

Neo sleep supplement – doplněk stravy ve formě orálně rozpustných minitablet obsahujících melatonin se zvýšenou rozpustností a biodostupností

Výhody produktu

- Neo sleep supplement obsahuje účinnou kombinaci tělu rychle dostupného melatoninu pro rychlý nástup spánku a vybraných aktivních látek pro zlepšení kvality spánku
- Díky pokrokové lékové formě, **tabletám rozpustných v ústech (ODT)**, poskytuje přípravek vysoký uživatelský komfort a zajišťuje rychlé uvolnění a vstřebání melatoninu. Tyto vlastnosti jsou silným předpokladem pro vysokou biodostupnost melatoninu a jeho plnohodnotný účinek.
- Za pomoci inovativního postupu **bylo docíleno rychlého uvolnění nejméně 85 % aktivní látky melatoninu z tablety do 30 sekund, zatímco** u komerčně dostupných produktů se uvolní pouhé 1-2 % této aktivní látky ve srovnatelné době. Došlo také k **nárůstu buněčné absorpce melatoninu o více než 50% a zvýšení jeho rozpustnosti o více než 100 % v porovnání s konkurenčními produkty.**
- Přípravek obsahuje také rostlinné extrakty standardizované na látky **5-hydroxytryptofan, L-theanin, extrakt z magnolie standardizovaný na obsah magnololu, a B-komplex**, které synergicky podporují účinky melatoninu, preventivně přispívají ke kvalitnímu spánku a navíc působí proti nežádoucímu probouzení během noci.
- U Neo sleep supplement jsou aktivní látky absorbovány a vstřebávány již v dutině ústní a horní části jícnu, průchodu játry se vyhýbají. Tímto je dosaženo **mnohonásobného zvýšení účinnosti i při malých dávkách. Pokud jsou aktivní složky podány v klasické tabletě**, procházejí trávicím traktem a následně játry, přičemž jsou z velké části odbourány či přeměněny na neúčinné látky – tím se **snižuje účinnost podané dávky.**

Popis produktu

- Založeno na **přírodních materiálech** – Neo sleep supplement obsahuje pouze látky přírodního původu
- **Uživatelsky přívětivá forma** – minitableta (průměr 4 mm) se rozpuští v ústech do 30 sekund, bez potřeby zapíjet vodou
- Produkt je bezpečný a nenávykový, nezpůsobuje závislost a ranní malátnost
- Doporučené dávkování – 1 tabletu těsně před spaním nechat rozpustit v ústech
- Vhodné také pro vegany a vegetariány

Vědecká studie (18. 12. 2017)

V rámci výzkumně vývojové spolupráce mezi společností mcePharma s.r.o., první lékařskou fakultou Univerzity Karlovy a její Biotechnologickým a biomedicínským centrem Akademie věd a Univerzity Karlovy ve Vestci (Biocev), bylo dosaženo zvýšené rozpustnosti a buněčné absorpce melatoninu, jako aktivní látky, a to za účelem inkorporace do v ústech rozpustných tablet (ODT) pro rychlé navození spánku.

Melatonin, jehož systematický název zní 5-N-acetyltryptamin, je hormon produkován epifýzou (částí mozku). Tento hormon zastává důležité funkce při řízení rytmů dne a noci. Hladiny melatoninu v těle jsou závislé na střídání světla a tmy, právě proto je jeho produkce největší během tmy, naopak během dne je tvorba melatoninu blokována. Melatoninu jsou přisuzovány tyto účinky:

- Mírnění či potlačení subjektivního pocitu únavy v důsledku časového posunu ^{1, 2},
- Zkrácení doby nutné pro usnutí a omezení probouzení během spánkového cyklu ^{3, 4, 5, 6}
- Zlepšuje kvalitu spánku ⁷.

Pro podpoření účinku melatoninu na usínání a kvalitu spánku byly do formulace rovněž zařazeny podpůrné aktivní látky, které preventivně přispívají ke kondici nervového systému, psychickému uvolnění, a rovněž preventivně zabraňují úzkosti (Tabulka 1).

Tabulka 1: aktivní látky a jejich účinek^{8, 9, 1, 11, 12}

Látka	Obsah v tabletě (mg)	Účinek	
Melatonin	3,0	Rychlý nástup spánku	
5-hydroxytryptofan (5-HTP)	2,0	Obnovení zásob serotoninu	
L-theanin	2,0	Uvolnění a předcházení úzkosti	
Magnolol	1,0	Uvolnění a předcházení úzkosti	
B-komplex	Vitamin B1	0,3	Lepší kondice nervového systému
	Vitamin B2	0,4	
	Vitamin B6	0,4	
	Vitamin B12	0,001	

U lidí je 90 % perorálně podaného melatoninu odbouráno již při prvním průchodu játry, čímž se velmi snižuje účinnost podané dávky¹³.

Zabránění tohoto nežádoucího jevu bylo docíleno pomocí sofistikovaného postupu, který zahrnuje tvorbu inkluzního komplexu s melatoninem již v pevné fázi v kombinaci s ODT. Důsledkem toho je dosaženo zvýšené rozpustnosti melatoninu a jeho zrychlené uvolňování již v ústech, kde se jej vstřebává většina. Cílem experimentů bylo prokázání zrychleného uvolňování melatoninu z Neo sleep supplement a zvýšená absorpce uvolněného melatoninu buněčnými kulturami v porovnání s konkurenčními produkty A a B.

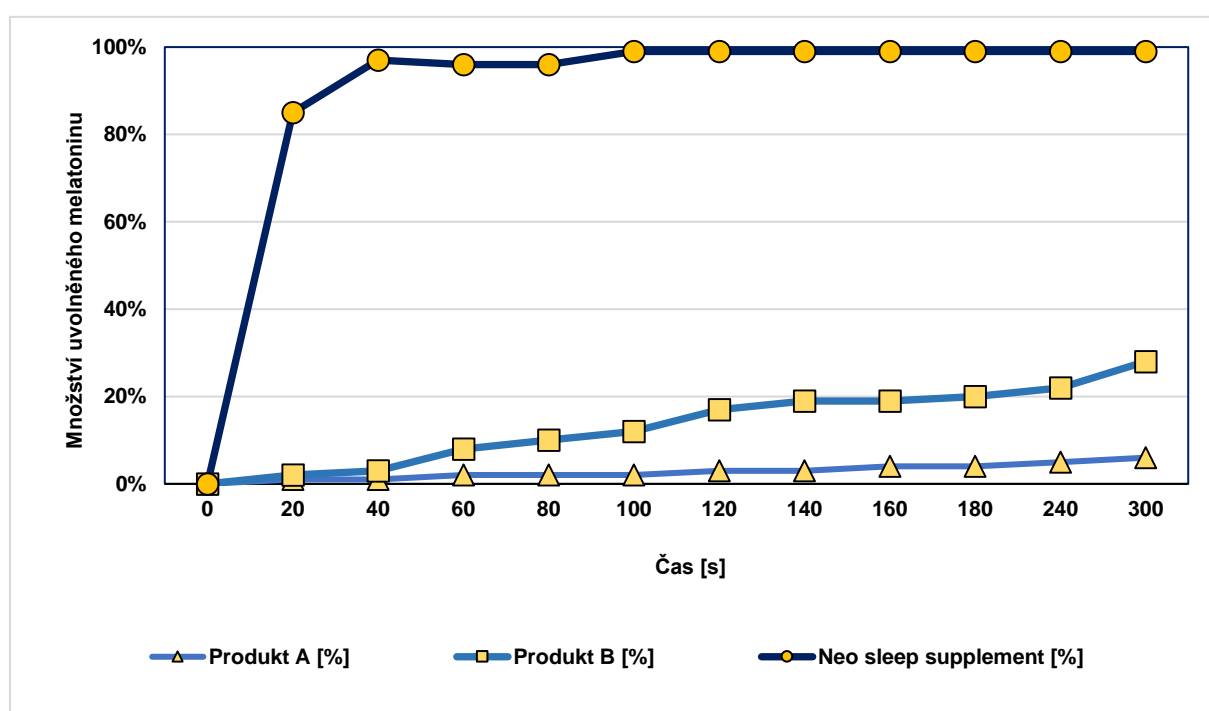
Jedním z problémů, spojených s užíváním melatoninu, je jeho nedostatečná rozpustnost. Tu lze zvýšit tvorbou komplexů s vhodnou látkou. Vznik těchto komplexů se řídí stechiometrickými poměry aktivní látky, v našem případě melatoninu, a komplexotvorné sloučeniny. Při následném styku s tělesnou tekutinou se melatonin z tohoto komplexu uvolňuje. Ve farmaceutickém průmyslu se nejčastěji využívají inkluzní komplexy a cheláty. Tento postup je možné využít i při úpravě rozpustnosti melatoninu.

V rámci vědecké studie byly studovány následující parametry:

1. Porovnání rychlosti uvolňování aktivní látky melatoninu

Postup: Cílem tohoto experimentu bylo mezi sebou porovnat uvolňování melatoninu ze 3 konkurenčních produktů s rovnocennou koncentrací melatoninu (3 mg melatoninu na tabletu) analytickou metodou HPLC-MS (vysoce účinná kapalinová chromatografie s následným vyhodnocením pomocí hmotnostní spektrometrie).

Výsledky: U produktu Neo sleep supplement dochází k uvolnění nejméně 85 % melatoninu do 30 vteřin po podání, zatímco u komerčně dostupných produktů se uvolní pouze 1-2 % této aktivní látky. (Obrázek 4)

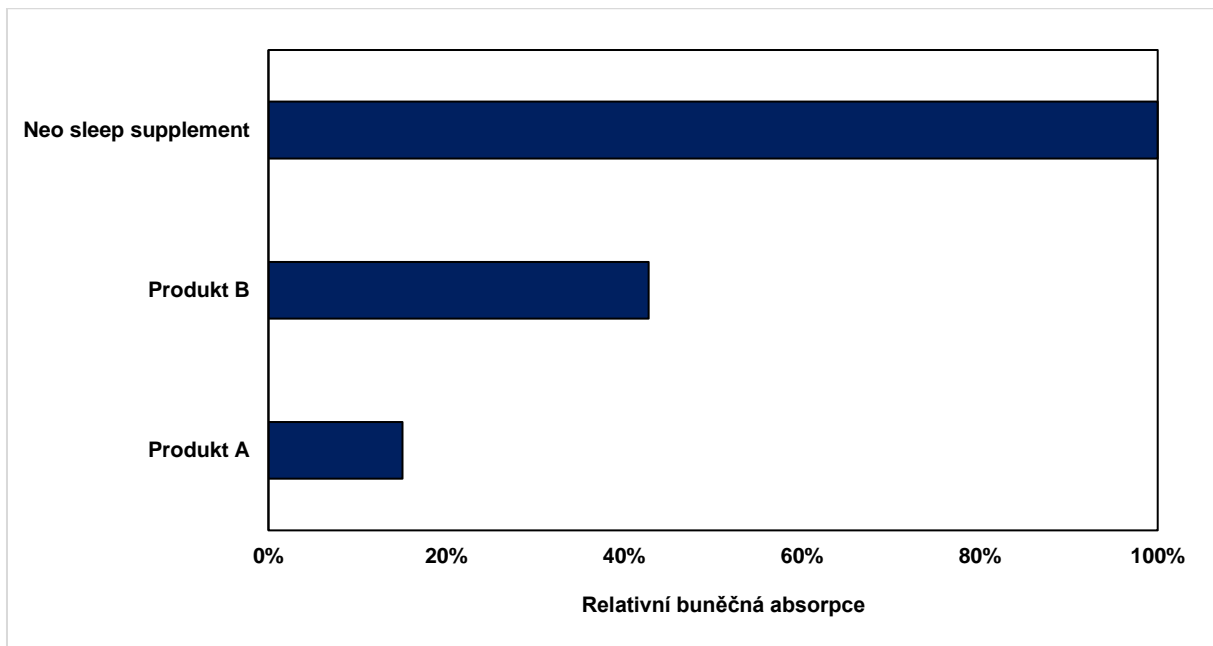


Obrázek 1: Relativní procentuální uvolnění melatoninu do roztoku, kritérium = max. 3 mg melatoninu/tableta. U produktu Neo sleep supplement dochází k uvolnění nejméně 85 % melatoninu do 30 vteřin po podání.

2. Zvýšená absorpce do živých buněk myšího karcinomu prsu

Postup: Cílem tohoto experimentu bylo zhodnotit buněčnou absorpci melatoninu u 3 konkurenčních produktů s rovnocennou koncentrací melatoninu (3 mg melatoninu na tabletu). V rámci experimentu byla změřena intenzita fluorescence buněčných kultur po 30 minutách inkubace s jednotlivými melatoninovými formulacemi. Intenzita fluorescence je vypočtena ze čtyř bodů na základě intenzity modré barvy v objektu vůči okolí.

Výsledky: Při porovnání intenzity fluorescence produktu Neo sleep supplement (C) se vzorky produktu A a B, bylo zjištěno, že dochází k nárůstu intenzity až o více než 50%. (Obrázek 5 a 6)



Obrázek 5: Porovnání relativní buněčné absorpce u kultur buněk myšního karcinomu prsu po inkubaci s konkurenčními produkty A a B a Neo sleep supplement. Neo sleep supplement vykazuje v porovnání s konkurenčními produkty až 50% nárůst relativní buněčné absorpce melatoninu.



Obrázek 6: Snímky buněčných kultur naočkovaných produkty A, B obsahujícími melatonin a Neo sleep supplement. Melatonin z produktů A a B proniká do buněk v daleko menší míře. Melatonin z Neo sleep supplement je ve větší míře absorbován buňkami. (zdroj: BIOCEV)

Shrnutí:

- Neo sleep supplement byl vyvinut v rámci vědecko-výzkumné spolupráce mezi mcePharma s.r.o a první lékařskou fakultou Univerzity Karlovy a její Biotechnologickým a biomedicínským centrem Akademie věd a Univerzity Karlovy ve Vestci (Biocev)
- Neo sleep supplement je inovativní přípravek přispívající k rychlého nástupu spánku, k zlepšení kvality spánku, a k podpoře nepřerušovaného spánku
- Obsahuje melatonin a synergicky působící složky 5-hydroxytryptofan, L-theanin, standardizovaný extrakt z magnolie a vitamíny B-komplexu. Ty dále přispívají k snížení míry únavy a vyčerpání, k normální psychické činnosti a normální činnosti nervové soustavy
- Za pomoci inovativního postupu bylo docíleno rychlého uvolnění nejméně 85 % melatoninu z tablety do 30 sekund, zatímco u komerčně dostupných produktů se uvolní pouhé 1-2 % této aktivní látky ve srovnatelné době.
- Rovněž bylo docíleno **nárůstu buněčné absorpce melatoninu o více než 50 % a zvýšení jeho rozpustnosti o více než 100 %** v porovnání s klasickými produkty obsahujícími melatonin.
- Produkt je ve formě **orálně rozpustných tablet (ODT)** zajišťujících uživatelský komfort, rychlé uvolnění a vstřebání melatoninu se zvýšenou buněčnou absorpcí. Tyto vlastnosti jsou silným předpokladem pro vysokou biodostupnost melatoninu a jeho plnohodnotný účinek.
- V případě Neo sleep supplement jsou aktivní složky absorbovány a vstřebávány již v dutině ústní a horní části jícnu, a tím se vyhýbají průchodu játry. Nejsou tedy z velké části odbourány či přeměněny na neúčinné látky. Tím se oproti **konkurenčním přípravkům zvyšuje účinnost podané dávky.**

Publikováno 20. prosince 2017 ve spolupráci


mcePharma s.r.o.
Budovatelská 1178/35
743 01 Bílovec
Česká republika

BIOCEV, 1. LF UK, Univerzita Karlova
Kateřinská 1660/32,
Praha 2, 121 08
Česká republika

Zastoupeno:


.....
Ing. Ivan Mikeš, CSc.,
(jednatel)

Zastoupeno:


.....
prof. RNDr. Vladimír Král,
Ph.D., DSc. (Vedoucí projektu)

www.mcepharma.com

Kontakt: sales@mcepharma.com

Literatura:

1. Herxheimer, A., et al.: Melatonin for the prevention and treatment of jet lag. *Cochrane Database Syst Rev.*, (2), 2002.
2. van Geijlswijk, I. M., et al.: Evaluation of sleep, puberty and mental health in children with long-term melatonin treatment for chronic idiopathic childhood sleep onset insomnia. *Psychopharmacol.*, 216, (1), 2011, 111-120.
3. Wade, A., G., et al.: Prolonged release melatonin in the treatment of primary insomnia: evaluation of the age cut-off for short- and long-term response. *Curr. Med. Res. Opin.*, 27, (1), 2011, 87-98.
4. Lemoine, P., et al.: Prolonged-release melatonin improves sleep quality and morning alertness in insomnia patients aged 55 years and older and has no withdrawal effects. *J Sleep Res.*, 16, (4), 2007, 372-380.
5. Arendt, J., et al.: Efficacy of Melatonin Treatment in Jet Lag, Shift Work, and Blindness. *J. Biol. Rhythms.*, 12, (6), 1997, 604-617.
6. Petrie, K., et al.: A double-blind trial of melatonin as a treatment for jet lag in international cabin crew. *Biol Psychiatry.*, 33, (7), 1993, 526-530.
7. Luthringer R, et al.: The effect of prolonged-release melatonin on sleep measures and psychomotor performance in elderly patients with insomnia. *Int. Clin. Psychopharmacol.*, 14, (5), 2009, 239 – 249.
8. Buscemi, N., et al.: Melatonin for treatment of sleep disorders. *Evidence Report/Technology Assessment (Summary)* (108), 2004, 1–7.
9. Song, C., H., et al.: Effects of Theanine on the Release of Brain Alpha Wave in Adult Males. *Korean J. Nutr.* 36, (9), 2003, 918-923.
10. Ritsner, M. S., et al.: L-theanine relieves positive, activation, and anxiety symptoms in patients with schizophrenia and schizoaffective disorder: an 8-week, randomized, double-blind, placebo-controlled, 2-center study. *J. Clin. Psychiatry.*, 72, (1), 2011, 34-42.
11. Kuribara, H., et al.: The anxiolytic effect of two oriental herbal drugs in Japan attributed to honokiol from magnolia bark. *J. Pharm. Pharmacol.*, 52, (11), 2000, 1425-1429.
12. Nakazawa, T., et al: Metabolites of orally administered *Magnolia officinalis* extract in rats and man and its antidepressant-like effects in mice. *J. Pharm. Pharmacol.*, 55, (11), 2003, 1583-1591.
13. Carnevale, G., et al.: Anxiolytic-like effect of *Griffonia simplicifolia* Baill. seed extract in rats. *Phytomedicine.*, 18, (10), 2011, 848-851.