

Федеральное Государственное Бюджетное Общеобразовательное
Учреждение Высшего Образования Пермский Государственный
Медицинский Университет им.ак.Е.А.Вагнера
Минздрава РФ

Кафедра фармакологии

Жаропонижающие средства. Механизм действия, сравнительная характеристика, показания к применению анальгетиков – антипиретиков.

Выполнил:

Студентка 3 курса пед.ф-та 308 гр.

Лоскутова Мария Андреевна

Ведущий преподаватель:

Волков Александр Геннадьевич

Пермь, 2020

Жаропонижающие препараты

- ЖАРОПОНИЖАЮЩИЕ СРЕДСТВА (син. антипиретики) — лекарственные вещества, понижающие температуру тела при лихорадке.





Рис. 25-1. Схема метаболизма простаноидов. Объяснение в тексте. Примечание: TxA_2 — тромбосан A_2 , $ПЦ I_2$ — простаглицлин I_2 , PrE_2 — простаглицлин E_2 , $PrF_{2\alpha}$ — простаглицлин $F_{2\alpha}$, 5-НРЕТ — 5-гидрокси-пероксиэйкозотетраеновая кислота.

Жаропонижающие средства

1. В норме: центр терморегуляции(ЦТР)
ТЕПЛООБРАЗОВАНИЕ = ТЕПЛООТДАЧЕ (t тела нормальная = 36 °)
2. Инфекция: ИЛ-1 ↑ЦОГ-3 ↑ПГЕ возбуждение ЦТР
↑теплообразование > ↓теплоотдачи (t тела повышается)
3. ННА -↓ЦОГ-3 -↓ПГЕ -↓ЦТР (нормализуется его работа)
 - теплообразование не изменяется
 - теплоотдача повышается
4. ↑потоотделение, расширение сосудов кожи, учащается дыхание (t тела снижается)

- Основное действие жаропонижающих препаратов лежит в их способности ингибировать активность фермента циклооксигеназы (ЦОГ) и снижать синтез воспалительных простагландинов.
- Метамизол > АСК > Парацетамол > Кетопрофен > Ибупрофен = Напроксен >



Сравнительная характеристика

Параметры	ЦОГ-1	ЦОГ-2
Регуляция	Общая	Локальная
Молекулярная масса	70 кД	70 кД
Ген	22 кб (11 экзонов)	8,3 кб (10 экзонов)
Выраженность экспрессии	Увеличение в 2–4 раза	Увеличение в 8–10 раз
Тканевая экспрессия	Тромбоциты, эндотелиальные клетки сосудов, желудок, почки и другие ткани	Предстательная железа, мозг, активированные моноциты, синовиоциты, фибробласты
Эффект глюкокортикоидов	Отсутствует	Выраженное подавление экспрессии
Предполагаемая роль фермента	Синтез простаноидов (простагландинов, простаглицлина I ₂ , тромбоксана A ₂), регулирующих физиологические функции организма	Синтез провоспалительных простагландинов, участвующих в развитии воспаления, контроле клеточного деления

ЛС	Доза, г/сут	Абсорбция	Биодоступность	Метаболизм	$T_{1/2}$, ч	Элиминация
Ацетилсалициловая кислота	3–4	80%, преимущественно в верхних отделах тонкой кишки. Зависит от pH среды	Зависит от абсорбции, обычно около 70% препарата	В течение первого часа метаболизируется 90% препарата	0,5	80% через почки (10–60% в неизменённом виде); 20% через ЖКТ и лёгкие
Фенилбутазон	0,6	Около 90%	85–90%, снижается при длительном приёме	95% в печени	24	70% через почки (5% в неизменённом виде), 30% через ЖКТ метаболиты
Индометацин (метиндол*)	0,1–0,15	100%	96–98% при оральном приёме; 85% — при ректальном	80% в печени	4–9	70% через почки (20% в неизменённом виде), 30% через ЖКТ метаболиты

Ибупрофен (бруфен*)	0,6–1,2	95–100%, пища замедляет скорость абсорбции	95–100%	90% в печени	2–3	80% через почки (10% в неизменённом виде), 20% – через ЖКТ метаболиты
Напроксен	0,5–1,0	100%	100%	90% в печени	12–15	98% через почки (10% в неизменённом виде), через ЖКТ – 2%
Диклофенак (ортофен*)	0,1	Около 100%	60–79%	99% в печени	1,5–3,5	75% через почки (1% в неизменённом виде). Через ЖКТ – 25%
Лорноксикам	0,004–0,032	Около 100%	Около 100%	95% в печени	3–5 ч	30% – почки, 70% – ЖКТ

Показания к применению

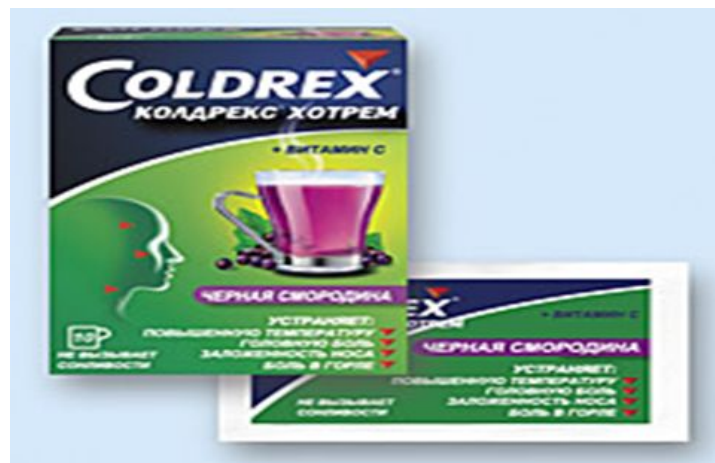
- Лихорадка выше 39 град. Опасность судорог. Полиглобулия (гематокрит выше 80¹)



Выбор препаратов ННА для снижения температуры у детей



Парацетамол (Калпол, Колдрекс, Фервекс, Тайленол), Ибупрофен.



Спасибо за внимание!