



УКРАЇНА

(19) UA (11) 56056 (13) U
(51) МПК (2009)
A61K 36/00
A61P 1/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ЗАСТОСУВАННЯ 40 % СПИРТОВОГО ВИТЯГУ З ЛИСТЯ АБО КОРЕНЯ ЛОПУХА ВЕЛИКОГО ЯК ПРОТИВИРАЗКОВОГО ЗАСОБУ

1

(21) u201006985
(22) 07.06.2010
(24) 27.12.2010
(46) 27.12.2010, Бюл.№ 24, 2010 р.
(72) ДРОГОВОЗ СВІТЛАНА МЕФОДІЇВНА, ХВО-
РОСТ ОЛЬГА ПАВЛІВНА, КУЦЕНКО ТЕТЯНА
ОЛЕКСАНДРІВНА, ОПРОШАНСЬКА ТЕТЯНА ВІ-

2

ТАЛІЇВНА, ПОЗДНЯКОВА АНАСТАСІЯ ЮРІЇВНА
(73) НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІ-
ВЕРСИТЕТ
(57) Застосування 40 % спиртового витягу з листя
або кореня лопуха великого (*Arctium lappa* L.) як
противиразкового засобу.

Корисна модель відноситься до фармації та медицини, а саме до засобів рослинного походження з противиразковою дією.

Відомий препарат альтан [1], який містить комплекс речовин поліфенольного походження - похідних елаготанінів (елагова та галова кислоти, етилгалат, альнітанін), одержаний з суплідь вільхи клейкої та вільхи сірої *Alnus glutinosa* (L.) Gaertn. *Alnus incana* (L.) Moench. Лікарські форми препарату - таблетки або мазь. Фармакологічні ефекти: ранозагоюючий, противиразковий, протизапальний, репаративний, антибактеріальний, антиоксидантний, мембраностабілізуючий, в'язучий, місцевоанестезуючий (мазь). Таблетки альтану призначають при лікуванні виразкової хвороби шлунку і дванадцятипалої кишки, гастритів, гастродуоденітів, колітів, ентероколітів. Мазь застосовують для лікування піодермій, опіків, гнійних ран.

Фармакологічна дія засобів рослинного походження обумовлена видом лікарської сировини, а також способами вилучення з неї певних компонентів біологічно активних речовин (БАР). Для забезпечення індивідуального підходу до лікування хворих, які потребують препарати, зокрема з противиразковою дією, необхідно розширювати арсенал таких засобів.

Відомий засіб з антимікробною та імуностимулюючою активністю [2] у вигляді витягу з листя або кореня лопуха великого 40% спиртом етиловим. Засіб одержують шляхом екстракції сировини протягом принаймні 12 годин при 3-4 кратному здійсненні процесу при загальному співвідношенні сировини до екстрагенту 1:12-1:20. Одержаний засіб проявляє антимікробну дію у відношенні широкого переліку патогенних мікроорганізмів і зміцнює імунну систему.

Проте відсутні відомості щодо противиразкової дії зазначеного засобу.

Завдання корисної моделі полягає у розширенні арсеналу противиразкових засобів рослинного походження.

Поставлене завдання вирішується шляхом застосування 40% спиртового витягу з листя або кореня лопуха великого в якості противиразкового засобу.

Корінь лопуха визнаний офіційною лікарською сировиною з діуретичною та жовчогінною фармакологічною дією [3]. У народній медицині також використовують корінь лопуха, рідко - листя та плоди. Відоме використання лопуха при нирковокам'яній та жовчнокам'яній хворобах, при захворюваннях суглобів і остеохондрозах, алергії, цукровому діабеті, тощо. Свіже листя лопуха використовують для компресів при болях у суглобах, мастопатії, для лікування ран, що довго не загоюються. Рослину використовують зовнішньо при лікуванні екзем і випадінні волосся (у вигляді реп'яхової олії або у вигляді відварів) [4].

Авторами вперше було досліджено противиразкову дію 40% спиртового витягу з листя або кореня лопуха, одержаного за відомим способом [2]. Такий витяг може бути у вигляді рідкого або густого або сухого екстракту в залежності від подальшого застосування в якості активної діючої субстанції при створенні препаратів з противиразковою дією у різних лікарських формах.

Корисна модель ілюструється прикладом.

Приклад 1. Вивчення противиразкової дії 40% спиртового витягу з листя або кореня лопуха великого у вигляді густих екстрактів проводили на моделі гострого ураження шлунку у щурів, викликаного преднізолоном та етиловим спиртом.

(19) UA (11) 56056 (13) U

«Спирто-преднізолонову» виразку у дослідях викликали у безпородних білих щурів-самців масою 200-250 г. Протягом 24 годин тварин утримували на голоді з вільним доступом до води. По закінченні зазначеного терміну щурам внутрішньошлунково вводили преднізолон із розрахунку 20 мг/кг та 80% етиловий спирт у дозі 0,6 мл/100 г маси тіла тварини. Перед тим як ввести преднізолон, його змішували з етанолом.

Препаратом порівняння був обраний альтан [1], що виявляє противиразкові властивості та застосовується при виразковій хворобі.

Досліджувані препарати вводили внутрішньошлунково у лікувально-профілактичному режимі: один раз на день, починаючи за 3 дні до моделювання патології, і закінчували у день відтворення виразки (через 1 годину після введення спирто-преднізолонової суміші) у дозах: густі екстракти кореня та листя лопуха по 50 мг/кг, альтан - 1 мг/кг.

Дослідні тварини були поділені на групи: інтактний контроль, контрольна патологія (неліковані тварини з патологією), тварини з модельною патологією + густий екстракт кореня лопуха, тварини з

модельною патологією + густий екстракт листя лопуха та тварини з модельною патологією + альтан. У кожну групу брали по 6 тварин.

В якості критерію оцінки ефективності противиразкових препаратів використовували величину противиразкової активності (ПВА) у відсотках, яку розраховували на основі наступних даних: відсоток тварин з виразками у групі (T_B), середня площа виразок у групі ($S_{Bсер}$) у балах, виразковий індекс (ВІ). Градацію у балах виразкової поверхні проводили у залежності від сумарної площі виразкових дефектів: 1-2мм² - 1 бал, 3-5мм² - 5 балів, 6-10мм² - 10 балів, понад 10мм² - 15 балів; у випадку загибелі тварини від перфорації шлунку інтенсивність ураження оцінювали в 15 балів.

Виразковий індекс та противиразкову активність розраховували за формулами:

$$BI = (S_{Bсер} \times T_B) / 100;$$

$$ПВА = 100\% - ((BI_{лік} \times 100\%) / BI_k),$$

де $BI_{лік}$ - ВІ у групі лікованих тварин з модельною патологією

BI_k - ВІ у групі нелікованих тварин з контрольною патологією

Результати дослідів наведені у таблиці 1.

Таблиця 1

Вивчення противиразкової активності густого екстракту кореня лопуха, густого екстракту листя лопуха та альтану на моделі гострого виразкового ураження шлунку у щурів, викликаного преднізолоном та етиловим спиртом

Варіанти дослідів	Показники		
	$S_{Bсер}$, бали	ВІ	ПВА, %
Інтактний контроль	---	---	---
Контрольна патологія	55,33±7,74	55,33	---
Густий екстракт кореня лопуха	24,50±2,90*	24,50	55,72
Густий екстракт листя лопуха	22,00±4,61*	22,00	60,24
Альтан	15,00±3,23*	15,00	72,89

Примітка:

* - достовірно по відношенню до групи контрольної патології ($P \leq 0,05$).

Аналіз результатів експерименту свідчить, що всі тварини з групи інтактного контролю за загальним станом були в нормі: добре їли корм, пили воду, були активні, реагували на зовнішні подразники, шерсть була без змін. Слизова оболонка шлунку (СОШ) інтактних тварин також була у нормі: нормального кольору, з нормальною складчастістю, без набряклості і геморагій. При макроскопічному дослідженні СОШ у групі інтактних тварин виразок не знайдено.

У групі контрольної патології загальний стан тварин був незадовільним: спостерігалася відсутність апетиту, зниження рухової активності, слабка реакція на зовнішні подразники, шерсть була наїжачена.

При макроскопічному розгляді шлунків тварин групи контрольної патології відмічено, що введення спирто-преднізолонової суміші призвело до утворення множинних глибоких уражень, появи набряку, значної гіперемії, крововиливів у слизову оболонку шлунку порушення її складчастості, появи ділянок некрозу. У декількох тварин спостеріга-

лося здуття усього шлунково-кишкового тракту (ШКТ). Наявність виразкових дефектів, як крапкових, так і масивних, відзначалася у всіх тварин даної групи, тому кількість тварин з виразками у цій групі склала 100% (слід відмітити, що цей показник був аналогічним у всіх групах) при середній площі виразок 55,33±7,74 бали, а виразковий індекс - 55,33.

Щури з модельною патологією, яких лікували густими екстрактами кореня та листя лопуха, а також у групі, лікованій альтаном, за зовнішнім виглядом та поведінкою майже не відрізнялися від тварин з групи інтактного контролю. У цих групах щурів здуття ШКТ не спостерігалася, а також відмічалася значно менша кількість та площа звиразкування; крововиливів було небагато, до того ж вони були крапковими; зміни кольору та складчастості СОШ у більшості тварин з даних груп не знайдено, а у решти - спостерігалися зміни у вигляді помірної гіперемії або блідості СОШ з незначним порушенням складчастості.

Середня площа виразок у групі, лікованій гус-

тим екстрактом кореня лопуха, дорівнювала $24,50 \pm 2,90$ бали. Виразковий індекс при цьому склав 24,50, а противиразкова активність - 55,72%.

Середня площа виразок у групі, лікованій густим екстрактом листя лопуха, дорівнювала $22,00 \pm 4,61$ бали. Виразковий індекс при цьому склав 22,00, а противиразкова активність - 60,24%.

Середня площа виразок у групі, лікованій препаратом порівняння - альтаном, дорівнювала $15,00 \pm 3,23$ бали. Виразковий індекс при цьому склав 15,00, а противиразкова активність - 72,89%.

Отже, результати дослідження свідчать про наявність противиразкової дії у густих екстрактів кореня та листя лопуха, що є порівнюваними та знаходяться на рівні дії препарату порівняння альтану, оскільки, незважаючи на кількісну перевагу ПВА альтану ефективність противиразкових активностей екстрактів, що досліджували, та альтану достовірно не відрізняються.

Наведений приклад є доказом об'єктивності твердження про наявність противиразкової активності у густих екстрактах кореня або листя лопуха великого.

Застосування 40% спиртових витягів з листя або кореня лопуха великого в якості противиразкового засобу дозволяє розширити арсенал рослинних препаратів зазначеної дії, придатних до тривалого вживання без побічних ефектів. Заявлений засіб може бути застосований як засіб вибору при індивідуальному підході до лікування хворих.

Джерела інформації:

1. Лекарственные препараты Украины. Под ред. В.П. Черных, И.А. Зупанца. Харьков, Изд-во НФаУ «Золотые страницы», 2005, С. 27.

2. Патент на винахід 85927, Україна, МПК А61К 36/28 (2006.01), А61К 125/00 (2006.01), А61К 127/00 (2006.01), Заявл. 06.06.2007, публ. 10.03.2009, Бюл. № 5.

3. Самура Б.А., Черных В.П., Банний и др.. Фитотерапия в клинике внутренних болезней. Харьков, Узд-во НФаУ «Золотые страницы», 2003, С. 336.

4. Ладынина Е.А. Травник для всех. Москва, Мосгорпечать, 1993, С. 194-196.