

Lipozomální vitamin C

cesta k dosažení účinných hladin



Oxidativní stres, chronický zánět a role antioxidantů

Jak ukázal moderní výzkum i klinické zkušenosti, představuje chronický zánětlivý proces základní etiopatogenetický faktor celé řady onemocnění. Na rozdíl od akutního zánětu, který představuje fyziologickou obrannou reakci organismu a končí v optimálním případě zhojením, je chronický zánět vysloveně škodlivým procesem, který může vést k závažným chorobám s fatálními následky. Jednou z častých příčin chronického zánětu je oxidativní stres, který vzniká, pokud není v organismu k dispozici dostatek antioxidantů (například vitaminu C) k odstranění přebytečných reaktivních sloučenin kyslíku (ROS, reactive oxygen species). Ke vzniku oxidativního stresu přispívá i znečištěné životní prostředí a převládající životní styl současné civilizace.

Oxidativní stres je nejen příčinou chronického zánětu, ale další ROS jsou navíc zánětem postiženými buňkami produkovány, tím je oxidativní stres prohlubován a spotřebovávány další antioxidanty. Nedostatek antioxidantů je tedy nejen příčinou, ale i důsledkem chronického zánětlivého procesu. Řada patologických stavů, včetně alergií a onkologických onemocnění, je kauzálně propojena s chronickým zánětem, oxidativním stresem a nedostatkem antioxidantů, především vitaminu C.¹⁻⁴ Mezi důležité oblasti, jejichž funkce je postižena při nedostatku antioxidantů, patří imunitní a nervový systém. Velmi častý je výskyt subklinického deficitu vitaminu C. Suplementace tohoto vitaminu proto má značný význam pro udržení fyziologických funkcí; má tedy význam preventivní, ale v situaci ohrožení oxidativním stresem i léčebný.

Účinnost vitaminu C závisí na plasmatické hladině

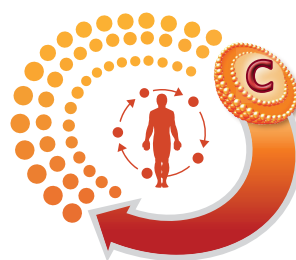
Vitamin C (kyselina askorbová) je pro lidský organismus nepostradatelná látka, potřebná nejen k zajištění řady základních metabolických

procesů a syntéze nepostradatelných látek jako je kolagen a neurotransmitery, ale navíc patří k neefektivnějším intracelulárním i extracelulárním antioxidantům. V průběhu oxidativního stresu je jeho zásoba v organismu rychle vyčerpána. Jak ukázal výzkum, k léčbě a prevenci různých patologických stavů, v jejichž etiologii hraje oxidativní stres rozhodující úlohu, je třeba zajistit relativně vysoké plasmatické hladiny vitaminu C. Je prokázáno, že zajištění dostatečně vysoké hladiny kyseliny askorbové v plasmě vede k obnově fyziologických funkcí, což má zásadní význam pro ochranu před rozvojem onemocnění, u nichž hraje roli oxidativní stres. Příkladem může být význam vysokých hladin vitaminu C pro kvalitu endotelální funkce, a tím pro ochranu před rozvojem kardiovaskulárních chorob.⁵⁻⁸ Důležitá je role dostatečně vysokých farmakologických hladin vitaminu C při zajištění funkce imunitního a nervového systému. Vysoké plasmatické hladiny vitaminu C jsou důležité i v ochraně před rozvojem onkologických onemocnění, v jejichž etiologii hraje chronický zánět důležitou roli.⁹

Potřebných plasmatických hladin ovšem nelze při perorální aplikaci běžných lékových forem dosáhnout. Vstřebávání je totiž omezeno kapacitou transportérů SVCT 1 a SVCT2 ve střevní stěně.¹¹⁻¹³ Přebytečné množství vitaminu, které se po perorálním požití nedokáže vstřebat, je během několika hodin vyloučeno stolicí. Řešením nejsou ani vysoké dávky běžných perorálních forem. Při jednorázovém požití 1000 mg klasického vitaminu C se tedy až 80 % tohoto množství vyloučí, aniž by byl organismus schopen jej využít. Navíc neabsorbovaný vitamin C může v gastrointestinálním traktu vyvolat nepříjemné zažívací nežádoucí účinky, například podráždění žaludku a průjem.

Lipozomální technologie zvyšuje vstřebávání

Je známo, že dosáhnout dostatečných plasmatických hladin v řádu milimolů je možno intravenózním infuzním podáním vysokých dávek vitaminu C.¹³ Infuzní aplikace se podává



v určité frekvenci a vyžaduje udržení plasmatických hladin v době mezi jednotlivými nitrožilními aplikacemi. Proto se hledají takové lékové formy, které by umožnily dosáhnout vyšších plasmatických hladin při perorální aplikaci, a přitom se vyhnout omezením způsobeným střevními transportéry. V tomto směru se jako perspektivní řešení jeví tzv. lipozomální forma vitaminu C, která umožňuje oproti běžným perorálním formám vstřebání vyššího podílu z podaného vitaminu C. Lipozomální technologie je jednou z nejnovějších technologií používaných ve farmaceutickém výzkumu, pomocí níž lze zvýšit biologickou dostupnost účinných látek.

Lipozomy jsou duté mikroskopické kuličky ohraničené fosfolipidovou dvouvrstvou. Fosfolipidy tvoří také buněčné membrány v lidském organismu a hrají nezastupitelnou roli v udržování fyziologického stavu

Lipozomy jsou duté mikroskopické kuličky ohraničené fosfolipidovou dvouvrstvou. Fosfolipidy tvoří také buněčné membrány v lidském organismu a hrají nezastupitelnou roli v udržování fyziologického stavu

zdravých buněk včetně jejich mitochondrií a DNA, jsou tedy látkami tělu vlastními. Podstata lipozomální technologie spočívá v naplnění lipozomálních kuliček účinnou látkou jako je v tomto případě vitamin C. Tento typ přípravků představuje velice inovativní metodu, jak dodat léčiva efektivně a v dostatečném množství do organismu. V případě vitaminu C umožňuje lipozomální forma dosáhnout dostatečně vysoké plasmatické koncentrace, schopné zabránit rozvoji oxidativnímu stresu a z něj plynoucím poruchám, například snížené funkci imunity nebo endoteliální dysfunkci. Je to umožněno tím, že lipozomální forma díky svému fosfolipidovému povrchu je vnímána střevní buňkou jako tělu vlastní a její vstřebávání není omezováno střevními transportéry jako je tomu po podání běžných perorálních forem.^{14,15} Díky tomu lze dokonce i snížit dávkování, neboť účinná látka se dostane tam, kde má skutečně působit. Díky účinnosti a mnoha výhodám, které byly prokázány při laboratorních a klinických pokusech, má dnes lipozomální technologie celou řadu využití. Její terapeutickou hodnotu potvrdilo mnoho klinických studií. K výhodám lipozomálních forem léčiv je urychlená a vyšší absorpce ze střeva, větší stabilita léčiva, ochrana střeva před potenciálně dráždivými látkami a větší biologická dostupnost účinné látky.¹⁴⁻¹⁸

Klinické studie s lipozomálním vitaminem C

Přednosti lipozomálních forem vitaminu C, pokud jde o dosažení vyšších plasmatických hladin, byly ověřovány v klinických studiích. Například ve studii, provedené v roce 2015 byla porovnávána lipozomální forma vitaminu C s tradiční perorální formou (kapsle) vitaminu C. Do studie bylo zařazeno 32 zdravých osob ve věku 21-65 let. Výsledky ukázaly, že vitamin C je v lipozomální formě absorbován v podstatně větší míře než běžná perorální forma a díky tomu je u po aplikaci lipozomální formy dosaženo signifikantně vyššího vzestupu plasmatických hladin kyseliny askorbové. Trvání zvýšených hladin je také delší u lipozomální formy než u běžných kapslí, vyšší je i u lipozomální formy i biologická dostupnost vitaminu C; z toho plyne i potenciál širší distribuce do biologických kompartmentů. Lipozomální forma byla ve studii hodnocena jako zcela bezpečná, neobjevily se žádné nežádoucí účinky.¹⁹

Tato zjištění byla potvrzena v další studii, publikované v roce 2016.²⁰ I v této studii, do které bylo zařazeno 11 zdravých osob ve věku 45 až 70 let, se ukázalo, že perorální podání lipozomálního přípravku (s obsahem srovnatelného množství vitaminu C jako běžná perorální forma) vede k dosažení vyšších plasmatických hladin. Podání lipozomálního vitaminu C umožnilo vyšší biologickou dostupnost kyseliny askorbové než běžný perorální přípravek. Autoři studie připomínají, že vyšší hladiny mohou vést nejen k účinné ochraně tkání před oxidačním stresem a chorobami, které vznikají na podkladě chronického zánětu, ale i ke zlepšení ostatních procesů, v jejichž fyziologickém prů-

běhu hraje roli vitamin C. Uvádějí jako příklad syntézu katecholaminů, kolagenu, podporu absorpce železa. Navíc podle autorů samotné fosfolipidy obsažené ve stěně lipozomálních částic mohou mít příznivé účinky. Jako příklad uvádějí například působení fosfatidylcholinu proti progresi demence.²¹⁻²³

Přípravek Lipo-C-Askor

Na trhu v ČR je nyní dostupná nová lipozomální forma vitaminu C - tobolky Lipo-C-Askor. S použitím inovativní technologie je v tomto přípravku vitamin C obalen vrstvou přírodních fosfolipidů. V průběhu vstřebávání ze střeva tato fosfolipidová vrstva poskytuje vitaminu C ochranný kryt a oproti běžným perorálním formám umožňuje dokonalejší absorpci kyseliny askorbové, dosažení vyšších plasmatických hladin a díky vyšší biologické dostupnosti i větší využití v cílových tkáních, např. v imunitním a nervovém systému. Vitamin C obsažený v přípravku Lipo-C-Askor se tak optimálně zužitkuje a dokáže zajistit vysokou hladinu vitaminu C v organismu na delší dobu. Díky efektivní absorpci je zároveň šetrný k zažívacímu ústrojí.

Vitamin C má celou řadu prospěšných účinků, např. přispívá k normální funkci imunitního systému, k ochraně buněk proti oxidačnímu stresu, jehož nežádoucí nadbytek poškozuje zdravé buňky, ke snížení míry únavy a vyčerpání, k normálnímu fungování nervového systému a udržování normálních psychologických funkcí, k normálním procesům energetického metabolismu, k normální tvorbě kolagenu, jež je důležitý pro hojení a pevnost tkání (cévy, chrupavky, kosti, kůže, vlasy ad.).

1 tobolka přípravku Lipo-C-Askor obsahuje v liposomálním obalu kromě 300 mg vitaminu C ještě přírodní účinné látky, jako je výtáček ze šípků a bioflavonoidy z citrusových plodů. Přípravek neobsahuje žádná umělá barviva, aroma, konzervanty nebo geneticky modifikované složky, které by pro organismus mohly představovat zátěž. Doporučená denní dávka je u dospělých 1 až 4 tobolky, u dětí starších 6 let 1 až 2 tobolky.



doplňk stravy

MUDr. Pavel Kostiuk, CSc.
EdukaFarm, Praha

LITERATURA

1. Lunec J, Blake DR. The determination of dehydroascorbic acid and ascorbic acid in the serum and synovial fluid of patients with rheumatoid arthritis (RA). *Free Radic Res Commun* 1985;1:31-39.
2. Shanmugasundaram K, Kumar S, et al. Excessive free radical generation in the blood of children suffering from asthma. *Clinica Chimica Acta* 2001;305:107-114.
3. Long CL, Maull KI, et al. Ascorbic acid dynamics in the seriously ill and injured. *J Surg Res* 2003;109:144-148.
4. Frikke-Schmidt H, Lykkesfeldt J. Role of marginal vitamin C deficiency in atherogenesis: in vivo models and clinical studies. *Basic Clin Pharmacol Toxicol* 2009;104:419-433.
5. Eskurza I, Monahan KD, Robinson JA, et al. Effect of acute and chronic ascorbic acid on flow-mediated dilation with sedentary and physically active human ageing. *J Physiol* 2004;556(pt 1):315-324.
6. Hirashima O, Kawano H, Motoyama T, et al. Improvement of endothelial function and insulin sensitivity with vitamin C in patients with coronary spastic angina: possible role of reactive oxygen species. *J Am Coll Cardiol* 2000;35:1860-1866.
7. Ling L, Zhao SP, Gao M, Zhou QC, Li YL, Xia B. Vitamin C preserves endothelial function in patients with coronary heart disease after a high-fat meal. *Clin Cardiol* 2002;25:219-224.
8. Taddei S, Virdis A, Ghiadoni L, et al. Vitamin C improves endothelium-dependent vasodilation by restoring nitric oxide activity in essential hypertension. *Circulation* 1998;97:2222-2229.
9. Mikirova N, Casciarri J, Rogers A, et al. Effect of high-dose intravenous vitamin C on inflammation in cancer patients. *J Transl Med* 2012;10:189.
10. Levine M, Padayatty SJ, Espey MG. Vitamin C - a concentration-function approach yields pharmacology and therapeutic discoveries. *Adv Nutr* 2011;2:78-88.

další literatura u autora