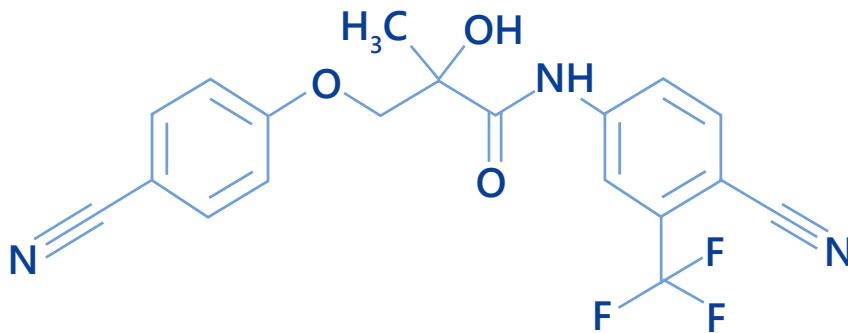


# Ostarina

## Nome

Ostarina (Ostarine)

## Struttura molecolare



## Formula di struttura

$C_{19}H_{14}F_3N_3O_3$

## Numero CAS

841205-47-8

## Nome IUPAC

(2S) 3-(4-cyanophenoxy)-N-[4-cyano-3-(trifluoromethyl)phenyl]-2-hydroxy-2-methyl-propanamide

## Altri nomi

MK-2866; GTx-024; Enobosarm

## Peso molecolare

389.328 g/mol

## Aspetto

Polvere beige

Di seguito si riportano alcune informazioni disponibili sulla molecola Ostarina:

L'ostarina è un modulatore selettivo del recettore degli androgeni (SARM); la molecola è ancora in fase di sviluppo come farmaco ed è stata testata sperimentalmente in ambito clinico per la prevenzione e il trattamento della perdita muscolare in pazienti con alcune tipologie di tumori maligni. Gli effetti collaterali più comunemente riscontrati tra i soggetti durante gli studi clinici sono stati fatica, anemia, nausea e diarrea. Ostarina appartiene ad una nuova classe di molecole non steroidee e che mostrano attività androgenica e anabolica in vivo. Il loro possibile uso è nella terapia per os sostitutiva del testosterone, contraccettivo maschile, trattamento del cancro alla prostata.

a) *EMCDDA, EDND database, Ostarine. 2013.*

b) <http://www.gtxinc.com/Pipeline/OstarineMK2866.aspx?Sid=4>

c) <http://www.osta-gain.com/osta-gain>

## Farmacologia e Tossicologia

La molecola è descritta in un brevetto sui modulatori selettivi del recettore degli androgeni e sul loro uso.

*Dalton JT et al (2003). Selective androgen receptor modulators and methods of use thereof. US Patent 6569896*

## Effetti

Ostarina è un nuovo modulatore selettivo dei recettori degli androgeni che ha mostrato risultati promettenti in studi clinici di Fase I e II in pazienti con cachessia, con un aumento della massa corporea magra totale, aumentando la performance funzionale e diminuendo la percentuale di grasso nei tessuti. Inoltre potrebbe funzionare come potente agente anabolico con effetti collaterali minimi per altri organi, costituendo una nuova potenziale strategia per il trattamento della cachessia nei pazienti oncologici. Tuttavia gli autori riportano che sono necessari ulteriori studi per confermare tali risultati.

*Zilbermint MF, Dobs AS. Nonsteroidal selective androgen receptor modulator Ostarine in cancer cachexia. Future Oncol. 2009 Oct;5(8):1211-20.*

In uno studio sulle proprietà in silico dell'ostarina, è emerso che la molecola non dovrebbe produrre effetti psicoattivi e che non dovrebbe essere in grado di attraversare la barriera ematoencefalica, sulla base delle sue proprietà chimico fisiche.

*Fazlin Mohd Fauzi, Alexios Koutsoukas, Andrew Cunningham, Ana Gallegos, Roumen Sedefov and Andreas Bender, Computer-aided (in silico) approaches in the mode-of-action analysis and safety assessment of Ostarine and 4-methylamphetamine, Hum. Psychopharmacol Clin Exp 2013; 28: 365-378, DOI: 10.1002/hup.2322.*

## Metabolismo

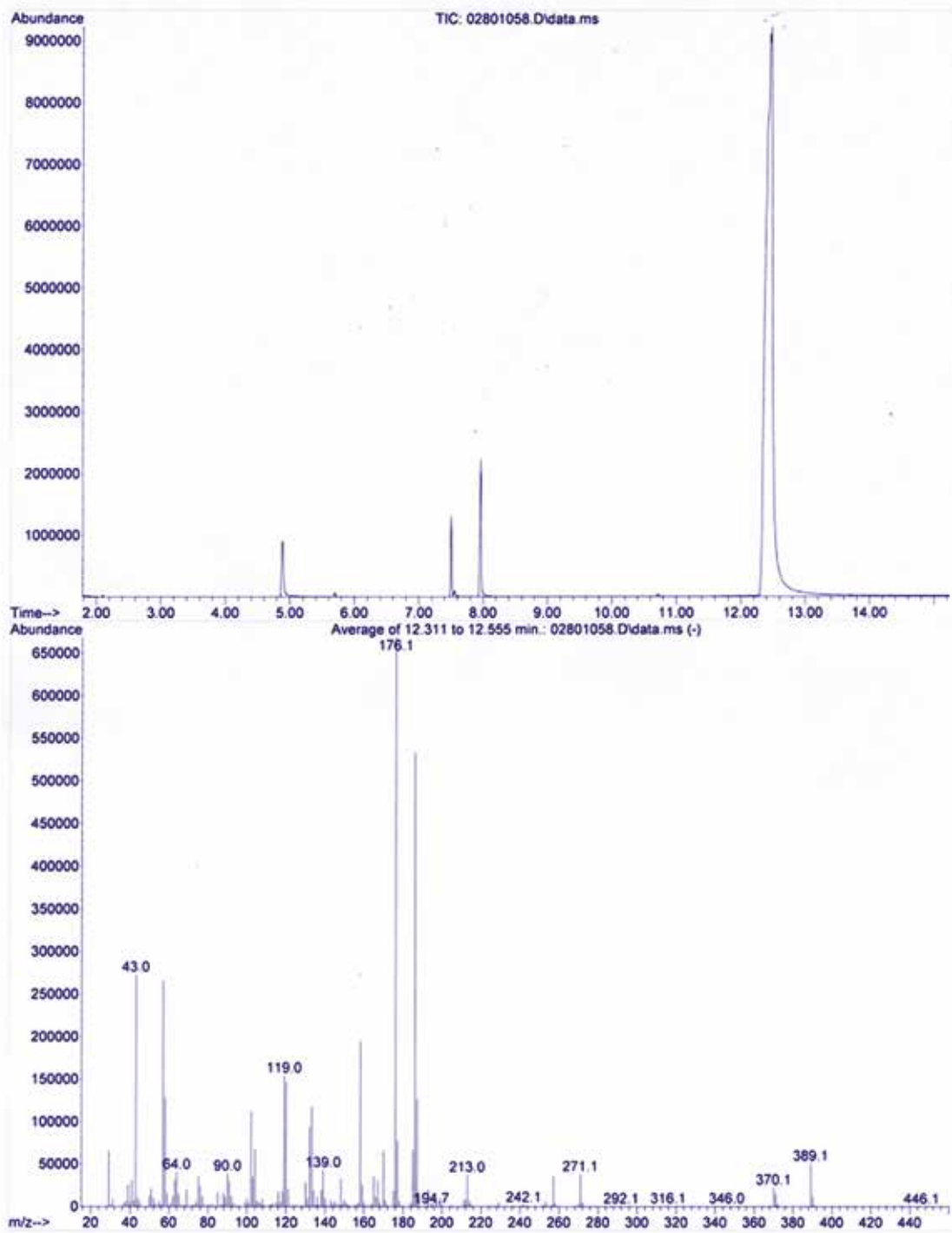
In letteratura viene riportata la formazione del metabolite O-defenilato dell'ostarina.

a) *Schragl KM. Novel pathway for the synthesis of arylpropionamide-derived selective androgen receptor modulator (SARM) metabolites of andarine and ostarine. Tetrahedron Letters. Volume 54, Issue 18, 1 May 2013, Pages 2239-2242;*

b) *de Rijke E, Essers ML, Rijk JC, Thevis M, Bovee TF, van Ginkel LA, Sterk SS. Selective androgen receptor modulators: in vitro and in vivo metabolism and analysis. Food Addit Contam Part A Chem Anal Control Expo Risk Assess. 2013 Sep;30(9):1517-26. doi: 10.1080/19440049.2013.810346. Epub 2013 Jul 24.*

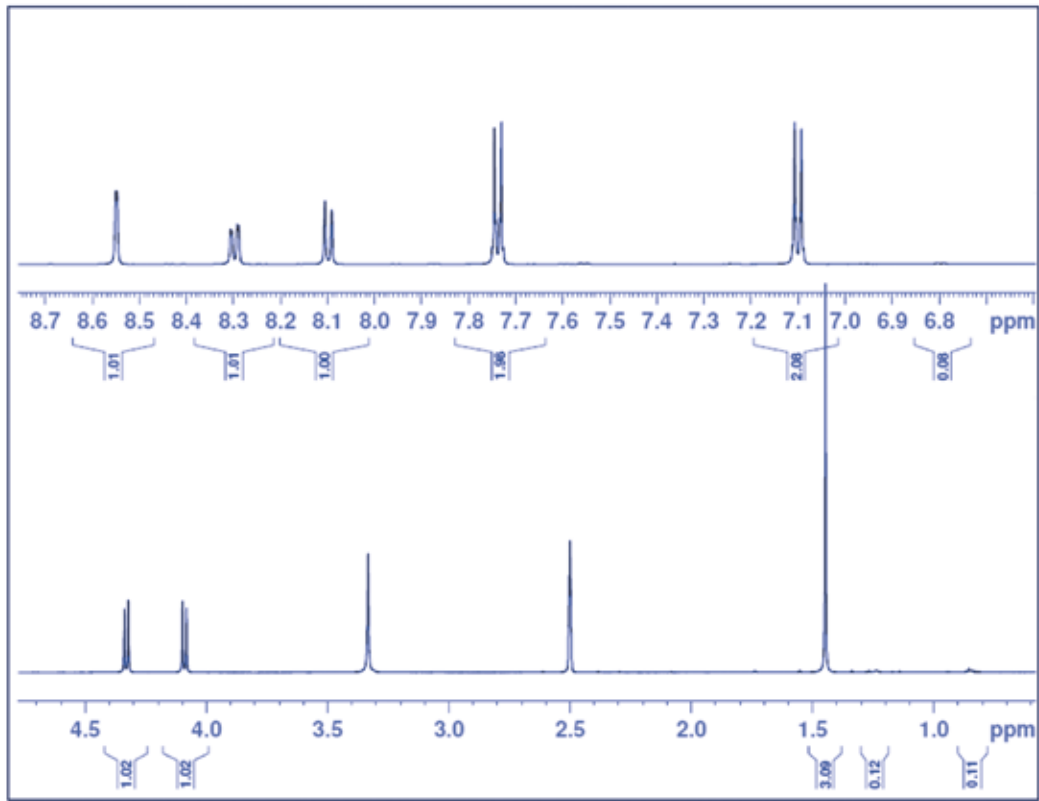
## | Caratterizzazione analitica

Di seguito si riporta il cromatogramma e lo spettro di massa della molecola ostarina, mediante analisi GC-MS:

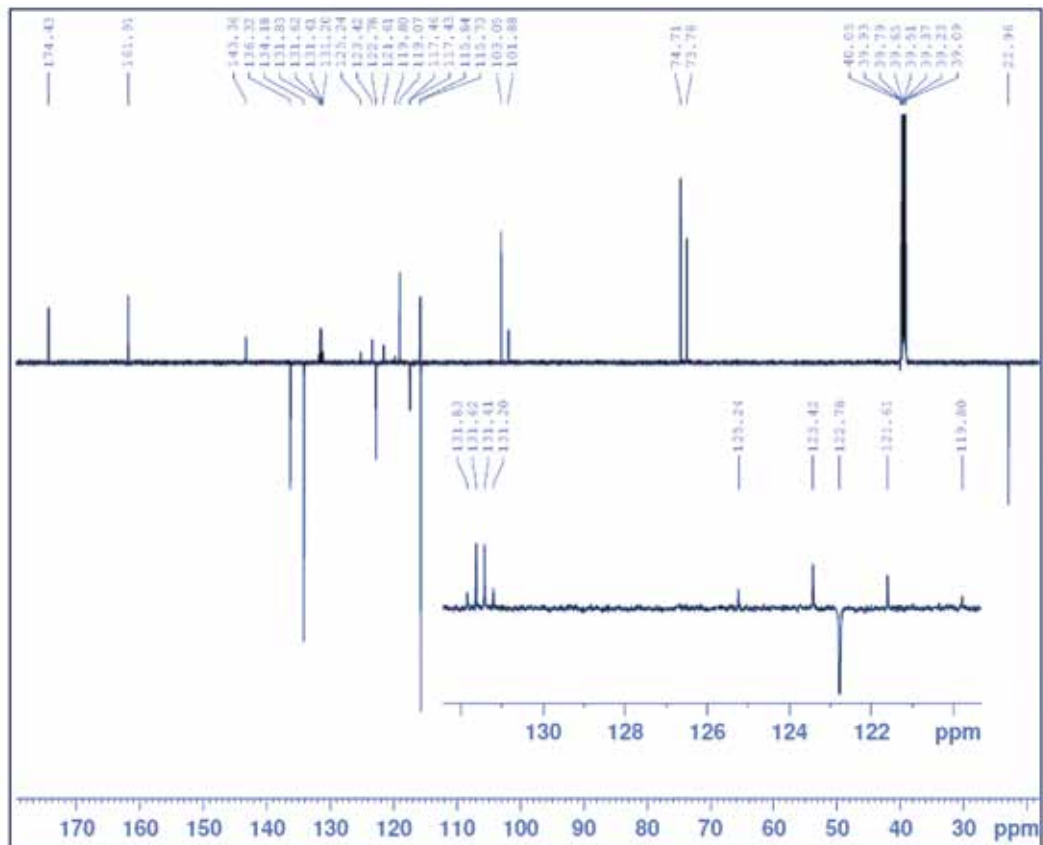


Fonte: Punto Focale Svedese.

Di seguito si riporta lo spettro  $^1\text{H-NMR}$  e  $^{13}\text{C-NMR}$  della molecola ostarina:



Fonte: Punto Focale Svedese.



Fonte: Punto Focale Svedese.

## Informazioni da Internet

Sul forum del sito "Vivere in forma" vengono riportate informazioni specialistiche sulla farmacologia dell'ostarina. Viene inoltre riportato che l'ostarina esercita i suoi effetti anabolici quasi esclusivamente sul tessuto muscolare, presentando un potenziale per la costruzione di massa muscolare per i bodybuilder ed atleti. Le dosi consigliate sul sito, per acquisire quasi ed esclusivamente la massa magra, sono 25 mg per 4-6 settimane. Viene inoltre riportato che la molecola presenta una emivita di circa 24 ore, quindi ciascuna di queste dosi va presa per via orale una volta al giorno, definita una integrazione estremamente facile (<http://www.vivereinforma.it/forum/showthread.php?389-Ostarina-il-tormentone-del-momento>, ultimo accesso 30 agosto 2013).

## Stato legale

In Italia la molecola Ostarina non risulta inclusa nelle Tabelle del D.P.R. 309/90 e s.m.i.

Non è noto lo stato legale di questa molecola nei paesi europei.

*EMCDDA, EDND database, Ostarine. 2013.*

## Fonti e database consultati

- *EMCDDA, EDND database, Ostarine. 2013.*
- *Pub Med database.*
- <http://www.gtxinc.com/Pipeline/OstarineMK2866.aspx?Sid=4>
- <http://www.osta-gain.com/osta-gain>
- Dalton JT et al (2003). *Selective androgen receptor modulators and methods of use thereof.* US Patent 6569896.
- Zilbermint MF, Dobs AS. *Nonsteroidal selective androgen receptor modulator Ostarine in cancer cachexia.* *Future Oncol.* 2009 Oct;5(8):1211-20.
- a) Schragl KM. *Novel pathway for the synthesis of arylpropionamide-derived selective androgen receptor modulator (SARM) metabolites of andarine and ostarine.* *Tetrahedron Letters.* Volume 54, Issue 18, 1 May 2013, Pages 2239–2242; b) de Rijke E, Essers ML, Rijk JC, Thevis M, Bovee TF, van Ginkel LA, Sterk SS. *Selective androgen receptor modulators: in vitro and in vivo metabolism and analysis.* *FoodAdditContamPartAChemAnalControlExpoRiskAssess.* 2013 Sep;30(9):1517-26. doi:10.1080/19440049.2013.810346. Epub 2013 Jul 24.
- *Punto Focale Svedese.*

