

AMILORID A ŠPORT

AMILORID AKO ZAKÁZANÁ LÁTKA

Amilorid je na Zozname zakázaných látok zaradený **do skupiny S5. Diuretiká a maskovacie látky**. Jeho užívanie je v športe trvalo zakázané (počas aj mimo súťaže).

MECHANIZMUS ÚČINKU

Amilorid je kálium (draslík) šetriace diuretikum, ktoré **blokuje sodíkový kanál na luminálnej membráne epitelu distálnych tubulov a zberných kanálikov**. Práve v distálnej časti distálneho tubulu a v proximálnej časti zberných kanálikov nefrónu je dôležitá spätná resorpcia Na^+ a exkrécia K^+ , ktorých výmena prebieha pomocou Na^+/K^+ -ATPázy. Dôsledkom blokovania sodíkových kanálov amiloridom sa zníži spätná resorpcia Na^+ a s tým súvisiaca exkrécia K^+ . Samotný diuretický účinok amiloridu je slabý, no uplatnenie našiel pre významnú moduláciu ovplyvnenia hladiny draslíka.

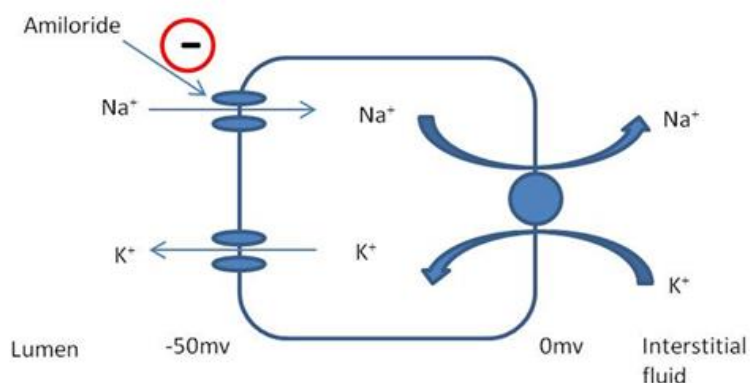
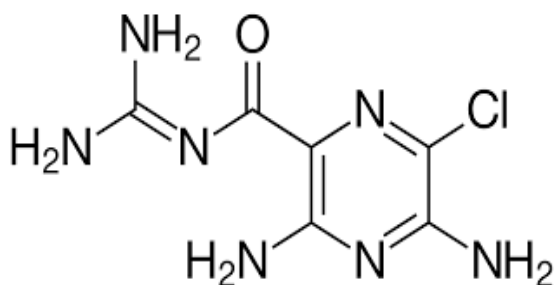


Schéma mechanizmu účinku amiloridu.

TERAPEUTICKÉ POUŽITIE

Pre vyššie uvedený hlavný účinok sa využíva najmä v kombináciách s inými diuretikami (najčastejšie s hydrochlorotiazidom, chlórthalidónom a furosemidom) na **terapiu hypertenzie**, kde pri znižovaní krvného tlaku zabraňuje nadmerným stratám draslíka. Ďalej je v kombinovaných liekoch s tiazidmi a furosemidom indikovaný na **edémy kardiálneho pôvodu (chronické srdcové zlyhávanie) alebo cirhózu pečene s ascitom a edémom**. Takto kombinovaná terapia zvyčajne poskytuje uspokojujúcu diurézu so zníženými stratami draslíka a so zníženým rizikom metabolickej alkalózy tým, že sa udržiava lepšia rovnováha sérových elektrolytov.

FARMAKOKINETIKA



Štruktúrny vzorec amiloridu.

Amilorid sa obvyčajne užíva vo forme perorálnych tabliet a začína pôsobiť v priebehu 2 hod. po podaní. Jeho účinok na vylučovanie elektrolytov dosahuje vrchol medzi 6. až 10. hod. a trvá asi 24 hodín. V pečeni sa nemetabolizuje a vylučuje sa v nezmenenej forme močom a stolicou.

NEŽIADUCE ÚČINKY A KONTRAINDIKÁCIE

Medzi časté nežiaduce účinky amiloridu patrí **hyperkaliémia (vysoká hladina draslíka v krvi), zvracanie, strata chuti do jedla a bolesti hlavy.**

Podávanie amiloridu je kontraindikované hlavne pri hyperkaliémií (definovaná ako >5,5 mmol/l) a renálnej insuficiencii (anúria, akútne renálne zlyhanie, diabetická nefropatia).

VYUŽITIE V ŠPORTE

Užívanie samotného amiloridu má minimálny diuretický účinok, a preto ho športovci užívajú ako **prevenciu vzniku nežiaduceho účinku hypokaliémie pri zneužívaní tiazidových diuretik alebo furosemidu.**

PRÍPADY DOPINGU A ŠTATISTIKA

Amilorid a drvivá väčšina diuretik sa deteguje zo vzoriek moču pomocou separačných analytických metód plynovej alebo kvapalinovej chromatografie v spojení s metódou hmotnostnej spektrometrie.

V roku 2017 mala pozitívny test na amilorid, hydrochlorotiazid a jeho metabolit chlóraminofenamid česká tenistka Kateřina Kramperová. Tieto diuretiká jej vraj boli predpísané na zníženie opuchu ramien a nôh, ktoré boli následkom reakcie užitia antibiotík po uhryznutí hmyzom. Po tejto skutočnosti požiadala o udelenie terapeutickej výnimky, ktorá jej bola zamietnutá. Za porušenie antidopingových pravidiel tak dostala zákaz činnosti na 6 mesiacov. V rovnakom roku bol amilorid spolu klenbuterolom a fluoxymesterónom detegovaný aj vo vzorke slovenského kulturistu, za čo dostal zákaz činnosti na 4 roky.

Podľa štatistiky WADA z roku 2018 bol amilorid **detegovaný vo vzorkách športovcov 10-krát, čo predstavuje 2 % všetkých nepriaznivých analytických nálezov v rámci skupiny diuretik a iných maskovacích látok.**