

性病 药物 治疗 手册

■ 谭仲楷 祝连庆 谢礼豪 编著

XINGBINGYAO WUZHILIAOSHOUCE

■ 山西科学技术出版社

性病药物治疗手册

谭仲楷 祝连庆 谢礼豪 编著

山西科学技术出版社

性病药物治疗手册

谭仲楷 祝连庆 谢礼豪 编著

*

山西科学技术出版社出版 (太原并州北路69号)

山西省新华书店发行 太原千峰科技印刷厂印刷

*

开本: 850×1168 1/32 印张: 11 字数: 294 千字

1997 年 8 月第 1 版 1997 年 8 月太原第 1 次印刷

印数: 1—4000 册

*

ISBN 7-5377-1297-2
R·515 定价: 22.00 元

内 容 提 要

《性病药物治疗手册》是一本药理学与临床治疗学相结合，主要供临床医师阅读的参考书。全书分上、下编。上编，按药物学分类介绍用于性病治疗的药物，包括药理、临床应用、不良反应、耐药性、药物相互作用、注意事项和市售成药。下编，简要叙述性病诊断和药物治疗要领，并就治疗上的某些重要问题作补充说明。内容新颖丰富，方便实用。

序

性病再次在我国流行，至今已报告的累计病例数逾 100 万，而且仍呈增长趋势。此外，我国自 1985 年发现第一例艾滋病患者以来，HIV/AIDS 病例数也不断增加。因此，积极防治性病已成为控制 HIV/AIDS 的重要策略之一。

在治疗性病中，药物治疗是一个很重要的环节。然而，性病的病原体种类繁多，而且有的细菌易发生耐药，因此用于治疗的药物种类也很多，而且不断有新的药物出现，以适应治疗的需要。在治疗中，临床医生对各种药物的药理作用、剂量、疗程、不良反应和药物的相互作用等都必须要有足够的认识，才能对病人进行正确、有效的治疗。国内虽然已出版了一些有关性病的书籍，如临床与实验室诊断方面的书籍、手册、图谱等，但还未见到将重点放在治疗药物方面的。有鉴于此，谭仲楷教授等撰写了这一本《性病药物治疗手册》（以下简称《手册》）。

《手册》以药物为中心，以治疗为线索，全面地介绍了国内外常用和较常用的性病药物。就性病治疗而言，所收载的药物品种是相当齐全的，而且，其中有不少是新近才问世的良药，它们的应用反映了现代性病治疗的新水平和新进展。《手册》把临床药理学和治疗学结合起来，围绕性病治疗的特点，深入浅出地阐述药物的作用和副作用，以及在临床上的具体应用。《手册》在治疗要领中还介绍了

国内外最新的药物治疗方案，并就治疗中有关的重要问题作必要的说明。该书内容丰富、新颖、实用，对临床医生掌握性病药物治疗的新方法、新经验和规范、合理地用药，提高医疗水平将有不少帮助。

总之，这本书不但对从事性病工作的医务人员极有参考价值，对其他专业的医务人员、防疫人员、医学院校师生也很有参考价值。相信此书的出版对性病的防治能起到积极、有益的作用。

国家卫生部性病专家咨询委员会副主任
中华医学会皮肤科学会副主任
《中华皮肤科杂志》主编
中国医学科学院皮肤病研究所顾问

徐文严 教授

前 言

近年来，在性病药物治疗方面进展甚速，新药相继问世，对老药有新的评价；通过进一步的基础研究和临床经验，原有的各种性病治疗方案也几经修订。

临床医师必须熟悉这些药物，了解其在性病治疗上的使用方法，才能规范地处理病人。国内外现行的治疗方案，包括药物选择、给药方式和疗程，是我们应予借鉴的，当然还要结合当时、当地和病人的实际情况灵活掌握。对于药物治疗，要知其然，同时知其所以然，才能在施治过程中合理应用，把握好分寸，保证安全，争取更好的疗效。所以，临床医师学一点有关的药理知识，对于提高医疗水平是很有帮助的。

《性病药物治疗手册》（以下简称《手册》）正是按照临床药理学和治疗学相结合的原则进行编写的。全书分两编。上编，按药理学分类介绍用于性病治疗的药物，包括药理、临床应用、不良反应、耐药性、药物相互作用、注意事项和市售成药，是本书的重点。下编，简要叙述性病诊断和药物治疗的要领，并就治疗上的某些重要问题作了补充说明。上、下编前后参照，相得益彰。

《手册》中药名正名均采用药理学通用的命名，并有相对应的非专利的英文名；中、外文商品名均列入“别名”项。文中在某些重要的药物使用经验之后注明参考文献出处。书后附有外文药名索引。

《手册》介绍目前国内外治疗性病的新药、新方法和新经验，叙述简明，重点突出，检索方便。可供皮肤性病科、妇产科、泌尿外

科及各级性病防治单位医师和有关人员参考。

谭仲楷 第一军医大学南方医院
(广州 邮编 510515)
祝连庆 北京军区二六四医院
(太原 邮编 030001)
谢礼豪 江门市皮肤病防治所
(广东省江门市
邮编 529000)

目 录

上编 用于性病治疗的药物

第1章 抗生素 (2)

第1节 β -内酰胺类 ... (2)

青霉素 (2)

普鲁卡因青霉素 ... (10)

苄星青霉素 (13)

氨苄青霉素 (14)

羟氨苄青霉素 (17)

舒它西林 (20)

羟氨苄青霉素-克拉维酸钾
..... (22)

替卡西林-克拉维酸钾 ...
..... (26)

头孢三嗪 (28)

头孢噻肟 (33)

头孢他定 (36)

头孢西丁 (38)

头孢呋新 (40)

头孢哌酮 (43)

头孢克罗 (45)

头孢克肟 (47)

头孢唑肟 (49)

头孢替坦 (51)

头孢美特酯 (52)

亚胺硫霉素-西拉司丁纳
..... (54)

第2节 氨基糖甙类 (57)

大观霉素 (57)

链霉素 (60)

庆大霉素 (62)

妥布霉素 (63)

巴龙霉素 (64)

第3节 四环素类 ... (65)

四环素 (65)

土霉素 (71)

脱氧土霉素 (72)

米诺环素 (75)

第4节 大环内酯类 (77)

红霉素 (77)

乙酰螺旋霉素 (82)

螺旋霉素 (83)

罗红霉素	(85)	第1节 抗真菌药	
克拉霉素	(87)		(131)
阿奇霉素	(89)	酮康唑	(131)
交沙霉素	(93)	依他康唑	(136)
第5节 酰胺醇类 ...	(95)	氟康唑	(139)
氯霉素	(95)	咪康唑	(143)
第6节 其他抗生素		益康唑	(144)
.....	(98)	克霉唑	(145)
万古霉素	(98)	噻康唑	(147)
林可霉素	(98)	布托康唑	(148)
克林霉素	(99)	特康唑	(148)
第2章 合成的抗菌药		氟胞嘧啶	(149)
.....	(103)	制霉菌素	(151)
第1节 喹诺酮类		两性霉素B	(152)
.....	(103)	特比萘芬	(155)
环丙氟哌酸	(103)	联苯苄唑	(157)
氟嗟酸	(108)	第2节 抗病毒药	
左旋氧氟沙星	(112)		(158)
氟哌酸	(114)	阿昔洛维	(158)
氟啶酸	(116)	叠氮胸苷	(167)
氟罗沙星	(118)	地丹诺辛	(171)
洛美沙星	(120)	札西他滨	(173)
甲磺酸妥磺沙星 ...	(122)	更昔洛韦	(174)
第2节 磺胺类	(123)	干扰素	(175)
复方磺胺甲基异噁唑 ...		阿糖腺苷	(183)
.....	(123)	磷钾酸钠	(185)
磺胺嘧啶	(129)	三氟尿苷	(188)
第3章 抗真菌、病毒、原虫和		三氮唑核苷	(188)
昆虫药	(131)	异丙肌苷	(190)

第3节 抗原虫和昆虫药	单纯疱疹病毒疫苗
..... (191)	 (216)
甲硝唑	其他疫苗
..... (191)	 (216)
替硝唑	第5章 其他内用药和外用药
..... (197)	 (217)
去氢依米丁	第1节 其他内用药
..... (197)	 (217)
双碘喹啉	丙磺舒
..... (198)	 (217)
二氯散	皮质类固醇激素
..... (199)	 (218)
戊烷脒	甲孕酮避孕针
..... (200)	 (222)
乙胺嘧啶	第2节 外用药
..... (201)	 (223)
氨苯砒	鬼臼树脂和鬼臼毒素
..... (202)	 (223)
阿的平	氟尿嘧啶
..... (204)	 (225)
呋喃唑酮	斑蝥素
..... (205)	 (226)
第4章 抗肿瘤药和生物制剂	林丹
..... (207)	 (226)
第1节 抗肿瘤药	硫磺
..... (207)	 (228)
阿霉素	克罗他米通
..... (207)	 (228)
长春碱和长春新碱	除虫菊素
..... (208)	 (229)
鬼臼乙叉甙	苄氯菊酯
..... (209)	 (229)
第2节 生物制剂	碘苷
..... (211)	 (230)
丙种球蛋白	其他外用药 (醋、三氯醋酸、硝酸银、凡士林、苯酚、碘、苯甲酸苄酯、百部、硼酸、酞丁安)
..... (211)	 (231)
免疫球蛋白	
..... (211)	
转移因子	
..... (213)	
甲型肝炎病毒疫苗	
..... (214)	
乙型肝炎病毒疫苗	
..... (214)	

下编 性病诊断和药物治疗要领

第1章 细菌、衣原体和支原体感染 (234)	阿米巴病 (302)
淋病 (234)	贾第鞭毛虫病 (304)
非淋菌性尿道炎 (244)	隐孢子虫病 (306)
梅毒 (251)	弓形体病 (307)
软下疳 (263)	第4章 体外寄生物感染 ...
性病性淋巴肉芽肿 (266)	 (310)
杜诺凡菌病 (269)	虱病 (310)
细菌性阴道病 (271)	疥疮 (311)
第2章 病毒感染 (274)	第5章 真菌感染 (315)
艾滋病 (274)	外阴阴道念珠菌病 (315)
尖锐湿疣 (281)	 (315)
生殖器疱疹 (284)	股癣 (319)
传染性软疣 (289)	第6章 某些性病临床综合征
人巨细胞病毒感染 (291)	 (321)
病毒性肝炎 (294)	盆腔炎病 (321)
第3章 原虫感染 (299)	前列腺炎 (325)
阴道毛滴虫病 (299)	附睾炎 (327)
	常用外文略语 (330)
	外文药名索引 (335)
	主要参考资料 (341)

上 · 编

用于性病治疗的药物

第1章 抗生素

第1节 β -内酰胺类

青霉素

benzylpenicillin

别名：苄青霉素，青霉素 G (penicilin G)。

本品原先是从音符型青霉菌 (penicillium notatum) 培养液中获得，目前多从 penicillium chrysogenum 发酵液中提取。青霉菌发酵液中至少含 5 种青霉素，其中以青霉素 G 作用最强，性质稳定，供临床应用。本品是一种有机酸，常用其钾、钠盐。白色结晶粉末，溶于水，但在水中不稳定。青霉素钾（钠）100 万 u 相当于 600mg。

为细菌繁殖期杀菌性抗生素，对各种革兰氏阳性球菌、革兰氏阴性球菌（包括淋菌）革兰氏阳性杆菌和梅毒螺旋体等均有较强的作用。在性病治疗中，主要用于梅毒和淋病。迄今，青霉素仍是治疗梅毒的首选药物，尚无充分证据确定梅毒螺旋体能产生耐药性。

在淋病治疗方面，80 年代以来，由于产酶菌株 (PPNG) 的不断增加，以及新型高效抗生素的问世，青霉素在抗淋菌感染中所占的地位已今非昔比。

据体外试验，青霉素对衣原体有一定作用，但在临床上治疗性病性淋巴肉芽肿 (LGV) 无效。

【药理】

青霉素分子由侧链和主核构成。主核为 6-氨基青霉烷酸，其中包括饱和的噻唑环和 β -内酰胺环。抗菌活性取决于主核，若其中的

β -内酰胺环被破坏,便失去了抗菌活力。侧链则与药理特性、抗菌谱有关。

吸收和分布 本品不耐酸,口服吸收量少且不恒定。肌注吸收迅速而完全。肌注 100 万 u,半小时后血浆浓度达峰值,约为 20u/ml。血清蛋白结合率为 60%~65%,广泛分布于肺、肾、肌肉、各种液体及发炎的骨组织。很易进入胎盘,肌注后 30 分钟~60 分钟胎儿的血清浓度即可达到母体的水平。乳汁中也含有本品。因脂溶性较差,故不易透入细胞内(包括多形核白细胞)。在无炎症时,CSF 和前列腺组织中的药物含量甚低,但有炎症时可增高。血清 $t_{1/2}$ 短,为半小时左右。在一次性注射后数小时,血中已不能测出。

代谢和排泄 主要在肾脏通过肾小球滤过和肾小管分泌以原型从尿排出。少量在肝脏代谢,经胆汁排泄。

作用机理 青霉素属 β -内酰胺类抗生素,通过干扰细菌细胞壁的合成而起抗菌作用。细菌细胞膜上的青霉素结合蛋白(PBP_s)是青霉素作用的靶部位。由于青霉素与 PBP_s 的结合,妨碍细菌细胞壁的合成,包括早期阶段和最后阶段(粘肽交联)。细菌细胞壁的缺陷导致菌细胞的破裂,终至死亡。这个过程发生在细菌繁殖期,故本类药属于繁殖期杀菌剂。

PBP_s 占细菌胞浆膜蛋白的 1%,具有催化粘肽代谢酶反应的功能。也有人认为,PBP_s 是参与细胞壁生物合成的酶,如转肽酶、内肽酶和羧肽酶等。不同种类细菌的 PBP_s 数目不等,分子大小不一,与抗生素结合的情况也有差异。

人类细胞无细胞壁,不会遭受青霉素的毒害作用。常规量青霉素几乎对人体细胞无不良影响。

梅毒螺旋体对本品极度敏感,药物浓度为 0.005 μ g/ml~0.018 μ g/ml(或 0.23u/ml)时即可被杀灭。

非 PPNG 对本品有不同程度的敏感性。MIC 为 0.004 μ g/ml~0.06 μ g/ml 者,可视作十分敏感,MIC 为 0.03 μ g/ml~2.0 μ g/ml 者,则属中等耐药。

【临床应用】

本品肌注虽然吸收迅速，在血中能达到相当高的浓度，但维持时间短，故在梅毒治疗中仅用于某些特殊情况。有时亦用于由敏感淋菌引起的某些感染。

1. 心血管梅毒 用于初期预备治疗。第1日，肌注10万u，1次；第2日，10万u，2次；第3日，20万u，2次；第4日起，改为作用较持久的普鲁卡因青霉素，按常规给药。

用本品前，应先纠正心衰。

2. 神经梅毒 本品静滴，每次200万u~400万u，每4小时1次（每日总量1200万u~2400万u），疗程14日。此法可使药物在CSF中达到高浓度（0.3μg/ml），比杀螺旋体最低浓度（0.018μg/ml）高数倍以上，对有症状的或无症状的神经梅毒都适用。HIV感染可改变梅毒的自然病程和对治疗的反应。对HIV感染者的神经梅毒若采用常规量治疗，部分病例无效（N Engl J Med, 1994, 331: 1469）。

3. 早期先天梅毒 对脑脊液有异常的早期先天梅毒（2岁以内），每日5万u/kg，分2次肌注或静滴，疗程10日。

4. 淋菌性眼炎 用于经药敏试验证明对本品敏感的淋菌感染。成人，每次1000万u，静滴，每日1次，疗程5日。新生儿，每日10万u/kg，分2次静滴，或肌注（7日以上婴儿分4次），疗程7日。

5. 播散性淋病 每次1000万u，静滴，每日1次，连续3日。其后改为口服羟氨苄青霉素。

【不良反应】

在性病治疗中，青霉素类短期应用所引起的副作用主要是过敏反应。治疗梅毒时，还可发生吉-海反应（JHR）。据统计，青霉素类治疗淋病、梅毒的副作用发生率在2%以下，而据某些性病诊所调查的数字，副作用发生率仅为0.66%。

1. 过敏反应 本品（注射）过敏反应，总的发生率为0.004%~0.04%，致死率为1/10万~2/10万。凡有既往过敏史者，日后误

用而发生过敏的比率高达12.8%，而从未用过本品或用后无不良反应者，过敏发生率仅为0.6%。

青霉素本身抗原性弱，但其降解产物、异构物和多聚物（如青霉烯酸等）可同蛋白质（载体）以共价键结合，形成抗原复合物-青霉噻唑蛋白，使机体产生相应的抗体，导致抗原抗体反应。抗原专属性取决于与蛋白载体结合的大抗原决定簇-青霉噻唑基团。此外，还有多种小抗原决定簇，如青霉噻唑酸盐、青霉吡唑酸盐和青霉胺等。

过敏性休克是过敏反应中最严重的一种，其发生与剂量大小无关；青霉素类的各种制剂和给药途径均可引起，其中以注射给药发生率最高。用药数分钟内即出现症状，表现为面色苍白、呼吸困难、血压下降、四肢厥冷、抽搐、意识障碍、大小便失禁，严重者可在短时间内死亡。过敏性休克属Ⅰ型变态反应，其发生机理是由于抗原的刺激，体内产生IgE抗体。IgE的产生主要是针对青霉素降解产物的小抗原决定簇，这些降解产物包括青霉氧酸、青霉烯酸、panamaldate、青霉烯二硫化合物和青霉胺。当抗原再进入体内时，便与附着在肥大细胞、嗜碱细胞表面的IgE结合，使细胞膜内的腺苷酸环化酶受抑制，妨碍环磷酸腺苷（cAMP）的生成，从而导致细胞颗粒内组织胺大量释放。组织胺作用于各组织器官，引起相应的病变，产生临床症状。除过敏性休克外，Ⅰ型变态反应还可表现为急性荨麻疹、喉头水肿和哮喘等。针对青霉烯-蛋白共轭物（大抗原决定簇）虽然也能产生IgE，但由于青霉烯同时引起IgG的生成，可作为IgE的封闭抗体，故通常不会引起速发型变态反应。

细胞毒反应（Ⅱ型变态反应），可导致溶血性贫血。青霉素的某些降解产物（大抗原决定簇）与红细胞膜结合，并诱导产生特异性IgG。由抗原抗体反应产生的细胞毒性作用，导致红细胞溶解。青霉素可引起白细胞减少，其机理不明，可能也属Ⅱ型变态反应。大剂量使用时，青霉素还可以与血小板的二磷酸腺苷受体部位结合，影响血小板的正常功能，导致出血。