

Fibráty

Fibráty jsou deriváty kyseliny fibrové. **Zvyšují aktivitu lipoproteinové lipázy a blokují lipolýzu** intracelulárně. Výsledkem je redukce kolujících VLDL (TAG). Lehce stoupá i množství HDL (pokles TAG uvolní kapacitu HDL pro vazbu esteru cholesterolu). Užívají se pro léčbu hypertriglyceridémie.

Mechanismus účinku

Účinně snižují TAG, ale nemají přesvědčivý doklad o snížení aterotrombotických příhod a mortality. Jde o nehomogenní lékovou skupinu, kdy jednotliví zástupci odlišnými způsoby ovlivňují aktivitu PPAR- α , β , δ . Studie s jedním zástupcem nelze aplikovat na fibrát jiný.

Obecně fibráty aktivují fylogeneticky starou odpověď organismu na hladovění aktivací peroxizomálních PPAR- α receptorů. Tím docílí transkripce a exprese mnoha genů zasahujících do metabolismu lipidů a glycidů (ovlivňují i metabolismus xenobiotik) → lipolýza, pokles TAG, zvýšení koncentrace HDL.







Indikace

Hypertriglyceridémie, ideálně u diabetiků. Dále smíšená hyperlipidémie, kdy je léčba statiny kontraindikována nebo nedostatečná. Indikovány taktéž u nemocných s velmi vysokými TAG a rizikem pankreatitidy.

Nežádoucí účinky

Mezi nejčastější nežádoucí účinky patří například nauzea, zvracení a kožní vyrážky. Udává se i riziko cholelitiázy u fibrátů kromě fenofibrátu. Při renálním selhání a kombinaci se statiny popisují studie vyšší riziko myalgii a myopatií (až rhabdomyolýzy) z důvodu zpomalení eliminace statinů. Z lékových interakcí je taktéž významné zvýšení účinku warfarinu a snížení účinku klopidoogrelu.

Zástupci

- **fenofibrát**  – aktivuje i PPAR- γ , koncentraci HDL prakticky neovlivňuje, nejlépe popsáný efekt u diabetiků (ovšem nesnižuje mortalitu)
- **klofibrát** 
- **bezafibrát** 
- **gemfibrozil** 
- **ciprofibrát** 
- **pemafibrát**  – nový, selektivní PPAR α modulátor, ve studiích ve srovnání s fenofibrátem vyšší účinnost a nižší incidence jaterních a ledvinových nežádoucích účinků.

Odkazy

Související články

- Hypolipidemika
- Lipoproteiny

Zdroj

- MARTÍNKOVÁ, Jiřina, Stanislav MIČUDA a Jolana CERMANOVÁ. *Vybrané kapitoly z klinické farmakologie pro bakalářské studium : Terapie hyperlipidemie* [online]. ©2001. [cit. 2010-07-05]. <<https://www.lfhk.cuni.cz/farmakol/predn/bak/kapitoly/hypolipidemika-bak.doc/>>.
- JAN, Švihovec a Kolektiv KOLEKTIV. *Farmakologie*. - vydání. Grada Publishing a.s., 2018. 1008 s. ISBN 9788024755588.
- JIŘINA, Martínková a Kolektiv KOLEKTIV. *Farmakologie : pro studenty zdravotnických oborů, 2., zcela přepracované a doplněné vydání*. - vydání. Grada Publishing a.s., 2018. 520 s. ISBN 9788024741574.
- Studijní materiály z výuky farmakologie Ústavu farmakologie 1. LF UK a VFN