

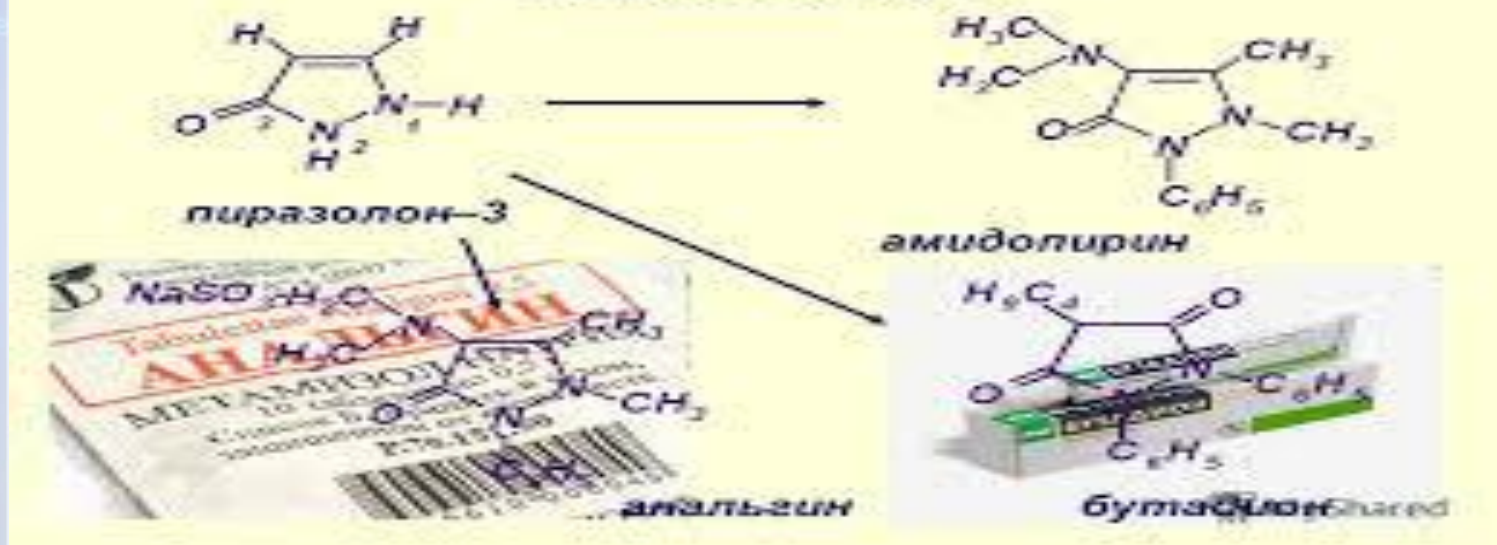
Производные пиразолонов



- Механизм действия пиразолоновых препаратов заключается главным образом в разобщении окислительного фосфорилирования и, следовательно, в снижении энергообеспечения воспаления, а также в воздействии на ряд медиаторных систем воспаления преимущественно в плане угнетения активности протеолитических ферментов, в меньшей степени — за счет уменьшения проницаемости капилляров и торможения воспалительной инфильтрации.
- Кроме того, им свойственны неспецифические жаропонижающие и обезболивающие эффекты, антикоагулянтное действие (торможение агрегации тромбоцитов и активности тромбина), усиление выделения мочевой кислоты, легкое анаболическое и спазмолитическое влияние.



Лекарственные препараты, производные пиразолона-3(5)



- Препараты этой группы хорошо всасываются в желудочно-кишечном тракте: 85% введенной дозы — через 8 ч. При приеме препарата в терапевтической дозе в течение трех суток в крови устанавливается постоянная концентрация его в 30—100 мг/л. пирина и некоторых противотуберкулезных препаратов.



- Производные пиразолона и их метаболиты связываются с сывороточными белками и в этом отношении являются конкурентами ряда лекарственных препаратов. Обладая более высоким сродством к белкам, бутадион может вытеснить из комплекса с белком антикоагулянты кумаринового ряда, ацетилсалициловую кислоту, сульфаниламиды, пенициллин и некоторые другие вещества, повышая фармакологический эффект последних. Это может иметь как нежелательные последствия (например, возникновение геморрагических явлений), так и положительные (усиление противовоспалительной или антибактериальной активности). Из организма пиразолоновые производные и их метаболиты элиминируются в основном почками, при этом конкурентно замедляя выделение пенициллина, амидопирина и некоторых противотуберкулезных препаратов.



- Амидопирин, метамизол натрия (анальгин) оказывают болеутоляющее, жаропонижающее и противовоспалительное (слабое) действие.
- Анальгин хорошо растворяется, поэтому эффект развивается быстро, но длится недолго (высокие скорости всасывания и выделения).
- Амидопирин малорастворим, следовательно, всасывается медленно и действует более продолжительно.



• Передозировка препарата может вызвать судороги. Бесконтрольное применение амидопирина и анальгина (при зубной, головной боли, высокой температуре) может дать серьезные осложнения, в частности, агранулоцитоз, аллергические реакции, сыпь, зуд, отек слизистых оболочек и даже анафилактический шок; начальные проявления агранулоцитоза выражены в общей слабости, ознобе, лихорадке, боли в горле, появлении язв в полости рта и другие.

- При аллергических проявлениях и нарушениях со стороны крови надо немедленно отменить препарат и назначить соответствующую терапию.

Во многих странах использование этих препаратов резко ограничено, вплоть до полного запрещения - Австралия, Норвегия, Ирландия и

