



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **105903**

(13) **U**

(51) МПК

**A61K 36/53** (2006.01)

**A61P 25/20** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ**

(21) Номер заявки: **u 2015 09399**

(22) Дата подання заявки: **30.09.2015**

(24) Дата, з якої є чинними  
права на корисну  
модель: **11.04.2016**

(46) Публікація відомостей  
про видачу патенту: **11.04.2016, Бюл.№ 7**

(72) Винахідник(и):

**Гончаров Олександр Володимирович**  
**(UA),**

**Ковальова Алла Михайлівна (UA),**

**Кошовий Олег Миколайович (UA),**

**Штриголь Сергій Юрійович (UA),**

**Ільїна Тетяна Василівна (UA),**

**Очкур Олександр Васильович (UA),**

**Юрченко Наталія Сергіївна (UA),**

**Осьмачко Аліна Петрівна (UA)**

(73) Власник(и):

**НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ**  
**УНІВЕРСИТЕТ,**

**вул. Пушкінська, 53, м. Харків, 61002 (UA)**

**(54) ЛІКУВАЛЬНО-ПРОФІЛАКТИЧНИЙ ЗАСІБ ІЗ СЕДАТИВНОЮ ДІЄЮ**

(57) Реферат:

Лікувально-профілактичний засіб, що проявляє седативну дію, у вигляді сухого екстракту глухої кропиви білої (*Lamium album* L.).

**UA 105903 U**



Корисна модель належить до фармації та медицини, а саме до лікувально-профілактичних засобів рослинного походження, які проявляють седативну дію.

Несприятливі соціально-економічні умови та прискорення темпу життя спричиняють неухильне зростання кількості тривожних розладів і психосоматичних захворювань. Результати епідеміологічних досліджень свідчать про високу (до 76 %) поширеність серед пацієнтів субклінічних тривожних розладів, корекція яких є важливою складовою лікування хворого з соматичною патологією.

Практичний інтерес мають препарати на основі лікарської рослинної сировини, що містять комплекс біологічно активних речовин, з більшою терапевтичною широтою дії порівняно з синтетичними аналогами. Седативні препарати рослинного походження не викликають міорелаксації, атаксії, сонливості, психічної та фізичної залежності, регулюють вплив на центральну нервову систему (ЦНС), посилюють процеси гальмування і знижують процеси збудження тощо.

Традиційно в медичній практиці для профілактики та лікування тривожних розладів застосовуються седативні засоби у вигляді спиртових або водно-спиртових настоек, такі як настойка собачої кропиви (пустирника), настойка півонії, настойка валеріани [1, 2, 3]. Проте усім спиртовмісним препаратам притаманний значний недолік - обмеження до використання в дитячому віці, вагітним жінкам та жінкам, які годують груддю, водіям та іншим особам, яким протипоказана пригнічувальна дія на ЦНС, особам, що відвикають від алкогольної залежності тощо. Крім того, при сумісному використанні низки лікарських препаратів із спиртовмісними лікарськими засобами виникає небезпечна можливість потенціювання етанолом пригнічувальної дії. До того ж, етанол не є фармакологічно індиферентною речовиною [4].

Відомі препарати седативної дії на основі сухих екстрактів, такі як таблетки валеріани [5], собачої кропиви [6], сухий екстракт пасифлори [7], сухий екстракт плодів унабі [8]. Недоліком таблетованих препаратів є те, що вони містять моно- та дисахариди (глюкозу, сахарозу, лактозу), тому їх не слід застосовувати пацієнтам із спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом мальабсорбції глюкози-галактози, а також хворим на цукровий діабет.

Задачею корисної моделі є пошук і створення нового лікувально-профілактичного засобу, що володіє достовірною седативною активністю, на основі доступної рослинної сировини, який можна одержати за простою технологією.

Поставлена задача вирішується таким чином, що лікувально-профілактичний засіб седативної дії у відповідності до корисної моделі містить сухий екстракт трави глухої кропиви білої (*Lamium album* L.).

Глуха кропива біла (*Lamium album* L.) - багаторічна трав'яниста рослина родини глухокропивні (*Lamiaceae*), яка має достатню сировинну базу на території України, містить флавоноїди, алкалоїди, іридоїди та ефірну олію, широко використовується в народній медицині багатьох країн як кровоспинний засіб, особливо при легневих і маткових кровотечах, при хворобах сечовивідних шляхів, місцево - при захворюваннях шкіри, екземі, золотусі [9].

Винахідниками вперше досліджено седативну активність екстракту глухої кропиви білої.

Заявлений екстракт отримують методом мацерації 70 % спиртом етиловим у співвідношенні сировина - екстрагент 1:10-1:12 при температурі 25 °С, проводячи екстракцію тричі тривалістю по 48 годин. Одержані спиртові витяги об'єднують, упарюють при 55-60 °С і тиску 80-85 кПа і висушують при 60-65 °С і тиску 80-85 кПа у вакуум-циркуляційному апараті.

Даний спосіб отримання забезпечує достатню екстракцію БАР (фенолкарбонові та гідроксикоричні кислоти, флавоноїди, іридоїди, амінокислоти, цукри), мінімальний час упарювання та сушіння і дозволяє отримувати екстракт на стандартному обладнанні.

Отриманий сухий екстракт - дрібнодисперсний аморфний порошок темно-коричневого кольору, з гірким смаком та специфічним запахом, добре розчинний у воді, 50 % і 70 % етиловому спирті, мало розчинний у 96 % етиловому спирті, практично нерозчинний у хлороформі та етилацетаті.

Корисна модель ілюструється прикладом.

Приклад. Седативну активність сухого екстракту трави глухої кропиви білої досліджували в умовах скринінгового тесту "відкритого поля". Як препарат порівняння використовували сироп "Алора" (Нобелфарма Ілач Санаї Ве Тіджарет А.Ш., Туреччина, серія 3AE0010A), що містить екстракт пасифлори інкарнатної (*Passiflora incarnata*), який володіє седативною активністю [10]. Експерименти виконували на білих рандомбрендних мишах-самцях масою 14-21 г. Тварин розподілили на 4 групи (по 6 у кожній) наступним чином: перша група - інтактні миші (контроль), яким вводили внутрішньошлунково (в/ш) 0,9 % розчин натрію хлориду; друга група тварин отримувала сироп "Алора" в/ш у дозі 375 мг/кг у перерахунку на рідкий екстракт пасифлори;

тваринам третьої та четвертої груп вводили водний розчин сухого екстракту трави глухої кропиви білої в/ш у дозі 10 мг/кг та 100 мг/кг відповідно в профілактичному режимі протягом 6 днів та за 20 хвилин до проведення тесту.

5 Спостереження за тваринами у "відкритому полі" відбувалось в один і той же час доби за однакових умов. Час експозиції кожної тварини у "відкритому полі" становив 3 хвилини. В індивідуальній поведінці тварин реєстрували наступні поведінкові акти: горизонтальну (локомоторну) активність, вертикальну активність, дослідницьку активність, грумінг [11].

10 Статистичну обробку результатів проводили з використанням методів варіаційної статистики. Достовірність міжгрупових відмінностей визначали за допомогою t-критерію Ст'юдента.

Результати досліджень наведено у таблиці 1.

Таблиця 1

Вивчення седативної дії сухого екстракту трави глухої кропиви білої в умовах скринінгового тесту "відкритого поля"

Показники	Контроль	Алора, сироп	Заявлений засіб (10 мг/кг)	Заявлений засіб (100 мг/кг)
Локомоторна активність (кількість квадратів)	75,67±10,94	54,33±10,29	76,50±9,31	51,50±6,70
Орієнтовно-дослідницька активність:				
- стійки	23,17±3,60	12,50±1,14*	12,50±2,78*	5,00±1,63*
- отвори	39,33±2,78	31,17±7,20	44,67±3,60	29,50±3,60
- сума	62,5±2,29	43,67±7,52*	47,17±6,05	31,17±4,9*
Емоційні реакції:				
- болюси	1,33±0,16	2,00±0,98	1,33±0,65	0,33±0,16*
- уринації	0,5±0,16	0,00±0,00	0,50±0,16	0,67±0,16
- грумінг	2,0±0,65	2,33±1,31	0,83±0,49	1,50±0,82
- сума	3,83±0,49	5,0±1,31	2,67±0,82	2,50±0,98
Сума всіх видів активності	140,33±13,56	103,0±18,6	136,33±14,54	90,17±11,27*

Примітки: \* - відхилення вірогідні порівняно з контрольною групою,  $p < 0,05$ .

15 Сухий екстракт глухої кропиви в дозі 100 мг/кг, а також референс-препарат пасифлори у дозі 375 мг/кг після однократного введення зумовлюють виражений психоседативний ефект, що проявляється у зниженні локомоторної та орієнтовно-дослідницької активності на 35,7 % та 26,6 % відповідно. Пригнічувальна дія на ЦНС більш виражена для екстракту глухої кропиви білої, ніж для препарату порівняння.

20 Відмінною рисою екстракту глухої кропиви у дозі 100 мг/кг є виражене зниження вегетативного супроводу емоційної реакції (зниження кількості актів дефекації, уринацій і грумінгу в 2 рази). Це свідчить про те, що заявлений засіб виявляє стреспротективну дію та може бути використаний для корекції перебігу захворювань, у патогенезі яких суттєву роль відіграє нейрогенний вплив (артеріальна гіпертензія, ішемічна хвороба серця, виразкова хвороба шлунку та ін.).

25 Таким чином, заявлено новий лікувально-профілактичний засіб у вигляді сухого екстракту з трави глухої кропиви білої. Засіб має більш виражену седативну дію у порівнянні з референтним препаратом (сироп "Алора") і може бути ефективно використаний при лікуванні дисфункції вегетативної нервової системи, неврозів з підвищеною дратівливістю та збудливістю, безсоння, нейроциркуляторної дистонії, ранньої стадії гіпертонічної хвороби та низки інших станів, пов'язаних з нейровегетативними розладами. Заявлений екстракт

30 одержують за простою технологією з використанням стандартного обладнання. Наведені результати дають підставу вважати, що клінічне використання заявленого засобу дозволить отримати препарат, що виявляє вибірково седативний вплив на ЦНС, та розширити контингент пацієнтів за рахунок категорій, яким протипоказані спирто- та цукровмісні лікарські

35 препарати.

Джерела інформації:

1. Інструкція для медичного застосування лікарського засобу Пустирника настойка [Електронний ресурс]. Режим доступу: <http://mozdocs.kiev.ua/likiview.php?id=2674>.
2. Інструкція для медичного застосування лікарського засобу Півонії настойка [Електронний ресурс]. Режим доступу: <http://mozdocs.kiev.ua/likiview.php?id=35672>.
3. Інструкція для медичного застосування лікарського засобу Валеріани настойка [Електронний ресурс]. Режим доступу: <http://mozdocs.kiev.ua/likiview.php?id=32942>.
4. Клиническая фармакология: национальное руководство / Под ред. Ю.Б. Белоусова, В.Г. Кукеса, В.К. Лепахина, В.И. Петрова. - М.: ГЭОТАР-МЕДИА, 2009. - С. 177-180.
5. Інструкція для медичного застосування лікарського засобу Валеріана Форте [Електронний ресурс]. Режим доступу: <http://mozdocs.kiev.ua/likiview.php?id=36607>.
6. Патент 97049, UA. МПК (2006.1) A61P 25/20, A61K 36/533, A61K 9/14, A61K 47/26. Лікувально-профілактичний засіб із седативною дією. - З. № а201013223; Заявл. 08.11.2010; Опубл. 26.12.2011, Бюл. № 24.
7. Патент 86862, UA. МПК (2014.1) A61K 31/00, A61K 36/00. Тверда лікарська форма препарату седативної та снодійної дії. - З. № u201309546; Заявл. 30.07.2013; Опубл. 10.01.2014, Бюл. № 1.
8. Патент 82229, UA. МПК (2006.1) A61K 35/66. Засіб із седативною та ноотропною активністю. - З. № u201301779; Заявл. 13.02.2013; Опубл. 25.07.2013, Бюл. № 14.
9. Yalcin, F.N. Ethnobotany, pharmacology and phytochemistry of the genus *Lamium* (Lamiaceae) scientific review / Funda N. Yalcin, Duyugu Kaya // *Fabad J. Pharm. Sci.* - 2006. - Vol. 31. - P. 43-52.
10. Burkard W., Kopp B., Krenn L. et al. Receptor binding studies in the CNS with extracts of *Passiflora incarnata* // *Pharm. Pharmacol. Lett.* - 1997. - Vol. 7. - P. 25-26.
11. Доклінічні дослідження лікарських засобів: методичні рекомендації / за редакцією членкор. АМН України О.В. Стефанова. - К.: Авіцена, 2001. - С. 74-97.

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

Лікувально-профілактичний засіб, що проявляє седативну дію, у вигляді сухого екстракту глухої кропиви білої (*Lamium album* L.).

---

Комп'ютерна верстка А. Крулевський

---

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

---

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601