

药理学辅导：抗疟疾药 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\\_\\_E8\\_8D\\_AF\\_E7\\_90\\_86\\_E5\\_AD\\_A6\\_E8\\_c23\\_18842.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022__E8_8D_AF_E7_90_86_E5_AD_A6_E8_c23_18842.htm)

人类的疟原虫主要有3种：间日疟原虫、三日疟原虫和恶性疟原虫。前二者合称为良性疟。间日疟48小时发作一次，三日疟72小时发作一次，恶性疟24-48小时发作一次。疟原虫生活史分为有性生殖(蚊体内)和无性生殖(人体内)两个发育过程。疟原虫子孢子因疟蚊吸血而传入人体血液后，经30分钟进入肝细胞发育成裂殖体。约8天后，裂殖体增殖分裂成数千至数万个裂殖子(恶性疟多达4万)，使肝细胞胀破逸出大量裂殖子。此时无临床症状，称为红细胞前期。红细胞前期产生的裂殖子(良性疟)，一部分侵入新的肝细胞，继续进行循环发育，称为红细胞外期。此种发育在肝细胞内反复进行(可潜伏1-3年)，也不引起临床症状，但当人体抵抗力减弱时，其裂殖子侵入红细胞，成为复发的根源。但恶性疟原虫没有红细胞外期，不存在复发的问題。裂殖子(前期和外期产生的)可侵入红细胞，进行无性生殖发育成为裂殖体。裂殖体成熟后胀破红细胞，释放出全部裂殖子及代谢产物，引起畏寒、发热等临床症状。称为红细胞内期。血流中大部分裂殖子被吞噬细胞吞噬，一部分侵入新的红细胞重复以上过程，产生症状的周期性发作。红细胞内期的裂殖子开始有性发育，形成雌雄配子体。配子体对人体无害，不引起症状，60-80天后被吞噬细胞吞噬。如配子体被雌按蚊吸入，则在蚊体内进行有性生殖。(一)主要用于预防的抗疟疾药：1、乙胺嘧啶(息疟

定)Pyrimethamine,Daraprim：对红细胞前期的疟原虫有较强的

杀灭作用。为病因性预防首选药。其预防作用可维持一周以上；对红细胞内期末成熟的裂殖体有抑制作用，可防止良性疟的复发，可用于休止期的治疗。但对已成熟的裂殖体无效，故不能控制症状；对配子体无明显作用，但在蚊体内可抑制原虫配子体的有性增殖。本品为二氢叶酸还原酶抑制剂，可阻止二氢叶酸进一步还原为四氢叶酸，抑制核酸(DNA、RNA)和蛋白质的合成，导致疟原虫不能分裂繁殖。主要用于预防。TMP作用原理与乙胺嘧啶相同；磺胺类与砒类可竞争性抑制二氢叶酸合成酶，阻止疟原虫合成二氢叶酸。此二类药单用效果较差，常合用。一般无不良反应。

2、氯胍(百乐君)与环氯胍Chloroguanide and Cyclochloroguanide：前者在体内转化为后者，能杀灭红细胞前期疟原虫，但对间日疟红细胞前期无效；能杀灭红细胞内期的疟原虫，但作用缓慢，不宜用于控制症状；能抑制疟原虫在蚊体内发育。但作用不持久，预防用药需每周给药多次。

(二)主要用于控制症状的抗疟药：

1、氯喹Chloroquine：能杀灭疟原虫红细胞内期裂殖体，作用快而强。是控制疟疾症状的首选药；对红细胞外期疟原虫无效；恶性疟因无红细胞外期，可根治，但其配子体消灭须加用伯氨喹。可杀灭阿米巴大滋养体，为阿米巴脓肿的首选药。对免疫反应的效应阶段有抑制作用，用于红斑狼疮、类风湿性关节炎、肾病综合征、支气管哮喘等。具有奎尼丁样作用，具有抗房颤效力。还可用于治疗脂溢性皮炎、流行性出血热等。不良反应主要是胃肠道反应。

2、奎宁Quinine：金鸡纳树皮含20余种生物碱，奎宁、奎尼丁、辛可宁Cinchonine、辛可尼丁Cinchonidine均有抗疟作用，而奎宁作用较强。奎宁作用与氯喹相似，能杀灭红细胞内期的疟

原虫，作用较弱，对间日疟有较好疗效，但对三日疟或恶性疟疗效较差。对红细胞外期疟原虫无效，不能根治良性疟，须并用伯氨喹。能杀灭良性疟配子体，但对恶性疟配子体须配用伯氨喹。优点是不产生耐药性、作用快。缺点是作用弱而短、不良反应较多、复发率高、不宜作常规用药。有解热止痛作用，可用于疟疾发热及各种神经痛。不良反应较多，主要有金鸡纳反应(恶心、呕吐、头痛、精神不振、耳鸣、视力减退、耳聋等)、特异质反应、心脏毒性、兴奋子宫、强烈局部刺激作用等。

3、其它：哌喹Piperaguine、羟基哌喹Hydroxypiperaguine、咯啉Pyracrine、咯萘啶(疟乃停)Malanidine、青蒿素(黄花蒿素)Artemisinin等。

(三)主要用于防止复发和杜绝传播的抗疟药：伯氨喹(伯氨喹啉,伯喹)Primaquine：能杀灭良性疟红细胞外期疟原虫，是防止复发的首选药。能杀灭各类疟原虫配子体，杜绝传播。对红细胞内期疟原虫作用较差，不单独用于控制症状。常与氯喹合用，可控制症状、消除复发与传播根源，达到根治目的。本品毒性较大，主要是对红细胞毒性，引起急性溶血性贫血和高铁血红蛋白血症。

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)