

OXIMETOLONA (C5)

Anabolizante

Melhora o desempenho esportivo

Aumenta os níveis de testosterona



Os esteroides anabolizantes foram inicialmente desenvolvidos para fins terapêuticos, como o tratamento de pacientes com deficiência natural de andrógenos, na recuperação de cirurgias e atrofia muscular, por melhorarem o balanço nitrogenado em estados catabólicos, prevenindo a perda de massa magra e reduzindo o aumento de tecido adiposo, e, também, no tratamento da osteoporose, do câncer de mama e anemias, uma vez que estimulam a eritropoiese.

Entretanto, o uso dessas drogas destacou-se principalmente no meio esportivo, devido às propriedades anabólicas que promovem o aumento de massa muscular, do desenvolvimento de força, da velocidade de recuperação da musculatura e o controle dos níveis de gordura corporal melhorando o desempenho físico, sendo que a ação trófica do hormônio exógeno é mais pronunciada do que aquela observada pelos níveis normais de testosterona na circulação.

Oximetolona é um esteroide sintético derivado da testosterona. Foi inicialmente desenvolvido para melhorar a saúde dos indivíduos afetados com anemia, uma desordem caracterizada pela diminuição na produção de glóbulos vermelhos (GR), células responsáveis principalmente pelo transporte de oxigênio necessário para as diferentes células e tecidos do corpo. A produção de células vermelhas do sangue depende de um hormônio chamado eritropoietina. Administração de oximetolona aumenta a produção desse hormônio e, portanto, é considerada benéfica em situações anêmicas. Adicionalmente, a oximetolona resulta no favorecimento do aumento dos níveis de testosterona no corpo. A testosterona é o hormônio masculino primário, e é responsável pelo desenvolvimento de músculos.

Nome Químico

17 β -hidroxi-2- (hidroximetileno) -17-metil-5 α -androstan-3-ona.

Classe Terapêutica

Port. 344 - C5

Dose usual

A dose recomendada em crianças e adultos é de 1 a 5 mg/kg do peso corporal por dia.

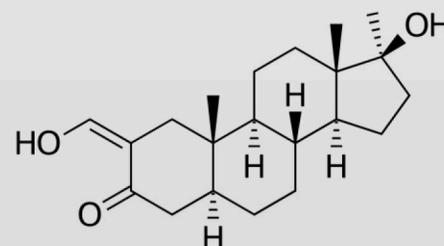
Dose usualmente eficaz é de 1 a 2 mg/kg/dia, porém doses mais altas podem ser necessárias e a dosagem deve ser individualizada.

Benefícios do produto

Anabolizante;

Deficiência na produção de eritrócitos e outros componentes sanguíneos (anemia aplástica)

Fórmula Estrutural



Oximetolona trata-se de um esteroide anabolizante, que colabora na construção de fibras musculares, evita momentos de catabolismo muscular, resultando em uma maior massa magra e diminuição dos efeitos de redução muscular.

MECANISMO DE AÇÃO

Oximetolona estimula a proliferação de células tronco e progenitoras hematopoiéticas, resultando em uma recuperação das células sanguíneas totais. Inverte também processos catabólicos e o balanço nitrogenado negativo, promovendo o anabolismo proteico e estimulando o apetite, se houver simultaneamente uma ingestão adequada de calorias e proteínas.

Em anemias causadas devido à insuficiência da medula óssea: Aumenta a produção e a excreção urinária de eritropoietina. Anemias devido à produção de eritrócitos deficiente: Estimula a produção de eritropoietina e pode ter uma ação direta na medula óssea. Ao aumentar as células vermelhas do sangue, oximetolona permite a absorção muscular de mais oxigênio e nutrientes, o que significa que o corpo pode regenerar mais rapidamente após um treino, resultando em aumento da hipertrofia, o crescimento muscular.

Oximetolona possui maior atividade anabólica, que influencia o aumento da massa muscular, força, velocidade de recuperação dos músculos e controle dos níveis de gordura corporal. E menor atividade androgênica, que influencia as características sexuais masculinas. Liga-se aos receptores de testosterona citoplasmáticas em órgãos que respondem a androgênios e tecido, formando um complexo com o receptor hormonal. Este complexo hormônio-receptor liga-se com o DNA melhorando sua transcrição e a formação de mRNA que, em última instância, leva à modificação da síntese de proteínas. Exerce efeito anabólico no esqueleto e músculos esqueléticos e também acelera a eritropoiese.

ESTUDOS

Oximetolona promove ganho de peso em pacientes com infecção avançada pelo vírus da imunodeficiência humana (HIV-1)

O efeito da oximetolona sozinha ou em combinação com o antagonista do receptor H 1cetotifeno, foi avaliada num estudo piloto prospectivo de 30 semanas. Trinta pacientes foram randomizados para monoterapia com oximetolona (n 14) ou oximetolona mais cetotifeno (n 16). Os pacientes que receberam tratamento foram comparados com um grupo controle composto por trinta pacientes não-tratados, que preencheram os mesmos critérios de inclusão. O peso corporal e o índice de Karnofsky, que avaliam a capacidade de realizar atividades da vida diária, e várias variáveis de qualidade de vida foram mensurados para avaliar a resposta à terapia.

O ganho de peso médio no pico foi de 8,2 (DP 6,2) kg (+ 14,5% do peso corporal na entrada do estudo) no grupo da oximetilona (P <0,001) e 6,1 (SD 4,6) kg (+ 10,9%) no grupo da combinação P <0,005, em comparação com uma perda de peso média de 1,8 (DP 0,7) kg nos controles não tratados. O tempo médio até o pico de peso foi de 196 semanas no grupo em monoterapia e 20,8 semanas no grupo de combinação.

O índice de Karnofsky melhorou igualmente em ambos os grupos de 56% antes para 67% após 20 semanas de tratamento (P <0,05). As variáveis qualidade de vida (atividades de vida diária e apetite / nutrição) melhoraram em 68% (P <0,05) e 91% (P <0,01) dos pacientes tratados, respectivamente. Oximetolona mostrou-se seguro e promoveu o ganho de peso em pacientes com caquexia portadores de infecção avançada de HIV-1.

REAÇÕES ADVERSAS

A hepatotoxicidade é a reação adversa mais grave associada à terapia com esteroides anabolizantes. O aumento reversível na retenção da bromossulfaleína pode ocorrer precocemente e parece estar diretamente relacionado à dose. O aumento da bilirrubina sérica, com ou sem aumento da fosfatase alcalina e transaminases (TGO e TGP), indicam um maior grau da disfunção excretora.

Pode ocorrer icterícia clínica, que é reversível quando a droga é descontinuada. O quadro histológico é o de uma colestase intra-hepática, com pouca ou nenhuma lesão celular. A terapia continuada pode estar associada à coma hepático.

Têm havido raros relatos de neoplasias hepatocelulares à “peliosis hepatis” associados à terapia prolongada com esteroides andrógenos-anabolizantes.

Outras reações adversas associadas à terapia anabólica androgênica incluem: câibras, náuseas, excitação e insônia, calafrios, sangramento em pacientes em terapia anticoagulante concomitante, fechamento prematuro da epífise em crianças, vômitos e diarreia.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

A administração concomitante de bupropiona e oximetolona deve ser realizada com cautela pois o efeito desta combinação é a redução do limiar de convulsão.

Dicumarol e Varfarina

Há aumento do risco de hemorragia.

Evitar o uso de associação com anticoagulantes.

Se usada, a relação do tempo de protrombina ou razão normalizada internacional (INR) deve ser atentamente monitorada após adição ou retirada do tratamento com oximetolona, e deve ser reavaliada periodicamente durante a terapia concomitante. Podem ser necessários ajustes na dose do anticoagulante a fim de manter o nível desejado do anticoagulante.

CONTRAINDICAÇÕES

Oximetolona não deve ser utilizado por mulheres grávidas ou que possam ficar grávidas durante o tratamento.

Não se sabe se os esteroides anabólicos são excretados pelo leite materno, por isso mulheres que utilizam oximetolona não devem amamentar, devido ao risco potencial de reações adversas em lactentes.

Pacientes com carcinoma da próstata ou da mama. Pacientes com nefrose ou fase nefrótica da nefrite ou com insuficiência hepática severa.

REFERÊNCIAS

ARAMWIT, P. et al. *The efficacy of oxymetholone in combination with erythropoietin on hematologic parameters and muscle mass in CAPD patients*. Int J Clin Pharmacol Ther. v. 48, n. 12, p. 803-813. 2010. Disponível em: < <http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/21084036> >. Acesso em: 30/03/2017, às 09:48. LACY F.C.; ARMSTRONG L.L.; GOLDMAN M.P.; LANCE L.L. *Drug Information Handbook*. American Pharmacists Association. Lexi-Comp. 23ª edição, 2014-2015. PAVLATOS, A.M. et al. *Review of oxymetholone: a 17alpha-alkylated anabolic-androgenic steroid*. Clin Ther. 2001. v. 23, n. 6, p. 789-801. THOMSON, MICROMEDEX. *Drug Information for the Health Care Professional. 25th ed. Volume 1. Plus Updates. Content Reviewed by the United States Pharmacopeial Convention, Inc.* Greenwood Village: CO. 2005.v.1 25th ed, p. 141. ULRICH R. H. et al. *Oxymetholone promotes weight gain in patients with advanced human immunodeficiency virus (HIV-1) infection*. British Journal of Nutrition. 1996. v.75, Issue 1, p.129-138 YANG Q. et al. *Androgens for the anaemia of chronic kidney disease in adults*. Cochrane Database Syst Ver. 2015. DOI: 10.1002/14651858.CD006881.pub2. ZHANG, Q. S. et al. *Oxymetholone therapy of fanconi anemia suppresses osteopontin transcription and induces hematopoietic stem cell cycling*. Stem Cell Reports: 2015, v. 4, n. 1, p. 90-102.

Alcântara - Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130

Centro / Zé Garoto - Rua Coronel Serrado, 1630, lojas 102/103. Telefone (21) 2605-1349



vendas@farmacam.com.br



whatsapp (21) 98493-7033



Facebook.com.br/farmacam



Instagram.com.br/farmacam