



C. CHIAMULERA
Università degli Studi di Verona

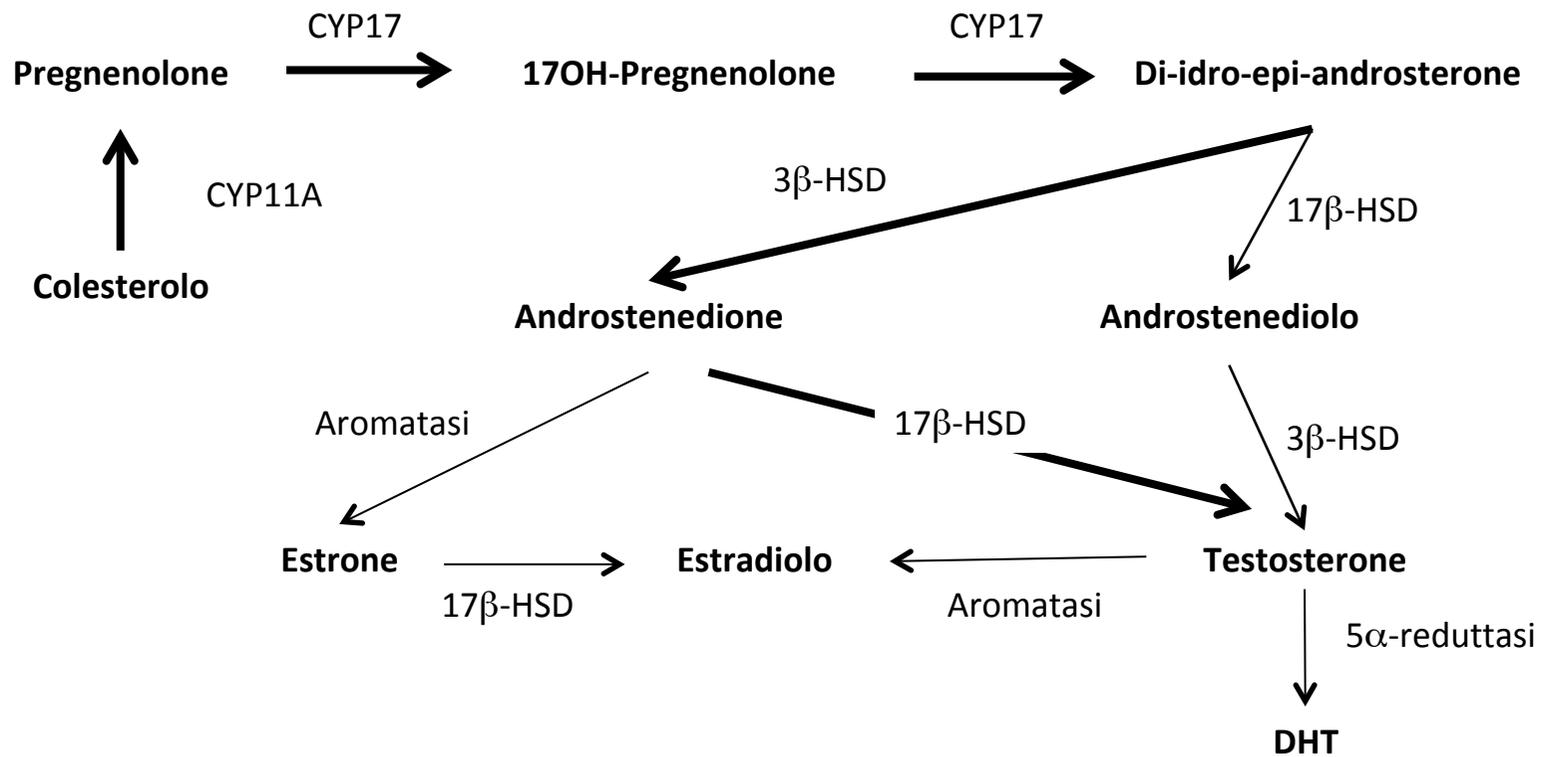
Corso di
“Farmacologia”
ANABOLIZZANTI ANDROGENI

Capitolo 38 Conforti (Sorbona ed.)

STERIODI ANABOLIZZANTI

- Derivati sintetici del testosterone che sono stati modificati per aumentare **l'azione anabolica** rispetto a quella androgenica

Biosintesi degli Steroidi Androgeni Anabolizzanti



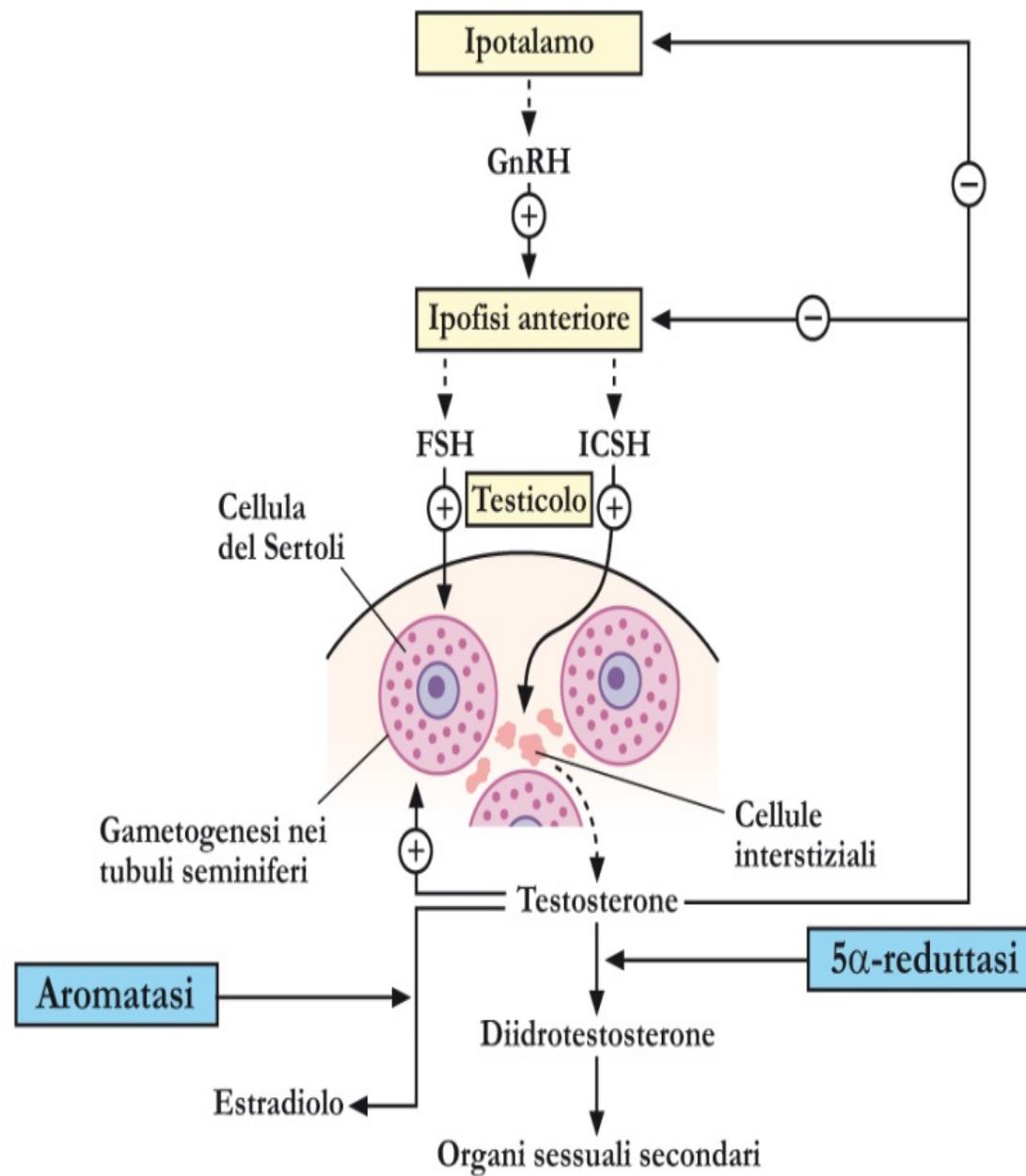


Figura 38.1. Rappresentazione schematica della regolazione della secrezione e metabolismo del testosterone.

EFFETTI FISIologici DEGLI ANDROGENI

Nell'embrione

- differenziazione in senso maschile dei genitali interni ed esterni

Alla pubertà

- sviluppo caratteri sessuali secondari
- aumento masse muscolari
- raggiungimento picco massa ossea
- modificazioni psichiche
- sviluppo libido e funzione spermatica

Nell'adulto

- mantenimento libido
- mantenimento caratteri sessuali secondari
- mantenimento forza muscolare
- mantenimento trofismo cutaneo
- mantenimento massa ossea

RAGGRUPPAMENTO AZIONI FISILOGICHE

- **Azioni morfogeniche:** irreversibili; si verificano durante l'embriogenesi
- **Azioni stimolatorie:** pubertà (peli, corde vocali, ossa)
- **Azioni di mantenimento:** reversibili; comportamento, libido, funzione riproduttiva
- **Altre azioni:** diminuzione tessuto linfoide; stimolazione eritropoiesi.

Raggruppamento azioni farmacologiche

- **Effetti virilizzanti:** regolazione gonadotropine; spermatogenesi; sviluppo sessuale
- **Effetti anabolici proteici:** incremento densità ossea, massa muscolare, globuli rossi

STEROIDI ANABOLIZZANTI

Effetti sulla composizione corporea

BODY COMPOSITION:

- aumento massa magra
- riduzione massa grassa
- riduzione dell'adiposità localizzata in regione glutea, femorale e tricipitale nelle donne
- effetto lipolitico ed anabolico sulla muscolatura scheletrica potenziato dalla restrizione calorica

USI CLINICI

Terapia sostitutiva

Ipogonadismo

prepuberale: congenito e acquisito; terapia per 2-3 anni fino alla pubertà; dosi basse di mantenimento livelli plasmatici

postpuberale: disfunzione testicolare primaria; secondario alla distruzione dell'adenoipofisi

Invecchiamento e impotenza

USI CLINICI

Tumore mammella; endometriosi

uso limitato a causa degli effetti virilizzanti

Azione anabolica proteica:

aumentato uptake aminoacidi; incremento RNA polimerasi nel muscolo scheletrico; antagonismo delle azioni dei glucocorticoidi; utilizzato per persone di bassa statura (19-nortestosterone)

SPECIALITÀ MEDICINALI, CONTENENTI STEROIDI ANABOLIZZANTI, PER USO TERAPEUTICO IN ITALIA

- Clobestol: Alfatrofodermin[®], Trofodermin[®]
- DHEA: Gynodian depot[®]
- Nandrolone: Deca-Durabolin[®], Dynabolon[®]
- Mesterolone: Proviron[®]
- Ossandrolone: Oxandrolone[®]
- Testosterone: Andriol[®], Androderm[®], Androgel[®], Facovit[®], TestoEnant[®], Testogel[®], Testovis[®], Testoviron[®], Sustanon[®]

EFFETTO DEL TE SULLA PERFORMANCE

- Aumento della forza muscolare volontaria
- Probabile effetto sulla performance di durata
- Il Te riduce il tempo di reazione e regola la trasmissione neuromuscolare

Modalità di assunzione degli AAS nel doping

Assunti, sia per via orale che iniettiva, in modo ciclico tipicamente per periodi di 6-8 settimane intervallati da un uguale periodo di astensione.

Si utilizza uno schema di tipo piramidale con dosi crescenti e poi decrescenti

Rispetto ai dosaggi utilizzati nella terapia dell'ipogonadismo i dosaggi nel doping sono 10 a 40 volte superiori (anche > 100 tra pesisti).

Spesso uso contemporaneo di più anabolizzanti per evitare la tolleranza a un particolare steroide (modalità "stacking" - letteralmente accatastare)

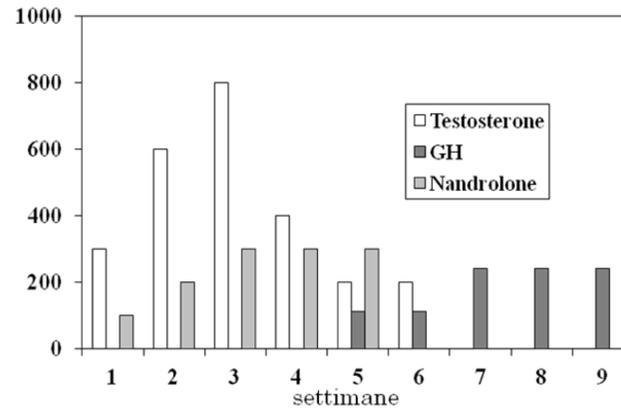
Utilizzo contemporaneo di altre sostanze

- ✓ per contrastare gli effetti avversi (es. HCG per ridurre inibizione testosterone endogeno)
- ✓ per evitare di essere individuati ai controlli antidoping
- ✓ per potenziare l'azione anabolizzante

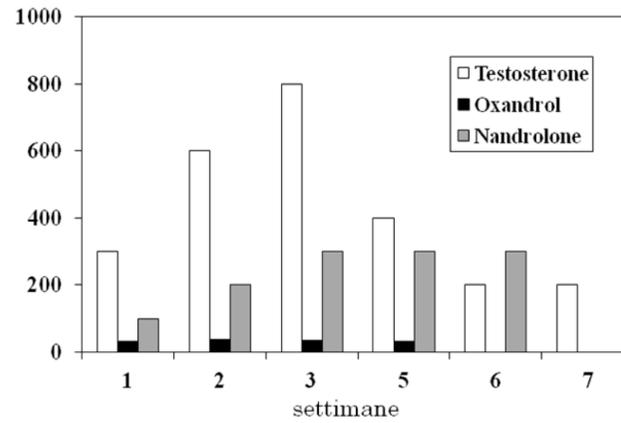
EFFETTI DEL TE SUL MUSCOLO SCHELETRICO

	Età	Dose di Testost.	Modifiche della massa magra	Modifiche massa grassa	Modifiche della forza muscolare
Bhasin 1997	19-47	100mg/sett per 10 sett	+10 %	Nessuna modifica	+ 22 %
Katzenelson 1996	22 69	100mg/sett per 18 mesi	+7%	-14% body -13% s.c.	Non misurato
Brodsky 1996	33 57	3mg/kg ogni 15 gg per 6 mesi	+15%	-11%	Non misurato
Wang 1996	19 60	5 mg s.l. tre volte al giorno per 6 mesi	+2 %	Nessuna modifica	+ 8.7 kg Leg-press
Snyder 2000	22 78	Te patch per 12-36 mesi	+3.1 %	Nessuna modifica	Nessuna variazione
Wang 2000	19 68	Gel 50-100 mg/die per 180	+2.7	-1 kg	+11-13 Leg-press

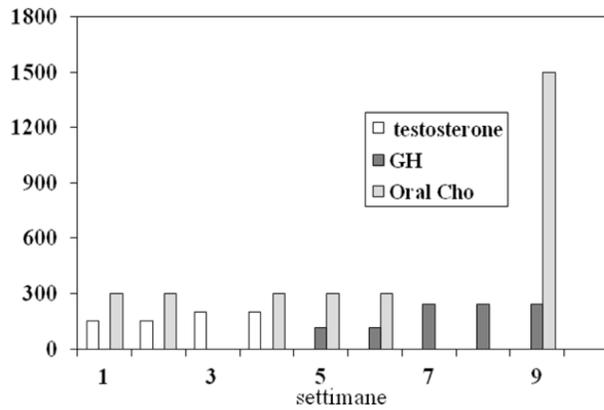
Protocollo sequenziale



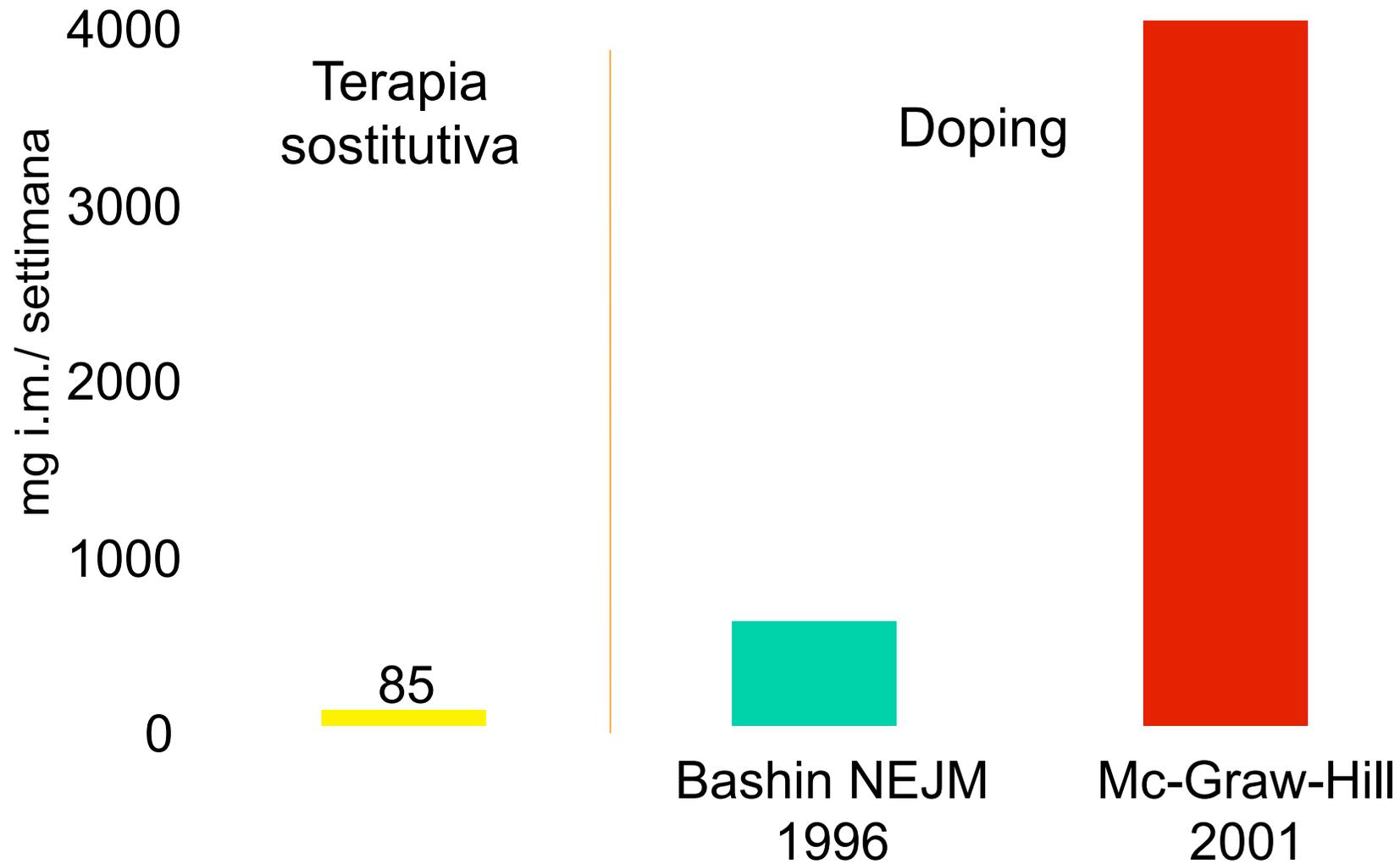
Protocollo piramidale



Protocollo per la preparazione di gare di durata



DOSI TERAPEUTICHE E DOPANTI DEGLI ANDROGENI NEL MASCHIO



GLI AAS COME DOPING FUNZIONANO!

- Aumentano la forza e la massa muscolare. Aumentano l'aggressività, la resistenza agli allenamenti e il recupero dopo carichi di lavoro intensi
- I giovani e le donne: risentono maggiormente dell'effetto anabolizzante degli steroidi in termini di performance, ma sono anche coloro che hanno il maggior rischio di effetti collaterali

DIPENDENZA DAGLI AAS

- **Dipendenza psicologica comune**
- **Dipendenza fisica controversa**

Sindrome d'astinenza da AAS (modello bifasico)

- **Prima fase (1-2 settimane)**
 - **agitazione, instabilità vasomotoria**
 - **Può essere necessaria ospedalizzazione**
- **Seconda fase (mesi)**
 - **depressione, debolezza**
 - **Esacerbazione sintomatologia da stato ipogonadale**

EFFETTI AVVERSI COMUNI A MASCHI E FEMMINE	
Sistema Nervoso	<ul style="list-style-type: none"> • Disturbi psichici (specie con uso discontinuo): • depressione, disturbi maniacali, psicosi, sindrome da astinenza con tendenza al suicidio • Euforia, mania, paranoia • Aggressività, ira, tendenza all'omicidio, abusi sessuali
Metabolismo	<ul style="list-style-type: none"> • Riduzione sensibilità insulinica • aumento colesterolo LDL, riduzione colesterolo HDL)
Sistema cardiovascolare	<ul style="list-style-type: none"> • Poliglobulia • Ipertensione arteriosa • Ipertrofia ventricolare sinistra • Aumento rischio cardiovascolare (?) • Alterazioni emocoagulatorie
Fegato	<ul style="list-style-type: none"> • Epatotossicità (con androgeni 17α-alchilati) • Aumento rischio di neoplasie epatiche primarie
EFFETTI AVVERSI NEL MASCHIO	
	<ul style="list-style-type: none"> • Soppressione della funzione riproduttiva (contraccezione maschile), riduzione del volume testicolare • Ginecomastia • Ipertrofia prostatica/aumentato rischio di neoplasie prostatiche
EFFETTI AVVERSI NELLA DONNA	
	<ul style="list-style-type: none"> • Amenorrea • Atrofia del seno • Irsutismo • ispessimento del clitoride • Abbassamento della voce • Alterazione disposizione adipe
EFFETTI AVVERSI IN ETÀ PREPUBERE	
	<ul style="list-style-type: none"> • Pseudopubertà precoce • accelerazione saldatura cartilagini di accrescimento e arresto della crescita • Infezioni: Ascessi/cellulite, HIV, epatiti virali • Rotture tendini (superallenamento?) • Edemi per ritenzione idrica • Policitemia