Size: 130 x 175 mm (front & back)

Инструкция по медицинскому применению препарата

НЕЙРОГРАМ сироп

СОСТАВ
Каждые 5 мл содержат:
Цитиколин натрия
Эквивалентный Цитиколину 500 мг
Ароматизированная сиропная основа в должном количестве
Краситель: Понсо 4R

ФАРМАКОЛОГИЯ
Фармакодинамика
Цитиколин - сложная органическая молекула, которая функционирует как промежуточное соединение в биосинтезе фосфолипидов клеточной мембраны. Цитиколин также известен как ЦДФ-холин и цитидиндифосфат холин (цитидин 5'-дифосфохолин). Цитиколин состоит из двух основных частей, цистидина и холина, связанных дифосфатным мостиком, и служит донором фосфохолина для 1,2-диацилглицерина (DAG) с образованием фосфатидилхолина. Это пиримидин-5'-нуклеотид, который служит важным предшественником в синтезе лецитина (фосфатидилхолина) и других фосфолипидов. Обширное повреждение, вызванное инсультом, требует восстановления и регенерации аксонов и синапсов нейронов, поэтому необходимо производство новых мембран.
Результаты различных исследований показали следующие действия цитиколина:
Предшественник фосфолипидов
Доказательства роли цитиколина как предшественника фосфатидилхолина были обнаружены в исследованиях на животных. Мозг использует холин преимущественно для синтеза ацетилхолина, что может ограничивать количество холина, доступного для производства фосфатидилхолина. Когда потребность в ацетилхолине увеличивается или запасы холина в головном мозге низкие, фосфолипиды в нейрональной мембране могут катаболизироваться, чтобы обеспечить необходимый холин. Таким образом, экзогенный цитиколин помогает сохранить структурную и функциональную целостность нейрональной мембраны. В исследовании в лабораторных условиях цитиколин в высоких концентрациях стимулировал ацетилхолинэстеразу мозга (AChE) вместе с Na + / K + -АТФазой. Постулируемый механизм включает биоконверсию цитиколина в фосфатидилхолин.
Ремонт нейрональной мембраны
Цитиколин исследовался как средство лечения пациентов с инсультом. Постулируются три механизма: (1) способность восстанавливать мембраны нейронов за счет увеличения синтеза фосфатидилхолина; (2) восстановление поврежденных холинергических нейронов за счет усиления выработки ацетилхолина; и (3) уменьшение накопления свободных жирных кислот в месте повреждения нервов, вызванного инсультом. Помимо фосфатидилхолина, цитиколин служит промежуточным звеном в синтезе сфингомиелина, другого фосфолипидного компонента нейрональной мембраны. Цитиколин показал способность восстанавливать постишемический уровень сфингомиелина. Цитиколин также восстанавливает уровень кардиолипина, фосфолипидного компонента внутренней митохондриальной мембраны. Механизм этого неизвестен, но данные свидетельствуют о том, что цитиколин ингибирует ферментативный гидролиз кардиолипина фосфолипазой А2. Цитиколин предотвращает, снижает или обращает вспять эффекты ишемии и / или гипоксии у большинства исследованных животных и клеточных моделей; он также действует при черепно-мозговых травмах, уменьшает и ограничивает повреждения мембран нервных клеток, восстанавливает чувствительность и функцию регуляторных внутриклеточных ферментов и ускоряет реабсорбцию отека мозга. Таким образом, накоплен значительный объем доказательств, подтверждающих использование цитиколина для увеличения, поддержания и восстановления мембран и функции нейронов в таких ситуациях, как ишемия и травматические повреждения уменьшает и ограничивает повреждения мембран нервных клеток, восстанавливает чувствительность и функцию регулирующих внутриклеточных ферментов и ускоряет повторное поглощение отека мозга.
Снижение накопления свободных жирных кислот
Цитиколин может принести пользу пациентам, страдающим ишемией, за счет уменьшения накопления свободных жирных кислот в месте поражения, которое происходит в результате повреждения и гибели нервных клеток. Вскоре после начала ишемии наблюдается значительное увеличение провоспалительной арахидоновой кислоты, глицеринов и свободных жирных кислот, вызванное разрушением мембран нейронов. Могут накапливаться токсичные метаболиты, а также простагландины, тромбоксаны и свободные радикалы, что приводит к дальнейшему повреждению. Исследования на животных продемонстрировали доказательства подавления накопления свободных жирных кислот. Данные о людях ограничены.
Влияние на бета-амилоид
Появились доказательства того, что цитиколин противодействует отложению бета-амилоида, нейротоксического белка, который, как считается, играет центральную роль в патофизиологии болезни Альцгеймера (БА). Характерным поражением при БА является образование бляшек и нейрофибриллярных клубков в гиппокампе. Степень когнитивной дисфункции и нейродегенерации при AD пропорциональна накоплению бета-амилоида.
Влияние на норэпинефрин
Доказательства способности цитиколина увеличивать высвобождение норэпинефрина у людей были обнаружены в исследовании, показывающем, что цитиколин повышает уровень в моче 3-метокси-4-гидроксифенилгликоля (MHPG), метаболита норадреналина. Цитиколин увеличивал уровни нейротрансмиттеров в головном мозге крыс в дозе 100 мг / кг, вводимой ежедневно в течение 7 дней. Норэпинефрин увеличился в коре головного мозга и гипоталамусе, дофамин увеличился в полосатом теле, а серотонин увеличился в коре головного мозга, полосатом теле и гипоталамусе.
Активация дофаминергической системы
Что касается дофаминергической активации, цитиколин, как сообщается, оказывает эффекты дофаминергических агонистов в полосатом теле, усиливает синтез дофамина в полосатом теле (путем активации тирозингидроксилазы), ингибирует захват дофамина синаптосомами и повышает чувствительность дофаминергических рецепторов, которые снижаются при длительной терапии леводопой. В небольших открытых и контролируемых исследованиях сообщалось, что добавление цитиколина к терапии леводопой (с другими антипаркинсоническими агентами или без них) улучшало симптомы у пациентов с болезнью Паркинсона.

Фармакокинетика
Абсорбция
Цитиколин хорошо всасывается при внутримышечном введении. После внутримышечного введения цитиколина в дозе 1000 мг максимальное повышение уровня холина в плазме наблюдалось через 0,4 часа, при этом уровни увеличивались с 11 мкмоль / л (исходный уровень) до 25 мкмоль / л.
Распределение
Холин, полученный из цитиколина, проникает через гематоэнцефалический барьер, предположительно служа источником синтеза ацетилхолина и фосфатидилхолина (лецитина). Большая часть дозы цитиколина, по-видимому, включается в ткани и / или используется в путях биосинтеза / биодеградации, включая синтез лецитина / липидной мембраны.

Метаболизм
Цитиколин метаболизируется в печени до свободного холина. Печень способна синтезировать лецитин из холина. Период полувыведения свободного холина составляет 2 часа после внутримышечного введения.

Экскреция
Только небольшое количество дозы выводится с мочой и калом (менее 3% каждый). Примерно 12% дозы выводится через легкие в виде углекислого газа.

ПОКАЗАНИЯ И ИСПОЛЬЗОВАНИЕ
- Снижение памяти и мышления, которое обычно происходит с возрастом. Прием цитиколина способствует снижению потери памяти у людей в возрасте от 50 до 85 лет.
- Группа заболеваний глаз, которые могут привести к потере зрения (глаукома). Прием цитиколина внутрь, в виде инъекции или в виде глазных капель может улучшить зрение у некоторых людей с глаукомой.
- Инсульт. Пациенты с инсультом, которые принимают цитиколин внутрь или внутривенно в течение 24 часов после инсульта, вызванного сгустком (ишемический инсульт), с большей вероятностью, чем другие пациенты с ишемическим инсультом, выздоровят в течение 3 месяцев. Цитиколин, скорее всего, подействует на людей, которые не могут получить лекарство под названием rtPA от инсульта.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ
Повышенная чувствительность к цитиколину.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ
Карбидопа, Леводопа и Энтакапон
Цитиколин может усиливать эффекты леводопы, карбидопы и андентакапона. Точный механизм неизвестен, но испытания на животных предполагают, что цитиколин может повышать уровень дофамина в головном мозге и / или улучшать выживаемость дофаминергических клеток. У пациентов с болезнью Паркинсона несколько исследований продемонстрировали эффект сохранения леводопы, в результате чего добавление цитиколина (500–1200 мг / день) позволило использовать более низкие дозы леводопы со стабильной или улучшенной терапевтической эффективностью и уменьшило побочные эффекты при лечении некоторых пациентов. Однако данные ограничены.
Совместное применение с центрофеноксином
Нельзя назначать одновременно с препаратами, содержащими центрофеноксин.

ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ И МЕРЫ ПРЕДОСТОРОЖНОСТИ
Беременность и кормление грудью: Недостаточно информации, чтобы знать, безопасно ли использовать цитиколин при беременности или кормлении грудью. Будьте осторожны и избегайте использования.

Дети: Цитиколин ВОЗМОЖНО БЕЗОПАСЕН при пероральном приеме до 1 года у детей до 13 лет.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ
При приеме внутрь: Цитиколин ВОЗМОЖНО БЕЗОПАСЕН при приеме внутрь в течение 90 дней. Большинство людей, принимающих цитиколин внутрь, не испытывают побочных эффектов. Но у некоторых людей могут быть побочные эффекты, такие как проблемы со сном (бессонница), головная боль, запор, диарея, тошнота, боль в животе, помутнение зрения, боли в груди и другие. Недостаточно информации, чтобы знать, безопасен ли длительный прием цитиколина внутрь или каковы могут быть побочные эффекты.

ДОЗИРОВКА И СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ
- **При снижении памяти и мышления, которое обычно происходит с возрастом:** 1000-2000 мг цитиколина в сутки.
- **Для группы глазных заболеваний, которые могут привести к потере зрения (глаукома):** 500-1600 мг в сутки.
- **Для инсульта:** 500-2000 мг цитиколина в день, начиная с 24 часов после инсульта.

БЕРЕМЕННОСТЬ И ЛАКТАЦИЯ
Беременность
Нет адекватных и хорошо контролируемых исследований цитиколина во время беременности. Цитиколин следует использовать во время беременности, только если потенциальная выгода оправдывает потенциальный риск для плода.
Кормление грудью
Следует проявлять осторожность во время кормления грудью, поскольку неизвестно, выделяется ли цитиколин с грудным молоком.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ
Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 30°C.

Храните лекарство в недоступном для детей месте.

УПАКОВКА
Флакон 30 мл упакован в картонную коробку вместе с инструкцией.

Произведено для:

Star Pharma

Лондон, Великобритания

Производитель:
Скотт-Эдил Фармасия Лтд.
56, ЕПИП, Фаза I, Джармаджри,
Бадди, ХП (Индия)