



NOTE SULL'AUTORE

Dott. Nicola Sacchi

Laureato in Farmacia e Biotecnologie, si occupa professionalmente del settore sportivo come personal trainer, preparatore atletico, istruttore e gestore di centri fitness, è inoltre docente per i corsi di formazione di NonSoloFitness (nicola.sacchi@nonsolofitness.it, www.ultimatetraining.it).



IMPIEGO DI FARMACI PER LA DISFUNZIONE ERETTILE NELLO SPORT

di Nicola Sacchi

Tra le ultime scoperte in campo farmaceutico vi sono sicuramente gli inibitori della fosfodiesterasi di tipo 5 (5PDE) utilizzati per il trattamento della disfunzione erettile. Queste sostanze hanno riportato un enorme successo sul mercato tanto che negli ultimi dieci anni hanno riempito le casse delle industrie produttrici. La Pfaizer che per prima ha introdotto sul mercato un farmaco di questo tipo, il Viagra, è divenuta la più importante casa farmaceutica mondiale grazie alle vendite del suddetto farmaco. Il fenomeno dell'erezione è dovuto ad un rilassamento della muscolatura liscia dei corpi cavernosi del pene cui segue una vasodilatazione arteriosa.

La parallela costrizione dei vasi venosi determina ristagno di sangue cui segue l'erezione. Il rilassamento dei muscoli lisci dei corpi cavernosi è un fenomeno mediato dall'ossido di azoto (NO). Esso attiva l'enzima guanilato ciclasi che catalizza la trasformazione della guanosina trifosfato (GTP) in guanosina monofosfato ciclico (cGMP) che stimola il rilassamento muscolare. Il cGMP viene degradato ad opera di una fosfodiesterasi di cui si conoscono almeno sei isoenzimi. Nei corpi cavernosi la fosfodiesterasi coinvolta è la fosfodiesterasi di tipo 5 (5PDE).

I farmaci per la disfunzione erettile agiscono inibendo la 5PDE, il che causa un aumento dell'afflusso di sangue, a seguito dell'aumento della concentrazione di cGMP, cui segue un miglioramento dell'erezione. Ai dosaggi terapeutici que-





ste sostanze non producono erezione in assenza di stimolazione sessuale.

Diversi sono ovviamente i possibile effetti collaterali causati dall'assunzione di queste sostanze. Infatti il principale rischio è legato al fatto che la vasodilatazione può portare ad ipotensione, con possibili scompensi cardiovascolari. Il trattamento della disfunzione erettile è stato quindi associato a gravi eventi cardiovascolari quali infarto miocardico, angina pectoris intermedia, morte cardiaca improvvisa, aritmie ventricolari, ictus, attacco ischemico transitorio ed alterazioni pressorie. Inoltre il sildenafil sembra inibire la stimolazione cardiaca beta adrenergica, infatti mentre gli effetti del sildenafil a livello cardiaco sono risultati minimi in condizioni di riposo, in condizioni di beta stimolazione o di sovraccarico pressorio il sildenafil ha diminuito le risposte cardiache indotte dalla dobutamina e gli effetti sistolici conseguenti alla beta stimolazione. Bisogna aggiungere che questi effetti sono sicuramente aggravati da una condizione cardiovascolare non ottimale. Tra gli effetti collaterali bisogna inoltre ricordare che si possono presentare anche disturbi quali vomito, diarrea, dispepsia, vampate di calore, oltre alle già accennate alterazioni pressorie.

Tra le molecole citate, il capostipite ed il primo ad essere commercializzato è il sildenafil (Viagra), successivamente alla sua immissione sul mercato sono nati altri due farmaci della stessa classe cioè il tadalafil (Cialis) ed il vardenafil (Le-

vitra). Dei tre composti il Viagra è quello con la durata d'azione più breve (6/8 ore) ma più forte, mentre gli altri hanno un'attività molto più prolungata (il Cialis oltre le 24 ore) ma meno intensa.

<<TRA LE MOLECOLE CITATE, IL CAPOSTIPITE ED IL PRIMO AD ESSERE COMMERCIALIZZATO È IL SILDENAFIL (VIAGRA) >>

Queste molecole hanno recentemente dimostrato di essere efficaci anche nel trattamento di un'altra patologia di origine vascolare: l'ipertensione polmonare. Questa patologia comporta una forte costrizione dei vasi sanguigni dei polmoni che riduce la capacità dell'apparato respiratorio di portare ossigeno al corpo. per effetto della azione vasodilatatrice, il sildenafil e le altre sostanze di questa classe, dilatano l'arteria ed altri vasi polmonari, provocando un abbassamento della pressione arteriosa nei polmoni ed aumentando la disponibilità di ossigeno. Tutto ciò rende la molecola in questione in grado di apportare considerevoli vantaggi in termini di resa energetica sotto sforzo ed i possibili benefici per l'utilizzatore si traducono in un miglioramento della capacità di fare esercizio fisico aerobico. Particolari studi condotti ad alta quota hanno dimostrato anche come il sildenafil porti ad un incremento significativo della saturazione di ossigeno nel sangue durante l'attività fisica.



Inoltre è stato evidenziato un aumento del massimo carico di lavoro e della massima capacità cardiaca. In pratica il sildenafil ha dimostrato di migliorare significativamente le capacità fisiche in condizioni di ipossia dovute all'altitudine. Alla luce di questa scoperta alcuni sportivi utilizzano di sildenafil con lo scopo di migliorare la performance aerobica in sport di lunga durata. Le informazioni sulle capacità di queste sostanze di influire l'attività fisica sono ancora poche, tuttavia, nonostante non tutti gli studi siano in grado di dimostrare reali benefici per gli atleti nelle capacità di endurance, la pratica di utilizzare inibitori della 5PDE prima della prestazione negli sport di resistenza è sempre più comune. Le capacità vasodilatatorie di queste sostanze, in particolare a livello polmonare, possono migliorare la capacità di ossigenare i muscoli, per questo motivo sempre più atleti di sport di endurance utilizzano questi prodotti.

A confermare questa pratica tra gli sportivi vi è anche uno studio italiano pubblicato nel 2014 [Loraschi et al.], che esamina questa pratica tra i ciclisti. Tale studio, attraverso un questionario anonimo, ha reso noto il fatto che in un campione di ciclisti, diversi di loro hanno ammesso di utilizzare il Sildenafil prima di una competizione. ■



BIBLIOGRAFIA

1. Barnett CF, Machado RF. Sildenafil in the treatment of pulmonary hypertension. *Vasc Health Risk Manag.* 2006;2(4):411-22.
2. Borlaug B.A. et al., *Circulation*, 2005, 112, 2642
3. Colahan PT, Jackson CA, Rice B, Szabo N, Jones JH. The effect of sildenafil citrate administration on selected physiological parameters of exercising Thoroughbred horses. *Equine Vet J.* 2010 Nov; 42 Suppl 38:606-12.
4. Di Luigi L, Baldari C, Pigozzi F, Emerenziani GP, Gallotta MC, Iellamo F, Ciminelli E, Sgrò P, Romanelli F, Lenzi A, Guidetti L. The long-acting phosphodiesterase inhibitor tadalafil does not influence athletes' $\dot{V}O_{2max}$, aerobic, and anaerobic thresholds in normoxia. *Int J Sports Med.* 2008 Feb;29(2):110-5.
5. Jacobs KA, Kressler J, Stoutenberg M, Roos BA, Friedlander AL. Sildenafil Has Little Influence on Cardiovascular Hemodynamics or 6-km Time Trial Performance in Trained Men and Women at Simulated High Altitude. *High Alt Med Biol.* 2011 Fall;12(3):215-22.
6. Loraschi A1, Galli N, Cosentino M. Dietary supplement and drug use and doping knowledge and attitudes in Italian young elite cyclists. *Clin J Sport Med.* 2014 May;24(3):238-44.
7. Rao RS, Singh S, Sharma BB, Agarwal VV, Singh V. Sildenafil improves six-minute walk distance in chronic obstructive pulmonary disease: a randomised, double-blind, placebo-controlled trial. *Indian J Chest Dis Allied Sci.* 2011 Apr-Jun;53(2):81-5.
8. Redfield MM1, et Al. Effect of phosphodiesterase-5 inhibition on exercise capacity and clinical status in heart failure with preserved ejection fraction: a randomized clinical trial. *JAMA.* 2013 Mar 27;309(12):1268-77.
9. Sacchi N. Farmaci e doping nello sport. Ed NonSoloFitness 2011
10. Spring RM, Ulrich S, Huber LC, Speich R, Maggiorini M, Treder U, Fischler M. Sildenafil for pulmonary hypertension: dose-dependent improvement in exercise performance. *Pulm Pharmacol Ther.* 2008;21(3):516-21.