

IBUTAMOREN



Mesilato de ibutamoreno

. Fator de liberação do hormônio do crescimento (GH)

DCB: -

DCI: 07682

CAS: 159752-10-0

Sugestão dosagem: 25 mg/dia. Uso oral.

É ativo de **dopping**.

Ibutamoren é um peptídeo mimético do hormônio liberador de GH e também aumenta os níveis de IGF-1 (fator de crescimento semelhante à insulina 1) (**KARAKELIDES; NAIR, 2005**).

Mecanismo de ação: funciona aumentando a liberação de vários hormônios, incluindo o hormônio do crescimento (GH) e IGF-1, sem afetar os níveis de cortisol. Além disso, auxilia no excesso de peso alterando o metabolismo da gordura corporal.

É um secretagogo consumido por via oral que tem como finalidade estimular a glândula pituitária a produzir hormônios de crescimento. Um secretagogo é uma substância estimuladora de hormônios e **não** possui a função de um modulador seletivo de receptores androgênicos.

É um peptídeo de ingestão oral, não é capaz de fazer supressão hormonal e nem afeta negativamente o nível de testosterona.

Atualmente, os atletas começaram a utilizar este ativo como um intensificador de desempenho para melhorar a resistência, perda de gordura e aumento da massa muscular.

A secreção do hormônio de crescimento (GH) é modulada pelo hormônio liberador de hormônio de crescimento (GHRH) e pela somatostatina. Na última década foi descoberto um terceiro mecanismo de controle, envolvendo os secretagogos de GH (GHS). A ghrelina, o ligante endógeno do receptor dos GHS, é um peptídeo acilado produzido no estômago, que também é sintetizado no hipotálamo. Este peptídeo é capaz de liberar GH, além de aumentar a ingesta alimentar. A ghrelina endógena parece amplificar o padrão básico de secreção de GH, ampliando a resposta do somatotrofo ao GHRH, estimulando múltiplas vias intracelulares interdependentes.

É a melhor forma de estimular a produção de HGH sem necessidade de injeções.

1) Auxilia na construção muscular

Uso como substância anabólica, para aumentar a massa magra do corpo. É um ativo de uso oral e pode ser administrado uma vez por dia. **J Clin Endocrinol Metab. 1996 Sep;81(9):3239-43. Growth hormone increases muscle mass and strength but does not rejuvenate myofibrillar protein synthesis in healthy subjects over 60 years old.**

2) Reduz o desperdício muscular

Em voluntários saudáveis saudáveis, ibutamoren inverteu a perda de proteína induzida pela dieta, que poderia causar perda muscular. J Clin Endocrinol Metab. 1998 Feb;83(2):320-5. MK-677, an orally active growth hormone secretagogue, reverses diet-induced catabolism. Murphy MG¹, Plunkett LM, Gertz BJ, He W, Wittreich J, Polvino WM, Clemmons DR.

3) Estudo favorável em pacientes com fratura de quadril

Em pacientes idosos com fratura de quadril, ibutamoren melhorou a velocidade de marcha, força muscular e reduziu o número de quedas.

4) Melhora o sono

Estudo mostrou que em ambos os indivíduos jovens e idosos, ibutamoren melhorou a qualidade do sono REM e duração do sono. Neuroendocrinology. 1997 Oct;66(4):278-86. Prolonged oral treatment with MK-677, a novel growth hormone secretagogue, improves sleep quality in man. Copinschi G¹, Leproult R, Van Onderbergen A, Caufriez A, Cole KY, Schilling LM, Mendel CM, De Lepeleire J, Bolognese JA, Van Cauter E.

5) Combate o envelhecimento e auxiliar na longevidade

- Effects of an Oral Ghrelin Mimetic on Body Composition and

Clinical Outcomes in Healthy Older Adults: A Randomized, Controlled Trial Ralf Nass, M.D.,¹ Suzan S. Pezzoli, B.A.,¹ Mary Clancy Oliveri, M.S.,¹ James T. Patrie, M.S.,² Frank E. Harrell, Jr., Ph.D.,^{1,3} Jody L. Clasey, Ph.D.,⁴ Steven B. Heymsfield, M.D.,⁵ Mark A. Bach, M.D.,⁵ Mary Lee Vance, M.D.,¹ and Michael O. Thorne, M.B., B.S., D.Sc.¹

6) Efeito nootrópico – devido ação sobre ghrelina

-J Clin Endocrinol Metab. 1999 Feb;84(2):471-5. Insulin-like growth

factor-I and cognitive function in healthy older men. Aleman A¹, Verhaar HJ, De Haan EH, De Vries WR, Samson MM, Drent ML, Van der Veen EA, Koppeschaar HP.

7) Benéfico no tratamento da deficiência de hormônio do crescimento

Ibutamoren aumenta os níveis de GH, IGF-1 e IGFBP-3 em crianças com deficiência de hormônio de crescimento. Além disso, estes efeitos são conseguidos sem alterar as concentrações de prolactina, glicose, triiodotironina (T3), tiroxina (T4), cortisol e insulina. Clin Pharmacol Ther. 2001 Jul;70(1):91-8. Effects of oral administration of ibutamoren mesylate, a nonpeptide growth hormone secretagogue, on the growth hormone-insulin-like growth factor I axis in growth hormone-deficient children. Codner E¹, Cassorla F, Tiulpakov AN, Mericq MV, Avila A, Pescovitz OH, Svensson J, Cerchio K, Krupa D, Gertz BJ, Murphy G.

Auxílio na cicatrização de feridas e regeneração de tecidos - hormônio do crescimento aumenta a regeneração de tecidos e a cicatrização de feridas. Ann Surg. 1994 Jul; 220(1): 19–24. Recombinant human growth hormone accelerates wound healing in children with large cutaneous burns. D A Gilpin, R E Barrow, R L Rutan, L Broemeling, and D N Herndon

8) Aumenta os níveis de GH e IGF-1.

Tanto o hormônio de crescimento como o IGF-1, por sua vez, aumentam a massa muscular, a força muscular e reduzem a gordura corporal. Effects of an Oral Ghrelin Mimetic on Body Composition and Clinical Outcomes in Healthy Older Adults: A Randomized, Controlled Trial Ralf Nass, M.D.,¹ Suzan S. Pezzoli, B.A.,¹ Mary Clancy Oliveri, M.S.,¹ James T. Patrie, M.S.,² Frank E. Harrell, Jr., Ph.D.,^{1,3} Jody L. Clasey, Ph.D.,⁴ Steven B. Heymsfield, M.D.,⁵ Mark A. Bach, M.D.,⁵ Mary Lee Vance, M.D.,¹ and Michael O. Thorne, M.B., B.S., D.Sc.¹

9) Aumento densidade óssea

Em mulheres pós-menopausa, ibutamoren aumentou a densidade mineral óssea, o que ajuda a aumentar a resistência óssea e prevenir a osteoporose. J Bone Miner Res. 1999 Jul;14(7):1182-8. Oral administration of the growth hormone secretagogue MK-677 increases markers of bone turnover in healthy and functionally impaired elderly adults. The MK-677 Study Group. Murphy MG¹, Bach MA, Plotkin D, Bolognese J, Ng J, Krupa D, Cerchio K, Gertz BJ.

Em homens obesos saudáveis, um tratamento de 2 meses com ibutamoren aumentou a massa magra e aumentou transitoriamente a taxa metabólica basal. J Clin Endocrinol Metab. 1998 Feb;83(2):362-9. Two-month treatment of obese subjects with the oral growth hormone (GH) secretagogue MK-677 increases GH secretion, fat-free mass, and energy expenditure. Svensson J¹, Lönn L, Jansson JO, Murphy G, Wyss D, Krupa D, Cerchio K, Polvino W, Gertz B, Boseaus J, Sjöström L, Bengtsson BA.

Ibutamoren aumenta os níveis de hormônio do crescimento, imitando a ação do hormônio grelina e a ligação a um dos de seus receptores (GHSR). Ativado GHSR estimula a liberação do hormônio do crescimento .

GHSR é encontrado em regiões cerebrais que controlam o apetite, prazer, humor, ritmos biológicos, memória e cognição.

Ibutamoren aumenta os níveis do hormônio do crescimento com pouco ou nenhum aumento em outros hormônios, como o cortisol. O cortisol suprime o sistema imunológico, reduz a cicatrização de feridas e prejudica o aprendizado e a memória.

Efeitos colaterais

Os efeitos secundários mais frequentes de ibutamoren são aumento no apetite, edema suave leve na extremidade inferior e dor muscular.

Estudos relatam um aumento na glicemia em jejum e uma diminuição da sensibilidade à insulina.

Estes efeitos secundários são semelhantes aos observados em pessoas com níveis elevados de hormônio do crescimento, principalmente dor nas articulações e resistência à insulina.

Hipertensos, diabéticos, pessoas com insuficiência cardíaca congestiva, pacientes com câncer e pessoas com doenças autoimune não devem fazer uso de ibutamoren.

Referência: <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC2757071/>

Referências:

. Proc Natl Acad Sci U S A. 2004 Mar 30; 101(13): 4679–4684. Ghrelin stimulation of growth hormone release and appetite is mediated through the growth hormone secretagogue receptor

. Bowers CY, Momany FA, Reynolds GA, Hong A. On the in vitro and in vivo activity of a new synthetic hexapeptide that acts on the pituitary to specifically release growth hormone. Endocrinology. 1984;114:1537-45.

. Smith RG, Van der Ploeg LHT, Howard AD, Feighner SD, Cheng K, Hickey GJ, et al. Peptidomimetic regulation of growth hormone secretion. Endocr Rev. 1997;18:621-45.

- . Korbonits M, Grossman A. Growth hormone-releasing peptide and its analogues -novel stimuli to growth hormone release. *Trends Endocrinol Metab.* 1995;6:43-9.
- . Howard AD, Feighner SD, Cully DF, Arena JP, Liberators PA, Rosenblum CI, et al. A receptor in pituitary and hypothalamus that functions in growth hormone release. *Science.* 1996;273:947-77.
- . Kojima M, Hosoda H, Date Y, Nakazato M, Matsuo H, Kangawa K. Ghrelin is a growth-hormone-releasing acylated peptide from stomach. *Nature.* 1999; 402:656-60.
- . Arvat E, DiVito L, Broglio F, Papotti M, Muccioli G, Dieguez C, et al. Preliminary evidence that ghrelin, the natural GH secretagogue (GHS)-receptor ligand, strongly stimulates GH secretion in humans. *J Endocrinol Invest.* 2000;23:493-5.
- . Van der Lely AJ, Tschop M, Heiman ML, Ghigo E. Biological, physiological, pathophysiological, and pharmacological aspects of ghrelin. *Endocr Rev.* 2004;25:426-57.
- . Sun Y, Wang P, Zheng H, Smith RG. Ghrelin stimulation of growth hormone release and appetite is mediated through the growth hormone secretagogue receptor. *Proc Natl Acad Sci U S A.* 2004;101:4679-84.
- . Gnanapavan S, Kola B, Bustin SA, Morris DG, McGee P, Fairclough P, et al. The tissue distribution of the mRNA of ghrelin and subtypes of its receptor, GHS-R, in humans. *J Clin Endocrinol Metab.* 2002;87:2988-91.
- . Cummings DE, Weigle DS, Frayo RS, Breen PA, Ma MK, Dellinger EP, Purnell JQ. Plasma ghrelin levels after diet-induced weight loss or gastric bypass surgery. *N Engl J Med.* 2002;346:1623-30.
- . Popovic V, Miljic D, Micic D, Damjanovic S, Arvat E, Ghigo E, et al. Ghrelin main action on the regulation of growth hormone release is exerted at hypothalamic level. *J Clin Endocrinol Metab.* 2003;88:3450-3.
- . Tannenbaum GS, Bowers CY. Interactions of growth hormone secretagogues and growth hormone-releasing hormone/somatostatin. *Endocrine.* 2001;14:21-7.
- . Pandya N, Mott-Friberg R, Bowers CY, Barkan AL, Jaffe CA. Growth hormone (GH)-releasing peptide-6 requires endogenous hypothalamic GH-releasing hormone for maximal GH stimulation. *J Clin Endocrinol Metab.* 1998;83:1186-9.