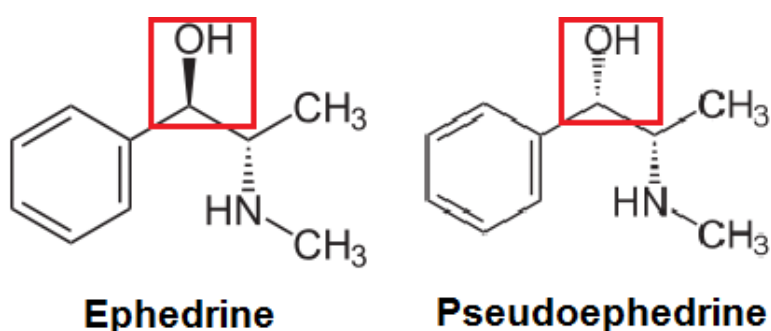


EFEDRÍN, PSEUDOEFEDRÍN A ŠPORT

EFEDRÍN A PSEUDOEFEDRÍN

Efedrín a pseudoefedrín sú klasifikované ako sympatomimetické alkaloidy obsiahnuté v tropických krovoch čeľade chvojníkovitých (Ephedraceae) rastúcich vo východnej Ázii a v strednej Európe. **Oba alkaloidy sú vzájomné optické izoméry** - majú rovnaký molekulový vzorec a konštitúciu molekuly, ale líšia sa priestorovým usporiadaním atómov alebo atómových skupín okolo chirálneho uhlíka (L-efedrín, D-pseudoefedrín).



Štruktúrne vzorce efedrínu a pseudoefedrínu.

MECHANIZMUS ÚČINKU A POUŽITIE

Efedrín a pseudoefedrín majú veľmi podobnú štruktúru ako adrenalín (epinefrín) a noradrenalín (norepinefrín). Tie sa viažu na alfa aj beta adrenergné receptory nachádzajúce sa na membráne väčšiny buniek v tele vrátane buniek srdca, pľúc a okolitých krvných ciev. Efedrín a pseudoefedrín majú však kombinované - priame aj nepriame sympatomimetické účinky:

- **priame** - dokážu sa viazať na alfa aj beta adrenergné receptory (priame agonisty)
- **nepriame** - zvyšujú uvoľňovanie natívneho noradrenalínu z nervových adrenergných zakončení - zvýšenie dostupnosti a pôsobenia prírodného neurotransmitera noradrenalínu na svojich receptoroch (nepriame agonisty)

Najvýznamnejšie účinky efedrínu sú účinky na srdce, hladké svalstvo ciev, bronchy a účinky na centrálny nervový systém (CNS). Efedrín pôsobí na srdce pozitívne inotropne a vyvoláva tachykardiu. Aj v najmenších dávkach pôsobí vazokonstrikčne a v terapeutických dávkach zvyšuje krvný tlak. Ovplyvňuje dýchanie jednak tým, že dráždi dychové centrum, jednak spôsobuje rozšírenie priedušiek. Pôsobí dráždivo na mozgovú kôru a na subkortikálne centrá.

Pri využívaní periférnych účinkov efedrínu je centrálny stimulačný efekt efedrínu často nežiaducim účinkom. Spolu s pseudoefedrínom potláča črevnú motilitu a zvyšuje hladinu cukru v krvi. Ako liečivo sa efedrín používa v kombinácii s antihistaminikami na alergické stavy (astma, alergická rinitída, urtikária, liekové exantémy). Indikovaný je aj na sínusovú bradykardiu a narkolepsiu.

Podľa farmakologických vlastností je pseudoefedrín menej aktívny a toxický. Má vazokonstrikčné a dekongesčné účinky na hyperemické sliznice horných dýchacích ciest, čím zvyšuje priechodnosť nosa a schopnosť odvádzať sekrét z dutín. Slabo stimuluje činnosť CNS a krvný tlak ovplyvňuje v porovnaní s efedrínom len minimálne. Pseudoefedrín sa najčastejšie používa v kombinácii s antihistaminikami, guajfenezínom, dextrometorfánom, kyselinou acetylsalicylovou, paracetamolom alebo ibuprofénom na liečbu alergickej rinitídy, zmiernenie príznakov chrípky a prechladnutia a symptomatickú liečbu chorôb horných dýchacích ciest. Keďže užívanie pseudoefedrínu aj efedrínu môže viesť ku vzniku závislosti, dĺžka liečby bez odporúčenia lekára by nemala trvať dlhšie ako 7 dní.

Oba alkaloidy ľahko prechádzajú hematoencefalickou bariérou a majú stimulačný účinok na CNS (**zvýšenie pozornosti, zníženie potreby spánku, prudký nárast energie, zníženie pocitu hladu, zlepšenie nálady**).

Je dobre známe, že efedrín i pseudoefedrín možno použiť ako **surovinu na výrobu pervitínu (metamfetamínu)**. Na Slovensku sú preto voľnopredajné lieky s obsahom pseudoefedrínu (lieky s obsahom efedrínu sú len na lekárske predpis) v lekárňach expedované maximálne v počte 2 balenia/osobu (napr. Nurofen stopgrip, Modafen).



Voľnopredajné lieky s obsahom pseudoefedrínu.

NEŽIADUCE ÚČINKY

Pri užívaní efedrínu/pseudoefedrínu môže nastať **búšenie srdca, arytmia, zvýšený krvný tlak, bledosť kože, potenie, chvenie rúk, nepokoj, nespavosť a závislosť** pri dlhodobom užívaní.

Na rozdiel od efedrínu má pseudoefedrín menej nežiaducich účinkov na srdce i CNS, a nevzniká po ňom tak výrazné prekrvenie slizníc.

FARMAKOKINETIKA

Efedrín a pseudoefedrín ľahko prechádzajú hematoencefalickou bariérou a **začínajú pôsobiť 15 až 30 minút po požití - trvanie účinku je 3 až 5 hodín**. Metabolizujú sa prevažne v pečeni a z veľkej časti sú vylučované močom.

EFEDRÍN A PSEUDOEFEDRÍN AKO DOPING

Na Zozname zakázaných látok je efedrín aj pseudoefedrín zaradený do skupiny S6. Stimulanciá (látky zakázané počas súťaže) s hraničnou koncentráciou:

- **efedrín** - zakázaný, ak je jeho koncentrácia v moči **vyššia ako 10 µg/ml**
- **pseudoefedrín** - zakázaný, ak je jeho koncentrácia v moči **vyššia ako 150 µg/ml**

Maximálne prípustné koncentrácie v moči boli stanovené na základe maximálnych terapeutických dávok efedrínu/pseudoefedrínu pri perorálnom podaní: efedrín (jednotlivo: 50 mg, denne - 150 mg), pseudoefedrín (jednotlivo: 60 mg, denne - 240 mg). Športovci by sa mali vyhnúť ich užívaniu 24 hodín pred súťažou.

Pri systémovom podaní efedrínu alebo pseudoefedrínu sa v dôsledku zvýšeného uvoľňovania endogénnych stimulantov - hlavne norepinefrínu zvyšuje termogenéza, srdcový tep a stimuluje sa CNS. Všeobecný dôvod užívania týchto stimulantov je **zvýšenie rýchlosti metabolizmu - spaľovanie tukov, potlačenie chuti do jedla a celkový stimulačný efekt na CNS**. Pre zvýšenie týchto účinkov sa často užívajú v kombinácii kofeínom. Existujú dôkazy o tom, že efedrín môže zvýšiť svalovú silu, a tiež pomáha udržiavať svalovú hmotu. Je potrebné poznamenať, že mechanizmus týchto účinkov ešte nie je úplne objasnený a v skutočnosti nebol špecificky študovaný.

V roku 2018 malo počas súťažného odberu vzoriek pozitívny dopingový test na efedrín 30 športovcov a na pseudoefedrín 4 športovci.