



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 45472

(13) C2

(51) 6 A61K35/78

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ЛІКУВАЛЬНО-ПРОФІЛАКТИЧНИЙ ЗАСІБ З ЛИСТЯ ГОРІХА ВОЛОСЬКОГО, ЩО МАЄ РАНОЗАГОЮВАЛЬНУ ТА АНТИМІКРОБНУ ДІЮ

1

(21) 99052779

(22) 20 05 1999

(24) 15 04 2002

(46) 15 04 2002, Бюл. № 4, 2002 р.

(72) Башура Олександр Геннадійович, Глушко Сергій Миколайович

(73) Башура Олександр Геннадійович, Глушко Сергій Миколайович

(56) RU 2020949 C1, 1994

RU 2038093 C1, 1995

RU 2106873 C1, 1998

RU 2106874 C1, 1998

2

RU 2106875 C1, 1998

(57) 1 Лікувально-профілактичний засіб, що має ранозагоювальну і антимікробну дію, на основі спиртового екстракту з листя горіха волоського, який відрізняється тим, що він містить рідкий або густий, або сухий екстракт, одержаний шляхом екстракції сировини 35-45% спиртом етиловим, з вмістом екстрактивних речовин не менше 3 мас. %

2 Лікувально-профілактичний засіб за п. 1, який відрізняється тим, що він виконаний у вигляді таблеток, капсул, мазей, супозиторіїв, кремів та гелів

Винахід відноситься до медицини та хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема до створення, виробництва та застосування лікувально-профілактичних засобів з рослинної сировини.

Відомий ранозагоювальний та протизапальний засіб "Екстракт фон Шперлінга", який вміщує подрібнену деревину хвойних рослин та/або ліпи, та/або стеблин злакових, сечовину та воду. Екстракт одержують в герметичних умовах шляхом обробки рослинної клітковини сечовиною в водному середовищі з витриманням при температурі 80 - 100°C на протязі 48 - 95 год. Застосовують у формі рідкого або сухого екстракту (1).

Відомий засіб, що має антимікробну активність і вміщує водний екстракт суміші кореневищ та коренів родовика лікарського, листя шавлії лікарської, листя подорожника великого, листя підбілу звичайного, трави деревію звичайного (2).

Відомий засіб, що має регенерувальну, цитопротективну та інгібуючу активність і вміщує суміш екстрактів листя горіха грецького, квітів нагідків лікарських та коренів жовтозілля лікарського. Суміш екстрактів розводять льняною олією (3).

Відомий антимікробний та антисептичний засіб на основі екстракту з листя евкаліпта і спирту етилового, вміст якого у засобі повинен бути не менше 65% (4).

Відомий засіб для лікування екземи, що вміщує екстракт з листя горіха грецького, канаміцину моносульфат та ланолін (5).

Відомий засіб "Хлорофілліт", що має антимікробну та ранозагоюючу дію. Вміщує суміш хлорофілів, здобуту з листя евкаліпта. Застосовується у формі 1% спиртового або 2% масляного розчину при лікуванні опіків та трофічних виразок, при пневкопичних захворюваннях, при носійстві стафілококів в кишечнику (6).

Найбільш близьким до заявляемого є ранозагоювальний та антимікробний засіб з листя горіха волоського форми сухого екстракту, який одержують шляхом багаторазової екстракції сировини 70 - 80% спиртом етиловим з подальшою його очищенням та упарюванням (7).

До недоліків прототипу та аналогів слід віднести недостатньо широкий спектр специфічної активності, наявність побічних негативних ефектів, протипоказання до застосування.

В основу винаходу поставлено завдання створення нового лікувально-профілактичного засобу з листя горіха волоського широкого спектра дії - ранозагоювальної, антимікробної, протизапальної, противиразкової, антиоксидантної, без побічних негативних ефектів, без протипоказань до застосування.

Поставлене завдання вирішується тим, що лікувально-профілактичний засіб, що має ранозагоювальну антимікробну дію, на основі спиртового екстракту з листя горіха волоського у відповідності з винаходом містить рідкий або густий, або сухий екстракт з листя горіха грецького, одержаний шля-

(13) C2

(11) 45472

(19) UA

хом екстракції сировини 35 - 45% спиртом етиловим, з вмістом екстрактивних речовин не менше 3мас %, причому його виконано у вигляді таблеток, капсул, мазей, супозиторіїв, кремів та гелів

Технічний результат, який отримують при здійсненні винаходу, полягає у створенні нового лікувально-профілактичного засобу з листя горіха волоського широкого спектра дії, без побічних негативних ефектів, без протипоказань до застосування

Наводимо конкретні приклади здійснення засобу

Приклад 1 Заявляємий засіб одержують таким чином В екстракторі 200кг листя горіха грецького замочують в 200л 35% спирту етилового (1 1) і настоюють протягом 2год Набухлу сировину заливають 400л 35% спирту етилового (1 2) і екстрагують методом настоювання протягом 48год, після чого одержаний спиртовий екстракт зливають у збірник Сировину знову заливають 200л 35% спирту етилового (1 1), настоюють протягом 12год, а одержаний екстракт зливають у збірник Сировину у третій раз заливають 200л 35% спирту етилового (1 1), настоюють протягом 12год, потім одержаний екстракт зливають у збірник, а сировину віджимають Об'єднані екстракти відстоюють три доби при 6°C, потім фільтрують Одержаний рідкий екстракт з вмістом екстрактивних речовин від 5 до 7мас % розливають у флакони і упаковують

Приклад 2 Заявляємий засіб одержують таким чином В екстракторі 200кг листя горіха волоського замочують в 200л 40% спирту етилового (1 1) і настоюють протягом 2год Набухлу сировину заливають 400л 40% спирту етилового (1 2) і екстрагують методом настоювання протягом 30год, після чого одержаний спиртовий екстракт зливають у збірник Сировину знову заливають 200л 40% спирту етилового (1 1), настоюють протягом 8год, а одержаний екстракт зливають у збірник Сировину у третій раз заливають 200л 40% спирту етилового (1 1), настоюють протягом 8год, потім одержаний екстракт зливають у збірник, а сировину віджимають Об'єднані екстракти відстоюють три доби при 8°C, потім фільтрують Одержаний рідкий екстракт концентрують будь-яким відомим способом до густого екстракту з вмістом екстрактивних речовин 75мас %, розфасовують у тару і упаковують

Приклад 3 Заявляємий засіб одержують таким чином В екстракторі 200кг листя горіха волоського замочують в 200л 45% спирту етилового (1 1) і настоюють протягом 2год Набухлу сировину заливають 400л 45% спирту етилового (1 2) і екстрагують методом настоювання протягом 24год, після чого одержаний спиртовий екстракт зливають у збірник Сировину знову заливають 200л 45% спирту етилового (1 1), настоюють протягом 6год, а одержаний екстракт зливають у збірник Сировину у третій раз заливають 200л 45% спирту етилового (1 1), настоюють протягом 6год, потім одержаний екстракт зливають у збірник, а сировину віджимають Об'єднані екстракти відстоюють три доби при 10°C, потім фільтрують Одержаний рідкий екстракт концентрують будь-яким відомим способом до сухого екстракту з вмістом екстрак-

тивних речовин 95мас %, розфасовують у тару і упаковують

Заявляємий лікарський засіб, який виконано у вигляді таблеток, капсул, супозиторіїв, мазей, гелів, кремів, містить густого екстракту листя горіха грецького відповідно таблетки і капсули - від 0,02г до 0,06г, супозиторії - від 0,01г до 0,5г, мазі і гелі - від 1,0г до 5,0г (на 100г маси), креми - від 0,5г до 2,0г (на 100г мазі)

Засоби на основі горіха волоського достатньо широко застосовуються у народній та научній медицині Лікарською сировиною головним чином є листя, свіжі незрілі плоди та навколоплідник Але й інші частини волоського горіха, наприклад, корені дерев та кора коренів, у різних формах (відвари, настої, мазі) використовуються для заживлення ран, при геморої та рахті Кора коренів грецького горіха вживається як нижній проносний засіб, що не спричиняє болю В деревині особливо цінні сік та кани як ранозагоюючі та кровоспинні засоби Застосовуються і відвари кори стовбура

Автори вибрали листя горіха волоського як найбільш доступну сировину, до того ж "щадящий" варіант для цінної рослини

Хімічний склад листя горіха волоського дуже різноманітний дубильні речовини, флавоноїди, ефірна олія, горечі, кислота подібна хризофановій, полісахарид інупін, алкалоїди, вітаміни С, В1, Р, провітамін А, каротин, фттонциди та інше З одного боку, це забезпечує широкий спектр фармакологічних властивостей засобів з цієї сировини З іншого боку, ускладнює процес здобування речовин, які ці властивості обумовлюють Завдяки розробленому авторами способу одержання оптимального комплексу біологічно активних речовин з листя горіха волоського вони змогли одержати новий ефективний засіб широкого спектра дії, без негативних побічних ефектів і протипоказань до застосування

Проведені фармакологічні дослідження специфічної активності заявляемого засобу у вигляді рідкого екстракту, свідчать про наявність у нього виразних ранозагоювальних, антимікробних, протизапальних, противиразових, антиоксидантних властивостей

Ранозагоювальну, репаративну активність заявляемого засобу досліджували у порівнянні з ефективним протизапальним та ранозагоювальним засобом олією обліпихи Результати дослідів цього виду активності свідчать, що засіб з листя горіха грецького перевершує препарат порівняння Так, на 21 добу в групі тварин, яких лікували заявляємим засобом, репаративна активність була виявлена на 52,3%, а при лікуванні олією обліпихи - на 38% При цьому процес загоєння в дослідних групах тварин відбувався значно швидше, ніж в контрольних групах

Протизапальну активність заявляемого засобу вивчали на кількох моделях запалення у порівнянні з ортофеном Рідкий екстракт заздалегідь випарювали, звільняючи від спирту, і вводили перорально у вигляді водного розчину Результати досліджень показали, що по цьому виду активності заявляємий засіб виявляє ефект, який рівняється ефекту ортофена, а на деяких моделях перевершує його При цьому необхідно враховувати відсу-

тність у заявляемого засобу негативних побічних явищ на відміну від ортофена, який має протипоказання при виразці шлунку та дванадцятипалої кишки, при вагітності, не рекомендується особам, що страждають від шлунково-кишкових захворювань, уражень печінки та нирок. Окрім того, при тривалому застосуванні ортофена необхідно контролювати картину крові.

Результати досліджень антимікробної активності заявляемого засобу свідчать, що він виявляє високий рівень по відношенню до широкого кола тест-штамів, в тому числі грампозитивних та грамнегативних мікроорганізмів, спороутворюючої культури (*B. subtilis*), культури гриба *Candida*, культури *P. aeruginosa* та інше.

Вивчення противиразкової дії заявляемого засобу у порівнянні з відомим противиразковим препаратом плантаглюцидом свідчить, що на різних моделях ураження він перевищує препарат порівняння. Так, на моделі адреналінового набряку засіб з листя горіха грецького діє у два рази активніше плантаглюциду.

Дослідження з метою розширення спектра фармакологічної дії заявляемого засобу продовжуються.

При проведенні першої фази клінічних досліджень використовували рідкий екстракт листя горіха волоського. Одержані результати лікування

хворих дозволили зробити такі висновки. Заявляемий засіб ефективний при лікуванні хворих хронічним гастритом, гастро-дуоденитом, які протікають на тлі збереженої та зниженої кислотоутворюючої функції шлунка. Прийом засобу призводить до зменшення клінічних проявів больового, диспепсичного синдромів, зменшення запалення слизової оболонки гастродуоденальної зони. Засіб з листя горіха волоського добре переноситься хворими, не викликає негативних побічних реакцій при тривалому вживанні, не має протипоказань до застосування.

В таблицях 1, 2 наводяться результати досліджень протизапальної активності заявляемого засобу у порівнянні з ортофеном.

Таблиця 1

Протизапальна активність заявляемого засобу		
Досліджувані засоби	Величина набряку (мг)	Протизапальна активність (%)
Контроль	336 ± 0,82	-
Заявляемий засіб	63,3 ± 5,6 [*]	82
Ортофен	181,3 ± 8,1 [*]	46

Таблиця 2

P<0,05								
Досліджувані засоби/доба	1	3	5	7	9	11	13	14
Заявляемий засіб	50,3 ± 3,8 100%	39,2 ± 3,2	30,5 ± 2,8	20,2 ± 2,1	8,7 ± 2,3	5,6 ± 0,7	-	-
Ортофен	49,1 ± 3,1 100%	43,2 ± 4,2	30,1 ± 3,3	19,1 ± 3,2	10,2 ± 5,1	6,3 ± 2,2	5,5 ± 2,8	-
Контроль	47,3 ± 2,4 100%	45,9 ± 3,1	38,1 ± 6,2	30,3 ± 2,2	16,0 ± 0,43	12,0 ± 0,5	9,0 ± 2,4	6,0 ± 1,8

Таким чином, заявляемий винахід повністю виконує поставлену задачу по створенню високо-

ефективного засобу з листя горіха волоського

ДП «Український інститут промислової власності» (Укрпатент)

вул. Сім'ї Хохлових, 15, м. Київ, 04119, Україна

(044) 456 – 20 – 90

ТОВ «Міжнародний науковий комітет»

вул. Артема, 77, м. Київ, 04050, Україна

(044) 216 – 32 – 71