

# Urapidil: neznámé / známé antihypertenzivum

Jiří Slíva

Ústav farmakologie, 3. LF UK, Praha

Esenciální arteriální hypertenze není nemoc, která by nemocné nějak významně negativně ovlivňovala v jejich každodenních aktivitách. Alespoň většinou. Přesto však zásadní měrou negativně ovlivňuje kardiovaskulární morbiditu i mortalitu. Zřejmá je přitom souvislost se stupněm hypertenze, věkem nemocného a samozřejmě i přidruženými chorobami a kardiovaskulárními rizikovými faktory. Cílem léčby hypertenze tak proto není pouze snažit se dosáhnout optimální redukce krevního tlaku, nýbrž v širším pohledu snížit riziko právě uvedených konsekvencí, tj. omezit nemocnost a snížit úmrtnost. V rámci farmakoterapie hypertenze lze využít i látky urapidilu, jejíž stručný popis je předmětem tohoto článku.

**Klíčová slova:** urapidil, hypertenze, léčba, antihypertenziva.

## Urapidil: an unknown / known antihypertensive

Essential arterial hypertension is not a disease that would significantly adversely affect patients in their daily activities. At least mostly. Nonetheless, it has a significant negative impact on cardiovascular morbidity and mortality. The tight correlation with the degree of hypertension, the patient's age and, of course, comorbidities and cardiovascular risk factors is obvious. Therefore, the goal of hypertensive therapy is not only to try to achieve optimal reduction of blood pressure, but in a broader sense to reduce the risk of the just mentioned consequences, i.e. to reduce morbidity and reduce mortality. The antihypertensive drug urapidil can also be used in pharmacotherapy, the brief description of which is the subject of this article.

**Key words:** urapidil, hypertension, treatment, antihypertensives.

## Úvod

V léčbě esenciální hypertenze je vedle obecně dobře známých režimových opatření k dispozici celá plejáda léčiv disponujících odlišnými mechanismy účinku a přirozeně též odlišnostmi ve svých bezpečnostních profilech. V souladu s nejnovějšími doporučeními k diagnostice a léčbě hypertenze dle ESC/ESH je třeba farmakoterapii zvažovat již u osob s hodnotami 130–139/80–85 mm Hg při velmi vysokém riziku za přítomného kardiovaskulárního onemocnění, zejména pak ischemické choroby srdeční. Farmakoterapie je rovněž doporučována u osob s nízkým až středním rizikem a bez zřejmých orgánových změn v případě, že aplikovaná nefarmakologická opatření nepřinesla požadovaný benefit; toto se týká i seniorů mladších 80 let (1).

## Urapidil a jeho farmakologické vlastnosti

Urapidil je látkou, kterou lze bez okolků označit za antihypertenzivum s duálním mechanismem účinku. Tuto skutečnost schematicky znázorňuje obrázek 1. Vedle periferní blokady alfa-1 adrenergních recep-

torů, a tedy navození poklesu periferní vaskulární rezistence, disponuje rovněž účinkem centrálním. Na úrovni mozkového kmene stimuluje serotoninové 5-HT<sub>1A</sub> receptory, čímž klesá aktivita serotonergních neuronů a aktivita sympatických ganglií. Zřejmý je efekt na srdce, kdy při poklesu krevního tlaku nedochází k reflexní tachykardii a analogicky též na úrovni ledvin, kde je zachována optimální perfuze (2–4).

Například oproti mnohým beta-blokátorům se urapidil vyznačuje veskrze příznivým metabolickým profilem, kdy byl u nemocných zaznamenán pokles glykemie nalačno i hladiny glykovaného hemoglobinu (5). Analogicky bylo rovněž zaznamenáno příznivé ovlivnění lipidogramu ve smyslu poklesu hladiny celkového cholesterolu, LDL-cholesterolu i triacylglycerolů za současného nárůstu HDL-cholesterolu při užívání dávky 60 mg denně po dobu 3 měsíců (2).

Stran farmakokinetických vlastností budiž uvedeno, že se po perorálním podání vstřebává z 80 až 90 %, přičemž maximální plazmatické koncentrace při volbě SR-forem je dosahováno s odstupem 4 až 6 hodin. V krvi je vázán na bílkoviny přibližně z 80 % a hodnota distribučního ob-