



УКРАЇНА

(19) UA (11) 13154 (13) U
(51) МПК (2006)
A61K 36/00
A61P 9/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

видається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ КАРДІОТОН

(21) u200509239
(22) 03.10.2005
(24) 15.03.2006
(46) 15.03.2006, Бюл. № 3, 2006 р.
(72) Стецюра Андрій Олексійович, Акіменко Андрій Павлович
(73) Стецюра Андрій Олексійович, Акіменко Андрій Павлович
(57) 1. Фармацевтична композиція, що є спиртово-водним екстрактом з суміші лікарських рослин, яка **відрізняється** тим, що суміш лікарських рослин складається з плодів глоду, трави кропиви собачої, коренів валеріани, плодів фенхелю, листя м'яти, квітів арніки при такому співвідношенні компонентів:

плоди глоду	25,0-35,0 г
трава кропиви собачої	15,0-25,0 г
корені та кореневища валеріани	15,0-25,0 г
плоди фенхелю	7,0-13,0 г
листя м'яти	7,0-13,0 г
квіти арніки	7,0-13,0 г
водний розчин етилового спирту	1 л.

2. Фармацевтична композиція за п. 1, яка **відрізняється** тим, що водно-спиртовий екстракт готується при такому співвідношенні компонентів:

плоди глоду	29,8-30,2 г
трава кропиви собачої	19,8-20,2 г
корені та кореневища валеріани	19,8-20,2 г
плоди фенхелю	9,8-10,2 г
листя м'яти	9,8-10,2 г

квіти арніки	9,8-10,2 г
водний розчин етилового спирту	1 л.

3. Фармацевтична композиція за п. 2, яка **відрізняється** тим, що водно-спиртовий екстракт готується при такому співвідношенні компонентів:

плоди глоду	30,0 г
трава кропиви собачої	20,0 г
корені та кореневища валеріани	20,0 г
плоди фенхелю	10,0 г
листя м'яти	10,0 г
квіти арніки	10,0 г
водний розчин етилового спирту	1 л.

4. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-3, яка **відрізняється** тим, що як основу водно-спиртового екстракту використовують водний розчин етилового спирту з вмістом етилового спирту 50,0-90,0 % за об'ємом.

5. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-4, яка **відрізняється** тим, що як основу водно-спиртового екстракту використовують водний розчин етилового спирту з вмістом етилового спирту 60,0-80,0 % за об'ємом.

6. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-5, яка **відрізняється** тим, що як основу водно-спиртового екстракту використовують водний розчин етилового спирту з вмістом етилового спирту 70,0 % за об'ємом.

7. Фармацевтична композиція за будь-яким з пп. 1-6, що має кардіотонічну дію.

Корисна модель відноситься до медицини та хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема, до фармацевтичних композицій для лікування серцево-судинних захворювань на основі рослинної сировини.

З патенту RU 2185847 відомий лікарський засіб "Фітоседатин", що є спиртовим екстрактом суміші лікарських рослин (глід, хміль, меліса, пусти-

ник звичайний, ехінацея, валеріана), і містить також гліцин, сорбіт і воду. Препарат проявляє седативну дію.

З патенту RU 2045276 (A61K35/78) відомий лікарський препарат - чайний збір "Кратевалін", що складається з настою коренищ з коріннями валеріани, суцвіть хмелю, листя кропиви дводомної, суцвіть глоду криваво-кровопостачання серцевого

(13) U
(11) 13154
(19) UA

м'язу та головного мозку. Однак цей препарат не забезпечує кардіотонічної, коронаролітичної та гіпотензивної дії. А оскільки цей препарат є водною настоянкою, то необхідність його попереднього приготування і термін зберігання, який не перевищує 7-ми діб, обмежують його використання.

З патенту UA 67289 відомий засіб для фітованни оздоровчо-профілактичної "Енергія природи", що містить траву кропиви собачої, сіно або вівсяну соломку, траву споришу, кореневищалепах, листя кропиви, шишки хмелю, траву материнки, траву лаванди.

Відомий лікарський засіб "Гербіон" виробництва фірми KRKA (Словенія) у формі водно-спиртового екстракту на основі листя та квіток глоду (*Crataegi folium cum flore*), коріння валеріани лікарської (*Valerianae radix*), трави омели білої (*Visci herba*). Препарат відноситься до групи комбінованих серцевих засобів, має м'яку кардіотонічну дію, підвищує скоротність міокарду, регулює підвищений кров'яний тиск та проявляє м'яку седативну дію.

Відомий лікарський засіб "Кратал" виробництва фірми ЗАТ НВЦ "Борщагівський хіміко-фармацевтичний завод" (Україна), що випускається в таблетках, кожна з яких містить таурин, екстракт плодів глоду густого, екстракт кропиви собачої та допоміжні речовини - крохмаль, стеарат магнію, аеросил. Препарат відноситься до групи комбінованих кардіологічних засобів. Має м'яку кардіотонічну дію, антиангінальну, короналітичну та антиаритмічну активність, крім того, виявляє антитоксичну, антиагрегаційну дію. Поліпшує кровопостачання та функціональний стан міокарда, збільшує "коронарний резерв", посилює скоротливу та насосну функцію серцевого м'яза, зменшує артеріальний тиск і нормалізує частоту серцевих скорочень. Підвищує працездатність, покращує настрій та проявляє м'яку седативну дію.

З довідника "Лекарственные средства" [Машковский М.Д., лекарственные средства: в 2 т. Т1. - 14-е изд., перераб., испр. и доп. - М.: ООО "Издательство Новая Волна": Издатель С.Б. Дивов, 2002. - 540 с., 8 с ил. - сторінка 408] також відомий лікарський засіб "Кардіплант" виробництва фірми "Доктор Вільмар Швабе ГмбХ і Ко" (Німеччина), що випускається в таблетках, кожна з яких містить сухий екстракт з листя та квіток глоду та допоміжні речовини - кислоти лимонної, натрію крокармелозу, емульсію протипінну SE 2, вискодисперсний діоксид кремнію та моногідрат лактози. Препарат призначений для лікування захворювань серцево-судинної системи, покращує скорочувальну здатність серцевого м'яза і оптимізує роботу серця в залежності від метаболічних потреб організму, підсилює кровообіг в коронарних судинах, покращує використання кисню серцем.

В основу корисної моделі поставлене завдання створення лікарського засобу у стабільній рідкій лікарській формі, в якому за рахунок оптимального підбору кількісного і якісного складу інгредієнтів досягається посилення кровообігу в коронарних судинах серця і головного мозку, зниження збудливості міокарду, антигіпоксичні, антиаритмічні, заспокійливі властивості.

Поставлене завдання вирішується тим, що при

виготовленні фармацевтичної композиції, що є спиртово-водним екстрактом з суміші лікарських рослин, використовують суміш лікарських рослин, що складається з плодів глоду, трави кропиви собачої, коренів валеріани, плодів фенхелю, листя м'яти, квітів арніки при такому співвідношенні компонентів:

плоди глоду	25,0-35,0г
трава кропиви собачої	15,0-25,0г
корені та кореневища валеріани	15,0-25,0г
плоди фенхелю	7,0-13,0г
листя м'яти	7,0-13,0г
квіти арніки	7,0-13,0г
водний розчин етилового спирту	1л

Переважно, водно-спиртовий екстракт готується при такому співвідношенні компонентів:

плоди глоду	29,8-30,2г
трава кропиви собачої	19,8-20,2г
корені та кореневища валеріани	19,8-20,2г
плоди фенхелю	9,8-10,2г
листя м'яти	9,8-10,2г
квіти арніки	9,8-10,2г

водний розчин етилового спирту 1л

Більш переважно, водно-спиртовий екстракт готується при такому співвідношенні компонентів:

плоди глоду	30,0г
трава кропиви собачої	20,0г
корені та кореневища валеріани	20,0г
плоди фенхелю	10,0г
листя м'яти	10,0г
квіти арніки	10,0г

водний розчин етилового спирту 1л

Переважно, як основу водно-спиртового екстракту використовують водний розчин етилового спирту з вмістом етилового спирту 50,0-90,0% за об'ємом.

Більш переважно, як основу водно-спиртового екстракту використовують водний розчин етилового спирту з вмістом етилового спирту 60,0-80,0% за об'ємом.

Більш переважно, як основу водно-спиртового екстракту використовують водний розчин етилового спирту з вмістом етилового спирту 70,0% за об'ємом.

Технічний результат, який отримують при здійсненні корисної моделі, полягає у створенні комбінованого кардіотонічного лікарського засобу у стабільній рідкій лікарській формі, в якому за рахунок підбору якісного та кількісного складу компонентів забезпечується зручність і комфортність при прийомі засобу, і досягається посилення кровообігу в коронарних судинах серця і головного мозку, зниження збудливості міокарду, антигіпоксичні, антиаритмічні, заспокійливі властивості.

До складу лікарського засобу входить цілий комплекс природних рослинних компонентів, що діють різносторонньо на обмін речовин.

Фізіологічне активні речовини плодів глоду: флавоноїди (значна кількість кверцетину та ін.), органічні кислоти, аміни (холін, ацетилхолін), ас-

корбінова кислота, бета-каротин, вітамін К, фенольні сполуки, кумарини, три терпенові кислоти та інші сполуки, які діють як гіпотензивні, кардіотропні, спазмолітичні, заспокійливі, проти алергічні засоби, сприяють надходженню фізіологічного сну. Тому препарати глоду широко використовуються не тільки для лікування ішемічної хвороби серця (ІХС), але і атеросклерозу, гіпертонічної хвороби, нервового збудження, мігрені, алергічних станів.

Лікувальні властивості кропиви собачої описані ще у 15 столітті. Трава кропиви собачої містить алкалоїди, флавоноїди, дубильні речовини, вітаміни (А,Е,С), солі біметалів (калій, кальцій, натрій, сірка), ефірну олію, глікозиди. Такий різносторонній склад обумовлює не тільки антистенокардичну дію, але і гіпотензивний, седативний, протисудомний, спазмолітичний, сечогінний ефекти.

Препарати пустирника широко застосовуються як засоби, що регулюють функціональний стан ЦНС, та як серцевий засіб. Європейські країни широко застосовують препарати з собачої кропиви при серцевих болях, серцевій слабкості та інше.

М'ята перцева містить, як відомо, ефірні олії, тритерпеноїди, стероїди, сапоніни, флавоноїди; вона широко застосовується як спазмолітичний та заспокійливий засіб.

Валеріана лікарська має іридоїди або валепотриати, основні з них валтрат та його похідні - ізо-валтрат, гомовалтрат, гідровалтрат; алкалоїди (актипідин, валерин), флавоноїди, фенолкарбонові кислоти, амінокислоти, органічні кислоти, глікозиди тритерпенового ряду та інш.

Плоди фенхелю містять до 5-6% ефірної олії, яка включає анетол, фенхол, анісову кислоту, білкові сполуки, флавоноїди, кумарин.

Арніка гірська культивується, як лікарська рослина. В надземній частині рослини міститься до 4% аргіцину, до 21мг% аскорбінової кислоти, до 0,016% ефірного масла, флавоноїди, каротиноїди, інсулін, холін, органічні кислоти (молочна, фумарова, яблучна), дубильні і смолисті речовини, цинарин, бетаїн, алкалоїди, фітостерини. Кофейна та хлоргонова кислоти визначають сечогінну, капілярпропекторну, протизапальну, антиоксидантну, мембранопротекторну дію. В даний час діючими речовинами вважають псевдогваяноліди, сесквтерпеновілактони азуленового ряду гелепалінацетат, арніколіди А і С арніфолін, який виділяють із квітів талистя. Гелепалін, 11-бета дигідрогелепалін визначають протизапальну і анальгізуючу дію, а також метаболічні ефекти - стимуляцію окислювального фосфорилування, синтезу простагландинів, стабілізацію лізосомальних мембран. Арніцитин обумовлюють кардіотонічний, судинорозширюючий та кардіопротекторний ефекти. Флавоноїди, особливо рутин, кверцетин обумовлюють антиоксидантний, мембраностабілізуючий, кардіопротекторний вплив. Вітамінні речовини особливо аскорбінова кислота, відіграють важливу роль у всіх метаболічних процесах. В тому числі у підтримці імунітету, загального тону організму.

Поєднання інгредієнтів та їх кількісний склад, підтверджений експериментами, дають засіб, який посилює кровообіг в коронарних судинах серця і судинах головного мозку, знижує збудливість міокарду, має антигіпоксичну, антиаритмічну, заспо-

коїливу дію. Препарат малотоксичний, не має сенсibilізуючих та алергічних властивостей.

Фармацевтична композиція використовується як лікувальний засіб при функціональних розладах діяльності серцево-судинної системи (нейроциркуляторні дистонії), а також як допоміжний лікарський засіб при легких формах порушень серцевого ритму (миготлива аритмія, пароксизмальна тахікардія).

Нижче проведені конкретні приклади реалізації корисної моделі.

Приклад 1

Необхідну кількість сухої лікарської сировини розміщують у екстракторі. Композицію одержують методом мацерації. Рослинну сировину настоюють та екстрагують при температурі 20-27°C на протязі 5 діб. В якості екстрагента використовують 1л спирту етилового 60%, який готують із спирту етилового 96,5% та води очищеної. Одержаний екстракт лікарської рослинної сировини відстоюють на протязі 48 годин при температурі 8-10 °С, після чого фільтрують. Отримують прозору рідину світло-коричневого кольору з приємним запахом.

При цьому беруть рослини в такому співвідношенні:

плоди глоду	29,8г
трава кропиви собачої	19,8г
корені та кореневища валеріани	19,8г
плоди фенхелю	9,8г
листя м'яти	9,8г
квіти арніки	9,8г

Приклад 2

Необхідну кількість сухої лікарської сировини розміщують у екстракторі. Композицію одержують методом мацерації. Рослинну сировину настоюють та екстрагують при температурі 20-27°C на протязі 5 діб. В якості екстрагента використовують 1л спирту етилового 70%, який готують із спирту етилового 96,5% та води очищеної. Одержаний екстракт лікарської рослинної сировини відстоюють на протязі 48 годин при температурі 8-10 °С, після чого фільтрують. Отримують прозору рідину світло-коричневого кольору з приємним запахом.

При цьому беруть рослини в такому співвідношенні:

плоди глоду	30,0г
трава кропиви собачої	20,0г
корені та кореневища валеріани	20,0г
плоди фенхелю	10,0г
листя м'яти	10,0г
квіти арніки	10,0г

Приклад 3

Необхідну кількість сухої лікарської сировини розміщують у екстракторі. Композицію одержують методом мацерації. Рослинну сировину настоюють та екстрагують при температурі 20-27°C на протязі 5 діб. В якості екстрагента використовують 1л спирту етилового 80%, який готують із спирту етилового 96,5% та води очищеної. Одержаний екстракт лікарської рослинної сировини відстоюють на протязі 48 годин при температурі 8-10 °С, після чого фільтрують. Отримують прозору рідину світло-коричневого кольору з приємним запахом.

При цьому беруть рослини в такому співвід-

7	13154	8
ношенні:		49,4±7,1 років. Клінічна картина жалоб усіх хворих
плоди глоду	30,2г	складалась із серцевих та загально невротичних
трава кропиви собачої	20,2г	проявів. Усім хворим провадилось обстеження
корені та кореневища вале-		згідно основного захворювання перед і після 10
ріани	20,2г	днів призначення фармацевтичної композиції за
плоди фенхелю	10,2г	прикладом 2 по 20-30 крапель тричі на добу. В
листя м'яти	10,2г	результаті курсового неперервного прийому у бі-
квіти арніки	10,2г	льшості хворих позначалось поліпшення самопо-
Приклад 4		чуття, а також об'єктивно більш сприятлива течія
Клінічні випробування. Було обстежено 23		захворювання, при чому тільки в одного хворого
хворих з захворюваннями серцево-судинної сис-		спостерігалися алергічні реакції та диспепсичні
теми - 11 чоловіків і 12 жінок. Середній вік хворих		розлади.