

S1. Anaboliká

Definícia

Skupina anabolických látok sa rozdeľuje do dvoch základných skupín:

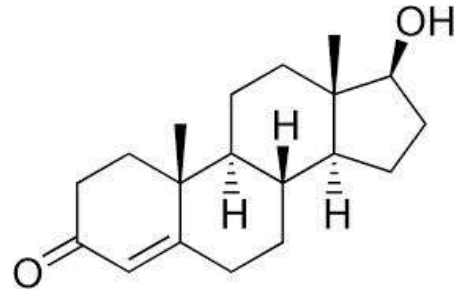
1. exogénne a endogénne anabolické androgénne steroidy (AAS)

Táto skupina zahŕňa steroidné hormóny ako mužský pohlavný hormón **testosterón** a látky s podobnými účinkami ako testosterón. Tieto látky môžu byť vyrábané synteticky a aplikované do organizmu z vonka (exogénne) alebo produkované prirodzene organizmom (endogénne).

2. iné anabolické látky, ako napríklad beta-2 agonisti **klenbuterol** a **zilpaterol**, ktoré majú anabolický efekt na muskulatúru, alebo **SARMs** (selektívne modulátory androgénnych receptorov), ktorých účinky sú podobné anabolickým androgénnym steroidom.



V roku 1988 bol Ben Johnson pozitívne testovaný na syntetický anabolický steroid stanozolol. (Image: GettyImages/Tony Duffy)



Molekula testosterónu.

Úvod

V roku 1988 na Olympijských hrách v Soule bol pozitívne testovaný atlét Ben Johnson na anabolický androgénny steroid **stanozolol** po tom, ako zabehol 100 m vo finále v rekordnom čase. Tento prípad bol celosvetovo medializovaný. Aj keď sa považuje za prelomový krok v boji proti dopingu, je len jedným z mnoha príkladov zneužitia anabolík medzi profesionálnymi športovcami. Anaboliká sa používajú na podporu svalového rastu, zlepšenie sily a výkonnosti, ako aj na zrýchlenie regeneračnej schopnosti po športovom výkone. K ich zneužitiu dochádza najmä v silových športoch. Mimosúťažné dopingové kontroly sú kľúčové v snahe odhaliť zneužívanie anabolík, pretože anabolické steroidy nie sú podávané pravidelne, ale len počas určitých tréningových fáz.

Anaboliká spôsobujú prevrat v športových výsledkoch

Anabolické steroidy sa začali používať v 50-tych rokoch. Následkom bolo enormné zlepšenie športových výkonov, predovšetkým v silových športoch. Napríklad, v priebehu desiatich rokov (1950-1960) bol mužský svetový rekord vo vrhu guľou zlepšený o 2,24 m na hodnotu 20,06 m. V nasledujúcich 30 rokoch bol rekord ešte vylepšený o ďalšie 3 metre, pričom takéto hodnoty sú pre súčasných aktívnych atlétov nedosiahnuteľné. Anabolické látky boli zaradené do Zoznamu zakázaných látok v roku 1974. Anabolické steroidy sa vyskytujú bežne v ľudskom organizme (testosterón) alebo sú vyrábané synteticky (stanozolol). V súčasnosti sú dostupné spoľahlivé analytické metódy na detekciu týchto látok. Samotná detekcia však nie je úplne bezproblémová, pretože sa vyvíjajú stále nové a nové syntetické steroidy, ako aj prepracované postupy ich užívania, na čo musí Svetová antidopingová organizácia flexibilne reagovať.

Anaboliká patria celosvetovo medzi najčastejšie detegované látky

Pozitívny dopingový prípad Bena Johnsona v roku 1988 nebol ani zďaleka jediný. Anabolické androgénne steroidy sú najviac sa vyskytujúce zakázané látky, ktoré sa detegujú vo väčšine dopingových analýz. 29. júl 2006: pozitívny test amerického šprintéra Justina Gatlina, svetového šampióna za rok 2005 v behu na 100 m a 200 m, vyvolal veľký rozruch, keďže v behu na 100 m vyrovnal svetový rekord v čase 9,77 sekúnd (12.5.2006).

6. august 2012: na Letných olympijských hrách v Londýne vyhrala Bieloruska Nadzeya Ostapchuk zlatú medailu vo vrhu guľou dosiahnutím hranice 21,36 metrov. O niekoľko dní neskôr jej bola zlatá medaila odobratá, pretože bola pozitívne testovaná na steroid metenolón.



V roku 2006 bol americký šprintér Justin Gatlin pozitívne testovaný na testosterón. (Image: Keystone, Frank Franklin II)

Účinok anabolických látok

Podávanie anabolík zvyšuje proteosyntézu, čím sa indukuje pozitívna dusíková bilancia v organizme (anabolický efekt). Anaboliká skracujú čas potrebný na regeneráciu a zároveň redukovujú podiel telesného tuku. Na druhej strane ovplyvňujú mužské pohlavné znaky (androgénny efekt). Napriek tomu, že je veľká snaha vyrábať syntetické steroidné látky, ktoré by mali výhradne anabolický efekt, takéto látky sa zatiaľ nepodarilo úspešne pripraviť.



Anaboliká ovplyvňujú organizmus na viacerých úrovniach.

Semenníky u mužov produkujú telu vlastný testosterón a v oveľa menšej miere je produkovaný aj vaječníkmi u žien.

Testosterón je uvoľnený do krvného obehu, transportovaný do celého tela, pričom sa viaže na androgénne receptory. Tieto receptory sú exprimované vo väčšine tkanív. Anaboliká, ktoré sa dostanú do tela z vonku, sa takisto viažu na tieto receptory.

Týmto mechanizmom má podanie anabolík za následok pozitívnu dusíkovú bilanciu s účinkom na rast svalov, skrátenie zotavovacieho času po športovom výkone, zvýšenie lipidového metabolizmu. Suma týchto účinkov vedie k zvýšeniu športového výkonu.

↑ Dusíková bilancia
↓ Zotavovací čas
↓ Percento telesného tuku

Odborné informácie

Biosyntéza steroidov

1. **Cholesterol** - základ biosyntézy steroidov
2. Postupným štiepením časti vedľajšieho reťazca molekuly cholesterolu dochádza k vzniku prekursorového hormónu **pregnenolónu**, od ktorého sú odvodené
 - mineralokortikoidy
 - glukokortikoidy
 - pohlavné hormóny (limitujúci krok)
3. konverzia na **17-hydroxypregnenolón** a **progesterón**
4. vzniká **17-hydroxyprogesterón** a ďalšie deriváty. V nadobličkách prebieha konverzia na **dehydroepiandrosterón** (DHEA) a **androsténdión**. Ďalšími produktami sú
 - **androsténdiol**
 - **testosterón**
 - **dihydrotestosterón**
 - **estrogény** (estrón, estradiol a estriol)

Spôsobu užitia

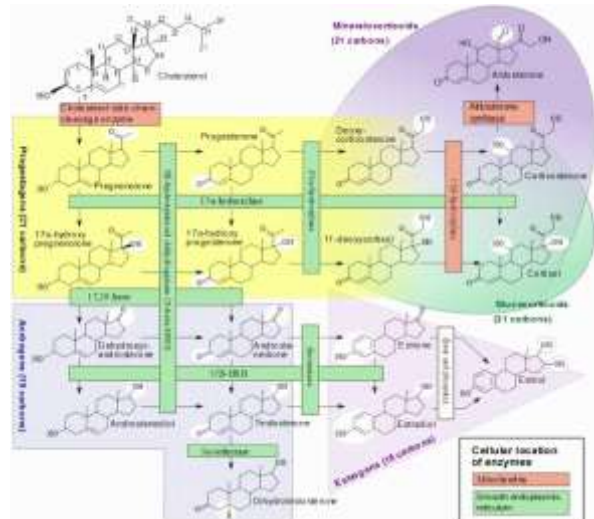
Na to, aby sa mohol testosterón využiť na liečbu rôznych hormonálnych deficiencií sa vývoj zamerával hlavne na

1. chemickú modifikáciu molekuly ako takej,
2. esterifikáciu na uhlíku C-17,
3. a rôzne spôsoby podania.

V princípe majú všetky tieto snahy rovnaký cieľ - umožniť aplikáciu prírodného hormónu ako takého v dobre kontrolovateľnej forme.

Testosterón môže byť podaný

- vo forme tabliet (orálne),
- injekčne,
- implantačne do kože (transdermálne),
- ako aj cez nosnú sliznicu,
- sliznicu oka,
- rektálne.



Biosyntéza steroidov. Väčšina enzýmov podieľajúcich sa na biosyntéze steroidov patrí do enzýmového systému cytochrómu P450. (Wikipédia)



Testosterón môže byť podaný rôznymi spôsobmi.

Odborné informácie

Selektívne modulátory androgénnych receptorov (SARMs)

Selektívne modulátory androgénnych receptorov (SARMs) majú podobný účinok ako anabolické androgénne steroidy. Ich zneužitie ako dopingových látok je zakázané.

Najlepšie preskúmanými SARMs sú **ostarín** (enobosarm) a **andrarín** (S-4). Tieto látky sa podávajú orálne. Boli vyvinuté na liečbu svalovej dystrofie, osteoporózy a benígnej prostatickej hyperplázie (nenádorové zväčšenie prostaty). Doposiaľ nebola žiadna z týchto možností oficiálne uznaná ako spôsob liečby spomínaných porúch. Napriek tomu sa prípravky s obsahom týchto látok nelegálne vyrábajú v Číne a sú ďalej distribuované do Európy a Ameriky.

Afinita týchto modulátorov k androgénnym receptorom je 10-krát vyššia ako v prípade testosterónu. Receptory sa po naviazaní SARMsablokujú a testosterón sa na ne nemôže viazať. SARMs molekuly nemajú typickú steroidnú štruktúru. Dominantne pôsobia na anabolické tkanivá ako sú svaly, pričom ovplyvňujú androgénne tkanivá (prostata) v oveľa menšej miere.

Svetová antidopingová organizácia (WADA) zaradila SARMs do Zoznamu zakázaných látok 1. januára 2008 s možnosťou ich detekcie v analytickej vzorke športovca. Medzi dopingové prípady, v ktorých boli športovci pozitívne testovaní na tieto látky patrí cyklista Nikita Novikov, jamajský skokan do výšky Damar Robinson a americký wrestler Obenson Blanc.

- Novikov (narodený v roku 1989) bol pozitívne testovaný na látku **ostarín** počas mimosúťažnej dopingovej kontroly v máji 2013 a bol mu udelený dvojročný zákaz činnosti.
- Robinson (1994) bol pozitívne testovaný na **andrarín** na juniorskom šampionáte v júni 2013 a bol potrestaný ročným zákazom.
- Blanc (1985) bol pozitívne testovaný na **ostarín** na americkom tímovom šampionáte v júni 2013 a bol mu udelený dvojročný zákaz činnosti.



V máji 2013 bol ruský profesionálny cyklista pozitívne testovaný na látku ostarín.

Dominantné športy

Keďže hlavným účinkom užívania anabolík je nárast svalovej hmoty, dominantne sa zneužívajú v športoch, v ktorých je rozhodujúca sila a svalová hmota. Znižujú aj čas regenerácie, čo predstavuje riziko, že ich budú používať aj športovci vo vytrvalostných disciplínach ako prostriedok na pomoc pri ťažkých a náročných tréningoch. Na rozdiel od silových športov užívajú anaboliká len v nízkych dávkach, pretože nadmerný nárast svalovej hmoty by negatívne ovplyvnil ich športový výkon.

Zneužívanie anabolík je v súčasnosti veľkým problémom najmä v oblasti kulturistiky a fitness. Táto športová sféra je málo regulovaná a len málo dopingových kontrol sa jej aj reálne venuje. Väčšina krajín nemá vypracovanú legislatívu proti takémuto zneužívaniu. Podľa vedeckých štúdií sa predpokladá, že 5% adolescentov v USA užíva steroidy, pričom podobný trend možno očakávať aj v európskych krajinách.



Vytrvalostní športovci ako napríklad triatlonistka Lisa Hütthaler (AUT) sa tiež uchylujú k užívaniu anabolík. Priznala sa k užívaniu testosterónu, ako aj iných zakázaných látok.

Všeobecné vedľajšie účinky

Fyzické vedľajšie účinky užívania anabolík

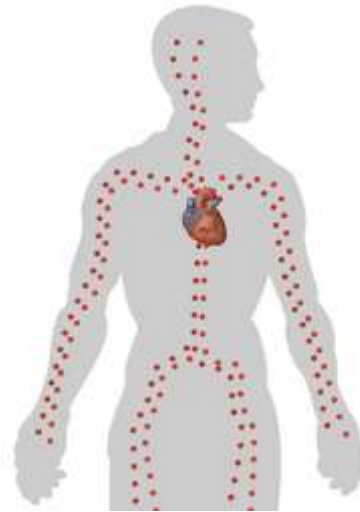
Okrem toho, že užívanie anabolík má vplyv na výkon športovca, nevýhodou je, že ich užívanie so sebou prináša aj mnohé negatíva, pričom niektoré z nich ohrozujú život. Môžu vyvolať fyzikálne zmeny, pri ktorých už niet cesty späť. Ovplyvňujú hlavne kardiovaskulárny systém a pečeň, metabolizmus tukov, ako aj zadržiavanie vody v tkanivách.

- Arterioskleróza
- Pečeň
- Nárast hmotnosti
- Suma účinkov

Psychické vedľajšie účinky

Užívanie anabolík ovplyvňuje aj psychickú stránku športovca. Zmeny nálad môžu pôsobiť v kladnom zmysle, napríklad zvýšená motivácia a eufória, ale aj negatívne, napríklad podráždenosť, emočná nestabilita a sklony k násiliu. Všetky tieto psychologické vedľajšie účinky môžu u športovca užívajúceho anaboliká spôsobiť problémy v súkromnom živote.

- Depresia
- Agresivita
- Sexuálny pud
- Erektálna dysfunkcia
- Závislosť



Anaboliká poškodzujú kardiovaskulárny systém a môžu viesť k srdcovým infarktom.



K možným vedľajším účinkom patria depresie, podráždenosť, strata sexuálneho pudu a psychická závislosť.

Špecifické vedľajšie účinky u mužov

Anaboliká narúšajú prirodzenú hladinu vlastných pohlavných hormónov, čoho výsledkom sú pohlavne špecifické vedľajšie účinky.

U mužov užívajúcich anaboliká môže dôjsť k zmenšeniu semenníkov a následnému zníženiu produkcie spermií. Sexuálna citlivosť, ako aj erektilné funkcie môžu byť znížené. Užívanie anabolík môže viesť aj k neplodnosti.

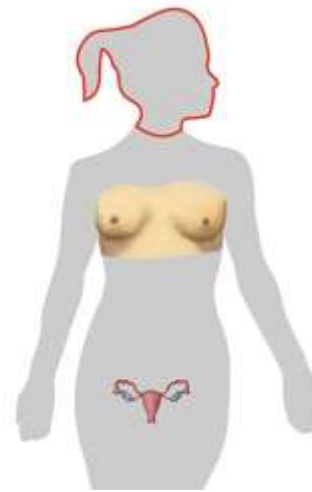
Často spôsobuje akné. Môže dôjsť aj k tzv. feminizácii tela, pretože nadbytočný testosterón je metabolizovaný na ženský pohlavný hormón estrogén, čo vedie napríklad ku gynekomastii (zväčšenie prsných žliaz u mužov).



Neprirodzený rast mužských pohlavných žliaz môže byť dôsledkom užívania anabolík.

Špecifické vedľajšie účinky u žien

U žien spôsobuje užívanie anabolických látok maskulinizáciu. Symptómy maskulinizácie sa označujú aj ako virilizácia a zahŕňajú mužský vzhľad postavy, mužské črty tváre, akné, rast ochlpenia na tvári, zhrubnutie hlasu ako dôsledok zväčšenia hlasiviek, poruchy menštruačného cyklu a zväčšenie klitorisu (ireverzibilne). Môže dôjsť aj k zmenšeniu prsníkov, pretože je narušené rozloženie tukového tkaniva. Takisto je zvýšené riziko rakoviny prsníka. Cysty a patologický rast tkaniva maternice sú ďalšími vedľajšími účinkami.



Užívanie anabolík vedie u žien k maskulinizácii.

Čo by ste ešte mali vedieť

Negatívna regulácia

Užívanie anabolík inhibuje produkciu testosterónu v tele, čo označujeme ako negatívna regulácia, ktorá sa generuje v rámci hypotalamo-hypofýzového systému. Uvoľnením tzv. uvoľňujúcich hormónov z hypotalamu dochádza k indukcii produkcie špecifických peptidových hormónov v hypofýze. Keď sú tieto molekuly zachytené ich špecifickými receptormi v cieľovom orgáne, napríklad pohlavné orgány, dokážu stimulovať tvorbu pohlavných hormónov. Pomocou cirkulácie krvi sa tieto molekuly vrátia späť do hypotalamu a hypofýzy, kde ich zvýšená koncentrácia inhibuje produkciu a uvoľnenie ďalších uvoľňujúcich hormónov.

Rôzne mechanizmy účinku steroidných a peptidových hormónov

Hormóny účinkujú na cieľové bunky z vonkajšieho alebo vnútorného prostredia bunky. Receptory, na ktoré sa viažu, môžu byť lokalizované buď na povrchu bunky - na bunkovej membráne, alebo v intracelulárnom priestore. Steroidné hormóny ako testosterón sú lipofilné, dokážu penetrovať cez lipidové membrány a viazať sa na vhodný receptor vo vnútri bunky. Na druhej strane peptidové hormóny ako hGH (ľudský rastový hormón) alebo EPO (erytropoetín) nevstupujú do bunky, ale viažu sa na receptory lokalizované na bunkových membránach. Ich účinky sú potom následne spustené sledom viacerých reakcií.

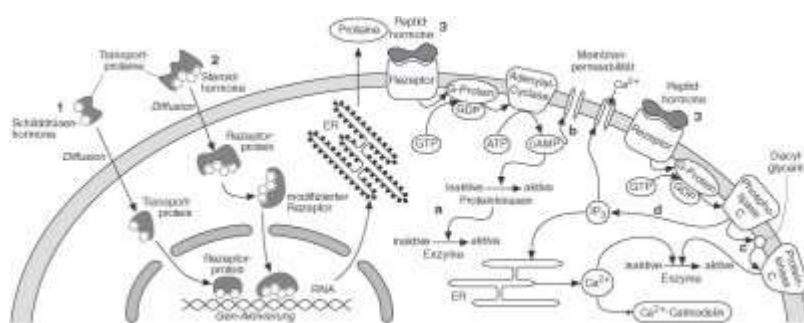


Diagram znázorňuje mechanizmy účinku steroidných a peptidových hormónov.