

ANABOLISANTS

Androgènes - stéroïdes - testostérone et dérivés

© www.preparation-physique.net

IMPORTANCE ET FONCTION DE LA TESTOSTÉRONNE

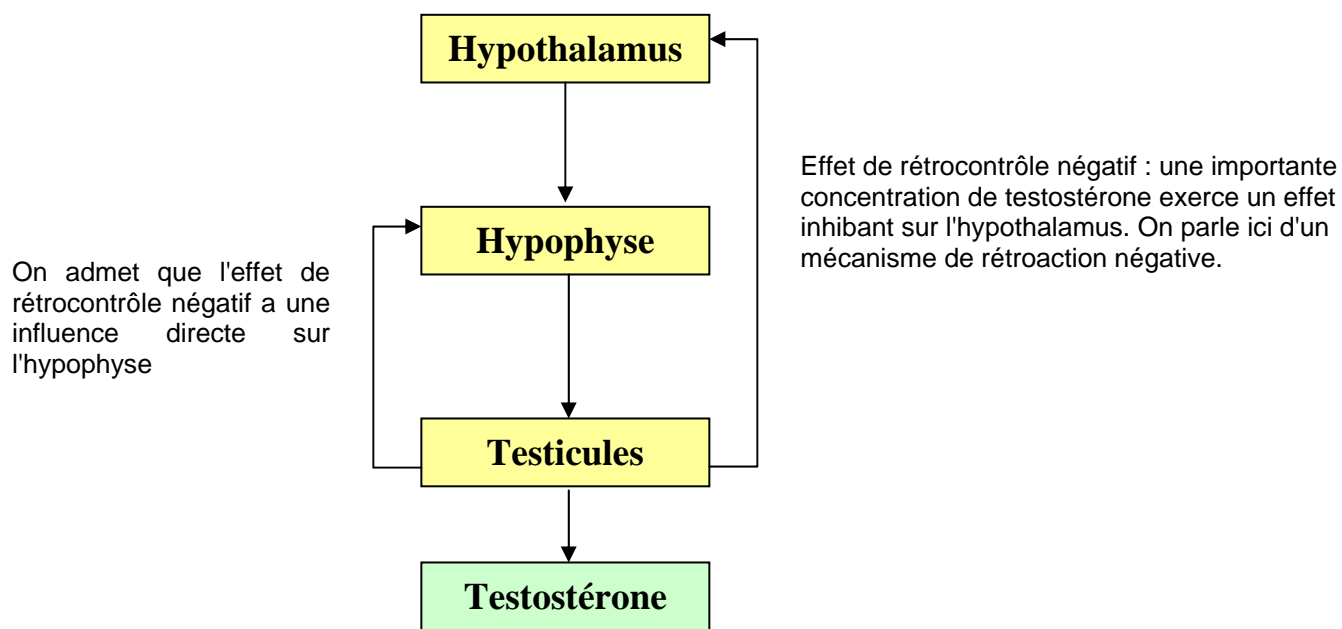
La testostérone étant à la base de la majorité des anabolisants stéroïdiens à composante androgénique, tout athlète devrait en effet disposer d'un minimum de connaissances à ce sujet. La plus grande partie des indications relatives à la testostérone apparaissant dans ce chapitre sont également applicables, en les adaptant aux anabolisants stéroïdiens à composante androgénique.

La testostérone est le plus important représentant de l'hormone sexuelle masculine, que l'on appelle également androgène. A la base de la formation de ce groupe d'hormones se trouve le cholestérol. La production des androgènes s'opère dans les glandes génitales de l'homme des testicules) grâce aux cellules de Leydig. Ce qui aboutit à la formation de la testostérone qui remplit trois fonctions dans l'organisme:

1 - Elle est d'une part responsable du caractère plus ou moins marqué des particularités masculines secondaires (système pileux plus important, apparition de la barbe, voix plus grave, production supérieure de glandes sébacées, développement du pénis, agressivité, comportement sexuel, libido, etc.) et de la maturation des spermatozoïdes. L'on considère également ces divers points comme faisant partie de la fonction androgénique de la testostérone. La différence entre hommes et femmes repose sur la quantité de testostérone que chacun des deux sexes produit chaque jour. Les hommes produisent quotidiennement entre 4 et 10 mg de testostérone, alors que les femmes n'en produisent qu'entre 0,15 et 0,4 mg.

2 - Elle favorise en outre la biosynthèse des protéines. Les propriétés fortement anabolisantes de la testostérone jouent ici un rôle de tout premier plan. Celles-ci entraînent un accroissement rapide de la musculature, une formation accrue des globules rouges, une régénération plus facile ainsi qu'un rétablissement moins long en cas de blessure ou de maladie. L'ensemble du métabolisme est stimulé et les graisses sont éliminées plus rapidement.

3 - Elle entraîne enfin un ralentissement du fonctionnement du cycle gonadique. Celui-ci comprend l'axe hypothalamus-hypophyse-testicules, lequel règle la quantité de testostérone produite dans l'organisme. Lorsque la concentration de testostérone dans le sang est importante, les testicules donnent l'ordre à l'hypothalamus de libérer une quantité plus faible d'hormones lutéinisantes (FSH). L'hypophyse distribue ainsi moins d'hormones gonadotropes et de FSH. En conséquence. Les cellules de Leydig, qui se trouvent dans les testicules, réduisent la production de testostérone.



Il est intéressant de noter que l'œstradiol, l'hormone sexuelle de la femme, exerce, elle aussi, une influence non négligeable sur le fonctionnement du cycle gonadique. De faibles quantités de cette hormone ont ainsi un effet inhibant sur l'hypothalamus, ce qui comme nous venons de le voir entraîne une baisse de la production de testo. Cette caractéristique se développe notamment lorsque les culturistes utilisent des stéroïdes se convertissant facilement oestrogènes. C'est en 1955 que, pour la première fois, une équipe de scientifiques a réussi à isoler de la testo provenant de testicules de taureaux et l'a cristallisée. Dans les années 40, on a produit en Europe de grandes quantités de testostérone injectable afin d'accélérer le processus de rétablissement chez les sujets souffrant de sous-alimentation, notamment les prisonniers de guerre. Il est probable qu'à la même époque les soldats allemands utilisaient, eux aussi, la testo afin d'augmenter leur agressivité. A la fin des années 40, les haltérophiles russes découvrirent que leurs performances augmentaient grâce à la testostérone exogène, ce que tendent à prouver les records qui, à cette époque, tombaient les uns après les autres.

QUELQUES GENERALITES SUR LES STEROIDES :

Les données actuelles font que chacun, ou presque, associe immédiatement le terme stéroïdes aux anabolisants stéroïdiens, plus connus sous le nom d'anabolisants. On oublie alors très souvent que ce que l'on appelle stéroïde, n'est en fait qu'un terme générique regroupant différents stéroïdes hormonaux représentés par les hormones corticosurrénales (glucocorticoïdes et minéralocorticoïdes), les hormones sexuelles de la femme (oestrogènes et progestérones) ainsi que les hormones sexuelles de l'homme (androgènes). C'est de ces dernières qu'il sera exclusivement question par la suite (le terme stéroïdes figurant sans autre description, se rapporte au groupe des anabolisants stéroïdiens à composante androgénique).

Les anabolisants stéroïdiens à composante androgénique sont des composés synthétiques présentant de nombreuses affinités avec la testostérone androgène naturelle de l'homme. On les définit donc comme des dérivés synthétiques de la testostérone. La raison principale qui a poussé les scientifiques à développer ces stéroïdes était de trouver une préparation possédant les mêmes effets anabolisants que la testostérone, sans toutefois avoir les aspects négatifs de ses composantes fortement androgéniques. « Nous avons énormément travaillé afin de développer un anabolisant pur, sans effets secondaires androgéniques, pour ce faire. Nous sommes intervenus directement sur la molécule stéroïdienne » (citation extraite de Doping - verbotene Arzneimittel im Sport, p. 51, Dirk Clasing, Manfred Donike, etc...).

Les nouveaux stéroïdes ainsi obtenus se caractérisaient soit par une perte d'efficacité accompagnée d'une baisse de l'action anabolisante et androgénique, soit par une augmentation de leur efficacité, après que les composants à la fois anabolisants et androgéniques ont été renforcés. Dans bien des cas, les nouvelles structures entraînent une androgénisation encore plus importante mais une réduction de l'activité anabolisante.

Cela explique les différences parfois très importantes que l'on constate dans l'action, les effets secondaires ainsi que l'efficacité des stéroïdes courants. Néanmoins, il n'a pas été possible d'établir un anabolisant pur, c'est-à-dire de séparer complètement les effets anabolisants des effets androgéniques. C'est pourquoi un stéroïde anabolisant entraîne également certains effets androgéniques tout comme un stéroïde androgénique possède certaines propriétés anabolisantes.

Ainsi, pour développer rapidement force et masse musculaires, il suffirait d'associer un stéroïde fortement anabolisant et une androgénisation minimale? Cela n'est pas tout à fait exact car le terme stéroïde anabolisant ne donne aucune information sur la puissance des effets anabolisants. Il indique uniquement que le rapport anabolisant/androgène du stéroïde de départ, la testo, a été déplacé. Afin de définir ce rapport et donc de classer tel ou tel stéroïde comme anabolisant ou comme androgène, on utilise la testo comme paramètre. Les stéroïdes possédant moins de propriétés androgéniques que cette dernière, sont définis comme anabolisants stéroïdiens. Ceux dont les propriétés androgéniques sont égales ou supérieures sont appelés stéroïdes androgènes. Mais où est donc le problème? Il est en fait très simple : la réduction des effets androgéniques s'accompagne d'une perte de l'activité anabolisante. Un anabolisant possède donc des propriétés nettement moins androgéniques que la testostérone, mais moins anabolisantes également, ce qui entraîne des effets moins importants.

Les stéroïdes développant la masse musculaire proviennent exclusivement du groupe des stéroïdes androgéniques et possèdent des propriétés à la fois androgéniques et anabolisantes, le meilleur androgène, c'est-à-dire la testostérone, est en même temps l'anabolisant le plus important chez l'homme. L'athlète se retrouve alors en plein dilemme, car les stéroïdes androgènes sont à la fois les plus efficaces et les plus dangereux. D'où la règle suivante : plus un stéroïde est efficace, plus il est androgénique et donc dangereux pour l'organisme.

Le reproche que l'on fait très souvent aux anabolisants stéroïdiens en les accusant de provoquer des dommages lourds de conséquences a été quelque peu amplifié. En revanche il est important de souligner que la plupart des effets secondaires sont surtout causés par des stéroïdes androgènes. Ainsi une généralisation du type « les stéroïdes sont mauvais pour le foie » ne veut pas dire grand chose étant donné les différences entre les stéroïdes existants.

C'est au début des années 50 que les premiers anabolisants stéroïdiens à composante androgénique font leur entrée officielle sur le marché. 10 ans plus tard, la plupart des préparations que l'on trouve aujourd'hui étaient déjà disponibles. La proportion des stéroïdes nouvellement développés était très faible, ces préparations peuvent être considérées comme des médicaments relativement anciens. Bien entendu, quelques innovations et modifications ont eu lieu tout au long de ces années : de nombreux stéroïdes furent, par exemple, retirés du marché, d'autres ont été réintroduits ailleurs sous un nom générique, quelques produits nouveaux se sont ajoutés à la liste dans les années 80, mais aucune découverte nouvelle ou révolutionnaire n'a véritablement marqué la recherche.

Pourtant, les stéroïdes sont considérés, aujourd'hui encore, comme le moyen le plus efficace d'améliorer les performances sportives. Les stéroïdes ont déjà fait leur entrée dans le monde du sport dans les années 50. L'introduction du **Dianabol**, un stéroïde oral découvert en 1956 par le médecin de l'équipe américaine d'haltérophiles, le docteur John Ziegler, en collaboration avec les laboratoires pharmaceutiques CIBA, devait jouer un rôle de premier plan dans les premiers liens se nouant entre les stéroïdes et le sport. Cette préparation et les produits qui en découlent eurent un franc succès à la fin des années cinquante, tout d'abord chez les haltérophiles puis, par la suite, dans de nombreux autres sports. L'utilisation des stéroïdes a augmenté dans les années soixante et soixante-dix en raison du développement du Bodybuilding. Les athlètes féminines en consommèrent elles aussi de plus en plus. En 1974, le CIO décida d'inscrire les anabolisants sur la liste des produits dopants, et c'est aux JO de Montréal, en 1976, que l'on assista aux premiers contrôles antidopage. On assiste actuellement à une diffusion considérable de ces médicaments. Comme le confirme d'ailleurs Melvin H. Williams « les anabolisants stéroïdiens forment un groupe de médicaments dont la consommation, dans les milieux sportifs, a pris des dimensions considérables. On suppose que plus d'un million d'Américains utilise des anabolisants stéroïdiens. Ce nombre comprend, entre autre, des sportifs et sportives de tous âges, du professionnel averti à l'écolier en pleine puberté. Les stéroïdes ne pouvant être obtenus que sur ordonnance on assiste à l'implantation d'un marché noir très florissant ».

La popularité grandissante du bodybuilding explique en partie l'augmentation croissante de la consommation des anabolisants stéroïdiens androgéniques. Il apparaît clairement que le bodybuilding est en étroite relation avec la propagation des stéroïdes. En effet, l'utilisation des stéroïdes a augmenté parallèlement à la popularité du bodybuilding. Lorsque, dans les années 70, le bodybuilding a commencé à être connu, on a également découvert l'usage des stéroïdes. Au cours des années 80, lorsque le bodybuilding est entré dans la catégorie des sports de masse, c'est le grand public qui a découvert les stéroïdes.

Tant qu'un corps musclé sera considéré comme une référence et qu'il n'existera pas d'alternative naturelle efficace remplaçant les anabolisants stéroïdiens à composante androgénique, les athlètes continueront à faire usage des produits pharmaceutiques.

Le succès récent du **Clenbuterol** montre bien que les athlètes n'utilisent que ce qui peut leur permettre d'atteindre leurs objectifs plus rapidement. Si les hormones de croissance disponibles à un prix raisonnable, elles seraient tout aussi largement diffusées que les stéroïdes.

Malgré tout, les stéroïdes ne sont pas un remède miracle, leur efficacité dépend également d'autres facteurs tels que l'entraînement, l'alimentation, le psychisme et les prédispositions génétiques de chacun. En effet de ceci dépend la manière dont l'organisme de l'athlète réagira à la prise d'anabolisants stéroïdiens et comment il les supportera.

MODE D'ACTION DES STEROIDES

La physiologie des anabolisants stéroïdiens à composante a androgénique étant particulièrement complexe, il est impossible de présenter ici une description précise de tous les processus biochimiques intervenant dans l'organisme lors de l'utilisation de ces préparations. Nous tenons toutefois à donner au lecteur un aperçu général et simplifié de ces processus, car il est essentiel de disposer d'un minimum de connaissances de bases avant de commencer un traitement aux stéroïdes. Etant donné que les sportifs s'intéressent exclusivement aux capacités stimulantes de ces préparations, nous nous limiterons, dans ce chapitre, à en étudier l'action sur les cellules musculaires.

Les stéroïdes sont administrés par voie orale ou intramusculaire. Lorsqu'il est injecté, le principe actif parvient directement dans le sang, alors que les comprimés sont véhiculés par le tube digestif jusqu'au foie, qui les élimine complètement ou partiellement, ou encore les transfère dans le sang. Le stéroïde utilisé se présente alors sous la forme d'innombrables molécules circulant dans tout l'organisme. Chaque molécule transporte un message, c'est-à-dire une information destinée à certaines cellules du corps bien précises. Les parois de ces cellules sont pourvues de multiples récepteurs, dont l'un, le récepteur de stéroïdes, est largement représenté dans les cellules musculaires. Ces récepteurs de stéroïdes s'adaptent parfaitement aux molécules stéroïdiennes. Les récepteurs et les molécules ont un important degré d'affinité, un peu comme une clef qui s'adapte à la bonne serrure. Le récepteur de stéroïdes capte donc la molécule qui lui convient, la molécule stéroïdienne, et laisse passer toutes les autres. Il en va de même pour tous les autres types de récepteurs qui attendent une molécule différente de celle du stéroïde. La molécule ne peut transmettre son message à la cellule musculaire qu'une fois associée au récepteur de stéroïdes. Il faut toutefois noter, à ce stade, qu'une grande partie des molécules stéroïdiennes se sont déjà associées, dans le sang, à des protéines de fixation (SHBG = globuline de fixation de l'hormone sexuelle). Nous dirons, pour simplifier que presque 98% des molécules stéroïdiennes présentes dans le sang s'associent à des protéines de fixation et que seuls 1 ou 2% de ces molécules restent à l'état libre. Dans ce dernier cas, on parle de molécules actives, car ce sont les seules pouvant s'associer aux récepteurs et former ainsi le complexe stéroïde-récepteur. Les molécules fixées sur la SHBG, quant à elles, sont des molécules passives, car elles ne présentent aucun intérêt pour les cellules musculaires. Pour être tout à fait exact, il faut rappeler que le processus de fixation de la SHBG est plus ou moins prononcé selon les stéroïdes. Les % cités plus haut peuvent donc être soumis à de légères variations.

Le complexe stéroïde-récepteur circule à présent dans le noyau de la cellule (nucleus). Il s'associe alors à l'acide nucléique présent dans l'ADN. Une transcription intervient sous la forme d'une empreinte effectuée à partir de l'ADN. L'ARNm obtenu quitte alors le noyau de la cellule et se combine à l'ARN présent dans le cytoplasme (partie liquide de la cellule). Cela engendre, par translation, une augmentation de la synthèse protéique. Associé à un entraînement de poids intensif, ce phénomène s'accompagne d'une hypertrophie transversale de la cellule musculaire (hypertrophie du muscle). Bien que l'augmentation de la synthèse protéique soit considérée comme l'action principale des stéroïdes sur les cellules musculaires, la molécule stéroïdienne transmet à celles-ci d'autres informations très importantes pour l'athlète. Les stéroïdes semblent également développer une action anti-catabolisante prononcée. Cela permet de réduire la proportion dans laquelle les protéines sont éliminées par l'intermédiaire des cellules musculaires. Les molécules stéroïdiennes occupent les récepteurs à la cortisone situés sur la membrane des cellules et les bloquent. La cortisone, une hormone fortement catabolique (dégradante) produite par l'organisme ne peut donc pas développer son action, et les cellules musculaires peuvent conserver toutes leurs protéines.

Les stéroïdes présentent également l'avantage d'augmenter la synthèse de créatine phosphate (PCr). La PCr a une importance capitale dans le processus de reconstitution de l'ATP. L'ATP est à la base de toutes les contractions musculaires, car il constitue le carburant dont ont besoin les muscles pour travailler. L'ATP est stocké dans les cellules musculaires et est, le cas échéant, convertie en ADP. Ce phénomène libère l'énergie nécessaire à la contraction d'un muscle. La PCr est essentiel à la reconversion de l'ADP en ATP. Plus la quantité de PCr disponible est importante, plus le processus de reconversion sera rapide, ce qui permettra aux muscles de disposer d'une plus grande quantité d'ATP. Dans la pratique cela signifie que les athlètes enregistreront une augmentation de leur force mais non de leur masse musculaire.

Ceux qui ont déjà utilisé le stéroïde **Oxandrolone** ont pu remarquer que cette préparation permettait surtout d'augmenter sa force. Cela est dû à l'importante action stimulante qu'exerce l'oxandrolone sur la de PCr dans les cellules musculaires. Un autre facteur positif pour l'athlète est le stockage, par les stéroïdes, d'une plus grande quantité d'hydrates de C sous la forme de glycogène. Ce processus s'accompagne d'une plus grande rétention de liquide, ce qui se traduit par une augmentation de volume d'endurance et de force. En outre, les stéroïdes réduisent la libération endogène d'insuline, car les cellules musculaires, de par l'utilisation de ces préparations sont à même d'enregistrer une plus grande quantité de substances nutritives (hydrates de carbone sous la forme de glucose et protéines sous forme d'acides aminés) sans dépendre de l'insuline. Cela diminue le taux de lipides de l'athlète et améliore sa fermeté musculaire. L'insuline, outre sa propriété d'être une hormone particulièrement anabolisante, permet en effet de convertir le glucose en glycérol puis en triglycéride, ce qui conduit à une croissance des adipocytes.

Ceux qui connaissent les stéroïdes savent que ces derniers améliorent nettement l'effet de congestion du muscle concerné. Ce phénomène s'explique par l'augmentation du volume sanguin et des globules rouges dans le sang. Le muscle se gonfle et sa vascularisation augmente. L'apport de sang permet, outre ses avantages un apport plus important des substances nutritives vers les cellules musculaires. Les stéroïdes fortement androgéniques notamment (dianabol, testostérone, et surtout anapolon) augmentent le volume de sang de façon significative et s'accompagnent d'un effet de congestion considérable, allant même jusqu'à être douloureux. L'augmentation de l'apport en oxygène est souvent très appréciée par les coureurs de fond. Lorsque le complexe stéroïde-récepteur a rempli sa tâche, la molécule stéroïdienne retourne dans le sang. Elle peut alors être réutilisée aux mêmes fins, ou convertie en une molécule moins puissante et moins efficace, pour être finalement évacuée par l'urine. Une fois l'apport exogène effectué. Les molécules stéroïdiennes contenues dans le sang ne se présentent pas toutes sous forme de molécules passives ou actives. Certaines d'entre elles sont directement métabolisées et éliminées par l'organisme: d'autres sont transformées en oestrogènes (hormone sexuelle de la femme). Ce dernier phénomène se caractérise par une modification des composants de la substance et paraît, à première vue, tout à fait incompréhensible.

Si l'on observe attentivement la structure de l'hormone sexuelle mâle la testostérone, et de l'hormone sexuelle femelle l'œstradiol, on remarque cependant une certaine similitude entre les deux. Grâce aux enzymes, l'organisme peut aisément modifier la structure de ces molécules. Quelques molécules stéroïdiennes se transforment tout comme une partie de la testostérone endogène et exogène, en dihydrotesto (DHT). La DHT est certes plus proche des récepteurs des cellules musculaires que la testostérone, ce qui fait croire à certains experts que la DHT est la plus efficace des deux hormones, mais elle présente également un important facteur de fixation aux récepteurs des glandes sébacées et des follicules pileux. Il est intéressant de noter ici que la DHT ne peut se convertir en oestrogènes. Mais après un certain temps toutes ces molécules sont finalement éliminées à travers l'urine.

ANDROGENES TESTOSTERONE et DERIVEES

ANDROTARDYL® testostérone

FORMES et PRÉSENTATIONS

Solution injectable IM (huileuse):
Ampoule (verre) de 1 mL, boîte unitaire.

COMPOSITION

Testostérone (DCI) énanthate : 250 mg
Excipient : huile de sésame.

INDICATIONS

Hypogonadisme masculin, par déficit documenté en testostérone, quelle qu'en soit l'étiologie.

POSOLOGIE et MODE D'ADMINISTRATION

Une ampoule par voie .IM par mois on moyenne.

Il est conseillé d'utiliser, pour lanjection, une seringue de verre. Cependant, compte tenu des études de compatibilités effectuées avec cette spécialité, il est possible d'utiliser une seringue en polypropylène. Dans ce cas, lanjection doit suivre immédiatement le remplissage de la seringue.

CONTRE-INDICATIONS

Cancer prostatique, adénome prostatique, cancer du sein chez l'homme, insuffisance cardiaque rénale ou hépatique sévère, sujet prépubère, états d'agressivité, hypersensibilité à l'un des constituants.

MISES EN GARDE et PRECAUTIONS D'EMPLOI

- Ce médicament n'est pas indiqué chez la femme car une androgénothérapie, même de courte durée est susceptible d'entraîner ou de favoriser une virilisation, on particulier pileire et vocale, définitive malgré l'arrêt du traitement.

Surveiller la prostate et les soins chez l'homme hypogonadique sous traitement androgénique.

- L'attention des sportifs sera attirée sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive des tests pratiqués lors dos. contrôles antidopages.

EFFETS INDÉSIRABLES

- Acné.
- Gynécomastie.
- Rétention hydrosodée.
- Possibilité d'hypercalcémie, surtout chez les sujets alités.
- Possibilité d'allergie.

PPHARMACODYNAMIE

Androgène (H: hormones sexuelles).

Chez les sujets hypogonadiques, la testostérone produit :

- un arrêt do croissance osseuse, par soudure des cartilages de conjugaison, généralement précédé d'une poussée de croissance,
- un développement des organes génitaux externes et internes,
- une poussée de la pilosité,
- une mue de la voix, l'apparition de la libido,
- un effet général d'anabolisme protidique,
- un développement de la musculature squelettique,
- une réduction de l'élimination urinaire d'azote, sodium, potassium, chlore, phosphore et eau.

NB: la testostérone n'entraîne pas le développement testiculaire : elle diminué la sécrétion hypophysaire de gonadotrophines.

PHARMACOCINETIQUE

La durée d'action on injection IM aux doses thérapeutiques est de l'ordre de 3 à 4 semaines.

PANTESTONE® testostérone

FORMES et PRÉSENTATIONS

Capsule (brun rougeâtre) : Tube (polypropylène) de 60.

COMPOSITION

Testostérone (DCI) undécanoate 40 mg

Excipients : acide oléique, parahydroxybenzoates d'éthyle et de propyle sodés, gélatine, glycérol, karion, dioxyde de titane, oxyde de fer rouge.

INDICATIONS

Thérapeutique du déficit en testostérone dans tous les cas d'hypogonadisme masculin démontré -biologiquement.

POSOLOGIE et MODE D'ADMINISTRATION

Les capsules sont avalées après les repas, la posologie sera répartie également entre le matin et le soir et en cas de nombre impair de capsules la dose la plus forte sera prise le matin.

La posologie est à adapter par le médecin, suivant la sévérité des symptômes et la réponse individuelle de chaque patient. En général, 3 ou 4 capsules par jour pendant 2 à 3 semaines, puis 1 à 3 capsules par jour, suivant le résultat obtenu en début de traitement.

CONTRE-INDICATIONS

Cancer du sein masculin, adénome prostatique, cancer prostatique, insuffisances cardiaque, rénale ou hépatique sévères, sujets prépubertaires, état d'agressivité

MISES EN GARDE et PRÉCAUTIONS D'EMPLOI

Mises en garde : cette spécialité doit être utilisée uniquement chez l'homme.

Précautions d'emploi : chez l'homme hypogonadique soumis aux androgènes, l'état prostatique et mammaire doit être surveillé.

L'attention des sportifs est attirée sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive des tests pratiqués lors des contrôles antidopage.

EFFETS INDÉSIRABLES

- Acné
- A fortes doses, diminution de la spermatogenèse (chez l'homme exempt de déficit androgénique).
- Gynécomastie.
- oedèmes.
- Virilisation chez la femme.
- Hypercalcémie possible, surtout chez les sujets âgés.

PHARMACODYNAMIE

- Chez les sujets atteints d'hypogonadisme : normalisation de la réponse de l'hypophyse à la stimulation LH-RH
- Activité protéoanabolisante (hypertrophie musculaire et croissance de la matrice osseuse).
- Activité androgénique (développement des caractères sexuels primaires et secondaires).
- Pantestone, administré par voie orale (dans l'huile d'olive), est rapidement absorbé avec des lipides au niveau de l'intestin par voie lymphatique avant de passer dans la circulation périphérique.
- La voie lymphatique évite l'activation par le foie.
- Pantestone est partiellement métabolisé dans l'intestin et hydrolysé en testostérone dans la circulation périphérique.
- Les dosages hormonaux ont objectivé un retour à la normale des taux de base de la testostérone, de la dihydrotestostérone, de l'androstènedione en 9 semaines.
- Les concentrations plasmatiques accrues des androgènes dans le plasma témoignent de cette bonne absorption.
- Le pic plasmatique se situe environ 4 à 5 heures après l'ingestion.

- Il n'y a ni accumulation, ni rétention.
- L'excrétion se fait soit dans l'urine, soit dans les fèces sous forme des métabolites bien connus de la testostérone.

PROVIRON®
mestérolone

FORMES et PRÉSENTATIONS

Comprimé (blanc): Boîte de 20.

COMPOSITION

Mestérolone (DCI) : 25 mg

Excipients : lactose, amidon de maïs, polyvidone 25, stéarate de magnésium.

INDICATIONS

Hypogonadisme masculin par déficit testiculaire primaire ou gonadotrope. Proposé dans oligospermie et hypofructospermie.

POSOLOGIE et MODE D'ADMINISTRATION

En moyenne 2 ou 3 comprimés par jour pendant une durée d'au moins 3 mois (durée d'un cycle de spermatogénèse).

CONTRE-INDICATIONS

Cancer prostatique, adénome prostatique, cancer du sein masculin, insuffisance cardiaque, rénal, ou hépatique sévère, sujets prépubertaires, états d'agressivité.

MISES EN GARDE et PRÉCAUTIONS D'EMPLOI

Mises en garde : cette spécialité doit être utilisée uniquement chez l'homme.

Précautions d'emploi : chez l'homme hypogonadique soumis aux androgènes, l'état prostatique et mammaire doit être surveillé.

L'attention des sportifs sera attirée sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive des tests pratiqués lors des contrôles antidopage.

EFFETS INDÉSIRABLES

Acné. A fortes doses, diminution de la spermatogénèse (chez l'homme exempt de déficit androgénique). Gynécomastie. Oedèmes. Une hypercalcémie est possible, surtout chez les sujets alités.

PHARMACODYNAMIE

Celles de l'hormone mâle: chez les sujets hypogonadiques, elle produit : un arrêt de croissance osseuse, par soudure des cartilages de conjugaison, généralement précédé d'une poussée de croissance, un développement des organes génitaux externes (verge, scrotum) et internes (prostate, vésicules séminales), une poussée de la pilosité,, une, mue de la voix, l'apparition de la libido, un effet général d'anabolisme protidique, un développement de la musculature squelettique, une réduction de l'élimination urinaire d'azote, sodium, potassium, chlore, phosphore et eau. La mestérolone est active par voie orale bien que dépourvue de fonction alkyle on position 17, sans dépression, aux doses thérapeutiques, de la fonction gonadotrope hypothalamo-hypophysaire.

PHARMACOCINÉTIQUE

La concentration maximale de la mestérolone dans le sang est atteinte à la 3e heure et diminue ensuite jusqu'à la 8e heure, La mestérolone est plus fortement liée que la testostérone à la globuline plasmatique porteuse. Elle ne peut, comme par exemple la testostérone, se convertir en estrogène. L'excrétion est principalement urinaire, sous forme de métabolites sulfo et glucuronocconjugués.

TESTOSTÉRONNE heptylate THÉRAMEX®

FORMES et PRÉSENTATIONS

Solution injectable IM (huileuse) à 50 mg, 100 mg, 250 mg: Ampoules (verre) de 1 mL.

COMPOSITION

Solution injectable à 50 mg :

Testostérone (DCI) heptylate 50 mg (correspondant à 36 mg de testostérone-base)

Solution injectable à 100 mg :

Testostérone (DCI) heptylate 100 mg (correspondant à 72 mg de testostérone-base)

Solution injectable à 250 mg :

Testostérone (DCI) heptylate 250 mg (correspondant à 180 mg de testostérone-base)

INDICATIONS

Hypogonadisme masculin, par déficit documenté en testostérone, quelle qu'en soit l'étiologie.

POSOLOGIE et MODE D'ADMINISTRATION

Voie intramusculaire.

100 à 250 mg par voie IM tous les 15 jours, puis 1 fois par mois.

La solution huileuse doit être injectée avec une seringue en verre. Toutefois, compte tenu des études de compatibilité effectuées pour cette spécialité, il est possible d'utiliser une seringue en polypropylène. Dans ce cas, l'injection doit suivre immédiatement le remplissage de la seringue.

CONTRE-INDICATIONS

Cancer prostatique.

Adénome prostatique.

Cancer du sein chez l'homme.

Insuffisance cardiaque, rénale ou hépatique sévères. Sujet prépubère.

Etat d'agressivité.

Hypersensibilité à l'un des constituants.

MISES EN GARDE et PRÉCAUTIONS D'EMPLOI

Ce médicament n'est pas indiqué chez la femme car une androgénothérapie même de courte durée est susceptible d'entraîner ou de favoriser une virilisation, en particulier pileuse définitive malgré l'arrêt du traitement.

L'attention des sportifs sera attirée sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive des tests pratiqués lors des contrôles antidopage.

Surveiller la prostate et les seins chez l'homme hypogonadique sous traitement androgénique.

EFFETS INDÉSIRABLES

Acné. Gynécomastie. Rétention hydrosodée. Possibilité d'hypercalcémie, surtout chez les sujets âgés. Possibilité d'allergie.

PHARMACODYNAMIE

Androgène (H: hormone sexuelle).

Chez les sujets hypogonadiques, la testostérone produit : un arrêt de la croissance osseuse par soudure des cartilages de conjugaison généralement précédé une poussée de croissance, un développement des organes génitaux externes et internes, une poussée de pilosité, une mue de la voix, l'apparition de la libido, effet général d'anabolisme protidique, un développement de la musculature squelettique, une réduction l'élimination urinaire d'azote, sodium, potassium, iode, phosphore et eau.

NB : la testostérone n'entraîne pas le développement testiculaire : elle diminue la sécrétion hypophysaire de gonadotrophines.

PHARMACOCINÉTIQUE

Durée d'action: de l'ordre de 20 jours.

ANDROGENES UTILISES COMME ANABOLISANTS

DYNABOLON® nandrolone undécanoate

FORMES et PRÉSENTATIONS

Solution injectable IM (huileuse) :
Ampoule de 1 mL boîte unitaire.
Modèle hospitalier: Boîte de 20.

COMPOSITION

Nandrolone (DCI) undécanoate exprimé en base 50 mg
Excipient: huile d'olive neutralisée

INDICATIONS

- Chez: le sujet âgé cachexie état de dénutrition.
- Suites d'interventions chirurgicales majeures. Brûlures. étendues, escarres Proposé dans le traitement de certaines ostéoporoses séniles ou iatrogènes

POSOLOGIE et MODE D'ADMINISTRATION

Solution huileuse devant être injectée avec une seringue en verre. Toutefois compte tenu des études de compatibilité effectuée pour cette spécialité, il est possible d'utiliser une seringue en polypropylène; dans ce cas, l'injection doit suivre immédiatement le remplissage de la seringue.

1 injection IM toutes les 1 ou 2 semaines; 3 à 6 injections au total

CONTRE-INDICATIONS

- Sujets prépubertaires ; femmes jeunes.
- Cancer de la prostate et adénome prostatique accompagné d'un syndrome obstructif. Insuffisance hépatique, hépatite chronique ou récente.
- Femme enceinte ou susceptible de l'être, ou qui allaite : cf Grossesse:et Allaitement.

MISES EN GARDE et PRÉCAUTIONS d'EMPLOI

Mises en garde : la prescription des anabolisants stéroïdes doit être mûrement pesée: ces substances conservent une activité de même type que la testostérone et peuvent, de ce fait, provoquer des effets androgéniques parfois irréversibles. Leur administration doit être occasionnelle, discontinuée et à posologie réduite.

Précautions d'emploi:

- En cas d'insuffisance cardiaque ou rénale, on raison du risque de rétention hydroélectrolytique. L'attention des sportifs est attirée sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive des tests pratiqués lors des contrôles antidopage.

INTERACTIONS MÉDICAMENTEUSES

Les anabolisants stéroïdes peuvent potentialiser l'action des hypoglycémiantes, insuline et sulfamides antidiabétiques, notamment.

GROSSESSE et ALLAITEMENT

Grossesse: contre-indiqué chez la femme enceinte ou susceptible de l'être, on raison des risques virilisants sur la femme et le fœtus. Allaitement : contre-indiqué.

EFFETS INDÉSIRABLES

Sont considérés comme susceptibles de survenir, à la suite d'un traitement par n'importe quel stéroïde anabolisant:

- effets androgéniques généralement réversibles à l'arrêt du traitement : acné, séborrhée, augmentation de la libido.
- effets androgéniques irréversibles : masculinisation avec hirsutisme, modification du timbre de la voix, chute des cheveux.
- effets antiestrogéniques : irrégularités menstruelles, dysovulation, aménorrhée;

- effets métaboliques: modification des tests de tolérance aux glucides et possibilité d'augmentation des lipides chez les sujets présentant une hyperlipidémie préexistante.

PHARMACODYNAMIE

Anabolisant stéroïde : activité anabolisante à composante androgénique.

Chez le rat, Dynabolon est anticatabolique, il augmente l'endurance à l'effort et retarde l'épuisement des réserves musculaires de glycogène.

PHARMACOCINETIQUE

Dynabolon est un ester. retard de la nandrolone, actif exclusivement par voie injectable

Dans l'organisme, le produit est lentement hydrolysé. La concentration sanguine maximum est atteinte on 24 h et on peut en suivre l'élimination au-delà de 21 jours. Suit la voie du métabolisme hépatique de la nandrolone sans risque particulier de toxicité hépatique, du fait de la non-substitution on 17.

PARABOLAN® trenbolone

FORMES et PRÉSENTATIONS

Solution injectable : Ampoule autocassable de 1,5 mL.

COMPOSITION

Trenbolone (DCI) hexahydrobenzylcarbonate 76 mg (soit 50 mg de trenbolone base par ampoule).

Excipients : alcool benzylique (75 mg/amp>, alcool éthylique 100° pharmaceutique (45 mg/amp), huile d'arachide neutralisée,.

INDICATIONS

Chez le sujet âgé: cachexie, états de dénutrition.

Suites d'interventions chirurgicales majeures.

Brûlures étendues, escarres.

Proposé dans le traitement de certaines ostéoporoses séniles ou iatrogènes.

POSOLOGIE et MODE D'ADMINISTRATION

ampoule en injection IM profonde :

tous les 15 jours pendant le 1^{er} mois (3 inj)

tous les mois pendant les 3 mois suivants (3 inj)

CONTRE-INDICATIONS

Sujets prépubertaires, femmes jeunes

Cancers de la prostate et adénome prostatique.

suffisance hépatique, hépatite chronique ou récente.

femme enceinte ou susceptible de l'être, ou qui allaite: cf Grossesse et Allaitement.

MISES EN GARDE et PRÉCAUTIONS D'EMPLOI

s'es en garde : la prescription des anabolisants stéroïdiens doit être mûrement pensée : ces substances conservent une activité de même type que la testostérone et peuvent donc provoquer des effets androgéniques parfois irréversibles. Leur administration doit être discontinuée, à posologie réduite.

L'attention des sportifs est attiré sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive au contrôles antidopage.

Précautions d'emploi:

En raison du risque de rétention hydroélectrolytique

- Insuffisance cardiaque.

- Insuffisance rénale.

INTERACTIONS

Possibilité de potentialisation des hypoglycémiant.

GROSSESSE et ALLAITEMENT

Grossesse : contre-indiqué chez la femme ou susceptible de le devenir en raison des risques virilisants sur la femme et le fœtus.

Allaitement : contre-indiqué

EFFETS INDÉSIRABLE

Susceptibles de survenir comme avec tous les produits de ce type:

- effets androgéniques généralement réversibles à l'arrêt du traitement : acné, séborrhée, augmentation de la libido.
- effets androgéniques irréversibles : masculinisation avec hirsutisme, modification du timbre de la voix, chute des cheveux.
- effets antiestrogéniques : irrégularités menstruelles, dysovulation, aménorrhée;
- effets métaboliques: modification des tests de tolérance aux glucides et possibilité d'augmentation des lipides chez les sujets présentant une hyperlipidémie préexistante.

PHARMACODYNAMIQUE

Activité anabolisante avec une composante androgénique

Positive le bilan azoté, stimule la fonction des ostéoblastes ; stimule la fixation des phosphates de calcium de l'os; stimule l'hématopoïèse, stimule le développement des masses musculaires.

PHARMACOCINÉTIQUE

Métabolisé au niveau du foie

TROPHOBOLÉNE®

estrarponicate, nandrolone undécanoate, hydroxyprogestérone heptanoate

FORMES et PRÉSENTATIONS

Solution injectable IM (huileuse):

Ampoule de 1 mL, boîte unitaire.

Modèle hospitalier : boîte de 20.

COMPOSITION

Estrarponicate (DCI) (ester propionique et nicotinique de l'estradiol 1,3 mg

Nandrolone (DCI) undécanoate exprimé en base 50 mg

Hydroxyprogestérone (DCI) heptanoate 80 mg

Excipients: mélange de benzoate de benzyle d45 mB + huile d'olive neutralisée (55 mB qsp 1 mL).

INDICATIONS

- Chez le sujet âgé: cachexie et état de dénutrition.
- Suites d'interventions chirurgicales majeures.
- Brûlures étendues, escarres.
- Proposé dans le traitement de certaines ostéoporoses séniles ou iatrogènes.

POSOLOGIE et MODE D'ADMINISTRATION

Adulte : 1 ampoule par voie IM tous les 15 ou 30 jours; en cure de 3 à 6 ampoules.

Solution huileuse devant être injectée (voie IM) avec une seringue en verre. Toutefois, compte tenu des études de compatibilité effectuées pour cette spécialité, il est possible d'utiliser une seringue en polypropylène; dans ce cas, la injection doit. suivre immédiatement le remplissage de la seringue..

CONTRE-INDICATIONS

- Sujets prépubertaires, femmes jeunes..
- Cancer de la prostate et adénome prostatique.
- Insuffisance hépatique, hépatite chronique ou récente.
- Maladies thrombo-emboliques.
- Tumeurs estrogénodépendantes du sein et de l'utérus.
- Femme enceinte ou susceptible de l'être, ou qui allaite : cf Grossesse et Allaitement.

MISES EN GARDE et PRÉCAUTIONS D'EMPLOI

Mises en garde:

La prescription des anabolisants stéroïdiens doit être mûrement pesée: ces substances conservent une activité de même type que la testostérone et peuvent donc provoquer des effets androgéniques parfois irréversibles. Leur administration doit être discontinuée; à posologie réduite.

En dépit de la faible dose d'estradiol administrée, il convient de considérer les contre-indications habituelles de l'estrogénothérapie.

Précautions d'emploi:

- En cas d'insuffisance cardiaque ou rénale, en raison du risque de rétention hydroélectrolytique.
- L'attention des sportifs est attirée sur le fait que cette spécialité contient un principe actif pouvant induire une réaction positive des tests pratiqués lors des contrôles antidopage.

INTERACTIONS MÉDICAMENTEUSES

Possibilité de potentialisation de l'action des hypoglycémifiants.

GROSSESSE et ALLAITEMENT

Grossesse: contre-indiqué chez la femme enceinte ou susceptible de l'être, en raison des risques virilisants sur la femme et le fœtus.

Allaitement: contre-indiqué.

EFFETS INDÉSIRABLES

Effets androgéniques : généralement réversibles à l'arrêt du traitement: acné, séborrhée, augmentation de la libido.

Effets androgéniques irréversibles : masculinisation avec hirsutisme, modification du timbre de la voix, chute des cheveux.

Effets antiestrogéniques : irrégularité menstruelle, dysovulation, aménorrhée.

Effets métaboliques : diminution de la tolérance aux glucides, possibilité d'augmentation des lipides chez les sujets présentant une hyperlipidémie préexistante. Possibilité de gynécomastie chez l'homme, liée à la présence d'un estrogène.

PHARMACODYNAMIE

- Anabolisant stéroïdien, caractérisé par l'activité anabolisante avec une composante androgénique, associé à un estrogène et un progestatif.
- Activité anabolisante accrue, en raison de l'association à d'autres stéroïdes.

PHARMACOCINÉTIQUE

L'élimination de la nandrolone se poursuit au-delà de la troisième semaine après administration, la concentration sanguine maximum étant atteinte précocement (2 heures). Les composants suivent les voies métaboliques normales de la nandrolone, de l'estradiol et de l'hydroxyprogestérone.