364
Östradiol-17 β	359	$\alpha, \alpha, 6$ -Trimethyl- β -äthylallenolsäure	366
17 α -Äthinylöstradiol	362	Diäthylstilböstrol	367
Östriol	363	Hexöstrol	371
		Dienöstrol	372
XVII. GESTAGENE	376		
Progesteron	378	17-Äthinyltestosteron	385
XVIII. ANDROGENE	388		
Dehydroepiandrosteron	392	17-Methyltestosteron	401
Androsteron	394	Methylandrostendiol	402
Testosteron	396		

XIX. CORTICOIDE	405		
Desoxycorticosteron	413	Cortison	431
Corticosteron	418	Aldosteron	446
11-Dehydrocorticosteron	420	Prednison	450
17-Hydroxydesoxycorticosteron	423	Prednisolon	451
17-Hydroxycorticosteron	427	Fludrocortison	452
XX. VITAMINE	459		
Vitamin A	460	p-Aminobenzoesäure	489
Vitamin B ₁	469	Folsäure	490
Vitamin B ₂	476	Vitamin B ₁₂	492
Vitamin B ₆	478	α-Liponsäure	495
Nicotinsäure und Nicotinamid	481	Vitamin C	497
Pantothensäure	482	Vitamin D	501
Inosit	484	Dihydrotachysterol	505
Biotin	486	Vitamin E	506
Cholin	488	Vitamin K	510
XXI. DESINFEKTIONSMITTEL	521		
Phenole	521	Phenylmerkuriverbindungen	528
Organische Quecksilber- verbindungen	524	Cetrimoniumbromid	529
Quartäre Ammoniumsalze	525	Benzalkonchlorid	530
Acridiniumverbindungen	527	Ceepryn	531
Nitrofurane	528	Acriflavin	532
		Aethacridin	533
XXII. SULFONAMIDE	536		
Antidiabetisch wirksame Sulfonamide	539	Sulfapyridin	549
Sulfanilamid	541	Sulfathiazol	549
Sulfacetamid	543	Sulfadiazin	552
Sulfaharnstoff	544	Sulfamerazin	553
Sulfathioharnstoff	544	Sulfadimidin	556
Sulfguanidin	545	Sulfisomidin	558
Benzamsulfonamid	547	Sulfachinoxalin	559
		Sulfafurazol	560
XXIII. TUBERKULOSEMITTEL	565		
p-Aminosalicylsäure	570	Isoniazid	574
Thioacetazon	572		
XXIV. SYNTHETISCHE ANTIBIOTIKA	581		
D-Chloramphenikol	585	Cycloserin	595
XXV. ARSEN-, ANTIMON- UND WISMUTHALTIGE CHEMOTHERAPEUTIKA	600		
Carbarson	604	Dichlorophenarsin	607
Acetarsol	604	Arsphenamin	608
Oxophenarsin	606	Neoarsphenamin	609

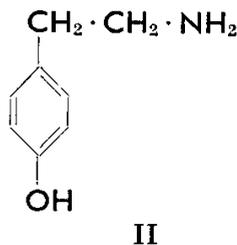
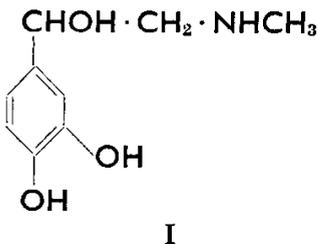
Fuadin	610	Solustibosan	613
Stibosan	611	Neobis	613
Stibosamin	612		
XXVI. ANTIMALARIAMITTEL	615		
Chinin	619	Sontochin	631
Pamaquine	623	Amodiaquin	632
Chinacrin	627	Proguanil	633
Chlorochin	629	Pyrimethamin	636
XXVII. ANTIPYRETIKA, ANALGETIKA UND ANTIRHEUMATIKA	640		
Salicylsäure	645	Amidopyrin	654
Acetylsalicylsäure	646	Melubrin	655
Salicylamid	647	Novalgin	656
Gentisinsäure	648	Phenylbutazon	657
Phenacetin	649	Cinchophen	658
Phenicarbazid	651	Neocinchophen	660
Antipyrin	651		
XXVIII. ANTICOAGULATIONSMITTEL	663		
Dicumarol	668	Warfarin	673
Pelentan	670	Acenocoumarol	674
Phenindion	671	Cyclocoumarol	674
Marcoumar	672		
XXIX. RÖNTGENDIAGNOSTIKA	677		
Abrodil	678	Jopansäure	685
Jodoxyl	679	Jophensäure	686
Diodon	680	Jodophthalein	687
Urokon	683	Pheniodol	687
Adipiodone	684	Jodierte Pflanzenöle	688
Amidotrizoesäure	684	Pantopaque	689
ERGÄNZUNG	692		
SACHREGISTER	713		
ERRATA	639		

I

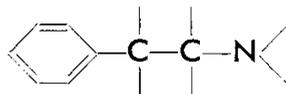
SYMPATHOMIMETIKA

Ein typischer Vertreter dieser Gruppe von Stoffen ist das im Mark der Nebennieren enthaltene *Adrenalin*. Die interessanten Wirkungen wäßriger Extrakte dieser Drüse auf den Blutdruck von Versuchstieren stellten als erste OLIVER und SCHAEFFER [1] fest. Mit dem Studium des wirksamen Prinzips befaßten sich dann eine Reihe weiterer Forscher (ABEL, FÜRTH, TAKAMINE, ALDRICH, JOWETT, BERTRAND, PAULY u. a.), denen es gelang, die wirksame Substanz, das Adrenalin (I), in kristallisierter Form zu isolieren und später auch ihre Konstitution zu bestimmen [2], welche bald darauf durch Synthese bewiesen wurde [3]. Es war das erste Hormon, das chemisch identifiziert wurde.

Eine ähnliche Wirkung auf den Blutkreislauf wurde auch bei Extrakten aus faulem Fleisch festgestellt, in denen *Tyramin* (II) und *Isoamylamin* nachgewiesen wurden [4]. Diese Amine entstehen durch bakterielle Decarboxylierung von Aminosäuren. In dieser Hinsicht klassisch sind die Arbeiten von BARGER und DALE, die eine große Zahl von meist synthetischen Substanzen darstellten und biologisch erprobten [4, 5, 6]. Von diesen Autoren stammt auch der Begriff „Sympathomimetisch“.



* Ein weiterer bedeutender Beitrag zum Studium der Sympathomimetika war die Entdeckung des Alkaloides *Ephedrin* (III), welches bei Versuchstieren ebenfalls den Blutdruck erhöht. Den angeführten drei Stoffen liegt das *Phenyläthylamin-Skelett* zugrunde.

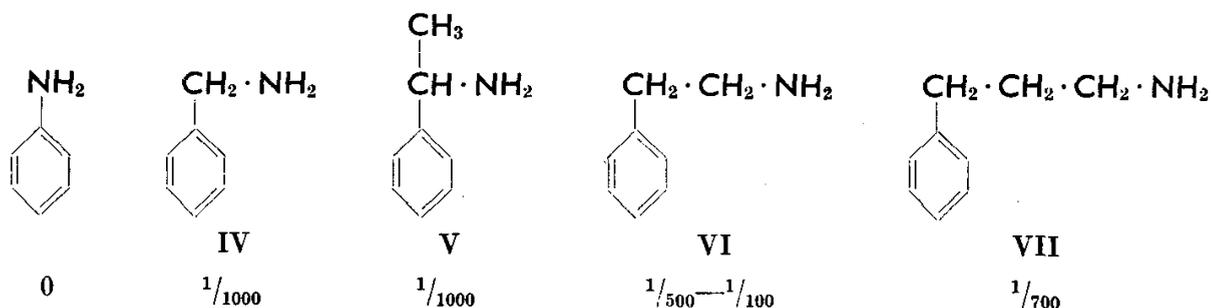


Diese Tatsache gab den Anstoß dazu, die Beziehungen zwischen chemischer Konstitution und pharmakodynamischer Wirkung bei den Substanzen dieses Typs intensiv zu durchforschen. Aus der unübersehbaren Reihe von Arbeiten (bis zum heutigen Tage sind über 500 Derivate des Phenyläthylamins pharmakologisch unter-

sucht worden) führen wir hier aber nur einige der interessantesten Beispiele an und verweisen den Leser im übrigen auf die Monographie von D. BOVET und F. BOVET-NITTI, *Médicaments du système nerveux végétatif* (1948).

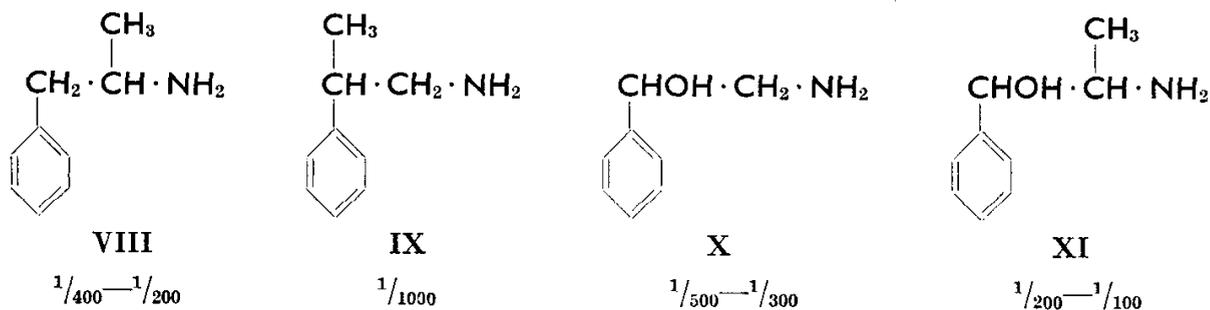
a) *Die Länge der Seitenkette*

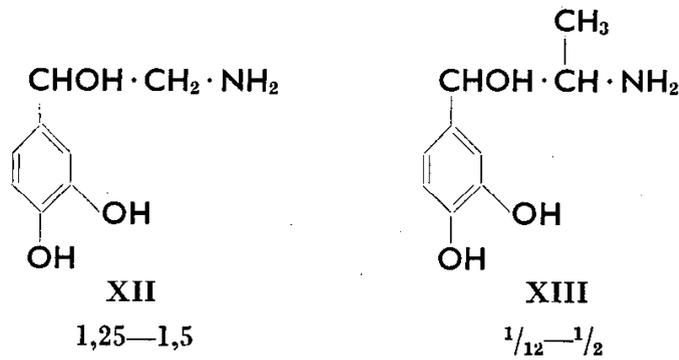
Anilin hat keine pressorische Wirkung, Benzylamin (IV) und α -Phenyläthylamin (V) wirken geringfügig, während β -Phenyläthylamin (VI) relativ wirksam ist. Bei einem weiteren Glied, dem γ -Phenylpropylamin (VII) sinkt die Wirksamkeit wieder ab. Auch aus anderen Fällen geht hervor, daß das Phenyläthylamin-Skelett den Optimalfall darstellt und, wie bereits erwähnt, auch den typischen Naturstoffen dieser Gruppe von Arzneimitteln zugrunde liegt.



b) *Alkylgruppe in der Seitenkette*

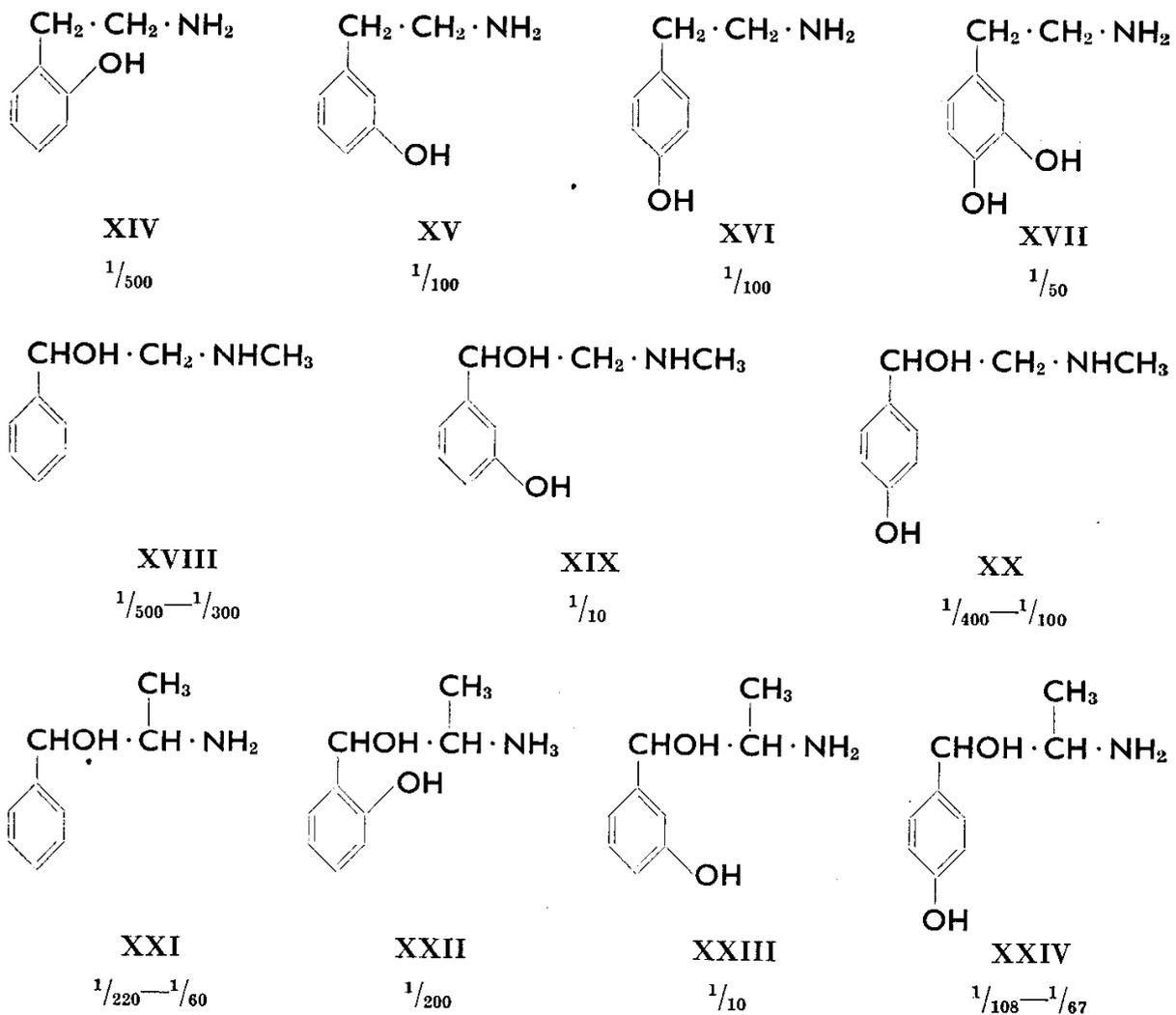
Der Eintritt einer CH_3 -Gruppe sowohl in α - als auch β -Stellung der Phenyläthylaminverbindungen setzt die pressorische Wirksamkeit zwar in der Regel herab (VI, VIII, IX, X, XI, XII, XIII), jedoch wirkt sich die α -Methyl-Gruppe auf das gesamte Molekül stabilisierend aus, so daß diese Stoffe durchweg auch bei peroraler Applikation wirksam sind [7]. VI und X sind bei peroraler Verabreichung unwirksam, wogegen VIII und XI ihre Wirksamkeit nicht nur beibehalten, sondern sogar noch viel länger wirken. Am auffallendsten ist dieser Unterschied bei dem Paar XII, XIII, da man die Labilität des Arterenols (XII) und Adrenalins gewöhnlich der chemischen Unbeständigkeit ihres Brenzcatechinkernes zuschreibt, Corbasil (XIII) aber trotzdem peroral wirksam ist. BEYER [8] erklärt diese Erscheinung damit, daß Stoffe mit einer Aminogruppe am primären Kohlenstoff ($-\text{CH}_2-$) in den Geweben leicht enzymatisch desaminiert werden, im Gegensatz zu Verbindungen mit einer Aminogruppe am sekundären Kohlenstoff ($-\text{CH}<$), die auf biochemischem Wege nur sehr allmählich desaminierbar sind.





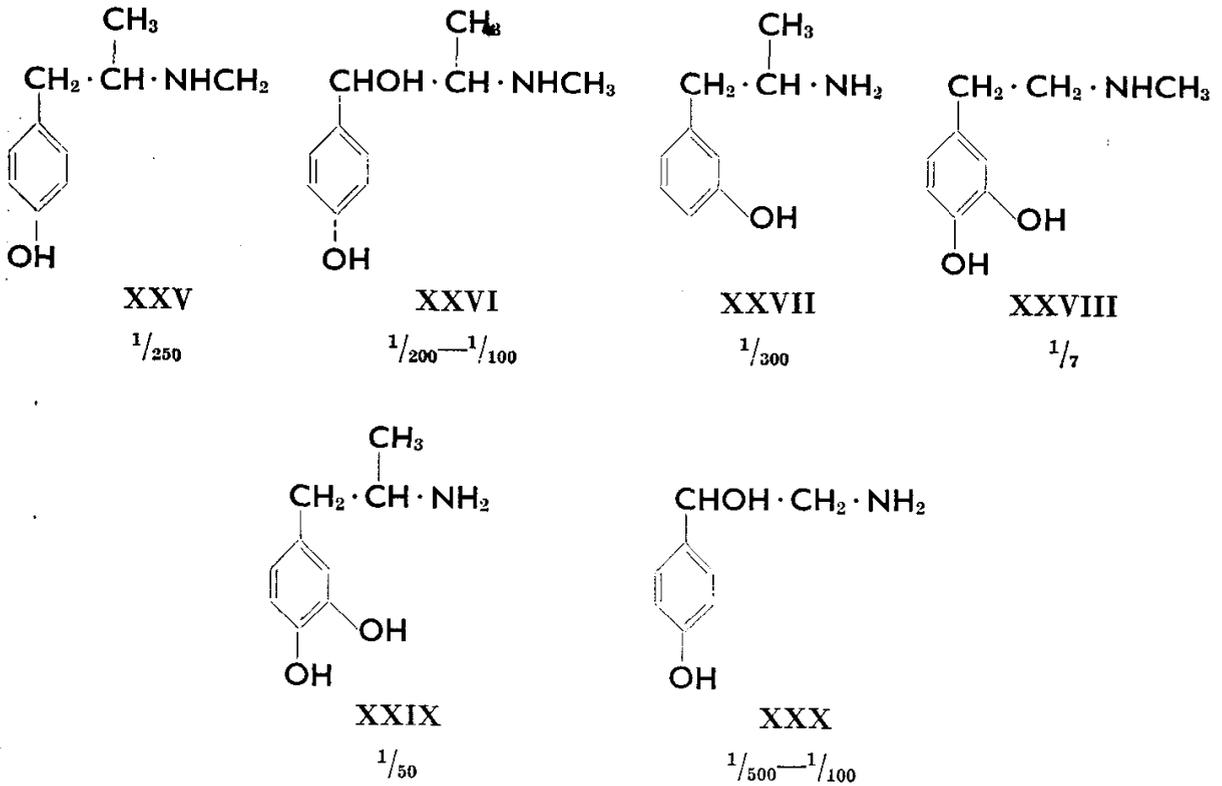
c) *Hydroxylgruppe am aromatischen Kern*

Die Einführung von Hydroxylgruppen in den Benzolkern erhöht die sympathomimetische Wirkung derartiger Substanzen stark. Von den Mono-Hydroxy-Derivaten sind in der Regel die m- und p-Verbindungen (XIV, XV, XVI, XIX, XX, XXII, XXIII, XXIV) [9] und von den mehrwertigen Phenolen die 3,4-Dihydroxy-Verbindungen (I, XII, XIII, XVII) am wirksamsten, während bei den Trihydroxy-Verbindungen die sympathomimetische Wirkung verschwindet.



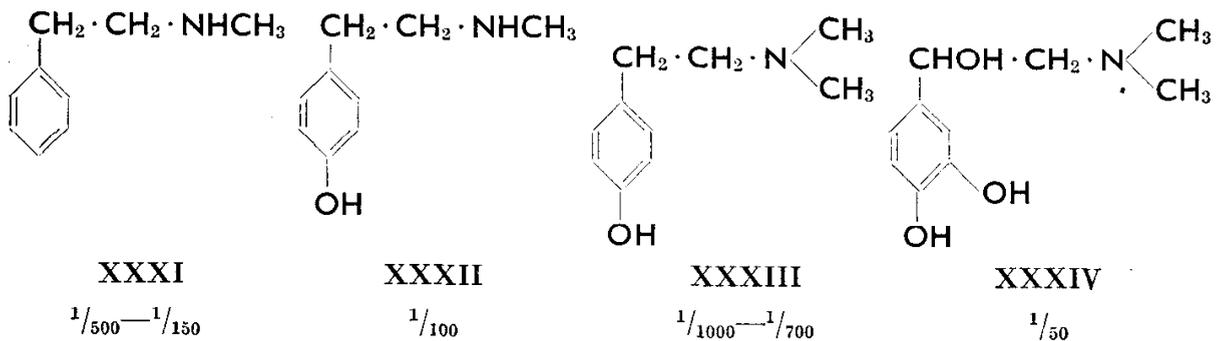
d) Hydroxylgruppe in der Seitenkette

Der Einfluß einer sekundären Alkoholfunktion in einer aliphatischen Seitenkette kann bei den nichtphenolischen Phenyläthylaminen praktisch vernachlässigt werden (VI, X; VIII, XI). Bei Phenyläthylaminen, die am Kern hydroxyliert sind, gibt sich die Alkoholgruppe durch merkliche Steigerung der pressorischen Wirksamkeit zu erkennen (XXV, XXVI; XXVII, XXIII; XXVIII, I; XXIX, XIII). Diese Regel ist jedoch nicht allgemeingültig, da Tyramin (XVI) größere pressorische Wirkung aufweist als der ihm entsprechende sekundäre Alkohol XXX.



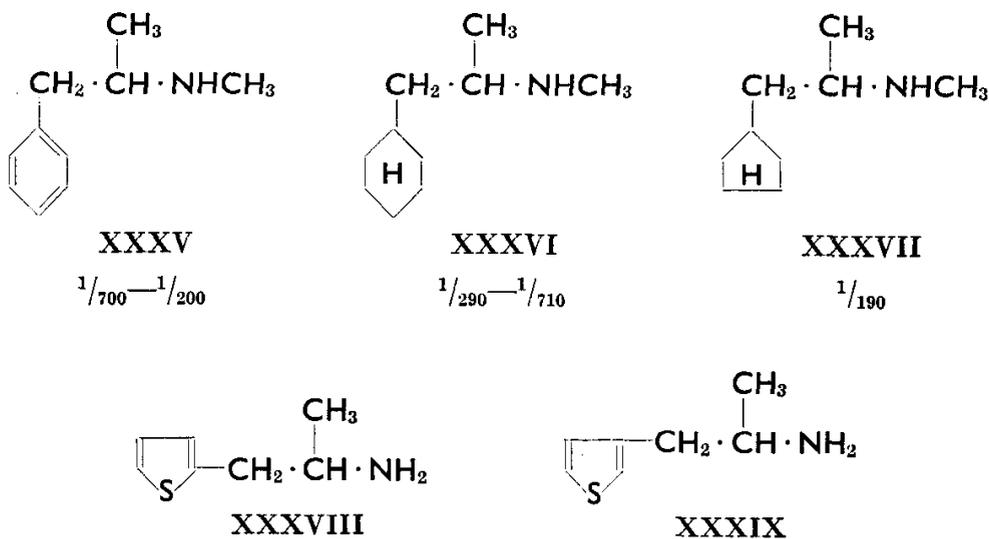
e) Alkylierung des Stickstoffes

Über die Alkylierung des Stickstoffes läßt sich ganz allgemein sagen, daß sie die sympathomimetische Wirkung von Stoffen herabsetzt [10], wie aus dem Vergleich folgender Paare bzw. Dreiergruppen von Substanzen hervorgeht: VI, XXXI; X, XVIII; XVI, XXXII, XXXIII; XII, I, XXXIV.

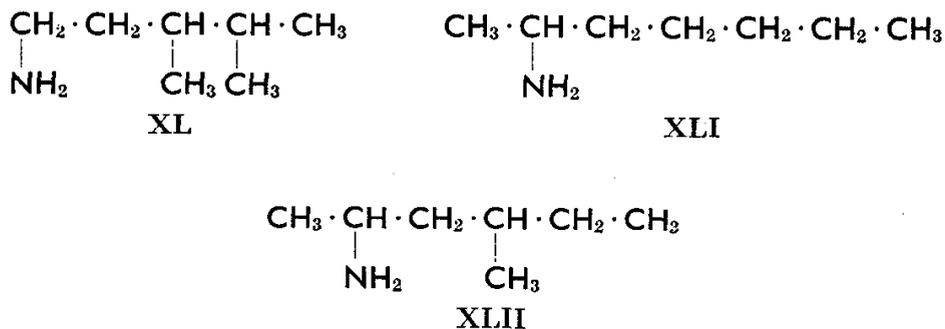


Dieser Einfluß ist namentlich bei höheren Alkylen sehr intensiv, denn während N-Äthyl-noradrenalin den Blutdruck erhöht, haben die höheren Homologen die gerade entgegengesetzte Wirkung. Durch Quaternisierung des Aminostickstoffes entstehen in der Adrenalin- und Ephedrinreihe Substanzen mit Curarewirkung.

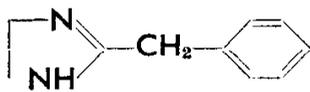
Die Ergebnisse pharmakologischer Arbeiten aus jüngster Zeit haben gezeigt, daß die sympathomimetische Wirkung keineswegs nur auf Stoffe mit Benzolkern beschränkt ist. Durch Hydrierung von 1-Phenyl-2-methylaminopropan (XXXV) zu 1-Cyclohexyl-2-methylaminopropan (XXXVI) wird die pressorische Wirksamkeit nur wenig verringert [11]. Die analoge Cyclopentyl-Verbindung (XXXVII) hat auf den Blutdruck etwa die gleiche Wirkung wie XXXV. Von den heterocyclischen Verbindungen steht in chemischer Beziehung das Thiophen dem Benzol am nächsten. Dementsprechend haben auch die Thenyläthylamine XXXVIII, XXXIX annähernd die gleiche Wirkung wie VIII [12].



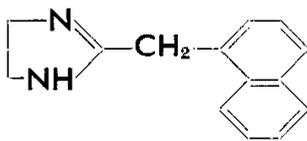
Auch in der aliphatischen Reihe finden wir wirksame Sympathomimetika. Bereits DALE stellte die hervorragenden pressorischen Wirkungen einiger primärer aliphatischer Amine fest [5], von denen das *n*-Hexylamin am wirksamsten war [6]. Diese Stoffe wurden später erneut studiert, wobei man die stärksten Wirkungen bei den Heptylaminen XL, XLI, XLII [13] feststellte; die ersten beiden dieser Substanzen finden klinisch in Form der Präparate *Tuamin* und *Methylhexamin* Anwendung.



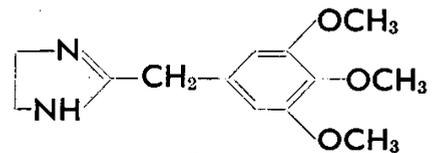
Bei der Untersuchung verschiedener Derivate des Imidazolins gelangten HARTMANN und ISLER [14] zu einer interessanten Erkenntnis. Während das 2-Benzylimidazolin (XLIII) sympatholytische Wirkung hat, indem es den Blutdruck herabsetzt und die Gefäße erweitert (Präparat *Priscol*) (s. S. 71), weist das analoge α -Naphthyl-Derivat XLIV sympathomimetische Wirkung auf (Präparat *Privin* s. S. 32). Auch die Präparate *Phedrazin* (XLV) und *Otrivin* (XLVI) sind Imidazolinverbindungen.



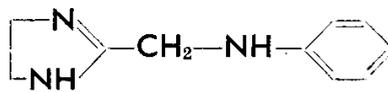
XLIII



XLIV



XLV



XLVI

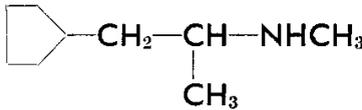
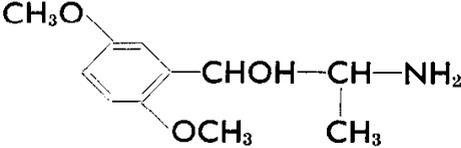
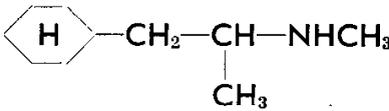
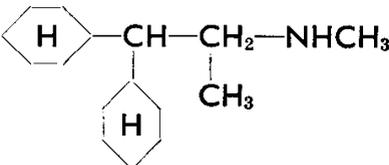
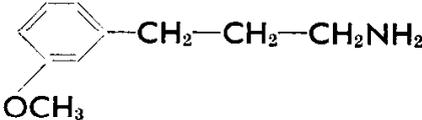
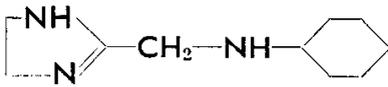
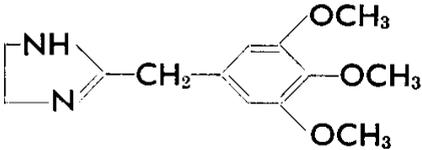
Zum Schluß müssen wir über die physiologische Funktion der Sympathomimetika und insbesondere des Adrenalins wenigstens kurz einiges sagen. Adrenalin ist nicht nur das Hormon des Nebennierenmarks, sondern entsteht auch an den Endungen sämtlicher *sympthischer Nerven*, die man daher auch *adrenergische Nerven* nennt. Eine Reizung des Nervs bewirkt die Bildung einer geringen Menge des sog. *Sympathins*, von dem man annimmt, daß es ein Gemisch aus *Adrenalin* und *Noradrenalin* darstellt. Durch dessen Vermittlung wird dann der Nervimpuls auf das umliegende Gewebe übertragen. Die sympathomimetische Wirkung gibt sich namentlich durch Erweiterung der Pupille, Beschleunigung der Herztätigkeit, Verengung der peripheren Gefäße in Haut und Schleimhäuten, Erweiterung der Bronchien, Erweiterung der Koronargefäße u. a. zu erkennen.

Ähnlich wie das Adrenalin wirken, wie wir eben gesehen haben, noch eine Reihe weiterer Stoffe, die wir in der Gruppe der *sympathomimetischen Amine* oder *adrenergischen Substanzen* zusammenfassen. In der Therapie werden sie besonders zu folgenden Zwecken verwendet:

1. zur Erzielung von Vasokonstriktion bei örtlicher Applikation von Lokalanästhetika, beim Stillen von Blutungen und zur Anämisierung der Schleimhäute in der Nasen- und Halsmedizin;
2. zur Erhöhung des Blutdruckes durch Kontraktion der Arterien und Steigerung der Herztätigkeit;
3. zur Erweiterung der Pupille;
4. zum Lösen von Krämpfen der Bronchialmuskulatur.
5. Einige dieser Stoffe dienen auch zur Anregung (Stimulierung) des Zentralnervensystems bei Erschöpfungszuständen, Depressionen, einigen Typen von Psychoseosen sowie bei Intoxikation durch Hypnotika und Narkotika. Hierher gehören insbesondere Stoffe vom Ephedrintyp, die man als sog. *Weckamine* bezeichnet.

Zusammenstellung der Sympathomimetika nach ihrer chemischen Konstitution

Bezeichnung									
	1	2	3	4	5	6	7	8	9
Amphetamin, Benzedrin	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H
Methedrin, Methyl-amphetamin, Pervitin	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	CH ₃
Vonedrin	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	CH ₃
Mephentermin, Wyamin	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
Phenyläthanolamin	H	H	H	H	OH	H	H	H	H
Nor-Ephedrin, Propadrin	H	H	H	H	OH	H	CH ₃	H	H
Ephedrin	H	H	H	H	OH	H	CH ₃	H	CH ₃
Nethamin	H	H	H	H	OH	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃
Isalon	H	H	H	H	OH	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃ CH ₂ N $\begin{cases} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{cases}$
Systogen, Tyramin, Tyrosamin, Uteramin	OH	H	H	H	H	H	H	H	H
Hydroxy-amphetamin, Paredrin	OH	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H
Paredrinol, Pholedrin, Veritol	OH	H	H	H	OH	H	CH ₃	H	CH ₃
Anhalin, Hordenin	OH	H	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃
Sympatol, Synephrin	OH	H	H	H	OH	H	H	H	CH ₃
Vasculat	OH	H	H	H	OH	H	H	H	n-C ₄ H ₉
Dilatol	OH	H	H	H	OH	H	CH ₃	H	CH $\begin{cases} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5 \end{cases}$
Ephetonal	NH ₂	H	H	H	OH	H	CH ₃	H	CH ₃
Adrianol, Phenylephrin	H	OH	H	H	OH	H	H	H	CH ₃
Effortil	H	OH	H	H	OH	H	H	H	CH ₂ CH ₃
Icoral B, Metaraminol	H	OH	H	H	OH	H	CH ₃	H	H
Supriphen	OH	H	H	H	OH	H	CH ₃	H	CH ₃
Methoxyphenamin, Orthoxin	H	H	OCH ₃	H	H	H	CH ₃	H	CH ₃
Epinin	OH	OH	H	H	H	H	H	H	CH ₃
Arterenol	OH	OH	H	H	OH	H	H	H	H
Corbasil	OH	OH	H	H	OH	H	CH ₃	H	H
Dihydroxyephedrin	OH	OH	H	H	OH	H	CH ₃	H	CH ₃
Butanephrin	OH	OH	H	H	OH	H	C ₂ H ₅	H	H
Adrenalin, Suprarenin	OH	OH	H	H	OH	H	H	H	CH ₃
Aludrin	OH	OH	H	H	OH	H	H	H	CH $\begin{cases} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{cases}$
Neoisuprel	OH	OH	H	H	OH	H	C ₂ H ₅	H	CH $\begin{cases} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{cases}$
Methadren	OH	OH	H	H	OH	H	H	CH ₃	CH ₃
Adrenalon, Kephlin, Stryphnon	OH	OH	H	—	O	H	H	H	CH ₃
Vaponephrin	OH	OH	H	H	CH ₃	—	—	H	CH ₃

<i>Bezeichnung</i>	
Tuamin	$\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \\ \\ \text{NH}_2 \end{array}$
Oenethyl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \\ \\ \text{NHCH}_3 \end{array}$
Octin	$\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{C}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_3 \\ \qquad \qquad \qquad \\ \text{CH}_3 \qquad \qquad \qquad \text{NHCH}_3 \end{array}$
Cyclopentamin, Clopan	
Methoxamin, Vasoxyll	
Benzedrex	
Cyverin	
Pulsoton	
Otrivin	
Phedrazin	
Privin	