

《药理学》辅导：抗疟药 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/18/2021\\_2022\\_\\_E3\\_80\\_8A\\_E8\\_8D\\_AF\\_E7\\_90\\_86\\_E5\\_c23\\_18626.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022__E3_80_8A_E8_8D_AF_E7_90_86_E5_c23_18626.htm) 一、疟原虫的生活史及

抗疟药作用环节疟疾：间日疟、三日疟、恶性疟。疟原虫的生活史可分为人体内的无性生殖阶段和雌性按蚊体内的有性生殖阶段（图47-1）。抗疟药可作用于疟原虫生活史不同环节，用以治疗或预防疟疾。二、常用抗疟药（一）主要用于控制症状的抗疟药氯喹（chloroquine）体内过程特点：（1）口服吸收快而完全，血药浓度达峰时间为1~2小时；（2）血浆半衰期数天至数周，并随用药剂量增大而延长；（3）广泛分布于全身组织，在肝、脾、肾、肺组织中的浓度常达血浆浓度的200~700倍，红细胞内的浓度比血浆浓度高约10~20倍，而被疟原虫入侵的红细胞又比正常红细胞高出25倍。抗疟作用：对间日疟原虫和三日疟原虫以及敏感的恶性疟原虫的红细胞内期裂殖体有杀灭作用，能迅速有效地控制临床发作。其特点是起效快、疗效高、作用持久。通常用药后24~48小时内临床症状消退，48~72小时血中疟原虫消失。氯喹也能预防性抑制疟疾症状发作，在进入疫区前1周和离开疫区后4周期间，每周服药一次即可。对间日疟和三日疟的配子体也有效，但对恶性疟的配子体无效，有益于防止良性疟传播。氯喹对红细胞外期疟原虫无效，不能用于病因性预防，也不能根治间日疟。机制：疟原虫生长发育所需的氨基酸主要来自宿主红细胞的血红蛋白。疟原虫摄取血红蛋白，在酸性食物泡内被蛋白酶分解，释放出氨基酸供虫体利用。氯喹为弱碱性药物，升高食物泡内pH值，影响蛋白酶的活性，从而降

低疟原虫利用血红蛋白的能力。 疟原虫在消化血红蛋白时释放血红素（高铁原卟啉IX），后者是一种毒性化合物，具有膜溶解作用。正常时，疟原虫血红素聚合酶催化血红素转变为无害的疟色素。氯喹能抑制该酶活性，可致血红素堆积，从而使疟原虫细胞膜溶解破裂而死亡。 氯喹可插入疟原虫DNA双螺旋结构中，形成稳固的DNA-氯喹复合物，影响DNA复制和RNA转录，从而抑制疟原虫的分裂繁殖。敏感恶性疟原虫体内氯喹浓度高，而耐药恶性疟原虫体内氯喹浓度低。疟原虫对氯喹耐药的机制可能与药物从虫体排出增多或浓集能力降低有关。

2.抗肠道外阿米巴病作用  
3.免疫抑制作用  
大剂量氯喹能抑制免疫反应，偶尔用于类风湿性关节炎、红斑狼疮等。

用药注意事项：（1）长期大剂量应用时角膜浸润，表现为视力模糊，少数影响视网膜，可引起视力障碍，应定期作眼科检查；（2）有致畸作用，孕妇禁用；（3）肝肾功能不良者慎用。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)