

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  $I_2$ ,  $ПрE_2$  — простаглицлин  $E_2$ ,  $ПрF_{2\alpha}$  — простаглицлин  $F_{2\alpha}$ , 5-HPET — 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 <sub>2</sub> , тромбоксана A <sub>2</sub> ), 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<br>(бруфен*)   | 0,6–1,2     | 95–100%,<br>пища замедляет<br>скорость<br>абсорбции | 95–100%    | 90% в печени | 2–3     | 80% через<br>почки (10%<br>в неизменённом<br>виде),<br>20% – через<br>ЖКТ метаболиты |
| Напроксен                | 0,5–1,0     | 100%  | 100%       | 90% в печени | 12–15   | 98% через<br>почки (10%<br>в неизменённом<br>виде), через<br>ЖКТ – 2%                |
| Диклофенак<br>(ортофен*) | 0,1         | Около<br>100%                                       | 60–79%     | 99% в печени | 1,5–3,5 | 75% через<br>почки (1%<br>в неизменённом<br>виде). Через<br>ЖКТ – 25%                |
| Лорноксикам              | 0,004–0,032 | Около<br>100%                                       | Около 100% | 95% в печени | 3–5 ч   | 30% – почки,<br>70% – ЖКТ  |



# Показания к применению

- Лихорадка выше 39 град. Опасность судорог. Полиглобулия (гематокрит выше 80<sup>л</sup>)





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



**Спасибо за внимание!**