

作用于神经系统的植物药

Walter H. Lewis (美国, 圣路易市华盛顿大学生物学教授)

在整个药物化学领域里, 那一种人工合成药是最成功的? 当然是阿司匹林, 美国人每天要消耗四千四百万片。在全世界除了酒精和尼古丁, 阿司匹林是最广泛使用的药物。

2400多年前, 希腊人就用白柳 (*Salix alba*) 和其它种类的柳树茎皮提取物来治疗疼痛、痛风和其它疾病。同样很久前, 北美印地安人也使用柳树来止痛和解热; 胡玛族人 (*Houmas*) 和阿拉巴马族人 (*Alabamas*) 用黑柳 (*S. niger*) 的根、茎皮的煎液内服和外浴来祛热; 契克骚族人 (*Chickasaws*) 用亮叶柳 (*S. lucida*) 根治头痛; 蒙太尼族人 (*Mentagnais*) 则饮用该植物叶的浸泡液以缓解头痛。他们还把这种植物茎皮捣成糊状, 敷贴在前额止痛。在北美人和欧亚人的民间验方中可以找到许多用各种柳树来缓解疼痛的许多例子。

柳树的这种作用主要是由于水杨甙的生理活性, 最早是于十九世纪从柳属多种植物〔白柳 (*S. alba*), 螺旋柳 (*S. helix*), 五蕊柳 (*S. pentadra*), 早生柳 (*praecox*)〕分离得到; 目前商业上主要来源是生长于欧洲或亚洲的爆竹柳 (*S. fragilis*) 和杞柳 (*S. purpurea*)。水杨甙亦从杨属植物银白杨 (*Populus alba*)、香胶杨 (*P. balsamifera*)、白壳杨 (*P. candicans*)、黑杨 (*P. nigra*) 中得到。现在仍有人用水杨甙作抗风湿药。水杨甙易水解为水杨甙元 (水杨醇), 后者药用为止

痛剂。水杨甙摄取后在体内可能被分解成水杨酸, 该化合物首次于1839年在蔷薇科植物欧洲合叶子 [*Filipendula (Spiracea) ulmaria*] 的花蕾中分得, 几年后就已人工合成。水杨酸是一种有效的消毒剂, 其防腐性可能优于苯酚。水杨酸亦常配成洗剂和软膏剂治疗多种皮肤病, 特别是慢性湿疹, 主要作用是角质分离, 其次是抗细菌和杀灭真菌。

从欧洲合叶子中得到水杨酸后不久, 人们在将其前体水解之后发现, 水杨酸的甲酯化合物就是杜鹃花科平铺白珠树 (*Gaultheria procumbens*) 叶中的冬绿油和桦木科甜桦 (*Betula lenta*) 茎皮中的甜桦油的主要成分。水杨酸甲酯主要用途是作为发红剂, 而以前曾用作抗风湿剂。

同水杨酸甲酯一样, 水杨酸也是抗风湿药, 但在十九世纪广泛应用时, 是迅速而有效地缓解其它类型的疼痛, 如神经痛、坐骨神经痛、肌肉痛和头痛, 它确是最佳的解热剂。遗憾地水杨酸引起严重的胃部不适、呕吐, 以致许多患者宁愿忍受风湿性关节炎的病痛而不愿服药。至1853年, 水杨酸首次以石炭酸为原料人工合成, 并随之合成了许多水杨酸的衍生物, 乙酰水杨酸就是其中的一个。然而, 直到拜尔 (*Bayer*) 公司研究人员寻找一个较好的解热、镇痛和抗风湿剂且无令人厌恶副作用的水杨酸代替品之前, 无人对此合成产品发生疑虑。乙酰水杨酸于

1899年被“再度发现”，它通过了拜尔公司各项技术要求，用“a”代表“acetyl”与其最初发现的植物属名“Spiraea = spirin”合而称为“Aspirin”。

在追溯古代药用柳树皮及由此产生十九世纪许多人工合成的范例—阿司匹林的进展过程之后，在进入二十世纪时，我们继续探讨这些类型的药物是怎样解除病人疼痛和疾患的。

一、中枢神经系统

(一) 抑制剂

1、麻醉药 麻醉药可抑制各类细胞尤其是神经组织细胞的生命功能。全身麻醉药可抑制中枢神经系统使痛觉和意识消失。如果麻醉药用特殊结构，譬如脊髓液，可阻断神经元对所支配器官的神经冲动。仅就外周神经末梢而论，则局麻药可直接用在需要止痛的局部。麻醉前给药的目的是止痛和减少忧虑，常用吗啡、吗啡衍生物、东莨菪碱等。

2、催眠药与镇静药 催眠药是指引起睡眠的药物，镇静药是用以解除紧张和焦虑的药物。催眠药使病人易于入睡，常用于失眠症；而镇静药通常在安全剂量下全天服用，不降低人的知觉和警觉。最常用的催眠药和镇静药是巴比妥酸的衍生物类。其它药物有乙醇、水化氯醛、阿片、氯丙嗪和利血平。对轻度的焦虑紧张症可用眠尔通、安定、利眠宁等一些抗焦虑药。

3、抗精神病药 抗精神病药即主要的安定药，可矫正急性或慢性精神病症候，这类药物的安定作用不同于巴比妥类和大多数催眠药和镇静药，即大剂量通常不产生意识消失和生命中枢抑制。这类药物均为合成产物，氯丙嗪是其代表。

4、抗惊厥药 最常见的惊厥病是癫痫，发病率为5%。投予足够剂量的巴比妥

类药物可治疗惊厥症，首选药是苯巴比妥，它可有效地抑制运动的活动度

儿童舞蹈病的特点是四肢肌和面部肌不规则痉挛性运动，可用利血平治疗。

巴金森氏症是中枢神经系统的胆碱能与多巴胺能神经递质机制间平衡失调的反映。在巴金森氏症患者大脑中正常存在的多巴胺有选择地减少，结果胆碱能占优势。因此治疗途径可以从给予抗胆碱能药和增加多巴胺两方面着手。遗憾的是多巴胺不易透过血脑屏障，而其前体左旋多巴则能通过。左旋多巴首先于1913年从蚕豆 (*Vicia faba*) 中得到，是已知最有效的抗巴金森氏症药物。给药6个月或更长时间，疾病缓解率到显效率为50%~90%左右。长期服用并未发现其它药物经常出现的疗效降低，但常见的副作用有消化道、心血管和精神的紊乱。阿托品、东莨菪碱和许多合成的抗胆碱能药，由于作用较差，故仅用于轻度的病例或那些不能耐受左旋多巴的患者。

Garcia等最近报导，鸭跖草科植物佛焰苞紫万年青 (*Rhoeo spathacea*) 叶片的紫色部分，含存的药理活性成分是多巴胺。显然，这种植物对于治疗巴金森氏病具有潜在的价值。

5、镇痛药 解除疼痛的药物称为镇痛药。有许多不同类型的疼痛：头痛、脓肿的跳痛、骨折的持续痛、心绞痛和心肌梗塞的剧痛。人们考虑这样或那样的疼痛，其主要目的应从疼痛的描述中得出充分的根据，便于对症下药解除病痛。

强效镇痛药基本是一些从罂粟 (*Papaver somniferum*) 未成熟蒴果乳汁制得的阿片中分离出的生物碱，以及人工合成的具有相近性质的一些阿片类 (Opioids) 药物。合成许多阿片类药物的目的是试图克服天然生物碱的许多缺点，但是至今没有获得满意的结果。吗啡是阿片中最重要也是含量最多的一种生物碱 (3~20%)；它是强效

镇痛药，口服、吸烟或注射均易吸收，用药后30分钟起效，可持续达12小时。

从罂粟中分离的25*种生物碱，包括可待因、那可汀、蒂巴因、那碎因和罂粟碱等主要的几种。可待因是弱镇痛药，几乎没有欣快作用，多用作止咳药或同阿司匹林或其他弱镇痛药配合治疗关节炎痛、头痛或感冒。

另一类弱镇痛药还兼具解热作用，少数也具有抗炎作用。阿司匹林是最常用的。因它具有镇痛和抗炎作用，也可用于治疗某些风湿性疾病。

许多植物含有镇痛或麻痹感觉的物质，如夹竹桃科的二歧狗牙花 (*Evatamia dichotoma*)、橄榄科的印度乳香 (*Boswellia serrata*)、菊科的茺蔚叶菊 (*Chrysanthemum anethifolium*)，但它们只限于家庭用药和民间用药。

(二) 兴奋药

1、抗忧郁药 忧郁症是常见的精神紊乱症。患有对社会环境不顺应、表情淡漠和忧郁的病人常服用某些抗忧郁药。苯丙胺类是最常开用的兴奋剂。其它最常用的为：单胺氧化酶抑制剂类，如异丙异烟肼、苯乙肼、反苯环丙胺以及二苯吡啶衍生物 (*Dibenzazepine*)，如丙咪嗪、阿密替林，但是这些合成药副作用严重，务须控制使用。

作用弱的中枢神经兴奋药，咖啡因、茶碱、可可碱，均能不同程度地兴奋中枢神经系统，而且大脑皮层最易受到影响。它们的主要作用是产生清醒的思维，祛除疲劳和瞌睡。一或两杯咖啡就足以提高条件反射的运动效应和增进大脑功能。此外，这些生物碱还可兴奋髓质的呼吸、迷走和血管运动中枢。

2、惊厥药和回苏药 惊厥药和回苏药可兴奋和刺激中枢神经系统的许多部位。其中最重要是对髓质的作用—小剂量用作兴奋药

或回苏药；不过这些药大剂量都可引起全身惊厥。临床上，这类药物对各种抑制药过量用药引起的生命功能衰竭是最有效的治疗剂。

士的宁是最为熟知的致惊剂，从产于南亚和澳大利亚的马钱 (*Strychnos nux-vomica*) 和吕宋豆 (*S. ignatii*) 干燥种子中得到的生物碱。番木鳖碱也是从这些植物中提取的。毒性低于士的宁。两种药都不常用于现代临床实践，但由于士的宁兴奋髓质的血管运动和迷走神经中枢，并显著增强触觉、嗅觉、听觉和视觉能力，故多用于神经病学的研究中，籍以阐明惊厥药的作用。士的宁亦作用于消化道，其苦味可增进食欲，对肠道的兴奋作用可用于便秘的治疗。

另一种有强力兴奋剂是倍半萜烯类化合物，称为印防己毒素 (*Picrotoxin*) 是从东南亚生长的防己科一种木本攀缘植物印度防己 (*Anamirta cocculus*) 的干果中得到的。它能有效地解除巴比妥类或吗啡引起的呼吸抑制，因此可用作上述药物中毒的解毒药。现知印防己毒素是阻断突触前的抑制而作用于脊髓。

具有和士的宁同效的惊厥药是兜状荷包牡丹碱 (*Bicuculline*)，是从罂粟科凹菫 (*Corydalis cava*) 中分离的生物碱。它是γ-氨基丁酸 (GABA) 对中枢神经元抑制作用的特殊的和逆转的拮抗剂。故其作用部位可能在大脑内那些以GABA为主要神经递质的区域。

从桔梗科祛痰菜 (*Lobelia inflata*) 提出的山梗菜碱，也是一种作用类似烟碱的强效生物碱，可兴奋呼吸作用，因而用以抢救服用麻醉药品过量的患者。

3、致幻药 尽管产生可逆性毒性幻觉症的药物不作治疗用途，但许多药物例如阿托品，用药过量则产生致幻作用。

(三) 外围神经系统

1、感觉或传入神经 局麻药和抗刺激

* 注：原文如此，据查应为35—校者。

药广泛用以缓解外周部位疼痛。抗刺激药是那些可在皮肤搓擦透入皮肤产生一定程度的刺激作用。刺激感觉神经并通过血管扩张神经使小动脉舒张，从而改善局部血液循环，促使皮肤发红或发热，并缓解某些类型的疼痛。例如甲基水杨酸擦剂、樟脑擦剂、芥末硬膏。

局麻药甚至很低浓度便能削弱神经纤维的传导，并迅速缓解疼痛。高浓度的局麻药也能阻滞躯体运动神经元和突触，并降低骨骼肌神经元对乙酰胆碱的反应性。柯卡 (*Erythoxylum coca*) 中存在的生物碱可卡因是一种众所周知的局麻药，但临床上更重要和有效的是合成物质，如利多卡因、普鲁卡因和苯佐卡因等。

2、躯体运动神经系统 毒扁豆 (*Physostigma venenosum*) 中提取的毒扁豆碱，可通过其抗胆碱酯酶作用而延长神经冲动传递到随意肌的效应，可治疗重症肌无力，但目前主要用在眼科。另外欧洲许多地方用华氏雪花莲 (*Galanthus waronowii*)，夏雪片莲 (*Leucojum aestivum*) 和胜利翁奇 (*Ungernia victoris*) 中提得的雪花莲胺碱治疗重症肌无力。

可以推断，如果药物在神经骨骼肌接头处阻断乙酰胆碱受体部位，就可以引起可逆性骨骼肌麻痹作用。这些肌松剂包括箭毒。箭毒是从里渥马钱 (*Strychnos castelaneii*)、毒马钱 (*S. toxifera*)、卡来氏马钱 (*S. crevauxii*) 和防己科植物毛刚多树 (*Chondodendron tomentosum*) 的皮和茎中提出的一种粗制干浸膏，是南美印地安人长久使用的箭头毒物。箭毒中毒可使呼吸器官麻痹而致死。

各个印地安人部族所用箭毒的成分是不同的，一般根据习惯改变配方，但箭毒中最重要的成分是从毛刚多树中得到的异喹啉类生物碱D——筒箭毒碱 (*Tubocurarine*)。在不需深度麻醉的外科手术中用作肌肉松弛

剂和用于控制土的宁中毒的惊厥。从刺桐属 (*Erythrina*) 的热带种类中得到的一族生物碱具有类似箭毒样的活性，但已不用于临床。

(四) 自主神经系统

1、胆碱能神经 毒蕈碱的作用部位

(1) 许多物质可产生拟似胆碱能神经元兴奋作用，如乙酰胆碱、氯化氨甲酰胆碱、拟胆碱类生物碱和抗胆碱酯酶药类。拟胆碱类生物碱中，如毒蕈碱可从蛤蟆菌 (*Amanita muscaria*)、豹斑鹅膏菌 (*A. pantherina*)、灰黄牛肝菌 (*Boletus luridus*)、魔王牛肝菌 (*B. satanus*)、白杯伞菌 (*Clitocybe dealbata*)、和毒红菇 (*Russula emetica*) 中得到；槟榔碱可从槟榔 (*Areca catechu*) 中得到；毛果芸香碱可从毛果芸香 (*Pilocarpus jaborandi*)、羽叶毛果芸香 (*P. ponnatifolius*)、小叶毛果芸香 (*P. microphyllus*)、刺毛果芸香 (*P. spicatus*)、糙片毛果芸香 (*P. trachylopus*) 中得到。抗胆碱酯酶药类包括毒扁豆碱和许多合成产物。

(2) 其它拮抗或抑制乙酰胆碱毒蕈碱样作用的药物：包括从多种茄科植物中得到的阿托品、东莨菪碱；罂粟中得到的罂粟碱；以及从茄科山莨菪 (*Anisodus tanguticus*) 中得到的山莨菪碱 (8-羟基阿托品)，据报道它的解痉作用比阿托品还强。

2、胆碱能神经 烟碱样作用部位 有些药物在自主神经节的节前与节后神经元接头处作用占优势。包括乙酰胆碱兴奋药如烟碱〔从烟草 (*Nicotiana tabacum*) 中得到〕和抑制药包括从腊肠状芽胞杆菌 (*Clostridium botulium*) 中提得的毒素，可阻止乙酰胆碱的释放；以及一些合成药 (六炔季胺、美加明、五甲哌啶)。

3、肾上腺素能神经 其它作用在交感神经元与平滑肌或腺体接头处的药物，兴奋剂有去甲肾上腺素、肾上腺素、多巴胺、麻

黄素等；其中只有麻黄素是易得的天然生物碱，它从麻黄 (*Ephedra sinica*) 和木贼麻黄 (*E. equisetina*) 中得到，且可人工合成。拮抗剂中有从萝芙木属多种植物中得到的利血平和从麦角菌 (*Claviceps purpurea*) 中得到的麦角胺以及溴苄胺、胍乙啶、酚妥拉明、心得安等合成药。

二、神经系统有关疾病和活 动

(一) 儿童多动症

儿童多动症的特征是好动、注意力不集中和学习差，属于天性的功能发育未全、情感紊乱或散在性脑损害所致。目前认为环境因素如食品中的人造调味剂和色素添加剂可促发某种过敏反应类型的多动症。右旋苯丙胺是治疗多动症的首选药物，但是有食欲减退、失眠、面部改变等副作用。最近 Schnackenberg 报告：两杯咖啡（相当于 200 ~ 300mg）足使多动症儿童安静正常，既不需要昂贵的药物治疗也不产生讨厌的副作用。

(二) 躁狂精神病

定时给予碳酸锂是最有效的治疗。最近证实这一古老药物不仅能平息躁狂发作并可预防未来的严重情绪波动。

(三) 记忆过程

给小鼠注射士的宁，可使学习能力明显改善，并有益于记忆。

(四) 周期性偏头痛

麦角胺可对抗脑血管扩张，是治疗偏头痛的急性发作的首选用药。与咖啡因、东莨菪碱、阿托品等合用，则效果更好。

(五) 晕动病

如果在舟、车、飞机上症状持续存在，可考虑顿服小剂量东莨菪碱是有益的。

(六) 风湿病和关节炎

可用免疫抑制药如皮质激素类、烷化剂、抗叶酸盐类等治疗，虽然常有较严重的

副作用。弱镇痛剂如阿司匹林仍是治疗风湿病和关节炎最常用的药物。

(七) 安眠药精神病

过多服用安眠药可诱发幻觉和精神分裂症。注射毒扁豆碱可改善大多数患者这种药源性症状。

三、草药疗法

(一) 关节炎和风湿病

Jarvis 介绍一种佛蒙特州治疗关节炎的民间药方：苹果汁醋、蜂蜜、卢戈氏液（碘）和 Parkelp（海藻）片再加上精心选择的日常饮食。显然这种治疗缺乏科学依据，许多目前广为推荐的非正统验方同样缺乏科学依据。

美洲槲木 (*Aralia racemosa*)：柴拉基几族人 (Cherokees) 和阿帕拉契 (Appalachian) 白人用这种植物的根煮茶，治疗背痛及风湿性关节炎。

伞形梅笠草 (*Chimaphila umbellata*)：卡陶巴人 (Catawbas) 药用治疗背痛。

兰龙胆 (*Gentiana catesbaei*)：卡陶巴人用热水浸泡本植物的根，用其浸液治疗背痛。

美洲金缕梅 (*Hamamelis virginiana*)：许多美洲印地安人将该植物的茎和叶煎汁，作擦剂外用治疗背痛、背部炎症。

斑点香蜂草 (*Monarda punctata*)：卡陶巴人将本植物叶捣碎，放入冷水中浸泡，饮服浸液缓解背痛。

美洲商陆 (*Phytolacca americana*)：佛吉尼亚州巴蒙凯印地安人 (Pamunkey indians) 煮煎本种植物的果实代茶，饮服治疗风湿病；也内服治疗慢性风湿病。

美洲血根草 (*Sanguinaria canadensis*)：拉帕汗罗克人 (Rappahannocks) 和密西西比河流域的印地安人用这种植物的浸液作饮料，治疗风湿病。

(二) 惊厥、痉挛、癫痫

曼陀罗 (*Datura Stramonium*): 在欧洲该植物的提取物和种子常用治躁狂症、癫痫、忧郁症、风湿病、惊厥和疯狂症。

(三) 抑制药和镇静药

杓兰属多种植物 (*Cypripedium Spp*): 这些植物曾被认为是有效的神经镇静药, 并广泛作家庭用药治疗癔病、神经痛等。印地安人用治各种神经疾患, 并通过其止痛作用治疗癔病发作, 消除紧张和改善睡眠。

粉色西番莲 (*Passiflora incarnata*): 过去曾作为镇静剂治疗失眠、各种惊厥及痉挛性疾病。又具有止痛作用, 用治各种神经痛、癫痫。目前仍是某些安眠药片的组成成分。

缬草 (*Valeriana officinalis* 和 华氏缬草 (*V. wallichii*): 缬草油有抑制整个中枢神经系统作用, 有些医生用它治疗癔病、疑病、精神不安和失眠, 另外还用作癫痫病的抗惊厥剂。缬草属植物中具有镇静作用的主要成分是单萜烯化合物缬草素 (*Valepotriotes*), 已在欧洲广泛使用。

(四) 发热

多花狗木 (*Cornus florida*): 从前乡村医生的处方, 常用该植物的花、果实和茎皮的浸液, 制成苦味的饮料, 治疗风寒发烧。这种治疗方法可从东美洲印地安人那里查询到, 他们早就应用狗木作解热剂。

贯叶泽兰 (*Eupatorium perfoliatum*): 从前的美国医生和印地安人都称赞这种植物的抗间歇热、关节炎、痛风、癫痫作用。贯叶泽兰实际上是一种万应药, 在当时比较考究的家庭都备有此药; 南部联邦军队亦曾广泛饮用其热浸液退热和作奎宁的代用品。

南部杨梅 (*Myrica cerifera*): 路易斯安那州的乔靠族人 (*Chockaws*) 水煮其叶、茎、制成汤剂退热。

伞房花耳草 (*Oldenlandia corymbosa*): 在印度用其煎剂治疗弛张热如疟疾、波

状热; 将药液涂于手心和脚底缓解发热时的烧灼感。又用作抗精神忧郁症。

(五) 头痛

长果银莲花 (*Anemone cylindrica*): 麦斯克华克依族人 (*Meskwakis*) 将该植物根作茶剂, 饮服治疗头痛和眩晕。

深红天南星 (*Arisaema atrorubens*): 帕尼人 (*Pawnees*) 将该植物的根研细, 干燥; 将细粉撒在头部和太阳穴上止痛。

胡薄荷 (*Hedeoma pulegioids*): 印地安人认为用这种植物治疗四肢任何部位的疼痛都可产生迅速止痛的效果。安伦达加族人 (*Onondagas*) 用这种芳草制成茶剂, 饮服治疗头痛。印地安人则搓擦其同属植物 *H. reverchoni* 的嫩枝, 嗅其香味治疗持续性头痛。

臭菘 (*Symplocarpus foetidus*): 密克马克人 (*Micmacs*) 压榨其叶, 吸入刺激性油治疗头痛。然而服用过量的本种植物根茎则引起恶心、呕吐、眩晕、视力模糊和头痛。

(六) 失眠

蔓虎刺 (*Mitchella repens*): 美诺密尼人 (*Menominees*) 服用这种植物叶片的茶剂, 治疗失眠。

美洲茄 (*Solanum americanum*): 雷帕海诺克人 (*Rappahanocks*) 用大量水浸泡少量叶片, 饮服浸液治疗失眠。

(七) 精神病

Watt 列举了 19 种治疗精神病的非洲植物药。其中着重地提到无毛花铁屎米 (*Canthium glabriflorum*) 的根、叶和毛马槟榔 (*Capparis tomentosa*) 的茎皮。还提到美洲人对一些疾病如癔病、健忘症和眩晕的其它疗法。

(八) 神经痛

最近印度人用一种当地药方与异烟肼配合治疗三叉神经痛取得极好疗效。这种专利药片的组成包括: 摩氏马槟榔 (*Capparis*

mōonii)、二雌云实(Caesalpinia digyna)、催眠茄(Withania somnifera)、心叶青牛胆(Tinospora cordifolia)、大蒜和其它植物,但不知那一种植物或那几种植物的复方组分对这种外周神经痛是必需的。

(参考文献25篇,略)

[Walter H. Lewis et al: Medical Botany《医用植物学》, Chapter 6, John Wiley & Son, New York 1977(英文)]

阎政译 苏中武删节并校 张紫洞审

氯霉素老药新用的瞻望

Dwight A. Powell等(美国,俄亥俄州大学医药学院)

氯霉素是过去几年来在临床应用上重新复活的少数抗生素之一。尽管该药已流行了20多年,由于严重的不良反应,它的应用已经受到限制。然而,随着流感嗜血杆菌b型菌株对氨苄青霉素产生抗药性,本品用于治疗年幼儿童细菌性脑膜炎已承担了重要的第一线药物的作用,目前在抗氨苄青霉素的b型流感嗜血杆菌引起的感染治疗中是一种首选药物。因此,最近有许多关于应用较新分析技术检验并重新阐述氯霉素、棕榈酸氯霉素、琥珀酸氯霉素药物动力学文章的报道。本文的重点是就药物生物利用度和代谢的新观点去综述氯霉素的临床应用,特别对婴儿和儿童。

药理作用

氯霉素的化学结构中含有硝基苯环连接于丙二醇和结合二氯醋酸衍生物的酰胺基团。本品的抗菌活性取决于完整的丙二醇和二氯醋酸部份。它是脂溶性分子,在水中最大的溶解度25℃时为2.5~4 mg/ml。琥珀酸氯霉素和棕榈酸氯霉素是本品两种有效的

酯化形式,必须水解成氯霉素才能获致生物活性。

氯霉素的抗菌作用取决于它对细菌核蛋白体50s亚基的结合。这种结合可阻止一个完全的氨酰转移RNA同菌核蛋白体连接,从而抑制了肽链的形成。氯霉素可逆地结合到核蛋白体的蛋白部份,当每一个核蛋白体结合一个氯霉素分子时,则蛋白质合成的抑制似达最大限度。

抗菌谱

氯霉素的抗菌活性是广谱的。在体外能抑制大多数革兰氏阳性和革兰氏阴性菌的繁殖(表1)。虽然早期的研究认为本品确是一种抑菌剂,但新近的资料证明对重要的人类致病菌如流感嗜血杆菌和肺炎链球菌具有杀菌活性。Rahal和Simberkoff指出,用0.78μg/ml的浓度能100%地杀死11种菌株的流感嗜血杆菌;用12.5μg/ml的浓度能100%地杀死10种菌株的肺炎链球菌。而另一种重要的人类致病菌即脑膜炎双球菌则要在50μg/ml以上的浓度才能杀死;不过象