

Chapter 46

抗寄生虫药

河北工程大学医学院 田河林

目录

1. 抗疟药
2. 抗阿米巴药及抗滴虫药
3. 抗血吸虫药及抗丝虫药
4. 抗肠蠕虫药

第一节 抗疟药

疟原虫生活史

1. 在人体内发育

① 红细胞外期

② 红细胞内期

2. 按蚊体内发育

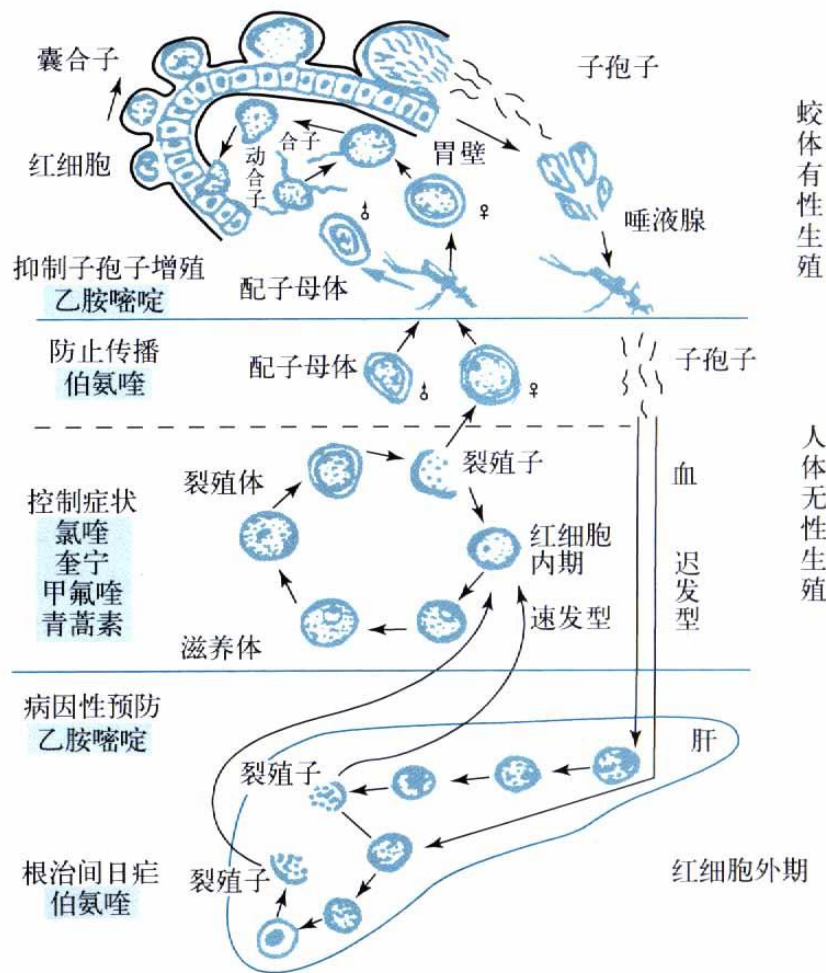


图 46-1 疟原虫的生活史及抗疟药的作用环节

第一节 抗疟药

抗疟药的分类

1. 主要用于控制症状的抗疟药

氯喹
奎宁
甲氟喹
青蒿素

2. 主要用于控制复发和传播的抗疟药

伯氨喹

3. 主要用于病因性预防的抗疟药

乙胺嘧啶

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制症状的抗疟药

氯喹 (chloroquine)

【体内过程】

1. 口服吸收快而完全， F 约为90%
2. 肝、脾、肾、肺中浓度为血浆200~700倍
3. 红细胞内浓度比血浆高10~20倍
4. 原型药物及代谢产物经肾排泄
5. 酸化尿液可促进肾排泄

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制症状的抗疟药

氯喹 (chloroquine)

【药理作用及临床应用】

1. 抗疟作用

- ① 抑制疟原虫血红素聚合酶活性，使其细胞膜溶解破裂而死亡
- ② 起效快，疗效高，作用持久
- ③ 预防性抑制疟疾症状发作
- ④ 防止良性疟传播

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制症状的抗疟药

氯喹 (chloroquine)

【药理作用及临床应用】

1. 抗疟作用 控制疟疾症状的首选药
2. 抗阿米巴原虫作用 肠外阿米巴病
3. 免疫抑制作用 { 类风湿关节炎
 红斑狼疮
 肾病综合征
 光敏性疾病

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制症状的抗疟药

氯喹 (chloroquine)

【不良反应】

1. 常见胃肠道反应、皮肤瘙痒、头晕、耳鸣
2. 长期大剂量：视网膜沉积而致视物模糊
3. 静脉给药：低血压、肺水肿、惊厥、昏迷
4. 急性中毒：氯化铵酸化尿液以促进排泄
5. 本品有致畸作用，孕妇禁用

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制症状的抗疟药

奎宁 (quinine)

【药理作用及临床应用】

1. 抗疟机制
 - ① 抑制疟原虫血红素聚合酶活性
 - ② 抑制疟原虫DNA复制和RNA转录
2. 临床应用
 - ① 耐药（氯喹）恶性疟
 - ② 脑型疟或重症疟疾

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制症状的抗疟药

奎宁 (quinine)

【不良反应】

1. 金鸡纳反应：恶心呕吐，腹痛腹泻，视物模糊，听力减退
2. 心血管反应：低血压，致死性心律失常，心脏抑制
3. 特异质反应：急性溶血（寒战、高热、血红蛋白尿、贫血）
4. 其他反应：刺激胰岛素分泌；兴奋妊娠子宫；支气管哮喘

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制症状的抗疟药

青蒿素 (artemisinin)

1. 中国学者从黄花蒿中提取的新型抗疟药
2. 干扰疟原虫线粒体结构，抑制蛋白质合成
3. 起效快，毒性低，但复发率高
4. 用于耐药恶性疟，抢救脑型疟
5. 与伯氨喹使用以减少复发率



黄花蒿

第一节 抗疟药

—— 主要用于控制复发和传播的抗疟药

伯氨喹（primaquine）

1. 口服吸收好，体内分布广，肝中浓度高
2. 损伤疟原虫线粒体，或阻碍疟原虫的电子传递
3. 主要用于防止疟疾复发和传播
4. 与红内期抗疟药合用，可根治间日疟
5. 大剂量可致高铁血红蛋白血症

第一节 抗疟药

—— 主要用于病因性预防的抗疟药

乙胺嘧啶 (pyrimethamine)

1. 抑制疟原虫二氢叶酸还原酶，阻碍其核酸合成
2. 与磺胺药合用，增强疗效并延缓耐药性形成
3. 作病因性预防用药，每周服药1次即可
4. 久用干扰人体叶酸代谢，可用亚叶酸钙治疗
5. 哺乳期及妊娠期妇女禁用

第二节 抗阿米巴药

抗阿米巴药的分类

1. 抗肠阿米巴病药

- ① 卤化喹啉类：喹碘方、氯碘羟喹、双碘喹啉
- ② 二氯乙酰胺类：二氯尼特、克立法胺
- ③ 抗生素类：巴龙霉素、四环素、红霉素

2. 抗肠外阿米巴病药 氯喹

3. 抗肠内、外阿米巴病药

- ① 硝基咪唑类：甲硝唑、替硝唑、奥硝唑
- ② 依米丁类：依米丁、去氢依米丁

第二节 抗阿米巴药

—— 抗肠阿米巴病药

喹碘方（chiniofon）

【药理作用】

1. 直接杀灭阿米巴滋养体（对包囊无效）
2. 抑制肠道共生菌，间接抑制滋养体生长

【临床应用】

1. 轻症慢性阿米巴痢疾，无症状带囊者
2. 急性阿米巴痢疾，与甲硝唑/依米丁合用

【不良反应】

消化道症状常见；碘过敏、甲状腺疾病及肝肾疾病禁用

第二节 抗阿米巴药

—— 抗肠外阿米巴病药

氯喹 (chloroquine)

1. 口服吸收后主要分布于肝、脑、肺、肾等组织
2. 控制疟疾症状的首选药
3. 可杀灭阿米巴滋养体，迅速改善阿米巴病症状
4. 主要用于甲硝唑无效的肠外阿米巴病
5. 尚未发现阿米巴原虫对本品产生耐药性

第二节 抗阿米巴药

—— 抗肠内、外阿米巴病药

甲硝唑 (metronidazole)

【体内过程】

1. 口服吸收迅速完全（ F 约为100%）
2. 体内分布广（阴道分泌物、精液、唾液、乳汁）
3. 脑脊液可达有效浓度
4. 代谢产物可使尿液呈棕红色

第二节 抗阿米巴药

—— 抗肠内、外阿米巴病药

甲硝唑（metronidazole）

【药理作用】 药物分子中的硝基抑制微生物DNA合成或其DNA变性

1. 抗阿米巴作用：可杀灭肠内、外阿米巴滋养体
2. 抗滴虫作用：杀灭阴道滴虫，而不影响正常菌群
3. 抗厌氧菌作用：对厌氧杆菌和球菌均有杀灭作用
4. 抗贾第鞭毛虫作用：对蓝氏贾第鞭毛虫具有抑制作用
5. 抗幽门螺杆菌作用：对幽门螺杆菌具有抑制作用

第二节 抗阿米巴药

—— 抗肠内、外阿米巴病药

甲硝唑 (metronidazole)

【临床应用】

1. 阿米巴病

- ① 治疗肠内、外阿米巴病首选药
- ② 与喹碘方/巴龙霉素使用，提高疗效，减少复发
- ③ 对无症状带囊者无效

2. 滴虫病

- ① 治疗阴道滴虫病首选药
- ② 治疗失败时需加大剂量重复治疗

第二节 抗阿米巴药

—— 抗肠内、外阿米巴病药

甲硝唑 (metronidazole)

【临床应用】

3. 厌氧菌感染

- ① 厌氧菌所致口腔、盆腔、腹腔感染及败血症
- ② 较少引起耐药性及二重感染

4. 贾第虫病 治愈率可达90%

5. 消化性溃疡 治疗胃及十二指肠溃疡

第二节 抗阿米巴药

—— 抗肠内、外阿米巴病药

甲硝唑 (metronidazole)

【不良反应】

1. 常见消化道症状：恶心、腹痛、口腔金属味
2. 偶见失眠、头晕、排尿困难、感觉异常
3. 干扰乙醛代谢；服药期间或停药不久应禁止饮酒

第三节 抗血吸虫药及抗丝虫药

— 抗血吸虫药

吡喹酮 (praziquantel)

【药理作用及作用机制】

影响虫体内 Ca^{2+} 分布，导致虫体挛缩和皮层受损
宿主的特异性免疫反应；影响虫体代谢

杀灭

血吸虫、华支睾虫、绦虫、棘球囊

第三节 抗血吸虫药及抗丝虫药

—— 抗血吸虫药

吡喹酮 (praziquantel)

【临床应用】

1. 血吸虫病：迅速改善症状；毒性低、疗程短、口服方便
2. 华支睾吸虫病：治愈率接近100%
3. 绦虫病：牛带绦虫、猪带绦虫等首选药
4. 棘球蚴病：皮下或组织棘球蚴病、脑棘球蚴病

【不良反应】

1. 神经系统反应：头痛头昏，偶可诱发精神失常
2. 消化系统反应：恶心呕吐，偶致消化道出血
3. 心血管系统反应：大剂量出现T波低平，停药可恢复

第三节 抗血吸虫药及抗丝虫药

— 抗丝虫药

乙胺嗪 (diethylcarbamazine)

【作用机制】

改变微丝蚴体表膜结构，易受宿主免疫攻击
使微丝蚴肌组织超极化，虫体失去活动能力



【药理作用】

杀灭班氏丝虫、马来丝虫的微丝蚴



【临床应用】

淋巴丝虫病首选药



【不良反应】

药物引起的胃肠反应
虫体引起的过敏反应

第四节 抗肠蠕虫药

—— 抗肠线虫药

甲苯咪唑 (mebendazole)

【体内过程】

口服吸收少，首过消除高，肠腔中药物浓度高

【药理作用】

抑制虫体微管蛋白；抑制虫体线粒体延胡索酸还原酶

【临床应用】

用于鞭虫、蛲虫、蛔虫、钩虫及绦虫感染（高效广谱驱虫药）

【不良反应】

大剂量可致暂时性肝功能异常；致畸

第四节 抗肠蠕虫药

—— 抗肠线虫药

左旋咪唑 (levamisole)

1. 抗肠虫作用

- ① 抑制虫体肌肉中的琥珀酸脱氢酶，减少能量产生
- ② 用于蛔虫、钩虫感染及丝虫病

2. 免疫调节作用

- ① 刺激T细胞和巨噬细胞功能，提高免疫力
- ② 降低免疫低下者感染发病率；化疗药的辅助用药

第四节 抗肠蠕虫药

—— 抗肠绦虫药

氯硝柳胺 (niclosamide)

【药理作用】

1. 抑制虫体线粒体氧化磷酸化过程及葡萄糖代谢
2. 对猪带绦虫、牛带绦虫等有强大杀灭作用

【临床应用】

1. 治疗绦虫病，与泻药硫酸镁合用
2. 防治血吸虫病，对钉螺有杀灭作用

思考题

1. 名词解释：金鸡纳反应。
2. 常用抗疟药的作用特点及应用。
3. 甲硝唑的药理作用及临床应用。
4. 治疗阿米巴病、滴虫病、血吸虫病及绦虫病的首选药。