

Центролин как средство нейропротекции и нейрометаболической защиты мозга

Одним из перспективных направлений метаболической защиты мозга от ишемии является воздействие на системы нейротрансмиттеров и нейромодуляторов, создание условий для нормализации соотношения процессов возбуждающей и тормозной нейротрансмиссии. Ацетилхолин, будучи одним из основных медиаторов нервной возбуждения в центральной нервной системе, играет в этом процессе важную роль, изменения в его обмене приводят к нарушению функций мозга. В частности недостаток ацетилхолина во многом определяет клиническую картину таких нейродегенеративных заболеваний, как болезнь Альцгеймера (Kihara T., Shimohama S., 2004). Окончания нервных волокон, для которых ацетилхолин служит медиатором, называют холинергическими, а рецепторы, взаимодействующие с ним, — холинорецепторами. Лекарственные средства, действующие подобно ацетилхолину, называют холиномиметиками и подразделяют на М-, Н- и М-, Н-холиномиметики (стимулирующие М-, Н- и М-, Н-холинорецепторы соответственно) (Чекман И.С. (ред.), 2013). Н-холиномиметики оказывают множество эффектов, поскольку стимулируют Н-холинорецепторы как парасимпатических (усиление моторики кишечника и секреции бронхиальных желез), так и симпатических (расширение сосудов, тахикардия, гипертензия) ганглиев. М-холиномиметики оказывают прямое (обычно возбуждающее) действие, за исключением сердца, где активация доминирующих M_2 -холинорецепторов оказывает тормозящий эффект, уменьшая силу и частоту сердечных сокращений (Нил М.Дж., 2015).

Холина альфосцерат — нейропротекторный и нейрометаболический препарат группы центральных холиномиметиков с преобладающим влиянием на центральную нервную систему. Будучи природным физиологическим прекурсором ацетилхолина, он представляет большой интерес как средство нейропротекции и нейрометаболической защиты мозга. Нейропротекторный эффект холина альфосцерата реализуется посредством восстановления межнейронных связей и нейротрансмиссии, прямой репарации нейрональных мембран и уменьшения дегенерации свободных жирных кислот. Холина альфосцерат потенциально способен предотвращать и корригировать биохимические повреждения, имеющие особое значение среди патогенных факторов психоорганического инволюционного синдрома, оказывая влияние на сниженный холинергический тонус и измененный фосфолипидный состав оболочек нервных клеток. При попадании в организм холина альфосцерат под действием ферментов расщепляется на холин и глицерофосфат. Первый принимает участие в биосинтезе ацетилхолина, второй является предшественником фосфолипидов (фосфатидилхолина) нейрональной мембраны. Таким образом, холина альфосцерат улучшает передачу нервных импульсов в холинергических нейронах, положительно влияет на пластичность нейрональных мембран и функцию рецепторов. Препарат улучшает церебральный кровоток, усиливает метаболические процессы в головном мозге, активирует структуры ретикулярной формации, восстанавливает сознание при травматическом повреждении головного мозга (Компендиум — лекарственные препараты, 2018).

Отмечено положительное влияние холина альфосцерата на показатели функций нервной системы у пациентов с острым ишемическим поражением мозга, что подтверждает целесообразность его применения в составе базисной терапии острого ишемического инсульта. Препарат способствует уменьшению неврологического дефицита (а у значительного количества пациентов — почти полному восстановлению речи, увеличению мышечной силы и др.), ограничению роста зоны инфаркта мозга с первых суток терапии, повышению способности пациентов к самообслуживанию, что улучшает качество их жизни и позволяет снизить инвалидность (Никонов В.В. и соавт., 2013).

Оценена эффективность и безопасность применения холина альфосцерата в комбинированной терапии амбулаторных пациентов с цереброваскулярными заболеваниями (инсульт, хроническая ишемия мозга), у которых присутствовали двигательные, координационные, эмоциональные и когнитивные расстройства. Отмечено улучшение неврологической симптоматики, когнитивных и эмоциональных функций, активности и настроения у пациентов. Клинический

эффект был выше у пациентов, перенесших инсульт (Kostenko E.V. et al., 2012).

Показано, что холина альфосцерат способствует заметному улучшению когнитивных функций у пациентов с болезнью Паркинсона (Levin O.S. et al., 2009), а также улучшает память и другие когнитивные функции при болезни Альцгеймера. Так, результаты мультицентрового двойного слепого рандомизированного плацебо-контролируемого исследования свидетельствуют о клинической пользе его применения в лечении когнитивных нарушений при деменции альцгеймеровского типа легкой и умеренной степени, и при этом хорошей переносимости (De Jesus Morelo Morelo M., 2003).

Потенциальные терапевтические эффекты холина альфосцерата на когнитивные нарушения, вызванные судорогами, протестированы на животной модели, что может послужить основой для рассмотрения его в качестве средства для улучшения когнитивной функции у пациентов с эпилепсией (Lee S.H. et al., 2017).

Среди представленных на фармацевтическом рынке Украины препаратов холина альфосцерат можно отметить препарат отечественного производства Центролин (ПАО НПЦ «Борщаговский ХФЗ»), выпускаемый в форме раствора для инъекций по 1000 мг в 1 ампуле. Препарат показан к применению в острый период тяжелой черепно-мозговой травмы с преимущественно стволочным уровнем повреждения (нарушение сознания, коматозное состояние, очаговая полусферная симптоматика, симптомы повреждения ствола головного мозга); при дегенеративно-инволюционных мозговых психоорганических синдромах или вторичных последствиях цереброваскулярной недостаточности, то есть первичных и вторичных нарушениях умственной деятельности у лиц пожилого возраста, которые характеризуются нарушением памяти, спутанностью сознания, дезориентацией, снижением мотивации и инициативности, снижением способности к концентрации; при изменениях в эмоциональной сфере и сфере поведения (эмоциональная нестабильность, раздражительность, равнодушие), псевдомеланхолии у лиц пожилого возраста (Компендиум — лекарственные препараты, 2018).

Центролин характеризуется высоким качеством, гарантированным производством в соответствии с требованиями стандартов GMP (БХФЗ, 2018).

Список использованной литературы — www.umj.com.ua



Информация для профессиональной деятельности медицинских и фармацевтических работников

ЦЕНТРОЛИН. Состав: 4 мл раствора содержат холина альфосцерата 1000 мг. **Фармакотерапевтическая группа:** средства, влияющие на нервную систему. Парасимпатомиметики. **Побочные эффекты:** реакции в месте введения препарата, тревога, бессонница, тошнота и др. **Полная информация о лекарственном средстве содержится в инструкции по медицинскому применению.**