

English—Chinese  
**Dictionary of  
Antibiotics**

**英汉抗生素  
词典**

张致平 姚天爵 编



化学工业出版社

# 英汉抗生素词典

English-Chinese  
Dictionary of Antibiotics

张致平 姚天爵 编



化学工业出版社

· 北 京 ·

## 图书在版编目(CIP)数据

英汉抗生素词典/张致平, 姚天爵编. —北京: 化学工业出版社, 2005.10  
ISBN 7-5025-7798-X

I. 英… II. ①张…②姚… III. 抗生素-词典-英、汉 IV. R978.1-61

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2005) 第 126045 号

---

### 英汉抗生素词典

English-Chinese

Dictionary of Antibiotics

张致平 姚天爵 编

责任编辑: 徐 蔓 李彦玲

责任校对: 李 林

封面设计: 于 兵

\*

化学工业出版社出版发行

(北京市朝阳区惠新里 3 号 邮政编码 100029)

购书咨询: (010) 64982530

(010) 64918013

购书传真: (010) 64982630

<http://www.cip.com.cn>

\*

新华书店北京发行所经销

北京云浩印刷有限责任公司印刷

三河市万龙印装有限公司装订

开本 880mm×1230mm 1/32 印张 23¼ 字数 1686 千字

2006 年 10 月第 1 版 2006 年 10 月北京第 1 次印刷

ISBN 7-5025-7798-X

定 价: 58.00 元

---

版权所有 违者必究

该书如有缺页、倒页、脱页者, 本社发行部负责退换

## 前 言

抗生素泛指由微生物产生的生物活性物质。自然中生物体的拮抗作用是抗生素产生的基础。一种生物体为抵抗他种生物的伤害产生的抑制他种生物的生长发育甚至杀死它们的代谢产物现今已由人们利用并不断造福人类。

早期的抗生素主要作抗感染的药物。现已扩展为抗肿瘤、与生理病理相关的酶抑制剂、受体拮抗剂、作用于免疫应答体系与各种细胞应答以及具有其他药理活性的物质。并已将其用途扩展到医学之外的工业、农业、畜牧、养殖、食品、轻工等广泛领域。

自青霉素发现以来, 抗生素的发现以及用途的扩展速度惊人。据报道, 现发现的抗生素类微生物产生的生物活性物质已逾万种, 并以每年百种的速度增长, 人们也同时在不断地修饰其结构, 改善其功能, 探索解决其应用中存在的问题, 使抗生素的发展蒸蒸日上, 成为人们战胜疾病的有力武器且创造了巨大的社会效益和经济效益。

本词典汇集国内外报道的抗生素与微生物产生的生物活性物质的主要生物和理化特性, 还收集了天然物的重要结构修饰物, 包括生物转化、基因工程与半合成等品种, 也简释了抗生素与微生物产生的生物活性物质研究与应用领域中的重要名词与术语。每个词条后面注明了文献来源, 可供从事有关工作的人员参考。

本词典共收集抗生素及相关词汇 5000 余条。以英文字母顺序排列, 给出其中文译名、结构、物性、作用及文献来源。

由于本词典内容涉及的时间跨度较大, 原始报告繁简各异, 而各种期刊表达的重点与方式又不尽相同。编者水平有限, 虽已做了较大努力, 力求完整规范, 但疏漏、不当与错误之处在所难免, 殷切期望读者提出宝贵指正。

编 者

2005 年 10 月

# 凡 例

## 一、词典内容

本词典共收集了抗生素与微生物产生的生物活性物质有关的词目 6000 余条。

## 二、词典编排

本词典按英文部分(黑体)的顺序排列。词目中的空格、阿拉伯数字、希腊字母及其他非拉丁字母,化学名称中表示位号与构型的斜体英文字母 *R*, *S*, *cis*, *trans* 和正体英文字母 *D*, *L*, *DL*, 以及作为词目中附加成分的拉丁字母(如上角、下角)均不参加排序。词目外文字母完全相同时,大写字母排在小写字母之前,正体字母排在斜体字母之前;如外字母及大小写、正斜体完全相同时,按照词目中其他成分排列,排列顺序如下:无附加成分、空格、符号、数字(阿拉伯数字和罗马数字)、拉丁字母、希腊字母、其他字母。

## 三、缩写词与符号

本词典所涉及的缩写词与符号如下。

|                     |                |                    |              |
|---------------------|----------------|--------------------|--------------|
| Ac                  | 乙酰基            | EC                 | 酶编号(国际生化联合会) |
| 7-ACA               | 7-氨基头孢烯酸       | EC <sub>50</sub>   | 半数有效浓度       |
| Aba                 | $\alpha$ -氨基丁酸 | ED <sub>50</sub>   | 半数有效剂量       |
| ADP                 | 腺苷二磷酸          | ELISA              | 酶联免疫吸附测定     |
| Aib                 | $\alpha$ -氨基丁酸 | Et                 | 乙基           |
| Ala                 | 丙氨酸            | GC                 | 气相色谱         |
| 6-APA               | 6-氨基青霉烷酸       | Gln                | 谷氨酰胺         |
| Asp                 | 天冬氨酸           | Glu                | 谷氨酸          |
| AUC                 | 药时曲线下面积        | Gly                | 甘氨酸          |
| Boc                 | 叔丁氧羰基          | His                | 组氨酸          |
| Bu                  | 丁基             | <sup>1</sup> H-NMR | 质子核磁共振       |
| <i>t</i> Bu         | 叔丁基            | HPLC               | 高效液相色谱       |
| <i>i</i> Bu         | 异丁基            | Hyp                | 羟脯氨酸         |
| Bzl                 | 苄基             | IC <sub>50</sub>   | 半数抑制浓度       |
| cfu                 | 菌落形成单位         | ID <sub>50</sub>   | 半数抑制剂量       |
| CL                  | 清除率            | Ile                | 异亮氨酸         |
| <sup>13</sup> C-NMR | 碳 13 核磁共振      | ILS                | 延长存活期        |
| C <sub>max</sub>    | 最高血药浓度         | IR                 | 红外吸收光谱       |
| Cys                 | 半胱氨酸           | K                  | 平衡常数         |
| DMF                 | 二甲基甲酰胺         | K <sub>m</sub>     | Michaelis 常数 |
| DMSO                | 二甲基亚砷          | LD <sub>50</sub>   | 半数致死量        |
| DNA                 | 脱氧核糖核酸         | Leu                | 亮氨酸          |
| 2D-NMR              | 二维核磁共振         | Lys                | 赖氨酸          |

|                  |          |              |            |
|------------------|----------|--------------|------------|
| MBC              | 最低杀菌浓度   | Pr           | 丙基         |
| Me               | 甲基       | Pro          | 脯氨酸        |
| MeO              | 甲氧基      | RNA          | 核糖核酸       |
| Met              | 甲硫氨酸     | Sar          | 肌氨酸        |
| MIC              | 最低抑制浓度   | Ser          | 丝氨酸        |
| Bz               | 苯甲酰基     | $t_{1/2}$    | 半衰期        |
| MLD              | 最小致死量    | T/C          | 治疗/对照比(指数) |
| MLR              | 混合淋巴细胞反应 | Thr          | 苏氨酸        |
| MS               | 质谱       | $T_{max}$    | 达到最高浓度时间   |
| NMR              | 核磁共振     | Trp          | 色氨酸        |
| Orn              | 鸟氨酸      | Tyr          | 酪氨酸        |
| PCR              | 聚合酶链反应   | UV           | 紫外吸收光谱     |
| PD <sub>50</sub> | 半数保护剂量   | Val          | 缬氨酸        |
| Ph               | 苯基       | $[\alpha]_D$ | 比旋光度       |
| Phe              | 苯丙氨酸     | Iva          | 异缬氨酸       |
| TLC              | 薄层层析     |              |            |

#### 四、说明

1. 本词典为了篇幅和版面的需要, 将一些常用单位略去。如: IC<sub>50</sub> 单位为  $\mu\text{g/ml}$ , MIC 单位为  $\mu\text{g/ml}$ , ID<sub>50</sub> 单位为  $\text{mg/kg}$ 。
2. 每条后的括号内为参考文献。
3. 本词典英文词条首字母均大写。

## 欢迎加入化学工业出版社读者俱乐部

您可以在我们的网站 ([www.cip.com.cn](http://www.cip.com.cn)) 查询、购买到数千种化学、化工、机械、电气、材料、环境、生物、医药、安全、轻工等专业图书以及各类专业教材, 并可参与专业论坛讨论, 享受专业资讯服务, 享受购书优惠。欢迎您加入我们的读者俱乐部。

### 两种入会途径 (免费)

- ◇ 登录化学工业出版社网上书店 ([www.cip.com.cn](http://www.cip.com.cn)) 注册
- ◇ 填写以下会员申请表寄回 (或传真回) 化学工业出版社

### 四种会员级别

- ◇ 普通会员    ◇ 银卡会员    ◇ 金卡会员    ◇ VIP会员

### 化学工业出版社读者俱乐部会员申请表

|           |         |     |
|-----------|---------|-----|
| 姓名:       | 性别:     | 学历: |
| 邮编:       | 通讯地址:   |     |
| 单位名称:     | 部门:     |     |
| 您从事的专业领域: | 职务:     |     |
| 电话:       | E-mail: |     |

◆ 您希望出版社给您寄送哪些专业图书信息? (可多选)

☐ 化学 ☐ 化工 ☐ 生物 ☐ 医药 ☐ 环境 ☐ 材料 ☐ 机械 ☐ 电气 ☐ 安全 ☐ 能源 ☐ 农业  
☐ 轻工 (食品/印刷/纺织/造纸) ☐ 建筑 ☐ 培训 ☐ 教材 ☐ 科普 ☐ 其他 ( )

◆ 您希望多长时间给您寄一次书目信息?

☐ 每月1次    ☐ 每季度1次    ☐ 半年1次    ☐ 一年1次    ☐ 不用寄

◆ 您希望我们以哪种方式给您寄书目? ☐ 邮寄纸质书目 ☐ E-mail电子书目

此表可复印, 请认真填好后发传真至**010-64982630**, 或者寄信至: 北京市朝阳区惠新里3号化学工业出版社发行部 读者俱乐部收 (邮编100029)

### 联系方式:

网上书店 电话: 010-64982511

E-mail: [cip64982511@126.com](mailto:cip64982511@126.com)

读者俱乐部及邮购 电话: 010-64982530

E-mail: [goushu999@126.com](mailto:goushu999@126.com)

# 目 录

前言

凡例

正文 ..... 1

中文索引 ..... 695

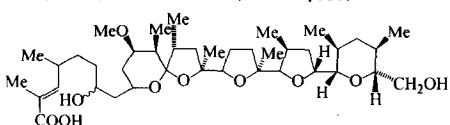
**Aabomycin** 阿博霉素 链霉菌 *Streptomyces hygroscopicus* var. *aabomyceticus* 产生的抗生素。C<sub>39</sub>H<sub>65</sub>O<sub>11</sub>N, 无色针状结晶, 熔点 144~145°C,  $[\alpha]_D^{25} + 93.5^\circ$  (c 1.0, CHCl<sub>3</sub>), 不溶于水。未报告结构。具有抗稻梨孢(稻瘟病菌)与红色发癣菌活性。小鼠可耐受 100mg/kg(静注)。(J. Antibiot. 1969, 22, 457, 463)

**Aabomycin X** 阿博霉素 X *Streptomyces hygroscopicus* subsp. *aabomyceticus* 325-17 (ATCC 21449) 产生的抗生素。C<sub>39</sub>H<sub>66</sub>O<sub>10</sub>N, 无色针状结晶, 熔点 168~170°C。具有抗革兰阳性细菌、皮肤真菌与植物病原真菌活性。此菌株还产生阿博霉素。(Jpn. Kokai. 77 90697, 1977)

**Abbeymycin** 阿贝霉素 *Streptomyces* sp. AB-999F52 产生的抗生素, C<sub>13</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, 无色片状结晶, 熔点 142~144°C(分解), 溶解于水、甲醇与 DMSO, 不溶于丙酮、乙酸乙酯与氯仿。 $[\alpha]_D^{25} + 303^\circ$  (c 0.741, 水)。抗菌谱窄, 仅对若干厌氧菌(如脆弱类杆菌、多形类杆菌、消化球菌与消化链球菌等)有微弱抗菌活性。小鼠 LD<sub>50</sub> 36.2(腹腔)。(J. Antibiot. 1987, 40, 145)

**Abicoviomycin** 阿毕病毒素 链霉菌 *Streptomyces abicovensis* 与 *Str. rubescens* 产生的抗生素, 与拉杜杀菌素为同一物质。C<sub>10</sub>H<sub>11</sub>NO, 熔点 140~141°C(分解),  $[\alpha]_D + 24^\circ$  (c 1.0, H<sub>2</sub>O)。苦味酸盐的熔点为 137~140°C(分解)。以 LiAlH<sub>4</sub> 或 NaBH<sub>4</sub> 还原, 得二氢化物, 熔点 60~61°C。1: 8000000 稀释液有抗东西方马脑炎病毒作用, 对委内瑞拉型病毒无作用。小鼠 LD<sub>50</sub> 7.7~8.3(静注); 96~104(皮下)。(J. Antibiot. 1951, 5, 469; 477, 1958, 11A, 231)

**Abierixin** 阿比利醚 *Streptomyces albus* NR-RL B-1865 产生的聚醚类抗生素。C<sub>49</sub>H<sub>68</sub>O<sub>11</sub>, 无色结晶, 熔点 83~85°C,  $[\alpha]_D^{25} + 45^\circ$  (c 0.03, 甲醇), 溶解于低级醇、氯仿, 不溶于水。具有良好的抗球虫与微弱的抗菌和离子载体活性。小鼠 LD<sub>50</sub> 600(口服)。(J. Antibiot. 1985, 38, 1655; 680)

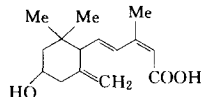


**Abkhasomycin** 阿布哈霉素 链霉菌 *Streptomyces badiocolir* var. *abkhasus* 产生的四烯类真菌抗生素, 未报告分子式与结构。(Antibiotiki

(Russ), 1975, 20; 195)

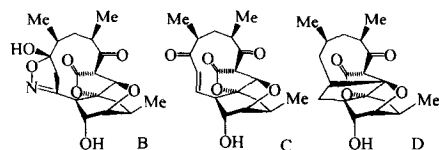
**Ablastomycin** 阿布拉丝霉素, 除瘟霉素 链霉菌 *Str. aburaviensis* var. *Ablastomyceticus* 产生的核苷类抗生素。C<sub>18</sub>H<sub>31</sub>N<sub>5</sub>O<sub>10</sub>, 熔点 163~165°C(分解),  $[\alpha]_D^{25} + 60^\circ$  (c 0.5, H<sub>2</sub>O)。未报告结构。具有抗霉菌与酵母活性。(J. Antibiot. 1968, 21, 37)

**Abiscic acid analog** 脱落酸同系物 菜豆尾孢 *Cercospora cruenta* 产生的稻秆苗生长抑制剂。C<sub>15</sub>H<sub>22</sub>O<sub>3</sub> 酸性, 油状物,  $[\alpha]_D^{16} + 2.5^\circ$  (c 0.4, 乙醇)。(Agric. Biol. Chem. 1984, 48, 1677)



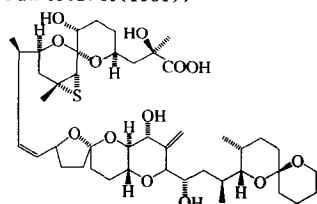
**Aburamycin** 阿布拉霉素, 油霉素 *Streptomyces aburaviensis* 产生的色霉素类抗肿瘤抗生素, 为多组分复合物。A, B, D 分别与色霉素 A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub>, A<sub>4</sub> 相同; C 与 7-甲基橄榄霉素、去乙酰色霉素 A<sub>2</sub> 相同。阿布拉霉素复合物为黄色结晶性粉末, 熔点 163~165°C, 具有抗革兰阳性细菌活性, 但对小鼠肺炎链球菌感染无效。对艾氏腹水癌有明显抑制作用。小鼠 LD<sub>50</sub> 2(静注), 2.5(皮下), 20(口服)。(J. Antibiot. 1956, 10A, 205)

**Abyssomicin** 阿比索霉素 海洋微生物 *Verrucospora* AB-18-032 产生的对氨基苯甲酸生物合成途径抑制剂, 分离纯化出 B, C, D 三组分, 结构如下。C 具有抗菌活性, 抗 MRSA 与金黄色葡萄球菌 Mu50 的 MIC 为 4 与 13。B 与 D 无活性。(J. Antibiot. 2004, 57, 271)



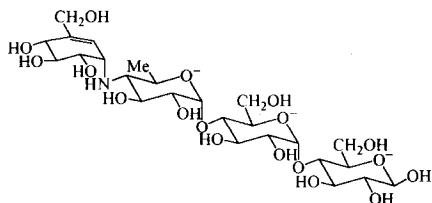
**7-ACA** 见 7-Aminocephalosporanic acid(21 页)。

**Acanthofolacin** 阿堪醚 *Pandarus ananthifolium* 产生的聚醚类抗生素, C<sub>44</sub>H<sub>68</sub>O<sub>13</sub>S, 结晶, 熔点 169°C,  $[\alpha]_D + 25.3^\circ$  (c 0.008, 氯仿), 具有细胞毒与抗肿瘤活性, 用作生长促进剂与驱球虫剂。(U. S. Pat. 4302740(1981))

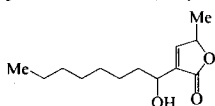


**Acanthomycin** 刺霉素 *Streptomyces spiss-nosus* subsp. *acanthus* (NRRL 11081) 产生的抗生素。(C<sub>60</sub>H<sub>135</sub>N<sub>19</sub>O<sub>42</sub>)<sub>n</sub>, 酸性, 无色无定形粉末,  $[\alpha]_D^{20} - 28.5^\circ$  (c 1, DMSO), 未报告结构。具有抗革兰阳性细菌活性。

**Acarbose** 阿卡波糖 游动放线菌 *Actinoplanes* sp. 产生的  $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制剂。C<sub>25</sub>H<sub>43</sub>NO<sub>18</sub>,  $[\alpha]_D^{18} + 165^\circ$  (c 1.0, H<sub>2</sub>O)。进行了生物合成研究, 并已全部合成, 现用于治疗糖尿病。(Drugs 1888, 35:214)

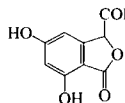


**Acaterin** 阿卡特灵 又称 3-(1-Hydroxy-2-methyl-5-methyl-2(5H)-faranone *Pseudomonas* sp. A92 产生的酰基辅酶 A : 胆固醇酰基转移酶 (Acyl-CoA : cholesterol acyltransferase, ACAT) 抑制剂。C<sub>13</sub>H<sub>22</sub>O<sub>3</sub>, 浅棕色油状物。在巨噬细胞 J774 中抑制氧化低密度脂蛋白存在下的胆固醇酯合成, IC<sub>50</sub> 45  $\mu$ mol/L, 抑制大鼠肝脏微粒体 ACAT 的 IC<sub>50</sub> 120  $\mu$ mol/L, 抑制 ACAT 作用是非竞争性的。(J. Antibiot. 1992, 45:1216)



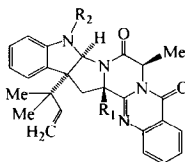
**Acetomycin** 醋霉素 *Streptomyces ramnulosus* 产生的抗人型结核杆菌与痢疾变形虫的抗生素。无色针状或柱状结晶, 熔点 115~116 $^\circ$ C, 高真空下于 70 $^\circ$ C 升华。 $[\alpha]_D - 167^\circ$  (c 1.47, 乙醇)。

**Acetophthalidin** 乙酰酞酯 *Penicillium* sp. BM 923 产生的哺乳动物细胞周期 (Cell cycle) 抑制剂。亦可由 3, 4, 6-三羟基蜂毒菌素在酸性下加热制取。C<sub>10</sub>H<sub>6</sub>O<sub>5</sub>, 白色结晶性粉末, 熔点 195~120 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{25} 0^\circ$  (c 1.0, 甲醇)。完全抑制 trFT210 细胞周期 M 期的浓度为 6.25  $\mu$ g/ml。3, 4, 6-三羟基蜂毒菌素 100  $\mu$ g/ml 仍无作用。(J. Antibiot. 1996, 49:216)



**5-N-Acetyldeamin** 5-N-乙酰基阿地胺 *Aspergillus fischeri* var. *brasilensis* AB 1826 M-35 产生的杂环化合物。C<sub>28</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>, 白色固体, 熔点 226~228 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{25} - 33^\circ$  (c 0.78, 甲醇)。从培养液还分离出阿地胺 (Atdeemin) 与 15b $\beta$ -羟基-5-N-乙酰基阿地胺 [2]。5-N-乙酰基阿地胺能增强抗肿瘤药长春新碱对耐药性肿瘤细胞的细胞毒

性。(J. Antibiot. 1993, 46:374, 380)



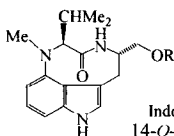
Atdeemin R<sub>1</sub>=R<sub>2</sub>=H  
[1] R<sub>1</sub>=H, R<sub>2</sub>=Ac  
[2] R<sub>1</sub>=OH, R<sub>2</sub>=Ac

**O-Acetylbenzeneamidinocarboxylic acid** O-乙酰苯胺基羧酸 *Gibberella*

*saubinetii* IAM 8049 产生的抗生素。C<sub>10</sub>H<sub>10</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, 无色针状结晶, 熔点 175~175.5 $^\circ$ C, pK<sub>a</sub> 10.65 (50% 二氧六环)。具有微弱的抑制肿瘤细胞作用。(Agric Biol. Chem. 1882, 46:1711)

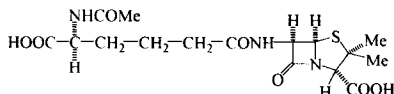
**O-Acetylcrinipellin A** 参见 Crinipellin (293 页)。

**14-O-Acetylindolactam V** 14-O-乙酰吲哚内酰胺 V *Actinomyces* NA34-17 产生的抗生素。C<sub>19</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>3</sub>, 无色粉末, 熔点 100~110 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{25} - 57^\circ$  (c 0.315, 乙醇)。此菌株还联产 (-)-吲哚内酰胺 V (Indolactam V)。C<sub>17</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>, 无色粉末, 熔点 130~165 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{26} - 170^\circ$  (c 0.499, 乙醇)。能诱导早期 Epstein-Barr 病毒抗原。(Agric. Biol. Chem. 1984, 48:1269)

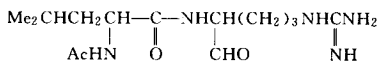


Indolactam V R=H  
14-O-Acetylindolactam V R=Ac

**N-Acetylisonipenicillin N** N-乙酰异青霉素 N *Streptomyces tokunonensis* PA-31088 (ATCC 31569) 产生的  $\beta$ -内酰胺类抗生素。酸性, C<sub>16</sub>H<sub>23</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>S, 钠盐为无色粉末, 溶解于水。对  $\beta$ -内酰胺敏感性大肠杆菌有作用。此菌株还产生 Asparenomycin A, B, C, PA-31088 II, 青霉素 N 与异青霉素 N。(J. Antibiot. 1982, 35:1646)

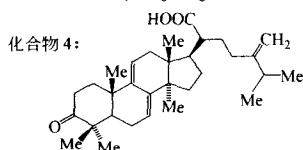
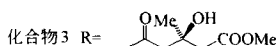
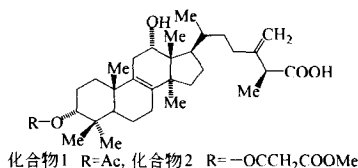


**Acetyl-L-leucyl-L-arginin** 乙酰-L-亮氨酸-L-精氨酸 杆菌 *Bacterium* sp. BMG520-yF2 产生的酶抑制剂。C<sub>14</sub>H<sub>27</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>, 白色粉末, 溶解于水, 熔点 129~132 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{25} - 45^\circ$  (c 0.5, 水)。具有抑制二肽酰胺酶 III 活性。(J. Antibiot. 1984, 37:680)

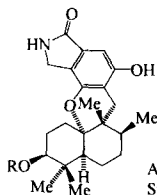


**3 $\alpha$ -Acetylpolyporenic acid A** 3 $\alpha$ -乙酰聚孔烯酸 A 桦滴孔菌 (*Piptoporus betulinus*) 产生的羊毛甾

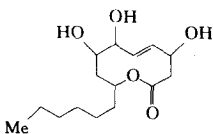
烷类化合物(化合物1)。无色油状物,  $C_{33}H_{52}O_5$ ,  $[\alpha]_D^{25} + 30^\circ$  ( $c$  0.18, 甲醇)。联产物有(25S)-(+)-12 $\alpha$ -羟基-3 $\alpha$ -甲酯基乙酰基-24-甲基羊毛甾-8,24-二烯-26-羧酸(化合物2)与已知的羊毛甾烷(化合物3)和聚孔烯酸C(化合物4)。化合物1,2,3与4具有抑制3 $\alpha$ -羟基甾烷脱氢酶活性,  $IC_{50}$ 分别为8.5, 4.0, 5.5与17.5(参比的吡喹酮为6.5 $\mu$ g/ml)。还具有抑制链球菌 $\alpha$ -透明质酸裂合酶活性,  $IC_{50}$ 分别为40.0, 3.5, 51.0与12.5, 对牛透明质酸裂合酶无作用。另具有微弱的抑制环加氧酶I活性。(J. Antibiot. 2004, 57:755)



**Acetylstachyflin** 乙酰葡萄糖菌素 葡萄糖霉 *Stachybotrys* sp. RF-7260 产生的抗A型流感病毒的抗生素。C<sub>25</sub>H<sub>33</sub>NO<sub>5</sub>, 无色针状结晶, 熔点 >300 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{24.5} + 136.4^\circ$  ( $c$  1.0, 甲醇)。联产的葡萄糖菌素(Stachyflin); C<sub>23</sub>H<sub>31</sub>NO<sub>4</sub>, 无色针状结晶, 熔点 >300 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{24.5} + 138.7^\circ$  ( $c$  1.0, 甲醇)。具有抗A型流感病毒(H1N1)活性,  $IC_{50}$ : 葡萄糖菌素与乙酰葡萄糖菌素分别为0.003与0.23 $\mu$ mol/L, 参比的金刚烷胺与扎那米韦各为5.3与0.75 $\mu$ mol/L。已完成全合成, 并进行了结构修饰与构效关系研究。(J. Antibiot. 2002, 55:155, 165)



**Achaetolide** 阿查氏内酯 *Achaetomium cristalliferum* PC 3252, *A. strumarium* (IMI 82624) 产生的内酯类化合物。C<sub>15</sub>H<sub>26</sub>O<sub>5</sub>, 熔点 122 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{21} - 19.3^\circ$  ( $c$  1.46, 乙



醇)。具有提高切割大麦叶的蒸腾作用。

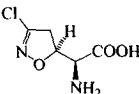
**Achromycin** 见 Puromycin(584 页)。

**Acidolin** 嗜酸乳杆菌 *Lactobacillus acidophilus* 产生的抗生素。黄棕色, 酸性, 吸湿性强, 易溶于水, 甲醇与丙酮, 微溶于氯仿。经多种层析方法分离纯化, 未获结晶。对热稳定, 未报告结构。具有抗革兰阳性菌与阴性菌活性, 但不抑制乳酸杆菌。对脊髓灰质炎病毒与痘苗病毒有抑制作用。(J. Antibiot. 1974, 27:631)

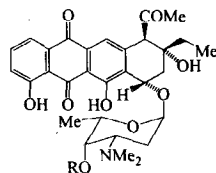
**Acidomycin** 见 Actithiazic acid(7 页)。

**Acidophilin** 嗜酸菌素 嗜酸乳杆菌 *Lactobacillus acidophilus* NRRL B 3208 产生的抗菌抗生素。微黄褐色液体,  $[\alpha]_D^{25} - 7^\circ$  ( $c$  0.5, 氯仿), 无特征性紫外吸收峰。未报告分子式与结构。抗菌活性微弱。(U. S. Pat. 3689640(1972))

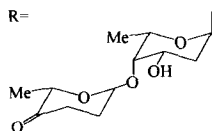
**Acivicin** 阿西维星 *Sre. sviveus* 产生的异呋啶类抗生素。熔点 228 ~ 230 $^\circ$ C,  $[\alpha]_D^{20} + 135^\circ$  ( $c$  1.0, 水)。具有抑制细胞活性与除草作用。(Antimicrob. Agents Chmother. 1975, 7:807)



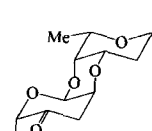
**Aclacinomycin** 阿卡拉霉素 又称 Antibiotic 77-3082。链霉菌 *Streptomyces galilaeus* 产生的蕙环类的抗肿瘤抗生素, 分离出 A、B、Y 等组分。A: 为主组分, C<sub>42</sub>H<sub>53</sub>NO<sub>15</sub>, 黄色结晶性粉末, 熔点 151 ~ 153 $^\circ$ C (分解),  $[\alpha]_D^{24} - 11.5^\circ$  ( $c$  1.0, CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>), LD<sub>50</sub> 22.6 (腹腔), 盐酸盐熔点 156.3 ~ 116.7 $^\circ$ C (分解),  $[\alpha]_D^{24} + 3^\circ$  ( $c$  1.0, CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>), LD<sub>50</sub> 13.7 (腹腔)。具有抗革兰阳性细菌与抑制肿瘤细胞活性, 用作抗肿瘤药物。B: 黄色粉末, C<sub>42</sub>H<sub>51</sub>NO<sub>15</sub>。Y: 黄色粉末, C<sub>42</sub>H<sub>51</sub>NO<sub>15</sub>, 熔点 153 ~ 155 $^\circ$ C (分解),  $[\alpha]_D^{24} + 66^\circ$  ( $c$  1.0, 氯仿), LD<sub>50</sub> 40 ~ 50 (腹腔)。(J. Antibiot. 1975, 28:830, 1979, 32:472, 791, 801, 1981, 34:47, 52, 331, 916, 1983, 36:1458)



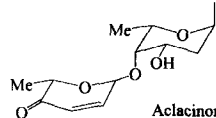
R=



Aclacinomycin A

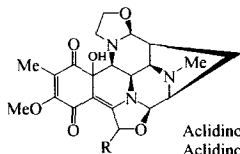


Aclacinomycin B



Aclacinomycin Y

**Acclidinomycin A, B** 阿卡利霉素 *Streptomyces halstedii* 产生的萘啶霉素型抗生素, 分离出 A, B 二组分。A:  $C_{21}H_{25}N_3O_6$ ,  $[\alpha]_D^{20} 0^\circ$  ( $c$  0.02, 甲醇)。B:  $C_{21}H_{25}N_3O_7$ ,  $[\alpha]_D^{20} +188^\circ$  ( $c$  0.16, 甲醇)。A 与 B 具有抗革兰阳性细菌与肿瘤活性。抗枯草芽孢杆菌, 藤黄微球菌的 MIC 6.25~25, 比萘啶霉素弱 50 倍。抗人白血病 K562 细胞的  $IC_{50}$  10, 比阿霉素弱 500 倍。(J. Antibiot. 2000, 54:304)

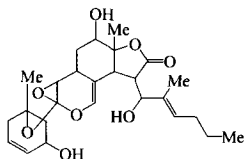


Acclidinomycin A R=H  
Acclidinomycin B R=OH

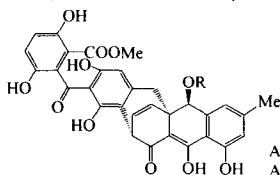
**Acmycin** 阿克霉素 *Streptomyces* sp. AC<sub>2</sub> 产生的七烯类抗生素。C<sub>33</sub>H<sub>68</sub>NO<sub>20</sub>, 两性, 硫黄色粉末, 溶于水, 熔点 142°C (分解),  $[\alpha]_D^{20} +50^\circ$  ( $c$  2, 甲醇)。未报告结构。具有抗酵母与真菌活性。(Folia Microbiol. 1982, 27:167)

**Acremodiol** 参见 Acremonol (4 页)。

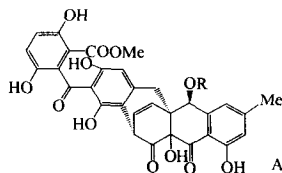
**Acremolactone A** 小枝顶孢内酯 A *Acremonium roseum* 14267 产生的具有除草作用的  $\gamma$ -内酯。C<sub>26</sub>H<sub>34</sub>O<sub>8</sub>, 无色结晶, 熔点 123.5~124.0°C,  $[\alpha]_D^{20} +68^\circ$  ( $c$  0.13, 甲醇)。对有害的杂草具有非选择性的强力除草活性, 作用高于合成除草剂甲草胺。(J. Antibiot. 1998, 51:967)



**Acremonidins** 枝顶孢菌素 *Acremonium* sp. LL-Cyan 416 产生的聚酮衍生的抗生素。分离出 A~E 五组分。其中 A, B, C 具有中度抗革兰阳性细菌, 包括耐甲氧西林金黄色葡萄球菌 (MR-SA) 与耐万古霉素肠球菌 (VRE) 活性, MIC 8~32。(J. Antibiot. 2003, 56:923)



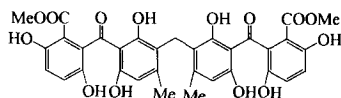
Acremonidin A R=Ac  
Acremonidin B R=H



Acremonidin C

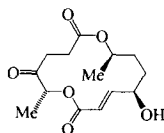


Acremonidin E

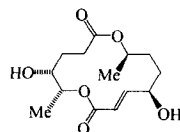


Acremonidin D

**Acremonol** 小枝顶孢醇 一株与小枝顶孢 *Acremonium* 类似真菌产生的两种双内酯类化合物。小枝顶孢醇: C<sub>14</sub>H<sub>18</sub>O<sub>6</sub>, 无色固体, 熔点 83~84°C,  $[\alpha]_D^{25} +40^\circ$  ( $c$  0.3, 甲醇)。小枝顶孢二醇 (Acremodiol): 无色固体, C<sub>14</sub>H<sub>22</sub>O<sub>6</sub>, 熔点 110~112°C,  $[\alpha]_D^{25} +98^\circ$  ( $c$  0.3, 甲醇)。两者具有抗革兰阳性细菌与真菌活性,  $\geq 4\mu\text{g/ml}$  可减少狗 PMNL 细胞氧化破裂。(J. Antibiot. 2002, 55:660)

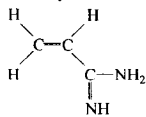


Acremonol

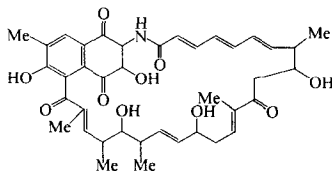


Acremodiol

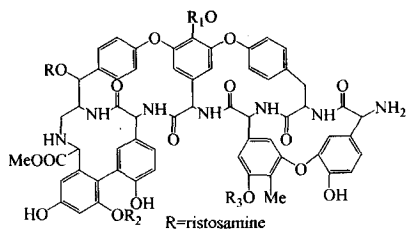
**Acrylamidine** 丙烯基 链霉菌 *Streptomyces* sp. D274-2 产生的抗生素。无色结晶, 熔点 138.5~139.5°C。具有微弱抗细菌与酵母活性, 50mg/ml 抑制 HeLa 细胞, 100mg/ml 抑制吉肉瘤生长, 对艾氏腹水瘤、肉瘤-180、L-1210 无作用。盐酸盐小鼠 LD<sub>50</sub> 44 (静注), 38 (腹腔), 38 (皮下)。(J. Antibiot. 1968, 21:444)



**Actamycin** 阿克他霉素 *Streptomyces* sp. E/784 产生的安沙类抗生素。C<sub>39</sub>H<sub>45</sub>NO<sub>10</sub>, 熔点 190~192°C。主要抗革兰阳性细菌。(Tetrahedron Lett. 1981, 22:1145, 1149)



**Actaplanins** 阿克拉宁 游动放线菌 *Actinoplanes missouriensis*, 产生糖肽类抗生素, 分离出 A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, B<sub>3</sub>, C<sub>1</sub>, C<sub>3</sub>, E<sub>1</sub> 与 G 等组分。均为两性化合物, 溶解于水。组分 A 的盐酸盐为白色结晶, 熔点  $>220^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} -42.3^\circ$  ( $c$  1.0, 水)。具有抗革兰阳性细菌活性, 用作生长促进剂, 可增加牛奶产量。(J. Antibiot. 1984, 37:85)



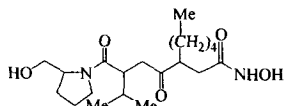
| 组分             | R <sub>1</sub> | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> |
|----------------|----------------|----------------|----------------|
| A              | 甘露糖葡萄糖         | 山梨糖            | 山梨糖            |
| B <sub>1</sub> | 鼠李糖葡萄糖         | 山梨糖            | 山梨糖            |
| B <sub>2</sub> | 葡萄糖            | 山梨糖            | 山梨糖            |
| B <sub>3</sub> | 甘露糖葡萄糖         | 山梨糖            | H              |
| C <sub>1</sub> | 鼠李糖葡萄糖         | 山梨糖            | H              |
| C <sub>3</sub> | 葡萄糖            | H              | 山梨糖            |
| G              | 葡萄糖            | 山梨糖            | 山梨糖            |

**Actidinone** 放线菌酮, 环己酰亚胺 又称 Cy-cloheximide。与奈良霉素 A 相同。为链霉菌产生菌 *Str. griseus* 产生的戊二酰亚胺类抗生素。无色片状结晶, 熔点 115 ~ 116.7°C,  $[\alpha]_D^{25} = -2.8^\circ$  (c 9.6, 甲醇)。

具有 R(-) 绝对构型, 已完成全合成。1mg/ml 对细菌无抑制作用, 但在 0.002mg/ml 即抑制新生隐球菌。能抑制小鼠艾氏腹水瘤的腹水增加, 但不能延长生存时间。小鼠 LD<sub>50</sub> 150 (静注), 375 (口服)。(J. Antibiot. 1952, 5; 166, 1955, 8A; 120)

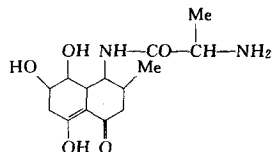
**Actiketol** 放线酮缩醇 *Streptomyces pulveraceus* subsp. *epiderstagenes* 产生的戊二酰亚胺类抗生素。C<sub>15</sub>H<sub>15</sub>NO<sub>5</sub>, 白色无定型粉末, 熔点 96 ~ 100°C。抑制 [<sup>3</sup>H] 胸苷参入表皮生长因子激活的 Balb/MB 细胞的 IC<sub>50</sub> 14.5 μmol/L, 比类似物 Actiphenol 强 (109.6 μmol/L), 但较 Epiderstatin 弱 3000 倍。(J. Antibiot. 1991, 44; 160)

**Actinin** 放线酰胺素 *Streptomyces* sp. ATCC 14903 产生的抗生素。无色针状结晶, 熔点 148 ~ 149°C,  $[\alpha]_D^{25} = -53.9^\circ$  (乙醇), -65.0° (水)。抗革兰阳性菌与分支杆菌, 0.25 μg/ml 抑制金黄色葡萄球菌噬菌体。小鼠 400g/kg 未显毒性。(U. S. Pat. 3240787 (1966))



**Actinobolin** 放线菌光素 *Str. griseoviridis* var. *atrofaciens* 产生的广谱抗生素。硫酸盐为无色结晶,  $[\alpha]_D^{22} + 54.5^\circ$  (c 1.0, H<sub>2</sub>O)。具有抗细菌作

用, 但可被多种氨基酸或丙酮酸等抵消, 对艾氏腹水瘤、肉瘤-180 等有抑制作用。LD<sub>50</sub> 800 (小鼠, 静注)。(Antibiot. Ann. 1959, 497, 505, 510, 522)

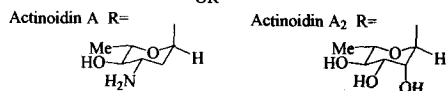
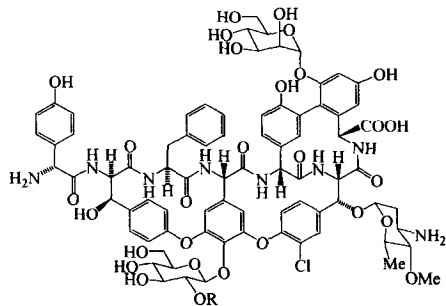


**Actinocarcin** 放线抗癌素 *Streptomyces cinnamomeus* 产生的肽类抗生素。不抗细菌、霉菌与酵母, 连续 6 天给药 1 (mg/kg)/d, 能延长荷有艾氏肉瘤细胞小鼠的生存时间。LD<sub>50</sub> 近似 40 ~ 50 (小鼠, 给药 6 天)。(J. Antibiot. 1974, 27; 994)

**Actinogan** 放线菌致癌素 土生诺卡氏菌 *Nocardia humifera* 产生的肽类抗生素。无色粉末,  $[\alpha]_D + 15.6^\circ$  (c 1.0, 水)。体外无抗菌活性, 注射给药 1 ~ 2mg/kg 对小鼠的艾氏腹水瘤、肉瘤-180、腺癌 755 有抑制作用。(J. Med. Chem. 1963, 6; 613)

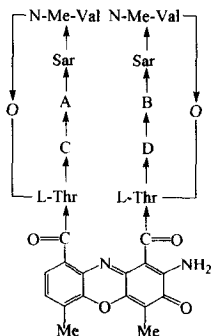
**Actinoidin** 类放线菌素 原放线菌 *Proactinomyces actinoides* 产生的糖肽类抗生素。盐酸盐为白色无定型粉末。具有抗革兰阳性菌与回归热螺旋体作用, 小鼠可耐受 2g/kg。(Antibiotiki 1957, 2(5); 44, 1958, 3(1); 112, 1961, 6(7); 609, 1962)

**Actinoidin A** 类放线菌素 A 一株为鉴定的 *Nocardia* sp. (SK8-F-AAJ-193) 产生的糖肽类抗生素, 分离出 A 与 A<sub>2</sub> 等组分。A: C<sub>84</sub>H<sub>94</sub>N<sub>2</sub>O<sub>31</sub>Cl, 熔点 > 300°C (分解),  $[\alpha]_D^{25} + 15.9^\circ$  (c 0.1, 水)。A<sub>2</sub>: C<sub>84</sub>H<sub>93</sub>N<sub>8</sub>O<sub>33</sub>Cl, 熔点 > 300°C (分解),  $[\alpha]_D^{25} + 3.3^\circ$  (c 0.1, 水)。主要抗革兰阳性细菌, 包括葡萄球菌与肠球菌等属细菌, 对金黄色葡萄球菌 HH 127 的 MIC 与 ED<sub>50</sub> (mg/kg) A 为 1.6 与 1.6, A<sub>2</sub> 为 1.6 与 2.6, 对照的万古霉素与替考拉宁为 1.6 与 1.4。(J. Antibiot. 1987, 40; 165, 630)



**Actinoleukin** 放线菌白素 *Streptomyces aureus* 产生的酯肽类抗生素。C<sub>29</sub>~30 H<sub>40</sub>~45 O<sub>7</sub>~8 N<sub>6</sub> S (分子量 648), 白色片结晶, 熔点 213℃ (分解),  $[\alpha]_D^{25} - 302^\circ$  (c 0.01, 乙酸乙酯)。未报告结构。具有抗革兰阳性菌、阴性菌(弱)活性, 腹腔注射可抑制小鼠艾氏腹水癌, 延长存活期。小鼠 LD<sub>50</sub> 1.5(腹腔)。(J. Antibiot. 1954, 7A: 125, 1955, 8A: 120, 1956, 9A: 86, 1958, 11A: 160)

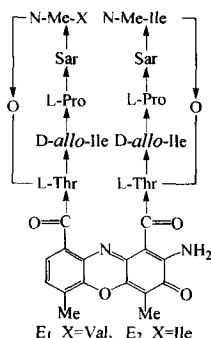
**Actinomycins** 放线菌素类抗生素 1940 年发现的一组放线菌 *Streptomyces chrysomallus*, *Str. antibioticus* 等产生的广谱抗生素, 毒性强。1952 年观察到有抑制动物肿瘤作用, 始引起关注。采用逆流分配、各种色谱等手段, 分离出 30 余组分。这组抗生素含有共同的发色团去肽放线菌素, 即 2-氨基-4,5-二甲基吩哌嗪-3-酮-1,8-二羧酸。其两个羧基各以酰胺键与以 5 个氨基酸组成两个肽链的末端 L-苏氨酸相连, 另一端氨基酸常为 L-N-甲基缬氨酸或 L-N-甲基异亮氨酸, 其羧基与苏氨酸的羟基相连, 形成两个内酯环, 各组分组成氨基酸不同。



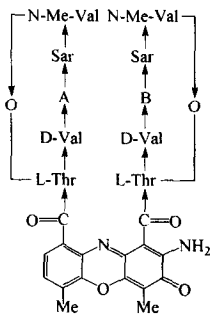
| 放线菌素       | A     | B            | C          | D          |
|------------|-------|--------------|------------|------------|
| I (=X0β)   | L-Pro | L-allo-HOPro | D-Val      | D-Val      |
| II (=F8)   | Sar   | Sar          | D-Val      | D-Val      |
| III (=F9)  | D-Pro | Sar          | D-Val      | D-Val      |
| IV (C1, D) | L-Pro | L-Pro        | D-Val      | D-Val      |
| V          | L-Pro | L-Oxo-Pro    | D-Val      | D-Val      |
| VI (=C2)   | L-Pro | L-Pro        | D-Val      | D-allo-Ile |
| VII (=C3)  | L-Pro | L-Pro        | D-allo-Ile | D-allo-Ile |
| X1         | Sar   | L-Oxo-Pro    | D-Val      | D-Val      |
| X2         | L-Pro | L-Oxo-Pro    | D-Val      | D-Val      |
| F1         | Sar   | Sar          | D-allo-Ile | D-allo-Ile |
| F2         | L-Pro | Sar          | D-allo-Ile | D-allo-Ile |
| F3         | Sar   | Sar          | D-allo-Ile | D-allo-Ile |
| F4         | L-Pro | Sar          | D-allo-Ile | D-allo-Ile |

放线菌素 E<sub>1</sub>、E<sub>2</sub> 结构与放线菌素 VII 相似, 不同之处仅是 E<sub>1</sub> 的左侧肽链末端氨基酸不是 L-N-甲基缬氨酸, 而代之以 L-N-甲基异亮氨酸, E<sub>2</sub> 的两侧肽链末端氨基酸都是 L-N-甲基异亮氨酸。Streptomyces parvulus (ACTT 12434) 在顺-4-甲基脯氨酸存在下培养产生放线菌素 K<sub>1c</sub>,

K<sub>2c</sub>, 在反-4-甲基脯氨酸存在下产生放线菌素 K<sub>1t</sub>, K<sub>2t</sub>。



放线菌素具有很强的抗菌活性, 并有抗肿瘤作用。机制是嵌入双链 DNA 之间, 作用于 mRNA 干扰转录, 从而抑制 DNA 合成。放线菌素 D 可用于治疗肾母细胞瘤、神经母细胞瘤、横纹肌肉瘤、霍奇金氏病, 对睾丸瘤与绒毛膜上皮癌亦有一定疗效。需注意骨髓抑制等不良反应。



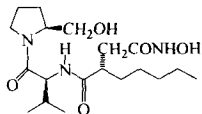
| 组分              | A, B                      | 分子式                                                             | 熔点 /℃   |
|-----------------|---------------------------|-----------------------------------------------------------------|---------|
| K <sub>1c</sub> | A/B = L-Pro/cis-4-MePro   | C <sub>63</sub> H <sub>88</sub> N <sub>12</sub> O <sub>16</sub> | 244~246 |
| K <sub>2c</sub> | A/B = cis-MePro           | C <sub>64</sub> H <sub>90</sub> N <sub>12</sub> O <sub>16</sub> | 236~237 |
| K <sub>1t</sub> | A/B = L-Pro/trans-4-MePro | C <sub>63</sub> H <sub>88</sub> N <sub>12</sub> O <sub>16</sub> | 248~250 |
| K <sub>2t</sub> | A/B = trans-MePro         | C <sub>64</sub> H <sub>90</sub> N <sub>12</sub> O <sub>16</sub> | 245~247 |

**Actinomycin X-14873B, C, D** 放线菌素 X-14873B, C, D *Streptomyces* sp. X-14873 产生的放线菌素。橙色。B:  $[\alpha]_D^{25} - 349.6^\circ$  (c 1, 氯仿), 具有抗肿瘤与球虫作用, 小鼠 LD<sub>50</sub> 0.16(腹腔); 2.9(口服)。C: C<sub>61</sub>H<sub>86</sub>N<sub>12</sub>O<sub>18</sub>,  $[\alpha]_D^{25} - 395.2^\circ$  (c 1, 氯仿), 酸水解产生脯氨酸与 3-羟基-5-甲基脯氨酸, 未报告结构, 具有抗肿瘤活性, 小鼠

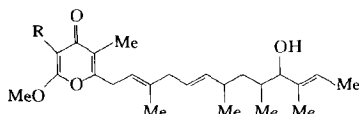
$LD_{50} > 1000$  (腹腔)。D: 为 C 的异构体,  $[\alpha]_D^{25} -145.5^\circ$  (c 1, 氯仿), 具有抗肿瘤活性, 小鼠  $LD_{50}$  71 (腹腔);  $> 1000$  (口服)。(Jpn. Kokai. 83-198484, 1983)

**Actinonin** 放线宁 *Streptomyces roseopul-latus* 产生的寡肽。

$C_{19}H_{35}N_3O_5$ , 小片状结晶, 熔点  $148^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} -48^\circ$  (c 1.0, 甲醇), 抗菌谱广, 并具有抑制氨肽酶活性。(J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1975, 819, 825, 857)

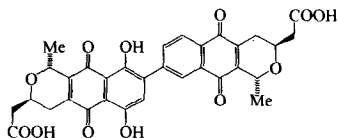


**Actinopyrone** 放线吡喃酮 *Streptomyces pactum* SI2538 产生的抗生素。分离出 A, B, C 三组分, 分子式依次为  $C_{25}H_{36}O_4$ ,  $C_{24}H_{34}O_4$ ,  $C_{26}H_{38}O_4$ , 均为无色油状物。对麻醉狗冠状血管有舒张作用, 并有微弱抗革兰阳性细菌与发酵菌活性。(J. Antibiot. 1986, 39; 32, 38)



A: R = Me, B: R = H, C: R =  $CH_2Me$

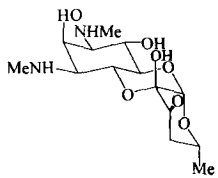
**Actinorhodin** 放线紫红素 又称 Antibiotic 17. *Str. coelicolor* 产生的苯并异色满醌 (Benzoisochromanquinone) 类抗生素, 红色细针状结晶, 熔点  $270^\circ\text{C}$  (分解),  $[\alpha]_D +117^\circ$ , pH 值 8.5 由红变蓝。具有微弱抗细菌与抗病毒 (HIV) 活性。进行了深入的生物合成研究。(Naturwiss 1974, 34; 190, 1962, 49; 131)



**Actinorubin** 放线菌红素 *Streptomyces* sp. A-105 产生的抗生素。盐酸盐为白色吸湿性粉末, 半日花酸盐为橙红色针状结晶, 熔点  $206 \sim 214^\circ\text{C}$  (分解), 抗革兰阳性菌、阴性菌、分支杆菌与个别真菌, 小鼠  $LD_{50}$  34 ~ 50 (腹腔)。(J. Bacteriol. 1946, 51; 591, 1947, 53; 695)

**Actinospectacin** 大观霉素奇放线菌素 又称 Antibiotic 1043A, Spectinomycin. *Streptomyces spectabilis* 产生的氨基糖苷类抗生素。无水物

为无定型粉末, 用丙酮-水处理得含 6 分子水的结晶, 熔点  $65 \sim 72^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D +7.6^\circ$  (c 1.0, 水), 硫酸盐含 4 分子结晶水, 熔点  $185^\circ\text{C}$  (分解),  $[\alpha]_D +17^\circ$  (c 1.0, 水)。为一广谱抗生素, 小鼠  $LD_{50}$  2000 (静注), 3867 (口服)。用于治疗淋病。(Anto-

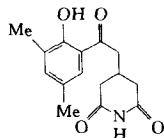


biot. Chemother. 1961, 11; 118, 123, 127, 661)

**Actinotiocin** 放线硫菌素 *Actinomadura pusilla* A-118 产生的含硫的肽类抗生素。无色柱状结晶,  $C_{49}H_{53} \sim_{54}N_{13}O_{10}S_5$ , 熔点  $247 \sim 249^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} +164^\circ$  (c 0.77, 二氧六环), 酸水解产生丝氨酸、脯氨酸、甘氨酸一个大分子含有芳杂环的新氨基酸和未鉴别的氨基酸。未报告结构。具有较强的抗革兰阳性细菌活性, 不与上市的抗生素交叉耐药, 小鼠腹腔或口服给药 1000mg/kg 未显毒性反应。(J. Antibiot. 1973, 26; 343)

**Actinoxanthine** 放线黄质素 *Streptomyces globisporus* 产生的多肽类抗生素。相对分子质量 13000 (凝胶过滤法), 可溶于水, 水解得赖氨酸、组氨酸、精氨酸、天冬氨酸、谷氨酸、苏氨酸、丝氨酸、脯氨酸、甘氨酸、丙氨酸、缬氨酸、异亮氨酸、亮氨酸、酪氨酸、苯丙氨酸与半胱氨酸。主要抗革兰阳性菌, 对小鼠艾氏癌、大鼠肉瘤-45、肉瘤 M-1 与 Crocker 氏癌有 60% ~ 90% 抑制率。小鼠  $LD_{50}$  0.24 (腹腔)。(Antibiotiki 1957, 2(1); 17, 21, 1958, 3(1); 3, 18, 22, 31)

**Actiphenol** 放线菌酚, 抗生素 C-73 又称 Zygomycin D<sub>1</sub>. *Streptomyces* sp. ETH 7796 产生的戊二酰亚胺类抗生素。白色针状结晶, 熔点  $199 \sim 200^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} +5.06^\circ$  (c 0.4, 二甲基甲酰胺)。对酵母有抑制作用。(Helv. Chim Acta. 1959, 42; 1523)

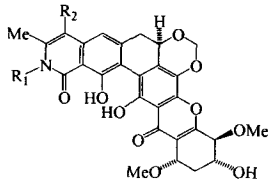


**Actithiazic acid** 放线噻唑酸 又称 Acidomycin. *Streptomyces virginiae* 产生的抗生素。白色针状结晶, 熔点  $140 \sim 141^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} -60.5^\circ$  (c 1.0, 无水乙醇),  $[\alpha]_D^{25} -54^\circ$  (c 1.0, 甲醇)。只具有抗分支杆菌活性, 对结核分支杆菌 H<sub>37</sub>Rv 的 MIC 为 0.0625 ~ 0.125, 小鼠  $LD_{50}$  (g/kg) 为 3.5 (静注), 20 (皮下)。日本用作抗结核药。(Antibiot. Chemother. 1952, 2; 399, 223, 453)

**Actinoplanone** 游动放线菌酮 *Actinoplanes* sp. R-304 产生的抗生素, 分离出 A, B 二主成分与 C ~ G 等微量组分。A:  $C_{28}H_{25}N_2O_{10}Cl$ , 熔点  $276 \sim 278^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} -619.8^\circ$  (c 0.29,  $CHCl_3$ )。B:  $C_{28}H_{25}NO_{10}Cl$ , 熔点  $240 \sim 243^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} -649.4^\circ$  ( $CHCl_3$ )。C ~ G 的分子式、熔点与比旋度见下表:

|                          | C                               | D                               | E                               | F                               | G                               |
|--------------------------|---------------------------------|---------------------------------|---------------------------------|---------------------------------|---------------------------------|
| 分子式                      | $C_{28}H_{26}^*$<br>$N_2O_{10}$ | $C_{28}H_{25}^*$<br>$N_2O_{10}$ | $C_{31}H_{29}^*$<br>$N_2O_{10}$ | $C_{32}H_{29}^*$<br>$N_2O_{11}$ | $C_{32}H_{30}^*$<br>$N_2O_{11}$ |
| 熔点<br>/ $^\circ\text{C}$ | 278 ~<br>282                    | 222 ~<br>224                    | 190 ~<br>193                    | 281 ~<br>282                    | 173 ~<br>176                    |
| $[\alpha]_D^{25}$        | -646.1°                         | -624.1°                         | -516.7°                         | 569.1°                          | 582.3°                          |

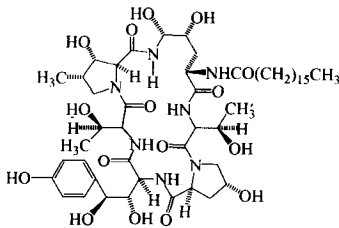
\*  $[\alpha]_D^{25}$  (氯仿)。



- A;  $R_1 = \text{NH}_2$ ,  $R_2 = \text{Cl}$   
 B;  $R_1 = \text{H}$ ,  $R_2 = \text{Cl}$   
 C;  $R_1 = \text{NH}_2$ ,  $R_2 = \text{H}$   
 D;  $R_1 = R_2 = \text{H}$   
 E;  $R_1 = \text{N}=\text{CMe}_2$ ,  $R_2 = \text{Cl}$   
 F;  $R_1 = \text{N}=\text{C}(\text{Me})\text{COMe}$ ,  $R_2 = \text{Cl}$   
 G;  $R_1 = \text{N}=\text{C}(\text{Me})\text{COMe}$ ,  $R_2 = \text{H}$

各组对 HeLa 细胞都有很强细胞毒性, C 与 G 的  $\text{IC}_{50} < 0.00004$ , 对其他肿瘤细胞 (如 P388, CHO, KB, HLC, KN 等) A 的活性较丝裂霉素 C、阿霉素强  $10^2 \sim 10^3$  倍。游动放线菌酮还具有较强抗真菌与细菌活性; 对稻梨孢的  $\text{IC}_{50} 0.0016 \sim 0.106$ , A 对革兰阳性菌的  $\text{MIC} < 0.0007$ , 对革兰阴性菌在  $0.05 \sim 12.5$  之间, 但 B 与 C 对革兰阴性菌无活性 ( $> 50 \mu\text{g}/\text{ml}$ )。

**Aculeacin** 棘孢曲菌素 *Aspergillus aculeatus* 产生的环肽, 分离出 A~G 七组分, A 为主组分,  $\text{C}_{51}\text{H}_{81}\text{N}_7\text{O}_{16}$ , 无定形粉末, 熔点  $162 \sim 166^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{24} - 54^\circ$  ( $c 1.0$ , 甲醇), 有抗真菌与酵母活性。其余组分结构未报告。(J. Antibiot. 1977, 30: 297, 303)

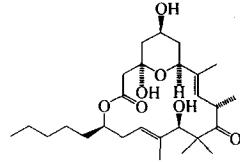


**Aculeximycin** 阿枯来霉素 *Streptosporangium albidum* 产生的抗生素。 $\text{C}_{81}\text{H}_{144}\text{N}_2\text{O}_{33}$ , 碱性, 白色无定形粉末, 熔点  $184 \sim 188^\circ\text{C}$  (分解),  $[\alpha]_D^{24} + 1.75^\circ$  ( $c 0.4$ , 甲醇);  $[\alpha]_D^{25} + 2.6^\circ$  ( $c 0.76$ , 水)。为 5 个单糖, 3 个双键和 1 个缩酮环组成的糖苷化合物。具有抗革兰阳性菌、阴性菌、酵母等真菌活性, 并有杀伤蚊幼虫作用, 小鼠  $\text{LD}_{50} 0.6$  (静注)。(Antibiot. 1983, 36: 1093, 1097, 1989, 42: 691, 701)

**Acumycin** 阿枯霉素, 尖霉素 *Streptomyces griseoflavus* 产生的十六元大环内酯类抗生素。无色棱状结晶, 熔点  $233 \sim 237^\circ\text{C}$  (分解),  $\text{pK} 6.43$  (乙二醇甲醚中),  $[\alpha]_D^{25} - 92^\circ$  ( $c 1.0$ , 氯仿)。主要抗革兰阳性菌, 金黄色葡萄球菌的  $\text{PD}_{50}$  为  $25 \text{mg}/\text{kg}$ 。

**Acutiphycin** 急非藻素 蓝绿藻 *Oscillatoria acutissima* 产生的大环内酯类抗生素。 $\text{C}_{27}\text{H}_{44}\text{O}_7$ ,

结晶, 熔点  $155 \sim 156^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} + 107^\circ$  ( $c 1.0$ , 氯仿), 具有细胞毒与抗肿瘤活性。其二氯化物熔点  $153 \sim 154^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{25} + 110^\circ$  ( $c 1.0$ , 甲醇), 亦有细胞毒与抗肿瘤活性。(J. Am. Chem. Soc. 1984, 106: 8193)

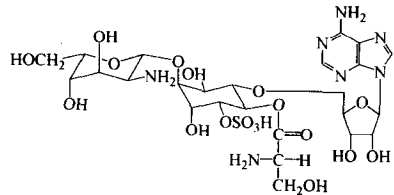


**Acylpeptidin** 参见 Antibiotic APD(61 页)。

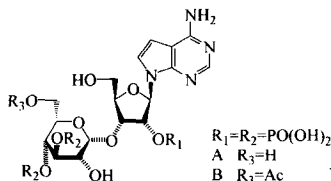
**Adechlorin** 腺氯菌素 *Actinomadura* sp. OMR-37 产生的核苷类化合物,  $\text{C}_{11}\text{H}_{15}\text{N}_4\text{O}_4\text{Cl}$ , 无色针状结晶, 熔点  $125 \sim 131^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{21} + 21^\circ$  ( $c 1.0$ , 水)。具有抑制腺苷脱氨酶活性,  $K_i 5.3 \times 10^{-10} \text{mol}/\text{L}$ , 能增强 Ara-A 抗病毒活性,  $100 \text{mg}/\text{kg}$  未显不良反应。急性毒性低于助间型毒素 (Coformycin) 与 2-去氧助间型毒素。(J. Antibiot. 1985, 38: 1008)

**Adecyphenol** 腺环戊醇 *Streptomyces* sp. OM-3223 产生的腺苷脱氨酶抑制剂。  $\text{C}_{12}\text{H}_{16}\text{N}_4\text{O}_4$ , 无色针状结晶, 熔点  $240 \sim 245^\circ\text{C}$ ,  $[\alpha]_D^{24} - 31.6^\circ$  ( $c 1.0$ , 水)。

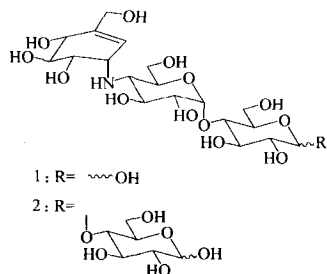
**Adenomycin** 腺苷霉素 *Streptomyces griseoflavus* C 19-97 产生的核苷类抗生素。碱性,  $\text{C}_{25}\text{H}_{30}\text{N}_7\text{O}_{18}\text{S}$ , 熔点  $210 \sim 220^\circ\text{C}$  (分解),  $[\alpha]_D^{22.5} + 10.5^\circ$  ( $c 2$ , 水)。二盐酸盐为白色粉末, 熔点  $165 \sim 168^\circ\text{C}$  (分解),  $[\alpha]_D^{25} + 14^\circ$  ( $c 1$ , 水), 溶解于水。具有抗革兰阳性菌、阴性菌与肿瘤活性。(J. Antibiot. 1981, 34: 130)



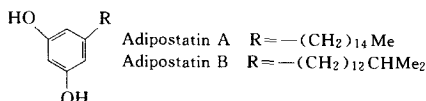
**Adenophostin** 腺苷磷汀 *Penicillium brevicompactum* SANK 11991 产生的肌醇-1,4,5-三磷酸受体拮抗剂。分离出 A, B 二组分, A:  $\text{C}_{16}\text{H}_{26}\text{N}_5\text{O}_{18}\text{P}_3$ ,  $[\alpha]_D^{25} + 28.6^\circ$  ( $c 0.71$ , 水); B:  $\text{C}_{18}\text{H}_{28}\text{N}_5\text{O}_{19}\text{P}_3$ ,  $[\alpha]_D^{25} + 33.8^\circ$  ( $c 0.91$ , 水)。A 与 B 对  $[^3\text{H}]\text{-InsP}_3$  抑制常数 ( $K_i$ ) 均为  $0.18 \text{nmol}/\text{L}$ , 高于  $\text{InsP}_3$  本身与  $\text{InsP}_3$  的亲合性 ( $0.15 \text{nmol}/\text{L}$ )。急性毒性  $\text{LD}_{50} > 200 \text{mg}/\text{kg}$ 。(J. Antibiot. 1993, 46: 1643, 1788)



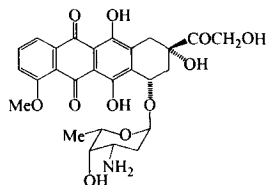
**Adiposin** 脂解素 *Streptomyces calvus* TM-521 与 *Str. sp.* A2396 的代谢产物, 分离出 1 与 2 两组分。均为弱碱性, 无定型粉末。脂解素-1:  $C_{19}H_{33}NO_{14}$ , 二水物熔点  $138 \sim 143^\circ C$  (分解),  $[\alpha]_D^{25} + 139^\circ$  (c 1.0, 水)。脂解素-2:  $C_{25}H_{43}NO_{19}$ , 二水物熔点  $157 \sim 162^\circ C$  (分解),  $[\alpha]_D^{25} + 163^\circ$  (c 1.0, 水)。两者均具有抗革兰阳性菌、阴性菌、植物病原真菌活性, 并具有较强的抑制  $\alpha$ -淀粉酶作用。小鼠  $LD_{50} > 10g/kg$  (静注)。(J. Antibiot. 1982, 35; 1156, 1160, 1167, 1234)



**Adipostatin** 抑脂肪素 *Streptomyces cyaneus* 2299-SV1 产生的甘油-3-磷酸脱氢酶(GPDH)抑制剂。分离出 A, B 二组分, A:  $C_{21}H_{36}O_2$ , 白色粉末, 熔点  $62 \sim 63^\circ C$ ; B:  $C_{21}H_{36}O_2$ , 白色粉末, 熔点  $90 \sim 91^\circ C$ 。抑脂肪素 A 与 B 抑制 GPDH 的  $IC_{50}$  分别为 4.1 与  $4.5 \mu mol/L$ 。(J. Antibiot. 1992, 45; 886)

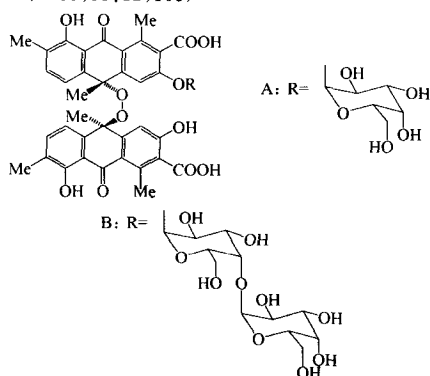


**Adriamycin** 阿霉素, 亚德里亚霉素, 14-羟基道诺霉素, 多柔比星 *Str. peucetius* var. *caesinus* 产生的蒽环类抗生素, 亦可由道诺霉素半合成制备。盐酸盐橙红色针状结晶, 熔点  $204 \sim 205^\circ C$  (分解),  $[\alpha]_D^{25} + 248^\circ$  (c 0.1, 甲醇)。具有抗革兰阳性菌活性, 对艾氏腹水癌, C3Hf 小鼠淋巴瘤, Oberling-Guerin 骨髓瘤、肉瘤-180、白血病 L-1210 的抑制率为  $65\% \sim 90\%$ 。小鼠  $LD_{50}$  21.1 (静注)。抗癌谱较广, 对多种肿瘤抑制率比道诺霉素高, 临床用于治疗急性白血病与多种实体瘤。亦有胃肠道、造血系统反应以及引起心动过速、心律不齐、心肌损害等不良反应。(Brit. Pat. 1161278, 1967)



**Adustin** 黑刺菌素 *Steccherinum adustin* 产生的抗酵母与发癣霉的抗生素。 $C_{11}H_8O_3$ , 无色长针状结晶, 熔点  $62.5 \sim 63.5^\circ C$ 。小鼠  $LD_{50}$  170 (静注), 369 (腹腔)。(抗菌素生物理化特性 第一分册, 1977)

**Adxanthromycin** 黏着霉素 *Streptomyces* sp. NA-148 产生的胞间黏着分子-1/淋巴细胞功能相关抗原-1(ICAM-1/LFA-1)介导的细胞黏着分子抑制剂。分离出 A, B 二组分, 均为浅黄色粉末。A:  $C_{42}H_{40}O_{17}$ ,  $[\alpha]_D^{25} + 120.5^\circ$  (c 0.2, DMSO)。B:  $C_{48}H_{50}O_{22}$ ,  $[\alpha]_D^{26} + 105.4^\circ$  (c 0.1, DMSO)。A 与 B 抑制 JY 细胞凝聚 ( $1.5 \mu g/ml$ ), 抑制人 T 细胞 SKW-3 黏着可溶性 ICAM-1,  $IC_{50}$  分别为 18.8 与 25.0。(J. Antibiot. 1999, 52; 198, 2000, 53; 12, 163)



**Aerobacin** 气杆菌素 *Aerobacter aerogenes*, *Escherichia coli* 与 *Klebsiella pneumoniae* 在缺铁状态下培养产生的柠檬酰异羟肟酸类高铁载体。无色粉末,  $[\alpha]_D^{25} - 10.8^\circ$  (水)。与之相近似的还有 *Bacillus magaterium* 产生的 Schizokinen, *Arthobacter* sp. 产生的 Arthobacin 和 *Nannocystis* sp. 产生的 Nannochelin A 等。(J. Antibiot. 1992, 45; 147)

