

最新药物临床试验管理规范与

临床用药用里指导应用实用手册

YAO WU LIN CHUANG



世界知识音像出版社

第二章 抗寄生虫药

寄生虫病是危害我国人民健康的主要疾病。抗寄生虫药根据作用的不同,分为抗疟疾药、抗黑热病药、抗阿米巴药、抗滴虫药、抗绦虫药、抗血吸虫药、抗肠虫药等。抗寄生虫药近年来发展较快,有些疗效差或毒性较大的药物逐渐被淘汰,代之以一些疗效较高、毒性较小的新药,现将各类药物分别进行介绍。

第一节 抗疟疾药

一、概述和分类

疟疾是疟原虫所引起的传染病,临床上以间歇性寒战、高热、出汗和脾肿大、贫血等为特征,恶性疟有侵犯内脏引起凶险发作的倾向。疟疾为一世界性疾病,但多见于东南亚、南非洲及南美洲等热带地区。

寄生人体的疟原虫有4种,即间日疟原虫、卵形疟原虫(两者均48小时发作一次)、三日疟原虫(72小时发作一次)和恶性疟原虫(热型不规则,可呈马鞍型热或持续高热,也可48小时发作一次)。其生活史基本相同。用药的选择须考虑到虫种的不同发育阶段。

疟原虫在雌性按蚊体内进行有性繁殖,按蚊叮咬人后,原虫进入人体,进行发育,可分为红细胞前期(红前期)、红细胞外期(红外期)、红细胞内期(红内期)和配子体等阶段。

红前期 带疟原虫的按蚊叮咬人后,孢子体进入血液,到肝脏进行裂殖,经6~12天形成大量裂殖子,逸出肝细胞并侵入红细胞。在进入红细胞前的阶段称为红前期。

红外期 间日疟原虫和卵形疟原虫的裂殖子除侵入红细胞外,还可继续侵入其他肝细胞,经裂殖产生更多的裂殖子。这个过程可长达3~6个月。肝细胞内的裂殖子是疟疾复发的根源。恶性疟原虫无红外期,所以没有症状消失后复发的问題。

红内期 肝细胞内逸出的裂殖子，侵入红细胞，发育成为滋养体，再变为裂殖体，最后裂殖体成熟，生成大量裂殖子逸出，引起红细胞破裂而产生疟疾发作的症状。裂殖子再侵入完整的红细胞而重复上述过程，引起疟疾反复发作。

配子体 疟原虫在红细胞内裂殖，经过3~5代，部分裂殖子分化为雌雄配子体。当按蚊叮咬时，它们进入蚊体进行有性生殖，再生成大量孢子体，一旦按蚊再叮咬健康人，即起传播疟疾的作用。

根据疟原虫的生活史，抗疟疾药作用于它的不同发育阶段，可分类如下：

1. 预防药 作用于红前期起预防感染疟疾的作用，如乙胺嘧啶。
2. 控制症状发作药 作用于红内期，杀灭裂殖体而控制疟疾症状发作，如氯喹、奎宁、青蒿素、咯萘啶等。
3. 抗复发药 作用于红外期，杀灭裂殖子，可防止疟疾症状消失后的复发，如伯氨喹。
4. 防止传播药 作用于配子体，使发病患者受按蚊叮咬时起不再传播疟疾的作用，如伯氨喹、乙胺嘧啶等。

二、用药原则

早先的疟疾治疗只注重于控制症状发作，复发率高，后来重视了抗复发治疗，并推行预防，因此，疟疾的威胁有所减轻。但是，有些药物反复长期应用，造成了疟原虫的抗药性，所以需要一些新的抗疟药来满足医疗需要。目前在疟疾的治疗方面，采用了控制症状与抗复发相结合，并加强了预防和防止传播，以及使用具多种作用的复方制剂或将作用性质不同的药物联合应用治疗，使疟疾的防治工作更加有效。应用药物中应能作用于红前期起预防作用，杀灭红内期裂殖体起控制症状作用；杀灭红外期裂殖体起抗复发作用，并能杀灭配子体起防传播作用。为此常选用控制症状药与伯氨喹或乙胺嘧啶合用，合用后可具有上述几种功能。

三、常用药物简介

氯喹（磷酸氯化喹啉）

【作用特点】 作用于疟原虫的红内期，能有效地控制疟疾的发作。本品对疟原虫的红外期无效，故不能根治间日疟或三日疟。而恶性疟因原虫无红外期，故能得以根治。本品的作用快，效力强、是控制疟疾症状发作的主要药物，但部分恶性疟原虫对本品耐药，需要改用其他抗疟药来治疗。

【应用】

1. 用法用量

(1) 成人常用量：①间日疟，口服首剂 1g，第 2、3 日各 0.75g。②恶性疟，静脉滴注，第 1 日 1.5g，第 2、3 日均为 0.5g，疗程 3 日，总量 2.5g。一般每 0.5~0.75g 氯喹加入 5% 葡萄糖注射液 500ml 中，第 1 日药量于入院 12 小时内全部输给。③抑制性预防疟疾，口服每周 1 次，每次 0.5g。

(2) 小儿常用量：①间日疟，口服首次剂量按体重 10mg/kg（以氯喹计算，以下同），最大量不超过 600mg，6 小时后按体重 5mg/kg 再服一次，第 2、3 日每日按体重 5mg/kg。②脑型恶性疟，静脉滴注，第 1 日为按体重 18~24mg/kg（超过 60kg 者按 60kg 计算），第 2 日按体重 12mg/kg，第 3 日按体重 10mg/kg。输液浓度为每 0.5g 磷酸氯喹加入 10% 葡萄糖注射液或 5% 葡萄糖氯化钠注射液 500ml，滴入速度为每分钟 12~20 滴，第 1 日药量于 8~12 小时内 1 次滴完。

2. 不良反应及注意 ①主要不良反应为头痛、头晕、胃肠道反应、耳鸣、皮肤瘙痒等。②长期服用则可发生较严重的不良反应，如粒细胞减少和视力障碍。偶可引起精神错乱和心律失常，甚至发生阿斯综合征而心搏骤停。③本品用量不足，恶性疟常在 2~4 周内复燃，且易致耐药性。④若与伯氨喹联合应用，可减少一次用量，即在服药首日只服首剂，8 小时后不服药，第 2、3 日仍照旧服用。⑤本品可引起胎儿脑积水、四肢畸形及耳聋，故孕妇禁用。⑥氯喹注射剂不宜作肌注，尤其是儿童，易致心肌抑制。禁止作静脉推注。

奎宁（规宁、鸡纳碱）

【作用特点】作用如氯喹，对红内期的疟原虫有抑制繁殖和杀灭作用，对间日疟最有效、三日疟次之，恶性疟较差。对红外期的疟原虫和配子体均无效，故不能有效地防止复发和预防感染。本品还有解热作用，有利于控制疟疾症状。常用于治疗耐氯喹的恶性疟，与乙胺嘧啶、磺胺类或砒类联合应用的疗效比单用满意。

【应用】

1. 用法用量

(1) 成人常用量：①用于治疗耐氯喹虫株引起的恶性疟时，采用硫酸奎宁，每日 1.8g，分次服用，疗程 14 日。严重病例（如脑型）可采用二盐酸奎宁，按体重 5~10mg/kg（最高量 500mg），加入氯化钠注射液 500ml 中静脉滴注，4 小时滴完，12 小时后重复 1 次，病情好转后改口服。②本品已不作为间日疟的首选药，必要时控制症状可口服重硫酸奎宁，第 1 日 1 次 0.48g，第 2 日 1 次 0.36g，每日 3 次，连服 7 日。

(2) 小儿常用量：用于治疗耐氯喹虫株所致的恶性疟时，小于 1 岁者每日给硫酸奎宁 0.1~0.2g，分 2~3 次服，1~3 岁 0.2~0.3g，4~6 岁，0.3~0.5g，7~11 岁为 0.5~1g，疗程 10 日。重症患者应用二盐酸奎宁注射液剂量同成人，按体重 5~10mg/kg（最高量 500mg）。

2. 不良反应及注意 ①每日用量超过 1g 或用药稍久，可出现金鸡纳反应，有恶心、呕吐、头痛、耳鸣、眼花、视力和听力减退等症状，严重时可出现发热、烦躁、

谵妄等。②特异质者可引起溶血性贫血、白细胞减少、皮疹、瘙痒、血管神经性水肿、支气管哮喘以及光敏反应等。③静注给药过速易引起心律失常或休克，因此目前已不用静注法给药，只宜缓慢静滴。肌注局部刺激性强，易致组织坏死。④有子宫收缩作用，孕妇忌用，月经期慎用。⑤心肌病变患者不宜用本品。⑥对诊断的干扰：奎宁可干扰17-羟类固醇的测定。

哌嗪（磷酸哌嗪、磷酸嗉哌）

【作用特点】 用于疟疾的治疗，也可作症状抑制性预防用。尤其是用于耐氯喹虫株所致的恶性疟的治疗与预防。

【应用】

1. 用法用量 抑制性预防疟疾，每月服0.6g，一月一次，临睡前服，可连服4~6个月，但不宜超过6个月。治疗疟疾，本品对耐氯喹虫株所致的恶性疟有根治作用，但作用缓慢，宜在奎宁、青蒿素、咯萘啶控制症状后继用本品，首次0.6g，第2、3日分别服0.6g及0.3g，总量1.2~2.5g。

2. 不良反应及注意 ①服后偶有头晕、嗜睡、乏力、胃部不适，面部和嘴唇麻木感，轻者停药休息后能自愈。②严重急性肝、肾及心脏疾患禁用，孕妇慎用。鉴于本品多积聚于肝脏，若给药剂量大，间隔时间短则易引起肝脏不可逆病变。③磷酸哌嗪1g含碱基0.54g，过去文献中计量方法不一，新版中国药典直接用磷酸盐来计算剂量。

伯氨喹（磷酸伯氨喹、伯喹）

【作用特点】 主要用于根治间日疟。对各种疟原虫的配子体有较强的杀灭作用，但只有在特殊的场合下，为了迅速扑灭恶性疟流行，用来消灭恶性疟配子体。

【应用】

1. 用法用量

(1) 成人常用量：口服。按伯氨喹计，根治间日疟采用每日口服22.5mg，连服7日。用于消灭恶性疟配子体时，采用每日15mg，连服3日。

(2) 小儿常用量：口服按伯氨喹计，根治间日疟采用每日按体重0.39mg/kg，连服14日。用于消灭恶性疟配子体时，剂量相同，连服3日。

2. 不良反应及注意 ①本品毒性反应较其他抗疟药为高。当每日用量超过30mg（基质）时，易发生疲倦、头昏、恶心、呕吐、腹痛等不良反应；少数人可出现药物热，粒细胞缺乏等，停药后即可恢复。②葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者服用本品可发生急性溶血性贫血，这种溶血反应仅限于衰老的红细胞，并能自行停止发展，一般不严重。一旦发生应停药作适当的对症治疗。当葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏时，会引起高铁血红蛋白过多症，出现紫绀、胸闷等症状，应用亚甲蓝1~2mg/kg，作静脉注射，能迅速改善症状。③孕妇及哺乳期妇女、糖尿病患者均应慎用。④系统性红斑狼疮及类风湿性关节炎患者服用本品易发生粒细胞缺乏。⑤应定期检查红细胞计数及血红蛋白量。

乙胺嘧啶（自症定）

【作用特点】 对某些恶性疟和间日疟原虫的红前期有抑制作用，还可抑制疟原虫在蚊体内的发育，用作为预防感染药。与伯氨喹配伍可抗间日疟复发。

【应用】

1. 用法用量

(1) 成人常用量：口服。①预防用药，应于进入疫区前1~2周开始服用，一般宜服至离开疫区后6~8周，每周服25mg。②耐氯喹虫株所致的恶性疟，每日50mg，分2次服，疗程3日。

(2) 小儿常用量：口服。①预防用药，一次按体重0.9mg/kg，每周服一次，最高剂量以成人量为限；②耐氯喹虫株所致的恶性疟，每次按体重0.3mg/kg，一日3次，疗程3日。

2. 不良反应及注意 ①口服一般抗疟治疗量时，毒性很低，较为安全。大剂量应用时，如每日用25mg，连服1个月以上，就会出现叶酸缺乏现象。主要影响生长繁殖特别迅速的组织，如骨髓、消化道粘膜，引起造血功能障碍及消化道症状，如味觉的改变或丧失，舌头疼痛、红肿、烧灼感及针刺感，口腔溃疡、白斑等，食管炎所致的吞咽困难、恶心、呕吐、腹痛、腹泻等。较为严重的是巨幼红细胞性贫血、白细胞减少症等，如及早停药，能自行恢复。甲酰四氢叶酸可改善骨髓功能，能减轻乙胺嘧啶的毒性作用。由于过敏所致的皮肤红斑则较少见。②乙胺嘧啶过量可引起急性中毒症状，儿童更易发生，本药具香味，儿童可误作糖果而造成中毒事故。误服过量后1~2小时内可出现恶心呕吐、胃部烧灼感、口渴、心悸、烦躁不安等，重者出现眩晕、视力模糊、阵发性抽搐、惊厥、昏迷，可引起死亡，此乃药物对中枢神经系统的直接毒性作用所致。③偶可引起药疹。④肾功能不良者及孕妇均禁用。⑤哺乳期妇女亦禁用。因本品可由乳汁中排出，干扰婴儿的叶酸代谢，若婴儿有葡萄糖-6-磷酸脱氢酶（G-6-PD）缺乏，则可引起溶血性贫血。⑥大剂量治疗时每周应检测白细胞及血小板2次。

青蒿素（黄花蒿素、黄蒿素）

【作用特点】 对疟原虫的红细胞内期有高效杀灭作用。对氯喹耐药的间日疟、恶性疟亦有效。对脑型疟有较好疗效。间日疟单用本品易复发，与伯氨喹联用可降低复发率。与甲氧苄啶合用有增效作用，并可减少近期复燃或复发。

【应用】

1. 用法用量 成人常用量：①控制疟疾症状（包括间日疟与耐氯喹恶性疟），口服，首次1g，6~8小时后0.5g，第2、3日各0.5g；直肠给药，首次0.6g，4小时后0.6g，第2、3日各0.4g。②恶性脑型疟，肌内注射，首剂0.6g，第2、3日各肌注0.15g。

2. 不良反应及注意 ①注射入深部肌肉内，深度不够可致局部肿块和疼痛。②少

数病人可致血清转氨酶升高。③口服可致轻度胃肠道反应。④孕妇禁用。

蒿甲醚（血防灵、甲基还原青蒿素）

【作用特点】 适用于各种疟疾，但主要用于抗氯喹恶性疟治疗和凶险型恶性疟的急救。抗疟作用比青蒿素强 10~20 倍。单用复燃率为 8%，与伯氨喹合用可使之降低。并对急性上呼吸道感染所致高热有退热作用。

【应用】

1. 用法用量

(1) 成人常用量：①口服，首剂 160mg，第 2 日起每日 1 次，每次 80mg，连服 5~7 日；②肌内注射，首剂 160mg，第 2 日起每日 1 次，每次 80mg，连用 5 日。

(2) 小儿常用量：肌内注射，首剂按体重 3.2mg/kg；第 2~5 日，每次按体重 1.6mg/kg，每日 1 次。

2. 不良反应及注意①本品遇冷如有凝固现象，可微温溶解后使用；②妊娠早期妇女慎用；③本品反应轻微，个别患者有门冬氨酸氨基转移酶、丙氨酸氨基转移酶轻度升高，网织红细胞可能有一过性减少。

咯萘啶（疟乃停、磷酸咯萘啶）

【作用特点】 本品用于治疗脑型、凶险型及耐氯喹虫株所致的恶性疟，也用于治疗间日疟。与邻二甲氧嘧啶、乙胺嘧啶合用有增效作用，可减少复燃及防止、延缓耐药性的产生。与伯氨喹合用，有较好的根治间日疟作用，根治率达 98%。

【应用】

用法用量 按咯萘啶计算

(1) 成人常用量 ①口服。第 1 日服 2 次。每次 0.3g，间隔 4~6 小时，第 2、3 日各服 1 次；②静脉滴注。每次按体重 3~6mg/kg，加入 5% 葡萄糖注射液 200~500ml 中，于 2~3 小时左右滴完。间隔 6~8 小时重复一次，12 小时内总剂量为按体重 12mg/kg；③肌内注射。每次按体重 2~3mg/kg，共给 2 次，间隔 4~6 小时。

(2) 小儿常用量 小儿口服总剂量为按体重 24mg/kg，分 3 次服。注射剂量参照成人。

不良反应及注意：①少数病例可有较轻的胃肠道反应、头晕、恶心、心悸等。②心、肝、肾功能不全者慎用。③本品不可直接静脉推注。④肌注后局部有硬块，每次注射应改变部位。⑤服药后尿呈红色。

磺胺多辛

【作用特点】 与乙胺嘧啶联合起防止感染作用。

氯苯碘

【作用特点】 与乙胺嘧啶或甲氧苄啶联合起防止感染作用。

甲氧苄啶 (TMP) 与磺胺多辛 (周效磺胺) 联合治疗间日疟和恶性疟。剂量：磺胺多辛 1g 和本品 0.5g，一次服下。不良反应参阅抗菌药物部分。

四环素类：四环素类有抗疟原虫作用，其效果不如氯喹，但对耐氯喹的虫株有一定的作用，可作为配合药应用，如服奎宁期间可加服四环素 0.25g，一日 4 次，用 7 天，以增强疗效。不良反应参见抗生素部分。

青蒿琥酯（青蒿酯）

【作用特点】 适用于脑型疟及各种危重症疾的抢救。

【应用】

1. 用法用量

(1) 口服：首剂 100mg，第 2 日起 1 日 2 次，每次 50mg，连服 5 日。

(2) 静脉注射：临用前，加入所附的 5% 碳酸氢钠注射液 0.6ml，振摇 2 分钟，待完全溶解后，加 5% 葡萄糖注射液或葡萄糖氯化钠注射液 5.4ml 稀释，使每 ml 溶液含青蒿琥酯 10mg，缓慢静注。首次 60mg（或按体重 1.2mg/kg），7 岁以下按体重 1.5mg/kg。首次剂量后 4、24、48 小时各重复注射 1 次。危重者，首次剂量可加至 120mg，3 日为一疗程，总剂量为 240~300mg。

2. 不良反应及注意 ①推荐剂量未见不良反应。如使用过量（大于 2.75mg/kg），可能出现外周网织细胞一过性降低。②动物毒理实验表明本品对胚胎有明显毒性作用，孕妇应慎重。③本品溶解后应及时注射，如出现混浊不可使用；④极度严重患者，首次剂量可加倍；⑤症状控制后，宜再用其他抗疟药根治；⑥静脉注射速度不宜太快，每分钟 3~4ml。

双氢青蒿素（利泰新）

【作用特点】 适应证同青蒿素

【应用】

1. 用法用量 口服 1 日 1 次，成人 1 日 60mg，首剂量加倍；儿童量按年龄递减，连用 5~7 日。

2. 不良反应及注意 ①推荐剂量未见不良反应。少数病例有轻度网织红细胞一过性减少。②在动物生殖毒性方面的研究证明，小鼠妊娠感应期给药，能增加胚胎吸收，但未见致畸作用。孕妇慎用。③药物应避光、密闭、在冷处保存。

苯茆醇

【作用特点】 主要用于治疗恶性疟疾，尤其适用于抗氯喹虫株所致的恶性疟疾的治疗。

【应用】

1. 用法用量 口服成人第 1 日 0.8g，第 2、3、4 日各顿服 0.4g。小儿每日按体重 8mg/kg，顿服，连服 4 日，首剂加倍，首剂最大用量不超过 0.6g。

2. 不良反应及注意 ①临床观察 217 例，未见明显不良反应，少数病人可出现心电图 Q-T 间期一过性轻度延长。②心脏病和肾脏病患者慎用。③恶性疟患者，在症状控制及红内期原虫消灭后，即可用磷酸伯氨喹杀灭配子体。

四、选用和比较

1. 治疗疟疾仍推荐应用氯喹（杀灭血中无性体控制临床发作）加伯氨喹（杀灭肝组织内疟原虫和配子体，起根治作用），对耐氯喹的恶性疟虫株，则以青蒿素及其衍生物或咯萘啶为首选，此外亦可采用奎宁或乙胺嘧啶加磺胺多辛。乙胺嘧啶主要用于预防。

2. 抗疟药的预防应用

(1) 防疟片一号：每片含氨基苯砒 100mg、乙胺嘧啶 20mg。成人首服 1 片、连服 2 日，以后每周服 1 片。

(2) 防疟片二号：每片含磺胺多辛 250mg、乙胺嘧啶 17.5mg。成人首服 2 片，连服 2 日，以后每 10 日服 1 次，每次 2 片，直到离开流行区后 50 天为止。本方案对恶性疟流行区适用。

(3) 防疟片三号：每片含磷酸哌喹 250mg、磺胺多辛 50mg。每月服 4 片（1 次或 2 次分服）睡前服下，连用 6 个月。本品还可用于治疗，用法用量：首次 2 片，隔 8 小时再服 1~2 片（视病人体重而定）。

(4) 磷酸氯喹 500mg，每周 1 次，自进入流行区前 1 周开始，直到离开流行区后 6 周。本方案对恶性疟无效。

表 9-2-1 疟疾现症病人合并疗法

药物名称	剂型	每疗程总剂量	用法
磷酸氯喹 +	每片含基质 0.15g	1.2g	第 1 日顿服氯喹 4 片，第 2、3 日每日顿服 3 片。
磷酸伯氨喹啉 奎宁 +	每片含基质 7.5mg 每片含双硫酸盐 0.12g	180mg 4.32g	每日顿服 3 片，连服 8 日。 每日 3 次，每次 3 片，连服 4 日。
磷酸伯氨喹啉 磷酸咯萘啶 +	每片含双硫酸盐 0.12g 每片含基质 100mg	180mg 1.2g	每日顿服 3 片，连服 8 日。 第 1 日每次 3 片，每日 2 次，第 2、3 日每日 3 片，顿服。
磷酸伯氨喹啉	每片含双硫酸盐 0.12g	180mg	每日顿服 3 片，连服 8 日。

（摘自《实用内科学》第 10 版 558 页）3. 抗疟药治疗应用

间日疟、三日疟、卵形疟 氯喹+伯氨喹；奎宁+乙胺嘧啶；奎宁+SD 或其他。

恶性疟 奎宁+乙胺嘧啶；奎宁+SD，必要时应静滴奎宁或其他。

对于一般病例（单纯急性感染无严重合并症）的治疗 氯喹加伯氨喹为首选（表 9-2-1）。奎宁可致流产，故孕妇不宜应用，以采用咯萘啶为妥。为防止妊娠期产生变性血红蛋白症或溶血反应，伯氨喹可在产后服用。输血疟疾单独应用氯喹、奎宁或咯萘啶等杀灭裂殖体的药物即可达到治愈目的。

第二节 抗黑热病药

一、概述与分类

黑热病是由杜氏利什曼原虫侵入人体而引起。主要通过白蛉叮刺而传播，偶可经口腔粘膜、破损皮肤、胎盘或输血而传播。带虫的白蛉叮咬人体，原虫鞭毛体进入人体转变为利杜体。为单核-吞噬细胞所吞噬，随血流带到肝、脾、骨髓、淋巴结等器官组织中，反复分裂，最后细胞破裂，释出大量利杜体又重复上述过程，造成巨噬细胞大量破坏和增生，浆细胞亦大量增生，临床特征为长期不规则发热、消瘦，进行性肝、脾肿大和全血细胞减少症等。

治疗药物主要有

1. 锑剂 葡萄糖酸锑钠，为五价锑。三价锑类的酒石酸锑钾，因毒性大，已不用。
2. 双胍类 喷他胍。

二、常用药物简介

葡萄糖酸锑钠（斯锑黑克）

【作用特点】 对黑热病有良好的疗效。

【应用】

1. 用法用量 肌内或静脉注射：一般成人一次 1.9g (6ml)，一日 1 次，连用 6~10 日；或总剂量按体重 90~130mg/kg (以 50kg 为限)，等分 6~10 次，每日 1 次。小儿总剂量按体重 150~200mg/kg，分为 6 次，每日 1 次。对敏感性较差的虫株感染，可重复 1~2 个疗程，间隔 10~14 日。对全身情况较差者，可每周注射 2 次，疗程 3 周或更长。对新近曾接受锑剂治疗者，可减少剂量。

2. 不良反应及注意 ①发生恶心、呕吐、咳嗽、腹泻以及少数患者白细胞减少等症状。可停药 1~2 日，待症状消失再继续给药。②肺炎，肺结核，严重心、肝、肾病患者禁用。③有出血倾向、体温上升、粒细胞减少等症状时，应暂停治疗。④罕见休克和突然死亡。

喷他胍（戊烷胍）

【作用特点】 对利什曼原虫抗锑株有效，适用于锑剂治疗无效、对锑剂过敏或用锑剂过程中出现粒细胞缺乏的患者。

【应用】

1. 用法用量 一次量 4mg/kg, 每日或间日一次, 新鲜配成的 10% 溶液作深部肌注, 10~15 次为一疗程。必要时间隔 1~2 周后复治。

2. 不良反应及注意 ①肌内注射局部可发生硬结和疼痛, 偶见形成脓肿; ②静脉注射易引起低血压以及其他严重即刻反应, 某些系由于组胺释放所致; ③偶可引起肝肾功能损害(均为可逆性)、低血糖症、口腔、金属味、焦虑、头晕、头痛、神经质、昏厥、嗜睡、幻觉、疲乏无力、恶心、口渴、饥饿感、皮肤发红、皮疹、心动过速或心律不齐、出血倾向等。④下列情况应慎用或禁用: 妊娠或哺乳期妇女、血液病、心脏病、糖尿病或低血糖症、肝肾功能不全、低血压等患者; ⑤同时作放射治疗可增加对骨髓的抑制作用, 药物剂量宜减少。⑥本品可影响血糖、肝功能、肌酐、钾和钙等的检测结果。

三、选用和比较

抗黑热病治疗以葡萄糖酸锑钠为首选, 连续用药 6 日为一疗程, 治愈率达 91%; 经过 2 个疗程治愈者可达 99%。对葡萄糖酸锑钠耐药或不适用者, 则用双胍类治疗。现国内黑热病的发病率低, 抗锑株罕见。

第三节 抗阿米巴病药

一、概述与分类

阿米巴病由溶组织内阿米巴原虫所引起。阿米巴原虫有滋养体和包囊两种形态, 阿米巴包囊是传染源。人食用包囊污染的食物, 包囊进入人体, 到小肠下段, 发育为滋养体, 引起阿米巴痢疾症状。有时滋养体可穿过肠腔, 随血流到达肝、脑、肺、肾、皮肤等处, 形成肠道外阿米巴病, 以阿米巴肝脓肿为多见。

抗阿米巴病药常见者有下列几类:

1. 甲硝唑。
2. 喹啉类 氯喹, 尚有喹碘方、氯碘喹啉、双碘喹啉等。
3. 有机砷化合物 卡巴砷。
4. 其他 呋喃唑酮、安痢平、四环素类、巴龙霉素、吐根碱、大蒜新素等。

二、常用药物简介

氯喹

【作用特点】 适用于肠外阿米巴病。

【应用】 口服每日 1g，连服 2 日后改为每日 0.5g，总疗程为 3 周。其他参见抗疟药部分。

甲硝唑（灭滴灵）

【作用特点】 本品为肠道和肠外阿米巴病（如阿米巴肝脓肿、胸腔阿米巴病等）有杀灭作用，为治疗阿米巴病的首选药物。治疗急性阿米巴痢疾时可与其他肠内抗阿米巴病药交替或联合应用。治疗阿米巴肝脓肿常与氯喹交替应用。

【应用】

1. 用法用量

(1) 成人常用量：肠道阿米巴病一次 0.4~0.6g，一日 3 次，疗程 7 日；肠道外阿米巴病一次 0.6~0.8g，一日 3 次，疗程 20 日。

(2) 小儿常用量：每日按体重 35~50mg/kg，分 3 次口服，10 日为一疗程。

2. 不良反应及注意 ①15%~30% 病例出现不良反应，以消化道反应最为常见，包括恶心、呕吐、食欲不振、腹部绞痛，一般不影响治疗；神经系统症状有头痛、眩晕，偶有感觉异常、肢体麻木、共济失调、多发性神经炎等，大剂量可致抽搐。少数病例发生荨麻疹、潮红、瘙痒、膀胱炎、排尿困难、口中金属味及白细胞减少等，均属可逆性，停药后自行恢复。②孕妇及哺乳期妇女禁用。有活动性中枢神经系统疾患和血液病者亦禁用。③本品的代谢产物可使尿液呈深红色。④原有肝脏疾患者，剂量应减少。出现运动失调或其他中枢神经系统症状时应停药。重复一个疗程之前，应做白细胞计数。⑤本品可抑制酒精代谢，服药期间应戒酒，饮酒后可能出现腹痛、呕吐、头痛等症状。

双碘喹琳（双碘羟喹）

【作用特点】 本品只对阿米巴滋养体有作用，对包囊无杀灭作用。用于轻型或无明显症状的阿米巴痢疾。对急性阿米巴痢疾及较顽固病例宜与依米丁、甲硝唑联合应用，才可达到根治效果。对肠外阿米巴病如肝脓肿均无效。

【应用】

1. 用法用量 成人每次口服 0.4~0.6g，1 日 3 次，连服 14~21 日。小儿每次口服按 10mg/kg 计，用法同成人。

2. 不良反应及注意 ①本品在治疗剂量上是较安全的，最主要的不良反应为腹泻，但不常见，一般在治疗第 2、3 日开始，不需停药，数日后即可自动消失。此外还可出现恶心、呕吐。②大剂量可致肝功能减退等。③对碘过敏、甲状腺肿大、严重肝肾疾

病患者禁用。④重复治疗需间隔 15~20 日。⑤在治疗期间可使蛋白结合碘的水平增高，能干扰某些甲状腺功能试验。

白头翁 一次用 15~30g (鲜品 30~60g)，煎汤内服，对肠道阿米巴病有效。

大蒜素用大蒜新素 (三硫二丙烯) 胶丸，一次服 3 粒 (每粒 20mg)，一日 3 次，治疗肠道阿米巴病。

鸦胆子 每次 10~15 粒，去壳取仁，装入胶囊内服，一日 3 次，治疗肠道阿米巴病。

三、选用和比较

抗阿米巴病药，历来主要使用喹啉类药物和卡巴肿。但双碘喹啉对视神经有毒性，卡巴肿则有肝毒性，故现均少用。氯喹因肝内浓度高对肠外阿米巴病有效，需与抗肠道阿米巴药伍用。甲硝唑对阿米巴病，无论是肠道阿米巴病或肝脓疡有良好疗效，现可作为主要治疗药物应用。

其他可选的药物有土霉素或四环素、呋喃唑酮、大蒜新素等，但这些药物只对阿米巴痢疾有效。

吐根碱是用来治疗肠道阿米巴病和阿米巴肝脓疡的药物，但因有心脏毒性，现已少用。

第四节 抗滴虫药

一、概述和分类

滴虫是一种单细胞原虫，寄生于阴道，引起尿道炎和阴道炎，为妇女的常见病。滴虫也可寄生于男性泌尿、生殖道，一般不引起症状，但偶可引起尿道炎和前列腺炎。滴虫病传染方式有两种：一是间接传染，病人将病原体带到浴池 (室)、游泳池或通过浴盆、衣服、马桶等传播；二是直接传染，多通过性交，临床以间接传染多见。

抗滴虫药物主要有：

1. 有机砷化合物 如乙酰胂胺 (已少用)；
2. 甲硝唑；
3. 其他 呋喃唑酮、白头翁、蛇床子等。

二、用药原则

对滴虫病过去采用局部治疗，例如冲洗后喷洒药粉，或给予阴道片（栓）剂，但因所用药物的选择性不高，根治率低，患者配偶的尿道里常寄生滴虫，可反复感染。因此，抗滴虫病最好是提供口服的药物，以便男女同治，使配偶双方的滴虫都被消灭。甲硝唑符合这个要求。乙酰肿胺（滴维净片）、大蒜等亦可治疗滴虫病。

三、常用药物简介

甲硝唑

【作用特点】 一次0.2g，1日4次，疗程7日；可同时用栓剂，每晚0.5g置入阴道内，连用7~10日。甲硝唑阴道泡腾片，1次0.2g每晚1次，置入阴道内，疗程7~10天。

【应用】 用法用量、不良反应见抗阿米巴病药。

乙酰肿胺

【作用特点】 对阴道滴虫及阿米巴原虫均有抑制作用，常制成滴维净片（每片含乙酰肿胺0.25g、硼酸0.03g）用于滴虫病。

【应用】

1. 用法用量 治疗阴道滴虫病，先以稀消毒液洗净阴道，然后放滴维净片于穹窿部，次晨坐浴。

2. 不良反应及注意 ①局部有轻度刺激；②月经期间忌用；③用药期间禁性交。

呋喃唑酮

【作用特点】 有抑制滴虫作用，常制成阴道栓应用。

蛇床子

【作用特点】 对滴虫性阴道炎有效。

【应用】 常制成栓剂应用。

四、选用和比较

以前，滴虫病主要局部治疗用药，如滴维净外用片、蛇床子阴道栓等可以起到一些局部作用，但是这些药物有一定的缺点，它们对较深部的滴虫无作用（因为只有滴虫直接接触药物，才能杀灭），还有常因男方为带虫者，反复感染，而不能根治。

甲硝唑对滴虫有可靠的疗效，男女双方同口服（女方加外用），可以根治。

呋喃唑酮也有类似作用，男方口服，女方口服并用阴道栓，也有较好疗效。

第五节 抗丝虫病药

一、概述与分类

丝虫病的病原体是丝虫，寄生于淋巴组织、皮下组织或浆膜腔，在我国流行的主要是班氏丝虫和马来丝虫。传染媒为库蚊和按蚊。带丝虫幼虫的蚊吸食人血时，丝虫幼虫侵入人体皮下组织，进一步侵入淋巴组织，发育为成虫，雌雄成虫交配后，雌虫产出微丝幼，随淋巴循环进入血液，当蚊再吸入血时，又进入蚊体，并发育成为幼虫而重复传染过程。主要症状有淋巴管和淋巴结炎、乳糜尿、鞘膜腔积液、象皮肿等。

二、常用药物简介

乙胺嗪（海群生）

【作用特点】 适用于班氏丝虫、马来丝虫和罗阿丝虫感染，也用于盘尾丝虫病。对前三者一次或多次治疗后可根治，但对盘尾丝虫病，因本品不能杀死成虫，故不能根治。

【应用】

1. 用法用量 口服（餐后）

(1) 治疗班氏和马来丝虫病：国内目前常用①总量4.2g，7日疗法。即每日0.6g，分2~3次服，7日为一疗程。间隔1~2月，可应用2~3疗程。②大剂量短疗程法，即1~1.5g，夜间顿服法，也可间歇服用2~3疗程。淋巴结出现率较高。

(2) 治疗罗阿丝虫病：宜用小剂量，每次按体重2mg/kg，每日3次，连服2~3周，必要时间隔3~4周可复治。

(3) 治疗盘尾丝虫病：初期药物剂量宜小，按体重不超过0.5mg/kg，第1日1次，第2日2次，第3日增至1mg/kg，口服3次，如无严重反应，增至2mg/kg，日服3次，总疗程14日。如初治全身反应严重，可暂停用或减少剂量。必要时可给以肾上腺皮质激素。

(4) 预防：在中国丝虫病流行区，有将乙胺嗪掺拌入食盐中，制成药盐全民食用以杀死血液中微丝蚴，防治效果迅速可靠，为消灭丝虫病传染源的较好措施。

2. 不良反应及注意 ①乙胺嗪本身的毒性甚低，偶可引起食欲减退、恶心、呕吐、头晕、头痛、乏力、失眠等。治疗期间的反应多由于大量微丝蚴和成虫杀灭后释放异

性蛋白质所致，可有畏寒、发热、头痛、肌肉关节酸痛、皮疹、瘙痒等。偶见过敏性喉头水肿、支气管痉挛、暂时性蛋白尿、血尿、肝肿大和压痛等。成虫死亡尚可引起局部反应如淋巴管炎、淋巴结炎、精索炎、附睾炎等，并出现结节。马来丝虫病患者出现的反应常较班氏丝虫病者为重，血中微丝蚴数多者反应也较重，盘尾丝虫病患者反应亦较严重。②用于治疗盘尾丝虫和罗阿丝虫感染时，应从小剂量开始，以减少因虫体破坏而引起的不良反应。重度感染的盘尾丝虫病患者，在接受单剂乙胺嗪后，可出现急性炎症反应综合征（Mazzotti 反应），表现为发热、心动过速、低血压、淋巴结炎和眼部炎症反应，多由微丝蚴死亡引起。③在重度罗阿丝虫感染者采用乙胺嗪治疗后可发生脑病和视网膜出血等。预先给予肾上腺皮质激素可减少不良反应。④对有活动性肺结核、严重心脏病、肝脏病、肾脏病、急性传染病以及孕妇、哺乳期妇女应暂缓治疗。对儿童有蛔虫感染者应先驱蛔虫。

左旋咪唑（左咪唑）

【作用特点】 对班氏丝虫、马来丝虫和盘尾丝虫成虫及微丝蚴的活性较乙胺嗪为高，但远期疗效较差。

【应用】

1. 用法用量 4~6mg/kg，分2~3次服，连服3日。

2. 不良反应及注意 ①可引起恶心、呕吐、腹痛等，少数可出现味觉障碍、疲惫、头晕、头痛、关节酸痛、神志混乱、失眠、发热、流感样症候群、血压降低、脉管炎、皮疹、光敏性皮炎等，偶见蛋白尿，个别可见粒细胞减少、血小板减少，少数甚至发生粒细胞缺乏症（常为可逆性），常发生于风湿病或肿瘤患者。另尚可引起即刻型和 Arthus 过敏反应，可能系通过刺激 T 细胞而引起的特应性反应。个别病例可出现共济失调、感觉异常或视力模糊。②肝肾功能不全、肝炎活动期、妊娠早期或原有血吸虫病者禁用；③干燥综合征患者慎用。

第六节 抗吸虫药

一、概述和分类

寄生于人体内脏致病的吸虫有血吸虫、姜片虫、华支睾吸虫（肝吸虫）和肺吸虫。它们由不同的病原吸虫所引起，于机体不同部位引起不同性质的疾病。

血吸虫病由血吸虫寄生于人体而引起。血吸虫寄生在门静脉血管内，卵随病人大便排出，在水中孵出毛蚴，毛蚴侵入钉螺体内繁殖，最后形成尾蚴；尾蚴入水，碰到

人体皮肤即钻入其内，进入血管，随血流到达肝脏门静脉，发育成为成虫以后产卵，血吸虫病的病理变化由虫卵引起。

根据症状，血吸虫病可分为急性、慢性和晚期。急性血吸虫病人大都发生于没有免疫力而新近感染大量尾蚴的病人，多出现畏寒、长期发热、头痛、乏力、咳嗽、腹泻等症状。慢性血吸虫病常见于流行区反复感染者，平时可无症状，或有乏力、头晕、腹痛、腹泻、便血等症状。晚期血吸虫病见于流行区反复多次大量受感染而未经及时治疗的病人，临床上可有巨脾、腹水等肝硬化征象，在儿童期则发展成侏儒症。

全世界有3种血吸虫，我国只有日本血吸虫1种，主要流行于南方各省。抗血吸虫病的药物主要分为①锑化合物：如酒石酸锑钾、次没食子酸锑钠等。②非锑化合物：呋喃丙胺、六氯对二甲苯（血防846）、吡喹酮、敌百虫等。近年试用合成药硝硫氢胺（7505）、硝硫苯酯治疗血吸虫病，获得较好疗效。

肺吸虫病是由肺吸虫寄居于人体肺中所引起的一种疾病，虫体尚可游窜，侵入肝、脑、皮肤等组织内，形成囊肿。抗肺吸虫病药主要有吡喹酮和硫双二氯酚（别丁）。

华支睾吸虫，又称肝吸虫，寄生于人体肝内胆管中，是由于吃了未熟的带吸虫囊蚴的鱼、虾而得的一种病，主要治疗药物为吡喹酮和硫双二氯酚，呋喃丙胺也可有效。

姜片虫病是由于姜片虫寄生于人体小肠上段而致的一种疾病。治疗本病的药物主要为吡喹酮，呋喃丙胺和硫双二氯酚也可有效。

二、常用药物简介

吡喹酮

【作用特点】 本品对血吸虫、姜片虫、华支睾吸虫、肺吸虫均有效，为治疗血吸虫病的主要药物，有剂量小，疗程短，不良反应较轻，近期疗效较高等优点。

【应用】

1. 用法用量 ①血吸虫病。各种慢性血吸虫病采用总剂量60mg/kg的1~2日疗法，每日量分2~3次餐间服。急性血吸虫病患者总剂量为120mg/kg，每日量分2~3次服。连服4日。体重超过60kg者按60kg计算。②华支睾吸虫病总剂量为210mg/kg，每日3次，连服3日。③肺吸虫病25mg/kg，每日3次，连服3日。④姜片虫病15mg/kg，顿服。

2. 不良反应及注意 ①常见的不良反应有头晕、头痛、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、乏力、四肢酸痛等，一般程度较轻，持续时间较短，不影响疗效，不需处理。②少数病例出现心悸、胸闷等症状，心电图显示T波改变和期外收缩，偶见室上性心动过速、心房纤颤。③少数病例可出现一过性转氨酶升高。④偶可诱发精神失常或出现消化道出血。⑤哺乳期妇女于服药期间，直至停药后72小时内不宜哺乳。⑥严重心、肝、肾病患者及有精神病史者慎用。⑦本品应吞服，不宜嚼服。