

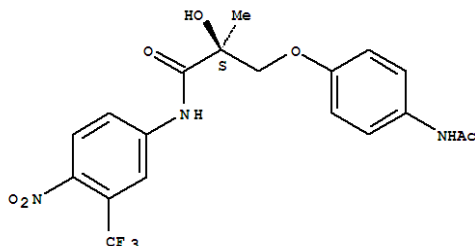
# ANDARINE GTX-007

**Anabolismo muscular**  
**Lipólise (queima de gordura corporal)**  
**Aumento da densidade óssea**

Agentes terapêuticos como SARMs (moduladores tecido-seletivos de receptor de androgênio não esteroidais) podem alcançar efeitos anabólicos no músculo esquelético, promovendo a síntese proteica com desenvolvimento de volume muscular. Nos ossos, promove aumento da densidade óssea, sem os efeitos adversos limitantes de dose associados à testosterona.

**Andarine (GTX-007)** é um SARM, especialmente eficaz na redução da gordura corporal e aumento de massa magra muscular, força e resistência, proporcionando aos atletas um efeito altamente desejado.

Não ocorre aromatização, isto é, não há conversão de andrógenos em estrógenos. **Andarine (GTX-007)** é um insumo seguro, com poucos efeitos colaterais relatados.



#### Nome químico

S-3- (4-acetyl-amino-phenoxy) - 2-hydroxy-2-methyl-N- (4-nitro-3-trifluoromethyl-phenyl) - propionamide; N [(trifluoromethyl) phenyl 4-Nitro-3-] - (2S) - 3 [4 (acetyl-amino) phenoxy] - 2-hydroxy-2-methylpropanamide

#### Fórmula Molecular

C<sub>19</sub>H<sub>18</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

#### Peso molecular

441,36

#### Sinônimos

S-4, GTX-007, SARM S4, Acetamidoxolutamide

#### Classe terapêutica

SARM (modulador seletivo de receptor androgênico)

#### Dose usual

50-75 mg no total por dia

#### Indicações

Anabolismo muscular  
Lipólise (queima de gordura corporal)  
Aumento da densidade óssea  
Tratamentos de Hiperplasia prostática benigna

## MECANISMO DE AÇÃO

Andarine (GTX-007) é um agonista parcial para os receptores de andrógenos, administrado por via oral. O mecanismo de ação androgênica no músculo permanece em grande parte desconhecido. A hipótese comum é que os andrógenos promovem a síntese proteica muscular tanto em homens idosos como em homens hipogonádicos jovens. Verificou-se que Andarine não só possui uma grande afinidade ao receptor androgênico, como também apresenta efeitos anabólicos superiores a alguns esteroides tradicionais.

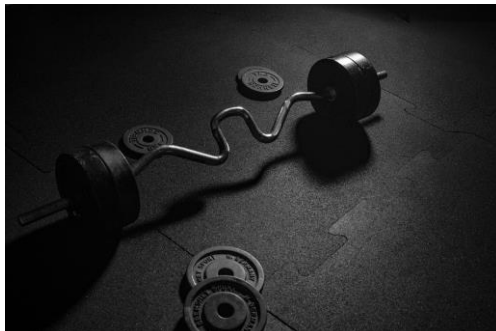
No músculo, o andrógeno aumenta as áreas transversais das fibras musculares do tipo I e do tipo II de maneira dose-dependente, mas não altera o número absoluto destas fibras. O andrógeno aumenta o número de células satélites, resultando em hipertrofia da fibra muscular.

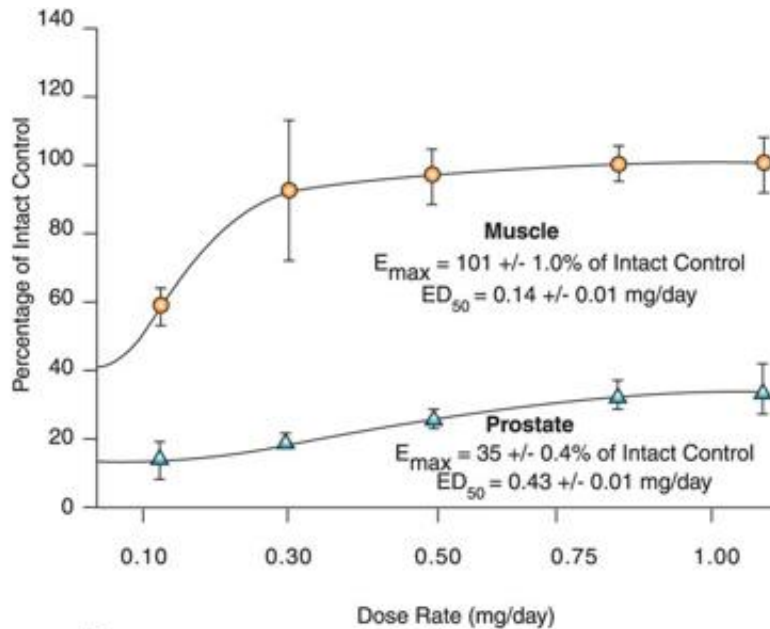
Diminuições na gordura corporal dependem da genética do paciente, mas Andarine apresenta fortes efeitos sobre a capacidade do organismo de oxidar o tecido adiposo.

## FARMACOCINÉTICA

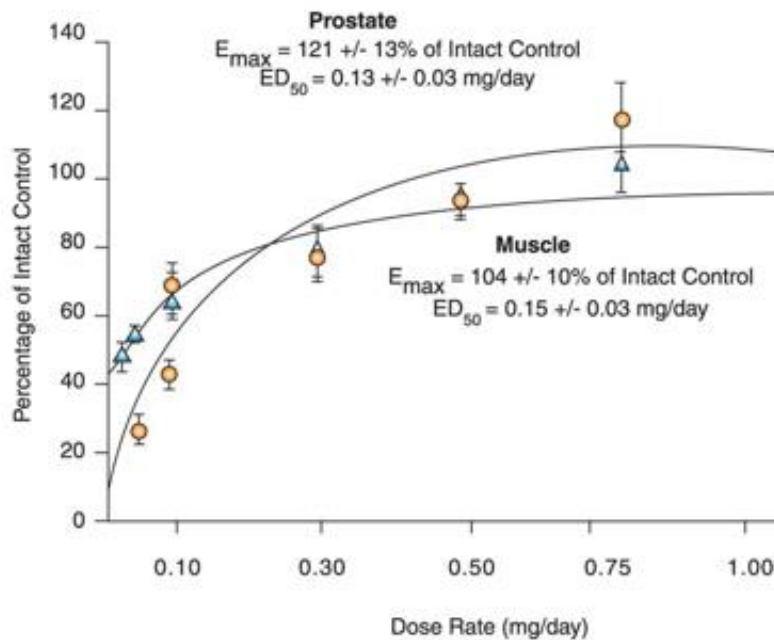
Em modelo animal (rato), Andarine exibiu uma farmacocinética linear dentro do intervalo de dose farmacológica. Após a administração oral, foi completo e rapidamente absorvido. Além disso, a biodisponibilidade oral é de 38%, 62% e 91% para as doses de 10 mg / kg, 1 mg / kg e 0,1 mg / kg, respectivamente.

A meia-vida de Andarine é de apenas 4-6 horas. Além disso, não é tóxico para o fígado, não afeta os níveis de colesterol, a pressão arterial sanguínea, os rins ou a próstata. Não ocorre supressão de HPTA grave (eixo testicular hipotalâmico hipofisário). Testes em humanos com esta droga foram relatados com sucesso, mas nenhum estudo foi publicado.





**B**



Atividade farmacológica de Andarine no anabolismo muscular e na próstata.

## ESTUDOS

### ANDARINE NO TRATAMENTO DA HIPERPLASIA PROSTÁTICA BENIGNA (HPB)

A HBP é uma doença comum associada ao envelhecimento e andrógenos. O androgênio intraprostático principal é a DHT, que é convertida a partir da testosterona, principalmente, pelo tipo 5  $\alpha$  reductase. Os sintomas do trato urinário inferior (STUI), comumente associados à HPB sintomática, são causados pelo bloqueio mecânico da hiperplasia DHT-dependente.

Em um estudo de Hershberger com ratos machos intactos, Andarine compete com andrógenos endógenos, podendo ser aplicado no tratamento de BPH (Hiperplasia prostática benigna) ou câncer de próstata, sem danos hepáticos.

Neste modelo de rato castrado, Andarine preveniu a atrofia induzida pela castração do músculo elevador do ânus e agiu como agonista fraco na próstata. Na dose de 3 mg / kg / dia, o GTX-007 restaurou parcialmente o peso da próstata para <20% do intestino intacto, mas restaurou totalmente o peso do elevador, a força muscular esquelética, a densidade mineral óssea, a resistência óssea e a massa corporal magra e suprimiu LH parcialmente (nas taxas de dose de 0,5 mg / dia ou mais).

Andarine (GTX-007) atuou como um agonista de receptor androgênico completo no músculo levantador do ânus.

Estes estudos indicam que os SARMs podem ser viáveis para o tratamento da HBP como terapia única ou combinada no futuro, indicando que seriam potentes e eficazes em tecidos anabólicos, mas não em tecidos androgênicos.

### PREVENÇÃO E TRATAMENTO DA OSTEOPOROSE

Numerosas linhas de evidência indicam que os andrógenos são importantes nos ossos, e que os SARMs podem representar uma nova abordagem para o tratamento da osteoporose. A redução da concentração de andrógenos se correlaciona bem com os marcadores de reabsorção óssea em homens admitidos para fratura de quadril, sugerindo que a perda de andrógenos pode contribuir para a perda óssea e aumento do risco de fratura.

A reposição androgênica previne a perda óssea e aumenta a densitometria óssea (DMO) em homens com hipogonadismo; no entanto, o efeito da substituição androgênica no risco de fratura permanece desconhecido.

Os SARMs aumentaram significativamente a DMO, especialmente no fêmur e a resistência óssea em um modelo hipogonadal, em ratos orquidectomizados e ovariectomizados.

Em ratos orquidectomizados, o tratamento com GTX-007 aumentou significativamente a DMO cortical nos ossos femoral e tibial, mas não afetou a DMO esponjosa em ambos os ossos, sugerindo que os SARMs promovem significativamente a DMO principalmente por ação anabólica, e não por ação anti-reabsorção.

Andarine pode restaurar a massa óssea mesmo para osteoporose grave, bem como para a osteoporose preventiva e em estágio inicial. A terapia combinada com agentes anti-reabsortivos pode aumentar sinergicamente a massa e força ósseas. Finalmente, os efeitos anabólicos do andrógeno no músculo são benéficos para aumentar a massa óssea e reduzir o risco de fratura.

## ANDARINE: ANABOLISMO MUSCULAR E AÇÃO LIPOLÍTICA

A administração de androgênio aumenta significativamente a massa muscular e a força em homens hipogonádicos jovens (dose de reposição fisiológica) e homens eugonadais (dose suprafisiológica).

Recentemente, os efeitos GTX-007 na massa e força do músculo esquelético em ratos orquidectomizados foram medidos. O tratamento (3 mg / kg e 10 mg / kg) aumentou significativamente a força muscular esquelética em animais orquidectomizados.

GTX-007 restaurou as perdas induzidas por castração em massa corporal magra. Alterações similares no tamanho muscular, força muscular e massa magra também foram observadas em animais tratados com DHT (3 mg / kg).

Andarine também pode minimizar a LPL (lipoproteína lipase), uma enzima que causa acúmulo de lipídios e desempenha um papel no armazenamento de tecido adiposo. A ação ocorre pela oxidação do tecido adiposo, servindo como fonte de energia, sendo eliminada do organismo.

GTX-007 aumenta a vascularização tecidual, sem retenção de água, com excelentes ganhos anabólicos.

### POSOLOGIA SUGERIDA

A dosagem típica de Andarine (GTX-007) é de 50-75 mg no total por dia, administrados de manhã e à noite em dosagens separadas, entre 8- 12 semanas.

Mulheres devem usar metade desta dose.

### CONTRAINDICAÇÃO

Andarine (GTX-007) é contraindicado em crianças, adolescentes, gestantes e lactantes.





## REAÇÕES ADVERSAS

Relatos de visão prejudicada e desconforto ocular são comuns com o uso de Andarine. Os usuários geralmente experimentam visão embaçada e amarelada, especialmente à noite, e flashes de visão também foram relatados. Esses efeitos ocorrem quando a molécula Andarine (GTX-007) se liga aos receptores androgênicos na retina. No entanto, o sintoma desaparecerá imediatamente após o medicamento ter sido descontinuado.

Andarine tende a suprimir a produção natural de testosterona mais do que outros SARMs, porém é dose dependente e varia de acordo com características genéticas do paciente.

Pode ocorrer uma supressão do hormônio luteinizante (LH) e do hormônio folículo estimulante (FSH) pelo uso de Andarine. O LH e o FSH promovem a produção de hormônios reprodutivos em homens e mulheres, e a supressão pode suprimir os níveis normais de estrogênio / testosterona.



### REFERÊNCIAS

1. BHASIN, S.; JASUJA, R. Moduladores Seletivos de Receptores Androgênicos (SARMs) como Função Promovendo Terapias. *Curr Opin Clin Nutr Metab Care*. 2009 maio; 12 (3): 232-240. Disponível em: <<https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC2907129/>>. Acesso em 20 ago. 2018.
2. CHEN, J.; KIM, J.; DALTON, J.T. Descoberta E Promessa Terapêutica Dos Moduladores Dos Receptores De Androgênicos Seletivos. *Interv. Mol*. Junho de 2005; 5 (3): 173-188. Disponível em: <<https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC2072877/>>. Acesso em 20 ago. 2018.
3. Latest Pharmaceutical Studies On SARMs: Journal of Process Analytical Technology. Fev. 2017. Disponível em: <<http://www.patjournal.com/tag/ostarine/>>. (Acesso em 26 set.2018).
4. Sarcopenia e fármacos: parte II. Disponível em: <<http://www.ideac.com.br/assets/sarcopenia-e-f%C3%A1rmacos-parte-ii.pdf>>. (Acesso em 26 set.2018).