!!!ZU_2012_09.qxd 18.05.2012 18:52 Page 36

Гилоба фитосомы: новые черты к портрету хорошо известного препарата

Лекарственные средства растительного происхождения, в том числе экстракт листьев дерева гинкго билоба, продолжительное время активно используются в официальной медицине для лечения различных заболеваний. Несмотря на это, появление новой формы доставки уже хорошо известного препарата нередко вызывает некоторую настороженность среди врачей, у которых возникает целый ряд вопросов: как скажутся используемые вспомогательные вещества на эффективности и безопасности лекарственного средства; повлияют ли балластные ингредиенты на переносимость и фармакокинетику препарата?
На эти и многие другие вопросы призвана ответить эта статья, повествующая о свойствах комплекса Гилоба фитосомы.

Какие компоненты входят в состав Гилоба фитосомы?

Препарат Гилоба фитосомы (Mega Lifesciences, Австралия) содержит в себе фитосомы гинкго билоба в соотношении 1:3, что соответствует 40 мг стандартного экстракта гинкго билоба.

Что такое фитосомы?

Многие фитопрепараты содержат полифенолы (флавоноиды). Характерной особенностью большинства полифенолов является слабое взаимодействие с маслами и другими липидами; это снижает способность флавоноидов абсорбироваться в желудочно-кишечном тракте и затрудняет их проникновение через наружную липидную мембрану энтероцитов в тонком кишечнике (Е.В. Голованова, 2010). В то же время водорастворимые молекулы флавоноидов могут трансформироваться в липофильные молекулярные комплексы, которые достаточно легко проникают из гидрофильной среды тонкого кишечника сквозь гидрофильную мембрану энтероцита непосредственно внутрь клетки, а затем непосредственно в кровь. Такие липофильные молекулярные комплексы растительного происхождения, обладающие высокой биодоступностью, получили название «фитосомы».

Каким образом синтезируют фитосомы?

Технология получения фитосом появилась в 1989 г. Как правило, для создания фитосомно-молекулярного комплекса используют разнообразные липидные субстанции, в большинстве случаев главной составляющей является фосфатидилхолин.

Чем фитосомы отличаются от липосом?

Несмотря на некоторое сходство в названиях, фитосомы и липосомы значительно отличаются друг от друга не только по строению, но и по возможностям клинического применения. Фитосома представляет субстанцию из нескольких связанных между собой молекул, она имеет высокую растворимость в липидной среде и хорошо проникает в липидную фазу внешней клеточной мембраны энтероцита. Липосома же представляет собой более крупный комплекс, состоящий из множества фосфолипидных молекул, которые окружены различными веществами (белками, активными фитомолекулами), не вступающими в какие-либо реакции с фосфолипидами. Липосомы, как правило, обеспечивают только транспорт активных субстанций через мембрану клетки, в то время как фитосомы обладают различными дополнительными свойствами (противовоспалительными, антинеопластическими, детоксикационными и др.).

Фитосомы – это инертные соединения?

Фитосомы облегчают проникновение действующей субстанции в клетку, а также обладают различными полезными свойствами. Так, фитосомы силибинина (флавонолигнаны силимарина) оказывают системное антиоксидантное, гепатопротекторное и противоопухолевое действие (M. Parris et al., 2009). Полифенол, содержащийся в большом количестве в корне куркумы (куркуминоид), способен улучшать антиоксидантную защиту организма, подавлять активность воспалительного процесса и препятствовать развитию неоплазий. Катехины зеленого чая также имеют антиоксидантные, противовоспалительные, антинеопластические свойства. Подобными действиями обладают фитосомы, выделенные из виноградных косточек (катехины и эпикатехиновый комплекс). Кроме того, катехины зеленого чая способствуют снижению массы тела, тогда как катехины виноградных косточек улучшают кровоснабжение периферических тканей.

Какими свойствами обладает гинкго билоба?

Специфическую фармакологическую активность гинкго билоба связывают с содержанием в листьях этого дерева большого количества активных веществ, основными из которых являются флавоноиды (кемпферол, проантоцианидины, кверцетин) и терпеновые лактоны, получившие название «гинкголиды» и «билобалиды».

В настоящее время имеются убедительные доказательства способности гинкголидов оказывать противовоспалительное действие, которое связывают со снижением синтеза провоспалительных цитокинов, в частности с уменьшением выброса интерлейкина-6 (L. Ching-Hsiang et al., 2012). Гинкго билоба также обладает выраженным антиоксидантным свойством; флавоноиды гинкго стабилизируют мембраны митохондрий, расширяют сосуды сетчатки, препятствуют вазоспазму и образованию тромбов (A.K. Cybulska-Heinrich et al., 2012).

Недавно были опубликованы интересные данные, продемонстрировавшие цитотоксическую активность трех гинкголиевых кислот (J. Oh et al., 2012). В условиях in vitro в присутствии флавоноидов, выделенных из листьев дерева гинкго билоба, исследователи зафиксировали замедление/прекращение роста нескольких линий опухолевых клеток: MCF-7 (аденокарциномы грудных желез), A549 (аденокарциномы легких) и HL-60 (лейкоза). Полученные данные ученые объясняют способностью гинкголиевых кислот ингибировать синтез фермента, ответственного за синтез жирных кислот в раковых клетках.

Какая отличительная особенность фитосом гинкго билоба?

Фитосомы гинкго билоба представляют собой комплекс, состоящий из фосфолипидов, покрывающих тонкой оболочкой мельчайшие капельки экстракта из листьев дерева гинкго. Эта фитосомальная субстанция, в отличие от стандартизированного экстракта листьев гинкго билоба, имеет более высокую биодоступность, а эффективность применения такого фитосомно-молекулярного комплекса может быть выше таковой препаратов, содержащих обычный экстракт гинкго.

Известно, что гинкголиды улучшают эластичность стенок кровеносных сосудов головного мозга и расширяют сосуды, что способствует кровоснабжению ткани головного мозга, активизации умственной деятельности и повышению антиоксидантной защиты организма. Поэтому в настоящее время фитосомы гинкго билоба входят в комплекс для лечения ишемических и инволютивных нарушений функциональной активности мозга, нейросенсорных нарушений, деменции и ангиопатий.

Изменяется ли артериальное давление при приеме гинкго билоба?

По данным американских ученых (T.E. Brinkley et al., 2010), распространенность гипертензии у лиц, получавших гинкго билоба, не отличается от таковой у пациентов, принимавших плацебо (ОШ 0,99; 95% ДИ 0,84-1,15). Исследователи также утверждают, что экстракт гинкго билоба не оказывает значимого влияния на уровень артериального давления ни у мужчин, ни у женщин (ОШ 0,75; 95% ДИ 0,48-1,16).

Есть ли вероятность развития кровотечения на фоне терапии гинкго билоба?

Вероятность возникновения кровотечения при приеме гинкго билоба была тщательно проанализирована в систематическом обзоре и метаанализе 18 рандомизированных контролированных исследований (A.J. Kellermann et al., 2011). Результаты испытаний немецких ученых показали, что экстракт гинкго билоба уменьшает вязкость крови (взвешенная разность средних: -1,03 мПа×с; 95% ДИ от -1,29 до -0,78 мПа×с), но не оказывает значимого влияния на показатели АДФ-индуцированной агрегации тромбоцитов, концентрацию фибриногена, активированное частичное тромбопластиновое время, протромбиновое время. В то же время подгрупповой анализ исследований, в которых пациентам было рекомендовано принимать высокие дозы гинкго билоба (≥240 мг/сут), зафиксировал значительное уменьшение активированного частичного тромбопластинового времени у больных с деменцией, сахарным диабетом или заболеваниями периферических сосудов. Подобный факт был отмечен в испытаниях, дизайн которых предполагал обследование только лиц с неврологической патологией без сопутствующего изучения исследуемых показателей у здоровых волонтеров. Таким образом, прием стандартных доз экстракта гинкго билоба не сопровождается увеличением риска развития кровотечения.

Уменьшается ли кардиоваскулярный риск при приеме гинкго билоба?

Анализ сердечно-сосудистого риска у больных, получавших гинкго билоба, проводился в рамках масштабного исследования Ginkgo Evaluation of Memory Study (n=3069). Участников рандомизировали для приема 120 мг гинкго билоба 2 р/сут или плацебо (L.H. Kuller et al., 2010). На протяжении всего периода наблюдения (медиана – 6,1 года) было зарегистрировано 355 летальных исходов (87 смертельных случаев были обусловлены ишемической болезнью сердца). Оказалось, что распространенность инфаркта миокарда (164 случая) и стабильной стенокардии (207 случаев) в группе приема гинкго билоба не отличалась от таковой в группе плацебо; при этом частота возникновения заболеваний периферических артерий была несколько ниже у пациентов, получавших гинкго (0,8%), чем таковая у больных, принимавших плацебо (1,5%; p=0,04). L.H. Kuller и соавт. считают нецелесообразным использование гинкго билоба для профилактики кардиоваскулярных событий.

Эффективно ли назначение гинкго билоба для лечения деменции?

Эффективность и безопасность терапии деменции различного генеза с помощью гинкго билоба изучались многими учеными. Результаты недавно опубликованного многоцентрового двойного слепого исследования, в котором приняли участие 410 пациентов с деменцией легкой или средней степени тяжести, развившейся на фоне болезни Альцгеймера или различной сосудистой патологии, подтвердили целесообразность назначения этого препарата при лечении деменции (H. Herrschaft et al., 2012). Оценив нейропсихиатрическое состояние пациентов перед включением в исследование и по завершению 24-недельного курса приема гинкго билоба при помощи специализированного опросника Neuropsychiatric Inventory (NPI), исследователи отметили значительное улучшение показателей NPI в когорте больных, получавших экстракт гинкго билоба (4,6±7,1 балла), по сравнению с участниками, принимавшими плацебо (2,1±6,5 балла; p<0,001).

В метаанализе, проведенном китайскими учеными (B.S. Wang et al., 2010), зафиксировано улучшение когнитивных функций у больных деменцией, принимавших гинкго билоба на протяжении 6 мес (средние различия: 0,89; 95% ДИ от -1,82 до 0,04). Исследователи также

!!!ZU_2012_09.qxd 18.05.2012 18:52 Page 37

отметили улучшение показателей шкалы оценки когнитивных функций у пациентов с болезнью Альцгеймера (средние различия: -2,65; 95% ДИ от -4,53 до -0,76).

Подобные результаты были получены немецкими учеными, опубликовавшими результаты систематического обзора и метаанализа 9 рандомизированных контролированных исследований с общим количеством участников 2372 человек. S. Weinmann и соавт. (2010) установили, что прием гинкго билоба способствовал улучшению когнитивных функций (средние различия: -0,58; 95% ДИ от -1,14 до -0,01; p=0,04), но не оказывал значимого влияния на объем элементарных действий по самообслуживанию (средние различия: -0,32; 95% ДИ от -0,66 до 0,03; p=0,08). В то же время анализ повседневной активности в подгруппе пациентов с болезнью Альцгеймера зафиксировал достоверное улучшение исследуемого показателя (средние различия: -0,44; 95% ДИ от -0,77 до -0,12; p=0,008).

Анализировалась ли эффективность гинкго билоба экспертами Кокрановского сотрудничества?

Один из систематических обзоров, выполненных экспертами Кокрановского сотрудничества, был посвящен изучению эффективности фармакологических методов коррекции когнитивных нарушений у больных рассеянным склерозом (D. He et al., 2011). В этот систематический обзор были включены рандомизированные контролированные исследования, дизайн которых предполагал применение одного из четырех препаратов: донепезила, гинкго билоба, мемантина и ривастигмина. К сожалению, эксперты Кокрановского сотрудничества не сделали четкого вывода о предпочтительном назначении того или иного лекарственного средства больным рассеянным склерозом по причине низкого качества проанализированных исследований. В то же время представители Кокрановской группы подчеркнули высокую безопасность и хорошую переносимость препаратов, содержащих экстракт гинкго билоба.

Стоит ли рекомендовать гинкго билоба пациентам с болезнью Альцгеймера?

Результаты систематического обзора, выполненного немецкими учеными, свидетельствуют, что назначение гинкго билоба пациентам с болезнью Альцгеймера позволяет уменьшить психопатологические проявления заболевания и расширить объем элементарных действий по самообслуживанию (I.M. Janssen et al., 2010).

Обосновано ли применение гинкго билоба при лечении ишемического инсульта?

Патогенетическое обоснование использования гинкго билоба в терапии ишемического инсульта приведено в работе иранских ученых (I.A. Thanoon et al., 2012). Авторы обследовали 31 пациента с острым нарушением мозгового кровообращения и 30 здоровых добровольцев. Больных рандомизировали для проведения стандартной терапии ишемического инсульта (n=15) или комбинированного лечения посредством дополнительного назначения 1500 мг/сут экстракта гинкго билоба на протяжении 30 дней. Как показали результаты исследования, уровень малонового диальдегида и концентрация высокочувствительного С-протеина в сыворотке крови у больных ишемическим инсультом были значительно выше, чем таковые у здоровых добровольцев (p≤0,001); ранний период острого мозгового нарушения кровообращения сопровождался значительным снижением общего антиоксидантного статуса. Дополнительный прием гинкго билоба способствовал уменьшению уровня высокочувствительного С-протеина (p≤0,01) и повышению общего антиоксидантного статуса (p≤0,01), не оказывая значимого влияния на концентрацию малонового диальдегида (p=0,19). Учитывая полученные данные, иранские ученые пришли к выводу, что применение гинкго билоба при остром нарушении мозгового кровообращения патогенетически обоснованно, т. к. препарат с содержанием его экстракта уменьшает степень оксидативного повреждения ткани головного мозга и снижает активность воспалительного процесса.

Справедливо ли мнение об эффективности гинкго билоба в лечении шизофрении?

Целесообразность назначения гинкго билоба больным шизофренией в качестве вспомогательного средства, уменьшающего проявления поздней дискинезии, была показана в рандомизированном контролированном исследовании, выполненном под руководством W.F. Zhang (2010). Исследователи рандомизировали 157 больных шизофренией для приема гинкго билоба (n=78) или плацебо (n=79) на протяжении 12 нед. Эффективность проводимой терапии оценивали, анализируя в динамике лечения показатели шкалы, предназначенной для оценки патологических непроизвольных движений (Abnormal Involuntary Movement Scale – AIMS). Ученые отметили, что исследование по протоколу завершили 152 пациента (96,8%), при этом на проводимую терапию ответили 51,3% больных из группы гинкго билоба и 5,1% из группы плацебо. W.F. Zhang и соавт. зафиксировали достоверное улучшение показателей шкалы AIMS (2,13±1,75) в группе пациентов, получавших экстракт гинкго билоба, по сравнению с таковыми у больных, принимавших плацебо (-0,10±1,69; p<0,0001).

Эффективность гинкго билоба в качестве вспомогательного лекарственного средства в лечении хронической шизофрении была также подтверждена в метаанализе, объединившем результаты 6 рандомизированных исследований (V. Singh et al., 2010).

Поможет ли прием гинкго билоба предотвратить приступ мигрени?

Итальянские ученые считают гинкго билоба эффективным препаратом для профилактики возникновения мигренозных приступов, уменьшения их частоты и продолжительности. Подобный вывод был сделан G. D'Andrea и соавт. (2010) на основании данных открытого многоцентрового исследования, в котором изучалась эффективность экстракта гинкго билоба в профилактике возникновения приступов мигрени с аурой. В этом испытании приняли участие 50 женщин с жалобами на частое развитие мигренозных приступов с типичной аурой. На протяжении подготовительного периода (2 мес перед началом испытания) пациенткам рекомендовали воздержаться от профилактического приема каких-либо лекарственных средств. Участницам исследования рекомендовали принимать 60 мг фитосом гинкго билоба, 11 мг коэнзима Q и 8,7 мг витамина B_2 2 раза в сутки на протяжении 4 мес (период T_1 – 1-2-й месяц, период T_2 – 3-4-й месяц). На протяжении всего испытания ученые оценивали частоту возникновения неврологических симптомов, частоту появления и продолжительность мигренозных приступов с типичной аурой. Оказалось, что прием фитосом гинкго билоба способствовал достоверному уменьшению количества мигренозных приступов (подготовительный период: 3,7±2,2; период T_1 – 2,0±1,9; период T_2 – 1,2±1,6; p<0,0001). Исследователи также отметили уменьшение продолжительности мигренозных приступов с аурой (подготовительный период: 40,4±19,4 мин; период T_1 – 28,2±19,9 мин; период T_2 – 17,6±20,6 мин; p<0,0001). Профилактическое применение фитосом гинкго билоба на протяжении 2 мес сопровождалось полным исчезновением мигренозных приступов у 11,1% пациенток, при увеличении длительности приема препарата до 4 мес этот показатель возрос практически в 4 раза и составил 42,2%. В заключение исследователи подчеркнули хорошую переносимость комбинированного препарата, содержащего фитосомы гинкго билоба.

Можно ли использовать гинкго билоба в лечении глаукомы?

Данные доказательной медицины подтверждают эффективность этого препарата в лечении различных форм глаукомы, в том числе с нормальным и высоким внутриглазным давлением (A.K. Cybulska-Heinrich et al., 2012).

Какие официально зарегистрированные показания к применению препарата Гилоба фитосомы?

В настоящее время в Украине зарегистрированы следующие показания к назначению фитосом гинкго билоба: нарушение мозгового кровообращения у лиц пожилого возраста, которые проявляются нарушением памяти и мыслительных способностей, отчужденностью и обеспокоенностью, головокружением и шумом в ушах, нарушением сна. Препарат Гилоба фитосомы также может быть назначен при состояниях, сопровождаемых нарушением периферического кровообращения и микроциркуляции в конечностях.

Существуют ли противопоказания к назначению Гилоба фитосомы?

Гилоба фитосомы не рекомендуется применять при наличии повышенной чувствительности к компонентам препарата, при обострении пептической язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, в остром периоде инфаркта миокарда, а также во время беременности. Несмотря на приведенные выше современные данные об отсутствии негативного воздействия гинкго билоба на уровень артериального давления и активность системы гемостаза, применение Гилоба фитосомы нежелательно у лиц, которым свойственны острая или хроническая гипотензия, сниженная свертываемость крови.

Какая схема приема Гилоба фитосомы?

Препарат Гилоба фитосомы рекомендуется принимать по 1 капсуле 3 раза в день после еды на протяжении 1-3 мес (в зависимости от тяжести заболевания и выраженности клинической симптоматики). В некоторых случаях при необходимости достижения стойкого терапевтического эффекта целесообразно продлить прием данного препарата до 6 мес.

Подготовила ***Лада Матвеева***

Список литературы находится в редакции.

!!!ZU_2012_09.qxd 18.05.2012 18:53 Page 38

Спазмомен®

Снимает спазм и боль как рукой

- Спазмомен купирует спазм и боль в животе
- Спазмомен восстанавливает физиологическую перистальтику толстой кишки
- Спазмомен действует локально*

Рег. свид. № UA/7146/01/01

* Информация для специалистов

BERLIN-CHEMIE
MENARINI