

# 東方人的長生不老藥 ——人參； 洋人却發現不老克因 ——Procaine

張弘

近來世界各國報章雜誌醫學刊載治療老人病症，並且返老還童功效的一種新藥，此種新藥定名為“H<sub>3</sub>”，並經醫學界承認，它是繼盤尼西林，荷爾蒙後之一大發現。它的發現者為 Prof. M. Aslan of Bucharest 科學家安姆，雅絲蘭教授。

1957 年 Prof. M. Aslan 安姆，雅絲蘭教授在德國醫學會提出報告；以百分之二“H<sub>3</sub>”水溶液肌肉注射，對老年人病症得到令人滿意的效果。

Prof. M. Aslan 安姆，雅絲蘭教授述及關於此返老還童的效能；為“H<sub>3</sub>”注射到體內，即轉變為 Diethylaminoethyl & P-Aminobenzoic Acid (Vitamin H<sub>3</sub>) "Compound H<sub>3</sub>" 對於血管、神經系統以及結締組織促進全體新陳代謝，細胞再生作用，使人體織器官恢復往日功能。

人體是以細胞組成的，估計成人約有一百萬億細胞，幼少年時期細胞逐漸增多，青年時期成平衡狀態，老年階段漸次減少；人類壽命記錄有超過百歲者，但細胞則隨時生死，很明顯的，工作時細胞破損多，要靠休息及睡眠時間來補充，長壽的要訣是要儘快補充死去的細胞。

衆所週知：細胞是由細胞膜，細胞質和核組成。細胞核內有核酸 Ribonucleic Acids (RNA) 和脫氧核酸 Deoxyribonucleic Acids (DNA)。細胞質的 RNA 主持蛋白質的合成，而 RNA 本身則由 DNA 合成的。

很有趣的，H<sub>3</sub> 的尾部恰巧與維他命 B 群一重要分子 Folie Acid 完全一樣，這一部份名為 P-Amino Benzoic Acid 簡稱 PABA。

前述 H<sub>3</sub> 進入消化系統或體內，很快分解為

PABA 及 Diethylaminoethanol (DEAE),  
Dimethylaminoethanol (DMAE)。

奇妙的是，新生狀態之 PABA 異常活躍，牠很快變成葉酸的驅幹，葉酸可以幫助製造核酸 DNA, RNA 而產生新細胞。如此說來，H<sub>3</sub> 的尾部係產生細胞核的鼻祖。

況且 H<sub>3</sub> 的頭部：DEAE, DMAE 有節制心跳的作用，對精力憔悴，性情抑鬱者，可使重振精神而會心情開朗，此所以老年人為何可以恢復年青時代的活力。

其實 Procain (H<sub>3</sub>) 早於 1905 年由德人 Alfred Einhorn 製造成功，列入各國藥典；局部注射有止痛作用，嗣又發現其近似 Vitamin 故又以 H<sub>3</sub> 名之，一物二名並不為奇。



宏昌書局

中國醫藥學院特約店

專營

各國名牌鋼筆毛筆一般文具紙張筆記簿、日記簿名片承印一般印刷、各種運動器材、各大專、高初中、小學等參考書、課本、簿本附設繡學號

歡迎駕臨賜顧

地址：臺中市中華路二段 121 號

# 吲哚的合成與反應

## THE SYNTHESIS AND REACTION OF INDOLE

徐聖煦博士

你們魏主任是我的老師，從魏老師那裡我得到了很多好處，相信大家在魏老師的指導下，會有好的成就。我在當學生時對有機化學就感興趣，完全是魏老師的引發，而後才有今天的成就，在此謹向魏老師致謝。

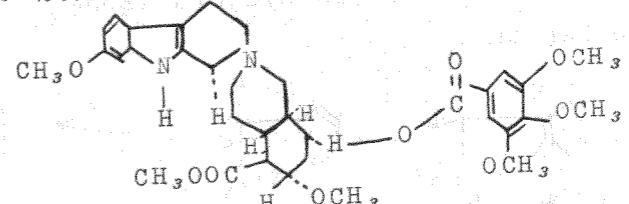
Indole 的 structure 為 其衍生物( derivatives )

在自然界中可從茉莉、橘花中提煉出來，而 tryptophan : 是人類所

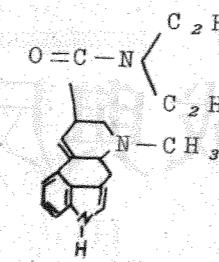
需蛋白質中八個主要 amino acid 之一: Serotonin : 是腦中控制

情緒的成分過多會產生神經病，少了也不行，這些都屬於 Indole derivatives。其他如 Rauwolfia alkaloids : 如 Reserpine 也有 Indole str.

Reserpine 有鎮靜及降血壓之效果，可治緊張性精神神經症。



Ergot alkaloids : 如 Lysergic acid diethylamide (L.S.D.) 可引起幻覺症。



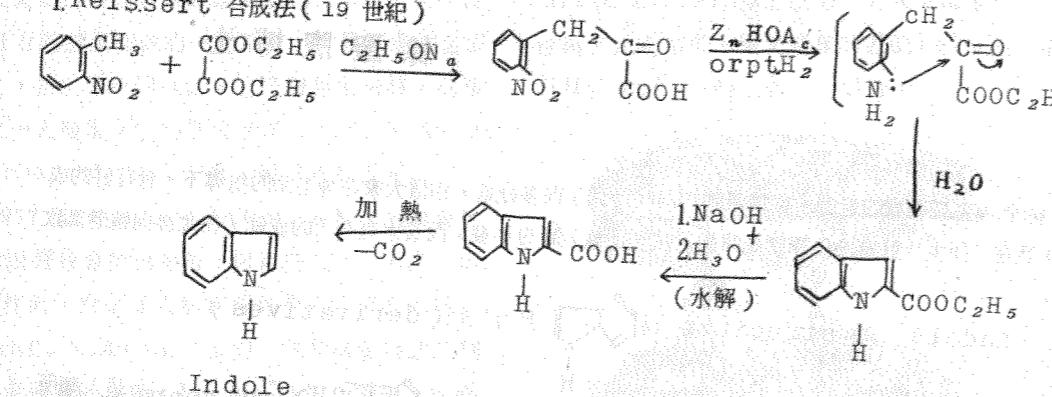
及 Indole-3-acetic acid

是植物的生長激素。

以上這些都是屬於 Indole str. 之 derivatives.

(+)Indole 及其 derivatives 之合成:

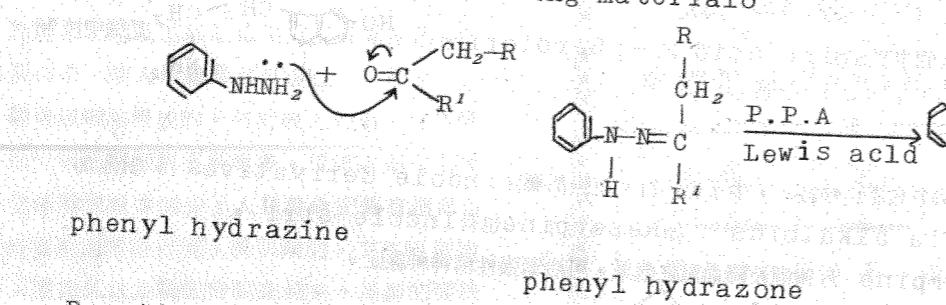
1. Reissert 合成法 (19 世紀)



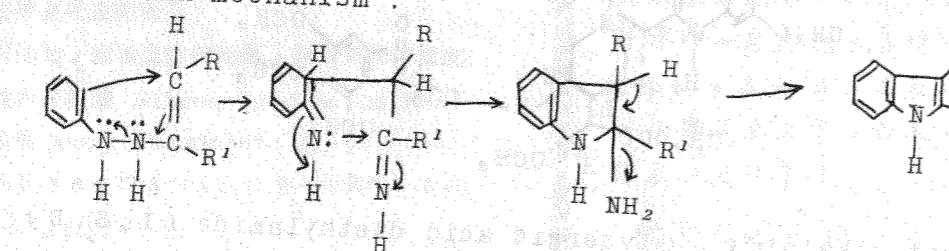
Indole

2. Fischer 合成法:

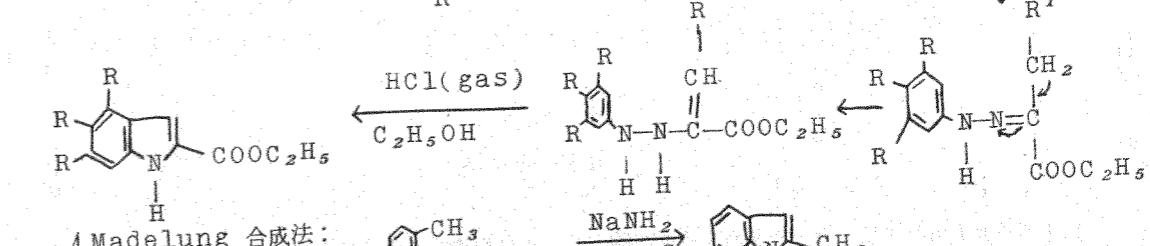
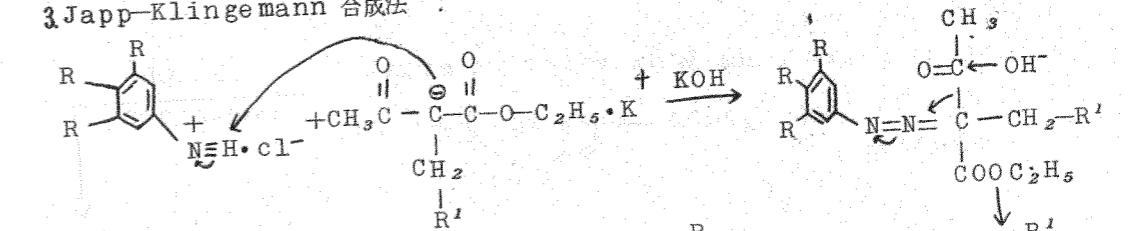
以 phenyl hydrazine 為 starting material



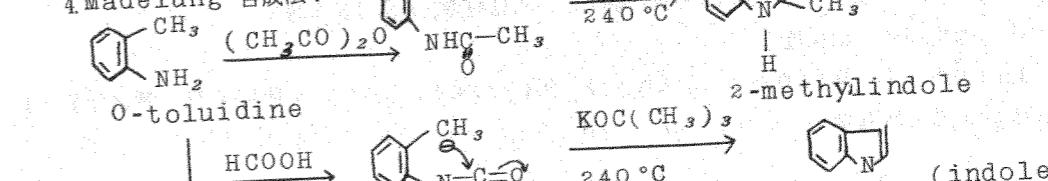
Reaction mechanism :



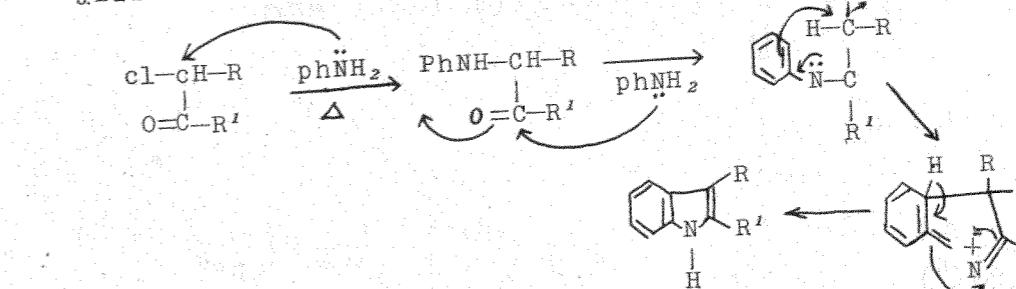
3. Japp-Klingemann 合成法 :



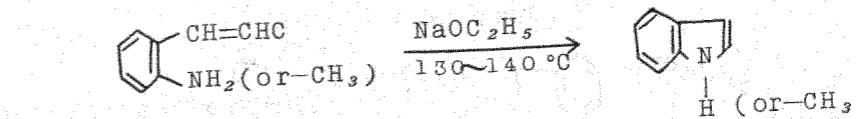
4. Madelung 合成法:



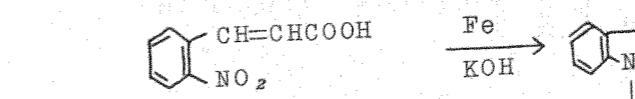
5. Bischler 合成法:



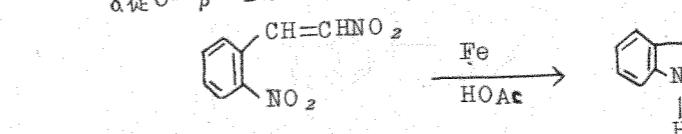
6. Lipp 合成法:



7. Beeyer Emmerling 合成法:

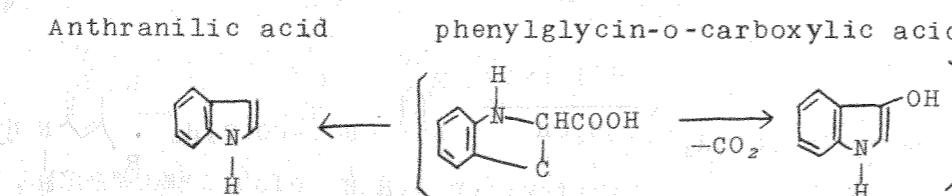
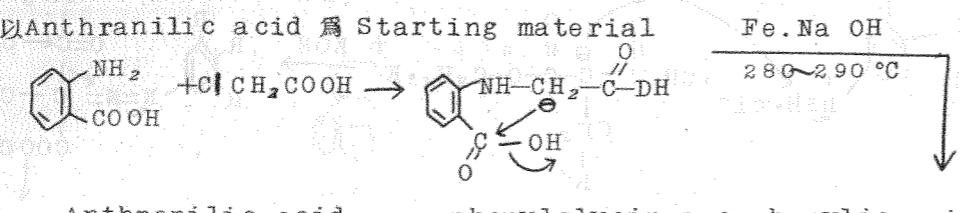


8. 從 O-β-Dinitrostyrene 合成 (在醋酸中加 Fe 還原):



9. 工業上製造 Indole 法：

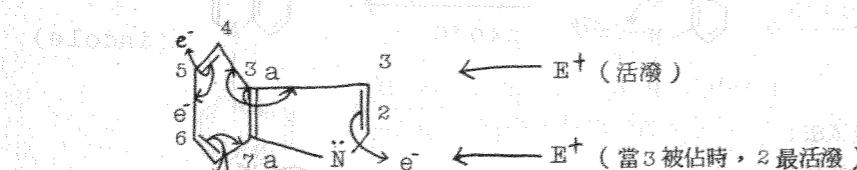
以 Anthranilic acid 為 Starting material



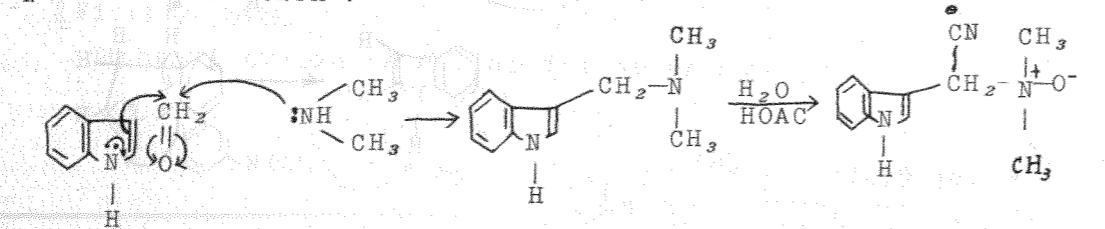
以上所學共有九種方法，而至今還有人發表新的方法，可見製造的方法是繁多的。

(2) Indole 之反應

Indole 有一個 benzene ring 及一個 pyrrole ring，所以兼有二者之性質，以第 3 位最活潑，然後第 2 position，再者為 5、7、4、6 position 等等。



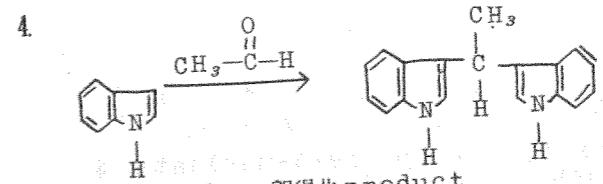
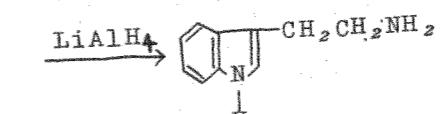
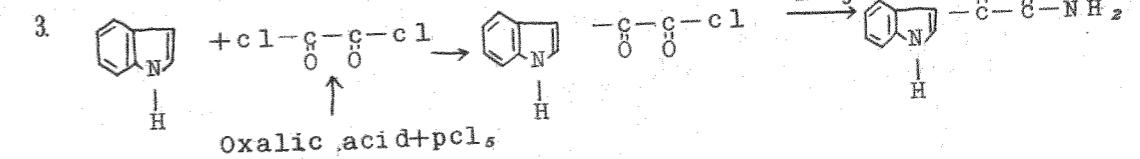
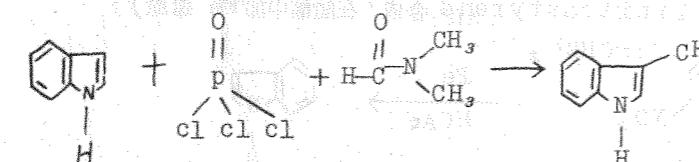
1 Mannich Reaction :



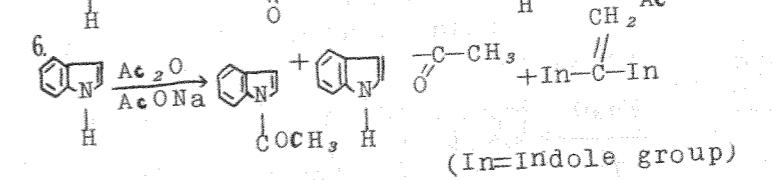
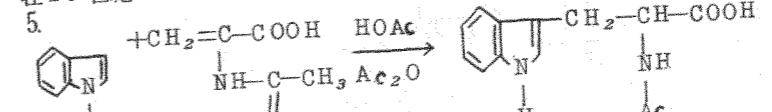
Gramine

Indole-3-acetic acid

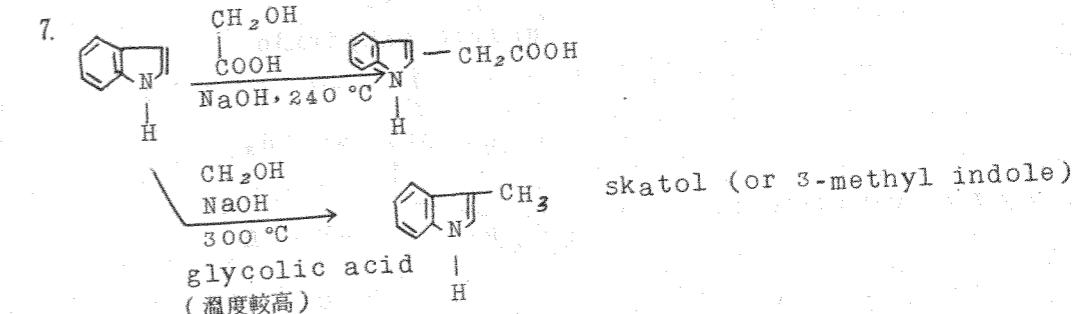
2 Vilsmeier Reaction :



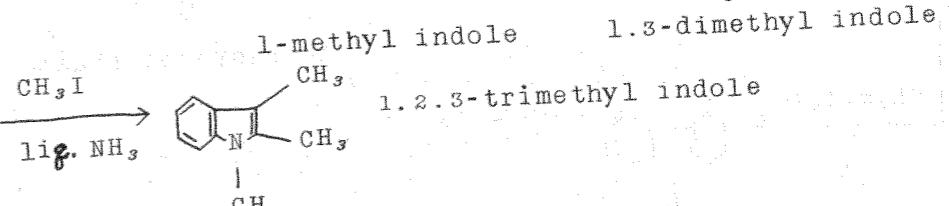
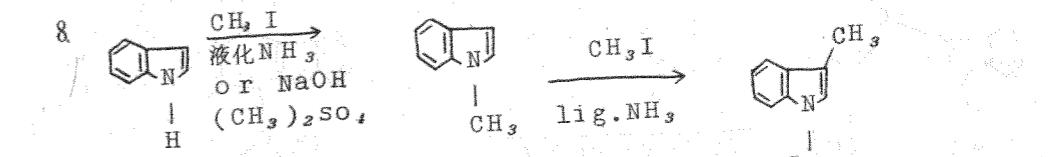
在 19 世紀 Fischer 卽得此 product.



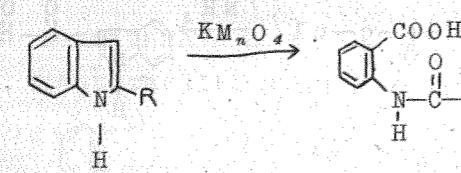
(In=Indole group)



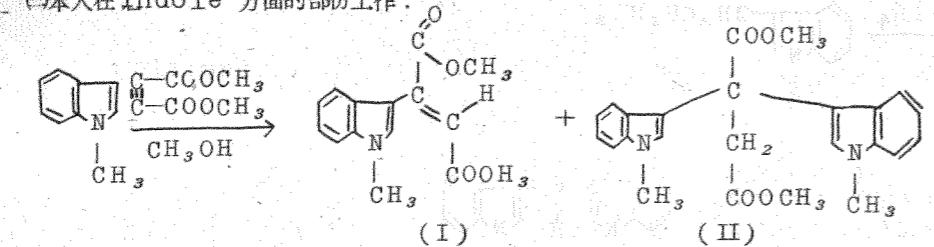
Skatol 臭氣很臭，人體排出之臭氣有此成分。



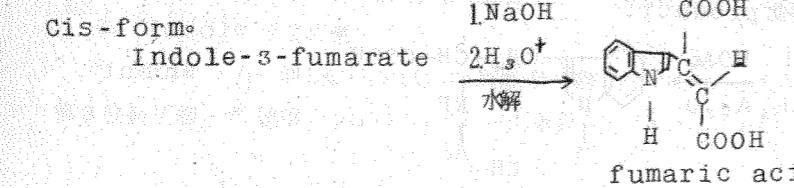
9. Indole 之氧化，以  $KMnO_4$  為 Oxidant:



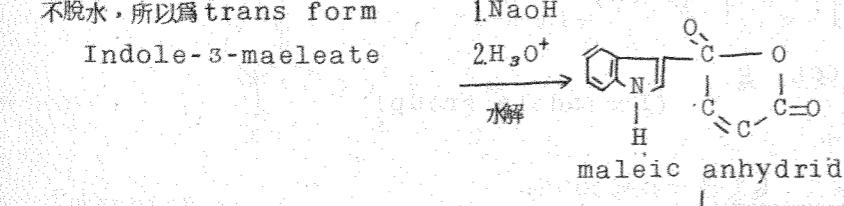
本人在 Indole 方面的部份工作：



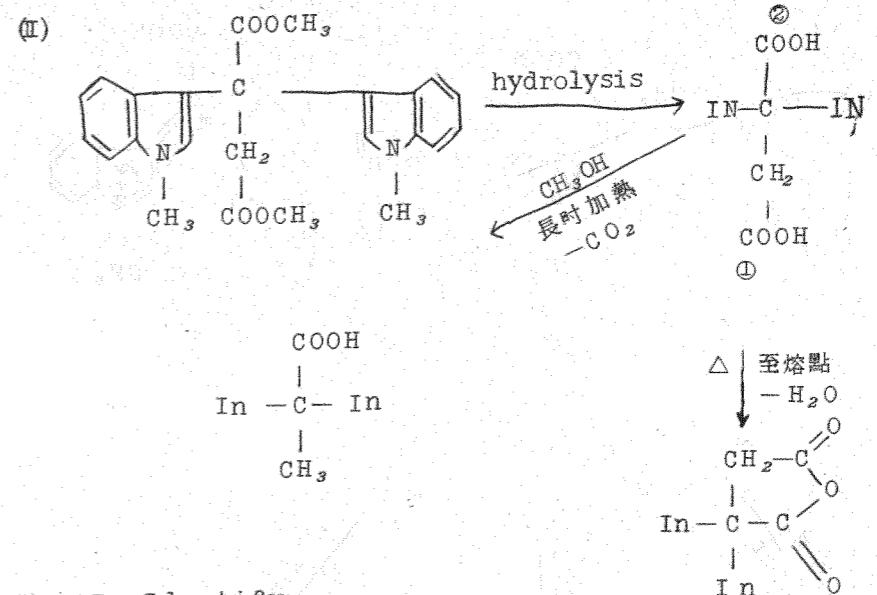
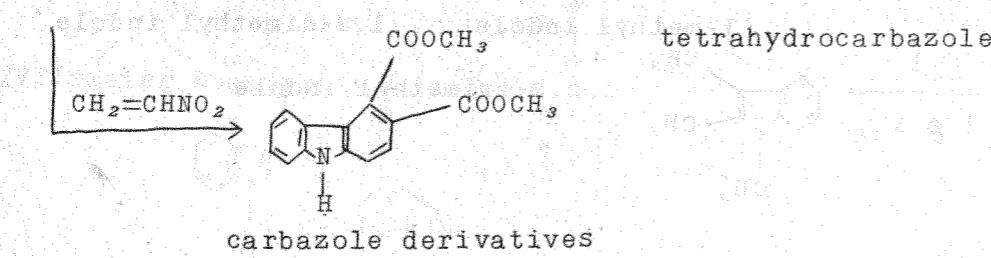
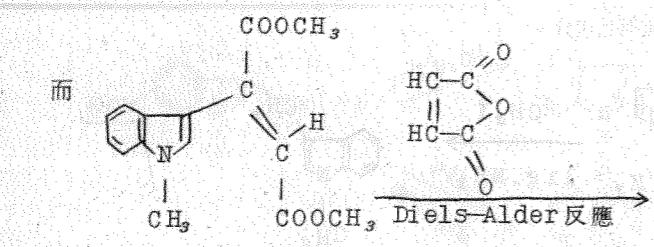
證明 Indole-3-Fumarate 為 trans form, Indole-3-maleate 為 Cis-form.



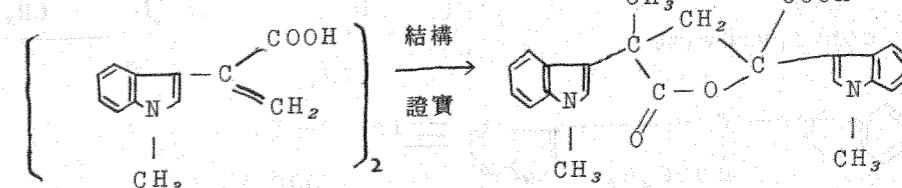
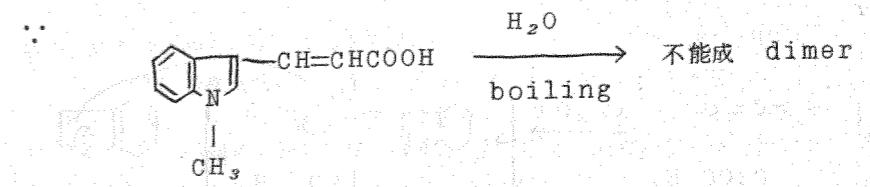
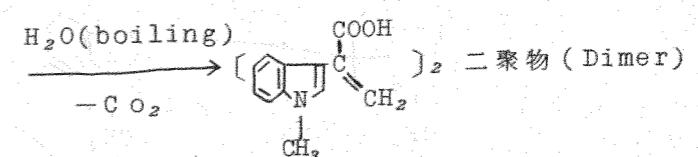
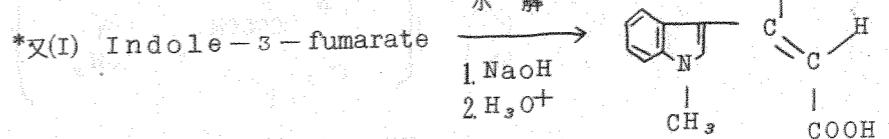
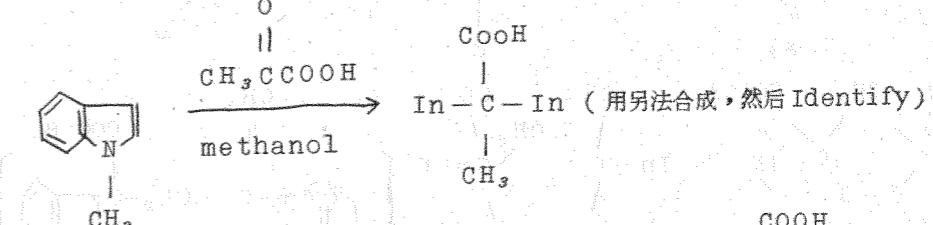
不脫水，所以為 trans form



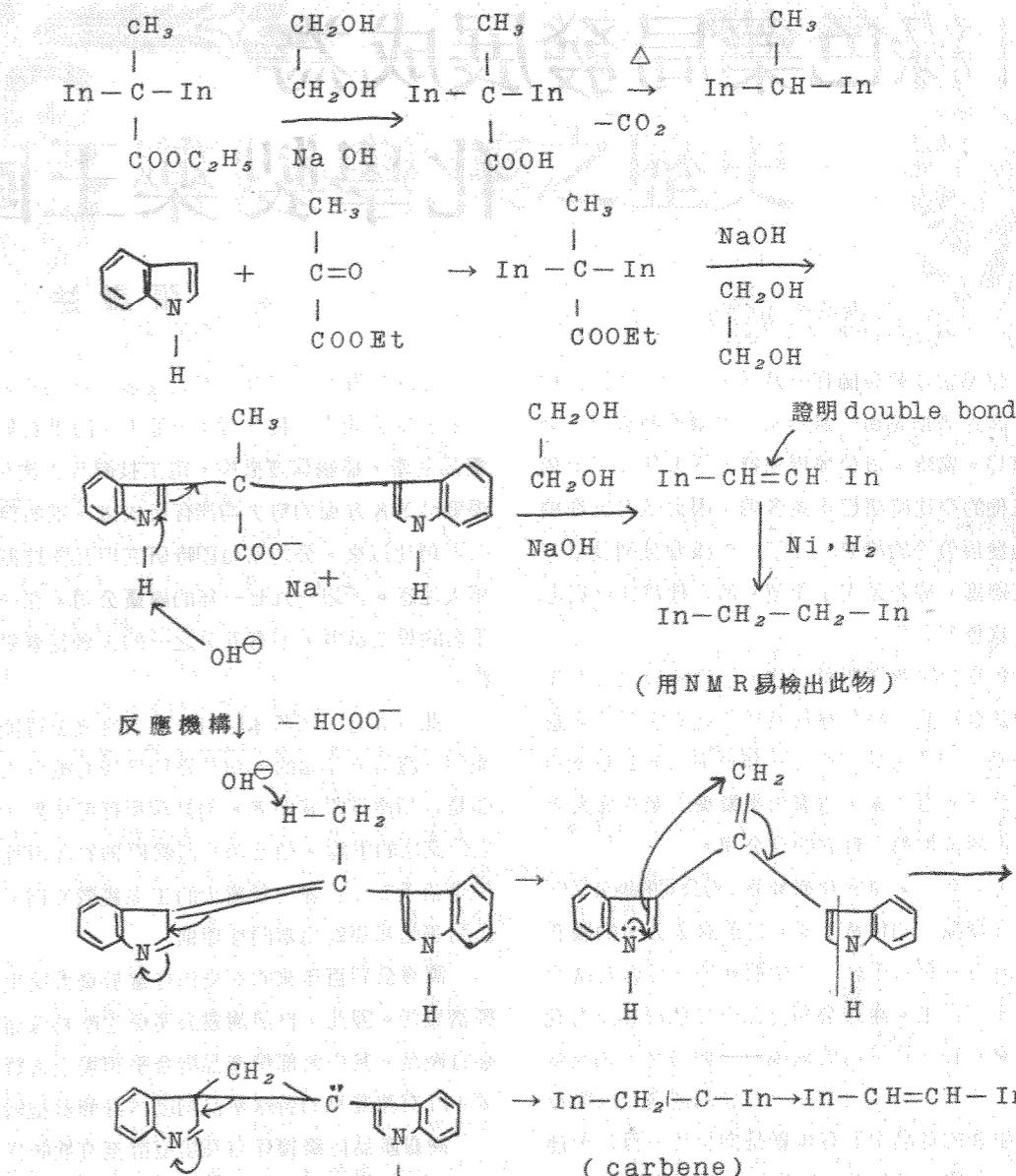
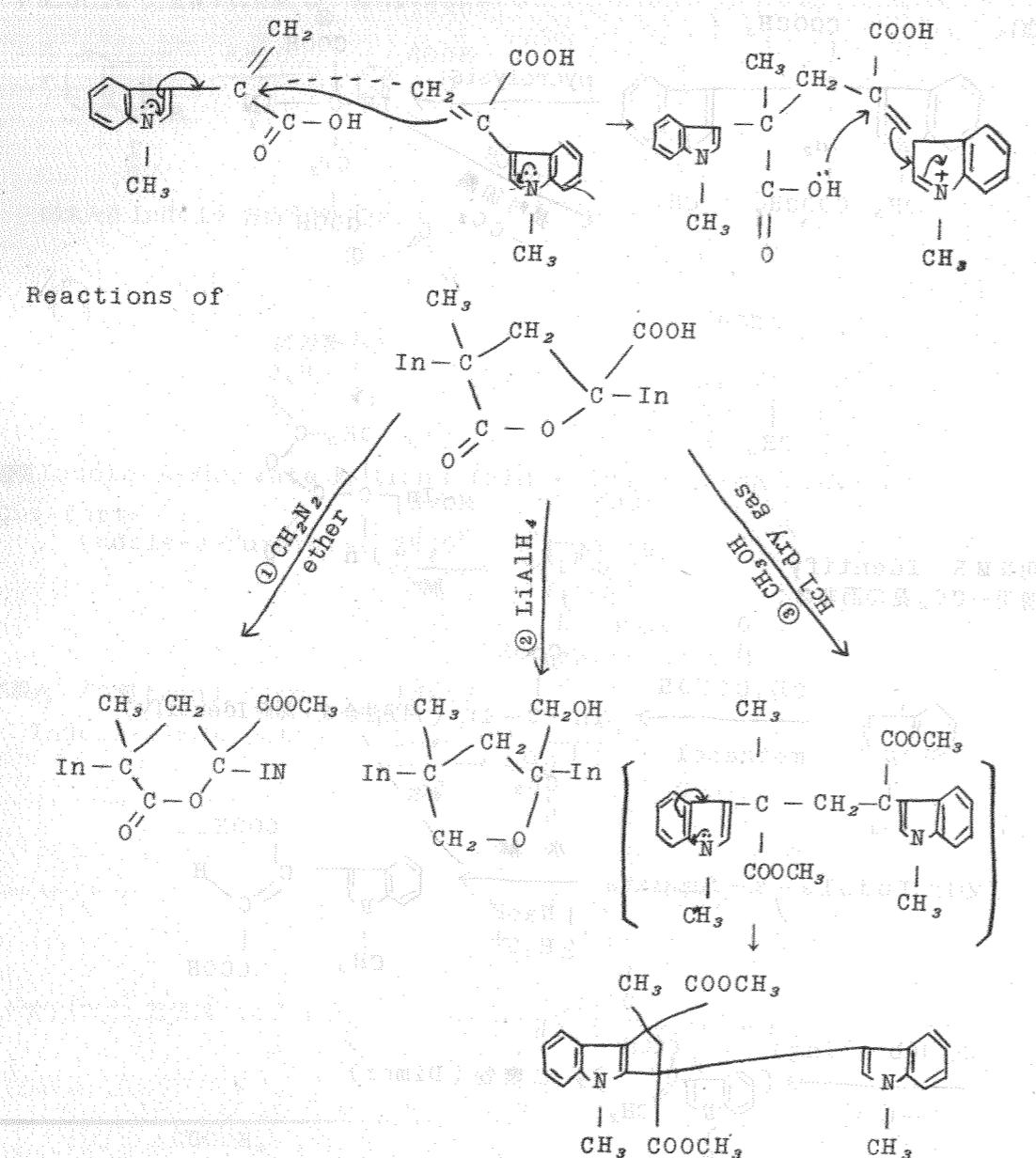
(Anhydride 證明為 cisform)



用 NMR Identify  
證明  $-CO_2$  是 ① 而非 ②：



Reaction mechanism:



以上是我在研究的合成與反應方面的部份工作。

目前台灣的教學水準並不比歐美差，僅在研究方面有許多不方便的地方，像有很多試藥，本省不能做，只有向美國訂貨，至少要兩三個月後才能寄到。若在美國僅須打一個電話就可以馬上送到。但是我們仍然可以研究，只是慢些。此外還可以用許多困難的方法，我在清華大學就常常用上，這些都是魏老師教給我的，魏老師的困難方法很多，這些你們都會學到的。

中華民國六十一年四月十日