

Гаметоцитотцидные средства (т.е. активные по отношению к половым формам плазмодия) препятствуют заражению комаров от больных людей и, значит, предотвращают распространение малярии.

Споронтоциды, не оказывая прямого влияния на гаметоциты, приводят к нарушению цикла развития плазмодия в теле комара и тем самым также способствуют ограничению распространения заболевания.

1.1. ХИНОЛИНЫ

Хинолиновые производные имеют более чем трехсотлетнюю историю применения для лечения малярии, первоначально в виде коры хинного дерева. Первые синтетические препараты были получены в 20–30-х гг. прошлого столетия. Широкое использование основного из них — хлорохина — привело к глобальному развитию резистентности *Plasmodium falciparum*, вызывающего тропическую малярию, которая характеризуется наиболее тяжелым злокачественным течением.

Все хинолины обладают сходным механизмом противопротозойного действия, связанным с нарушением процессов деградации гемоглобина в пищеварительных вакуолях клеток плазмодия, в основном за счет ингибирования фермента гем-полимеразы.

С учетом некоторых особенностей химической структуры группа хинолинов подразделяется на 4-аминохинолины (**хлорохин**, **гидроксихлорохин**, **хинин**, **мефлохин**, **амодиахин**, **пиперахин**) и 8-аминохинолины (**примахин**, **тафенохин**) (табл. 75), отличающиеся по действию на различные формы плазмодия и, следовательно, по клиническому применению.

ХЛОРОХИН

Синтетический 4-аминохинолин. В течение многих лет имел наиболее широкое применение для лечения и профилактики малярии. В настоящее время используется более ограниченно в связи с развитием резистентности *P. falciparum* в большинстве эндемичных по малярии регионов земного шара: Африке, Юго-Восточной Азии, Индии и Южной Америке.

Кроме противомаларийной активности хлорохин обладает также противоамебным действием. Проявляет медленно развивающуюся противовоспалительную активность, поэтому применяется в качестве базисного противоревматического средства, а также при фотодерматитах.

Спектр активности

Малярийные плазмодии: эритроцитарные формы (шизонты) *P. vivax*, *P. ovale* и *P. malariae*. Фенотипы *P. vivax* со сниженной чувствительностью к хлорохину выявлены в Новой Гвинее, Индонезии, Мьянме (Бирме), Вануату. Не действует на персистирующие тканевые (печеночные) формы, характерные для *P. vivax* и *P. ovale*; только в отдельных регионах (некоторые страны Карибского бассейна, Центральной Америки, Ближнего Востока, Египет) к хлорохину сохраняет чувствительность *P. falciparum*.

Амебы:

E. histolytica (тканевые формы).

