



УКРАЇНА

(19) UA (11) 38567 (13) A

(51) 7 A61K35/78, A23F3/16

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ  
НА ВИНАХІДвидається під  
відповідальність  
власника  
патенту

## (54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ЛІКУВАЛЬНО-ПРОФІЛАКТИЧНОГО ФІТОЧАЮ ПРОНОСНОЇ ДІЇ

(21) 2000074501

(22) 26.07.2000

(24) 15.05.2001

(33) UA

(46) 15.05.2001, Бюл. № 4, 2001 р.

(72) Привалова Єрвілія Геннадіївна, Безчаснюк  
Олена Михайлівна, Відюкова Олександра Іванівна

(73) Державний науковий центр лікарських засобів

(57) Спосіб одержання лікувально-профілактичного  
фіточаю проносної дії, що включає подрібнення  
кори крушини, листя кропиви, трави дерев'яної,  
екстракцію суміші рослинної сировини гаря-

чою водою з подальшою фільтрацією отриманого екстракту, який відрізняється тим, що кору крушини, листя кропиви, траву дерев'яної беруть у співвідношенні (2,0-5,0):(1,0-3,0):(0,5-1,5), подрібнення здійснюють одночасно з екстракцією, після фільтрації екстракту проводять упарювання, потім фільтрацію упареного екстракту з подальшою його сушкою, змішуванням сухого екстракту з цукровою пудрою при співвідношенні (29-33):(67-71), зволоженням отриманої суміші 85-94% спиртом етиловим, гранулюванням і сушкою гранул.

Винахід відноситься до медицини та хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема, до розробки способів одержання з рослинної сировини лікувально-профілактичних засобів у вигляді фіточаїв проносної дії.

Відомий спосіб одержання лікарських речовин з кори крушини здійснюють таким чином. Подрібнену кору крушини завантажують в батарею екстракторів і екстрагують 70% спиртом етиловим, в який додають гамма-лактонглюкуронову кислоту. Об'єднаний екстракт упарюють до отримання густого залишку, змішують з карбонатом магнію і висушують у сушильній шафі. Отримують препарат з високою біологічною активністю, який має послаблюючу дію [1].

Відомий спосіб одержання екстракту крушини, який полягає в тому, що подрібнену кору крушини екстрагують 3 рази гарячою водою при перемішуванні, отриманий екстракт відфільтровують, додають цукор, перемішують до повного розчинення цукру, розчин профільтровують і отримують кінцевий продукт - сироп крушини, який має послаблюючу дію [2].

Відомий спосіб одержання послаблюючого засобу, який полягає в тому, що листя та стручки сени подрібнюють в тонкий порошок та просіюють через сито. Отриманий порошок змішують з вазеліновим маслом. Сухі плоди сливи промивають гарячою водою, обробляють гострим паром, після набухання звільняють від кісточок та витримують при 70-80°C. Пропускають через гомогенізатор і отримують пасту сливи. Аналогічним образом готують пасту інжиру. Змішують пасту інжиру та сливи, гомогенізують, додають оброблену вазеліновим

маслом суміш порошоків листя та стручків сени і знову гомогенізують. Отримують масу, з якої готують лікарську форму пресуванням (кубики). Склад 1 кубика (близько 8,4 г): листя сени - 0,07 г, стручки сени - 0,3 г, плоди інжиру - 4,4 г, плоди сливи - 2,2 г, вазелінове масло - 0,84 г [3].

Відомий спосіб одержання проносного засобу в формі драже, який складається з продуктів помолу насіння та насінної шкірки подорожника, плодів сени, рослинної олії, цукру, тальку та інших допоміжних речовин. Спосіб полягає у попередньому нарізному тонкому подрібненні насіння та насінної шкірки подорожника, плодів сени, з подальшим їх змішуванням з середовищем-носієм з трагтанту у визначеному співвідношенні, обробці отриманої суміші водою, висушування, гранулювання з подальшим дражуванням. Для дражування застосовується суспензія, в якій, крім цукру, може міститись звичайні у фармацевтичній технології ароматичні есенції, такі як олія м'яти перцевої, кмінна або шавлієва олія, а також пігменти. Отриманий проносний засіб застосовують при запорах та для регулювання випорожнення [4].

Найбільш близьким до даного є спосіб одержання засобу проносної дії у вигляді настою, який отримують з суміші подрібнених лікарських рослин такого складу: кора крушини - 3 частини, листя кропиви - 2 частини, трава дерев'яної - 1 частина. Спосіб здійснюють таким чином: 5 г (1 столову ложку) суміші рослинної сировини заварюють 200 мл кип'ятку, екстрагують методом настоювання 20 хв. і фільтрують (5).

До недоліків способу-прототипу потрібно віднести малий вихід і низьку стабільність біологічно-

активних речовин кінцевого продукту, який отримують у вигляді водного розчину, що призводить до скорочення терміну зберігання та небезпеки його повторного мікробного забруднення.

В основу винаходу поставлено завдання створення способу одержання з рослинної сировини фіточаю проносної дії шляхом підбору технологічних операцій в такій послідовності та взаємозв'язку і з такими режимами та параметрами, які б забезпечили високий вихід і стабільність біологічно активних речовин, а також отримання готового продукту з гарантованою мікробною чистотою і зі значно збільшеним терміном зберігання та використання.

Поставлене завдання вирішується тим, що спосіб одержання фіточаю проносної дії, що включає подрібнення кори крушини, листя кропиви і трави деревію, екстракцію суміші сировини гарячою водою з подальшою фільтрацією отриманого екстракту, відповідно до винаходу, кору крушини, листя кропиви та траву деревію беруть у співвідношенні (2,0-5,0):(1,0-5,0):(0,5-1,5), подрібнення здійснюють одночасно з екстракцією, після фільтрації екстракту проводять упарювання, потім фільтрацію упареного екстракту з подальшою його сушкою, змішуванням сухого екстракту з цукровою пудрою при співвідношенні (29-33):(67-71), зволоженням отриманої суміші 85-94% спиртом етиловим, гранулюванням і сушкою гранул.

Технічний результат, якого досягають при здійсненні винаходу, полягає в розробці способу одержання лікувально-профілактичного фіточаю проносної дії, який забезпечує підвищення виходу і стабільності біологічно активних сполук готового продукту, гарантовану мікробну чистоту, значне збільшення терміну його зберігання та застосування.

Наводимо конкретні приклади здійснення винаходу.

Приклад 1. В екстрактор заливають 1140 л води, яку нагрівають до 80°C, включають роторно-пульсаційний апарат і завантажують рослинну сировину: 30 кг кори крушини, 18 кг листя кропиви, 9 кг трави деревію (співвідношення компонентів у суміші рослинної сировини становить 5,0:3,0:1,5). Екстракцію проводять одночасно з подрібненням рослинної сировини протягом 40 хв. Отриманий екстракт фільтрують, шрот промивають гарячою водою, промивні води об'єднують з екстрактом, після чого упарюють. Одержаний концентрат фільтрують і сушать на розпилювальній сушарці. Сухий екстракт (33 кг) перемішують з 67 кг цукрової пудри (співвідношення сухого екстракту і цукрової пудри становить 33:67). Одержану суміш зволожують 94% спиртом етиловим при перемішуванні до однорідності.

Вологу масу гранулюють, гранули сушать, просівають і одержують готовий продукт - фіточай проносної дії.

Приклад 2. В екстрактор заливають 1200 л води, яку нагрівають до 85°C, включають роторно-пульсаційний апарат і завантажують рослинну сировину: 30 кг кору крушини, 20 кг листя кропиви, 10 кг трави деревію (співвідношення компонентів у суміші рослинної сировини становить 3,0:2,0:1,0). Екстракцію проводять одночасно з подрібненням рослинної сировини протягом 40 хв. Отриманий

екстракт фільтрують, шрот промивають гарячою водою, промивні води об'єднують з екстрактом, після чого упарюють. Одержаний концентрат фільтрують і сушать на розпилювальній сушарці. Сухий екстракт (31 кг) перемішують з 69 кг цукрової пудри (співвідношення сухого екстракту і цукрової пудри становить 31:69). Одержану суміш зволожують 90% спиртом етиловим при перемішуванні до однорідності. Вологу масу гранулюють, гранули сушать, просівають і одержують готовий продукт - фіточай проносної дії.

Приклад 3. В екстрактор заливають 1225 л води, яку нагрівають до 90°C, завантажують рослинну сировину: 28 кг кори крушини, 14 кг листя кропиви, 7 кг трави деревію (співвідношення компонентів у суміші рослинної сировини становить 2,0:1,0:0,5). Екстракцію проводять одночасно з подрібненням рослинної сировини протягом - 40 хв. Отриманий екстракт відфільтровують, шрот промивають гарячою водою, промивні води об'єднують з екстрактом, після чого упарюють. Одержаний концентрат фільтрують і сушать на розпилювальній сушарці. Сухий екстракт (29 кг) перемішують з 71 кг цукрової пудри (співвідношення сухого екстракту і цукрової пудри становить 29:71). Одержану суміш зволожують 85% спиртом етиловим при перемішуванні до однорідності. Вологу масу гранулюють, гранули сушать, просівають і одержують готовий продукт - фіточай проносної дії.

За даним способом отримують лікувально-профілактичний засіб, гранульований фіточай, розчинний у воді, який застосовується при порушенні функцій шлунково-кишкового тракту (при запорах як проносне). Готовий продукт фасують по 150 г в банки скляні або по 3 г в ододозові пакети. Термін зберігання - 2 роки.

Склад суміші рослинної сировини, в якому кора крушини, листя кропиви, листя деревію беруть у співвідношенні (2,0-5,0):(1-3):(0,5-1,5) є експериментальне обґрунтованим. Порушення якісного і кількісного складу суміші призводить до зниження специфічної активності фіточаю і утрудненнь технологічного характеру при його виробництві.

Кора крушини містить антрахінони і антраглікозиди (3-8%), дубильні речовини (10,4%), а також алкалоїди, сапоніни, пектини, мінеральні солі, таніни, гіркоти, ензими та ін. Кора крушини має легкий послаблюючий ефект, який настає через 8-10 год. після прийому. Її використовують при хронічних запорах, спастичних колітах, при тріщинах прямої кишки, при геморої, а також в гастроентерології.

Листя кропиви містить глікозид уртицин, вітаміни групи А, В, С і К, каротиноїди, ксантофіл, флавоноїди, фенолкарбонові кислоти, таніни, віск, дубильні речовини (2%), фітонциди, мінеральні солі (15-19%), ензими та ін. Використовують листя кропиви як кровоспинне при кровотечах ниркових, кишкових, маточних і гемороїдальних, крім того, як сечогінний, протизапальний та ранозагоюючий засіб.

Трава деревію містить органічні кислоти, дубильні речовини, флавоноїди, мінеральні солі, мікроелементи, вітамін К, ефірні масла, до складу яких входять азулени, а також сесквитерпени, камфора та ін. Водні екстракти деревію діють як спазмолітик на гладкі м'язи кишечника, сечовивідних і

жовчних шляхів, проявляють протизапальні, бактерицидні, ранозагоючі і антиалергічні властивості.

Взаємозв'язок і послідовність технологічних операцій способу, підбір режимів і параметрів повністю забезпечують виконання поставленого завдання. Спосіб одержання засобу для лікування та профілактики захворювань шлунково-кишкового тракту у формі водорозчинного фіточаю проносної дії розроблявся з урахуванням наявності в рослинах лабільних біологічно активних сполук (ефірні масла, флавоноїди, азулени, каротиноїди, органічні кислоти, алкалоїди, сапоніни, пектини, ензими, вітаміни, фітонциди та ін.), які зазнають деструкції під дією температурних факторів, при зміні кисло-лужного середовища, при окисленні киснем повітря, під впливом сонячного світла та ін.

Використання і переробка рослинної сировини у вигляді трикомпонентної суміші без застосування роздільного подрібнення кожного з видів рослин з подальшим їх екстрагуванням зумовлено необхідністю збереження високого рівня біологічної активності речовин, що містяться в рослинах, економії сировини, екстрагенту, часу, енерго- і трудовитрат. При цьому зберігається необхідний фармакотерапевтичний ефект готового продукту.

При розробці способу були проведені дослідження по визначенню оптимальних умов подрібнення рослинної сировини і водної екстракції, подальшому отриманню концентрату шляхом згущення водних екстрактів, висушуванню концентрату методом розпилення як найвразливішим стадіям процесу, при яких може спостерігатися розкладання біологічно-активних речовин.

В способі подрібнення і екстракцію здійснюють із застосуванням інтенсивної технології: подрібнення проводять одночасно з екстракцією при оптимальному співвідношенні екстрагент-сировина, завдяки чому зберігається біологічна активність сполук, що входять до складу рослин. Таким чином, в способі не застосовували подрібнення рослинної сировини загальноприйнятими способами, при яких спостерігається місцеве перегрівання, окислення і осмолювання сировини, внаслідок чого відбувається розкладання діючих сполук і зменшується їх біологічна активність та погіршується якість кінцевого продукту.

Застосування гарячої води як екстрагента зумовлено тим, що необхідна дія на сечовивідну систему в найбільшій мірі досягається в лікарських формах, отриманих при водній екстракції лікарських рослин, що входять до складу рослинної суміші.

Значна залежність виходу екстрактивних речовин від умов проведення подрібнення і екстракції рослинної сировини підтверджується тим, що за

способом вихід екстрактивних речовин складає 89,9-92,7%, в той час як за способом-прототипом - 47-48%, причому при екстракції даним способом кількість екстрагенту в 1,3-2,0 рази менша, ніж при екстракції за способом-прототипом.

Умови проведення процесів упарювання і сушки екстракту також залежать від його властивостей: термолабільності, схильності до окислення і осмолювання внаслідок теплової обробки. Сушка методом розпилення дає можливість отримати сухий екстракт у вигляді порошку, не здатного до легкого окислення і осмолювання. З метою одержання з нього гранул необхідної якості, автори використали у складі фіточаю цукрову пудру, яка виконує декілька функцій: коригента смаку, наповнювача, зв'язуючої речовини, консерванту і гідрофільного пластифікатора. Використання цукрової пудри в незначних кількостях, необхідних для коригування смаку, не призвело до поліпшення технологічних і фармакотерапевтичних властивостей отриманих гранул, які розпадалися, осмолювалися, комкувалися. Для виключення цих недоліків підвищили вміст цукрової пудри до кількостей, що заявляються. Крім того, цукрова пудра, яку застосовують як наповнювач, не є інертним формоутворювачем, а значною мірою визначає швидкість і повноту вивільнення і всмоктування біологічно активних речовин з гранул фіточаю. Використання цукрової пудри як зв'язуючої речовини забезпечує міцність гранул фіточаю за рахунок утворення агломератів при взаємодії цукрової пудри з сухим екстрактом. Як консервант цукрова пудра гарантує стабільність готового продукту. Цукрову пудру в якості гідрофільного пластифікатора використовують для поліпшення розпадаємості гранул фіточаю при розчиненні їх у воді.

При проведенні процесу гранулювання суміш сухого екстракту і цукрової пудри зволожують спиртом етиловим. Найбільш прийнятні концентрації спирту етилового були визначені експериментально. Так, при зволоженні суміші 85-96% спиртом етиловим отримують якісні гранули, які добре розчиняються у воді. При зволоженні суміші 80-84% спиртом етиловим через надлишок вологи в гранулах в процесі подальшої сушки спостерігається перегрів продукту, внаслідок чого при зберіганні гранули осмолюються і стають пластиліноподібними. Використання 95-96% спирту етилового при промисловому виробництві, відповідно до вимог техніки безпеки, не рекомендується. Таким чином, використання 85-94% спирту етилового як зволожувача забезпечує одержання фіточаю у вигляді швидко розчинних гранул високої якості при дотриманні правил безпеки технологічного процесу.

## Порівняльний аналіз заявляемого способу і способу-прототипу

Спосіб-прототип 1	Заявляємий спосіб 2
1. Роздільне подрібнення рослинної сировини (окремо кожного компоненту) з подальшим змішуванням 2. Екстракція суміші рослинної сировини гарячою водою шляхом настоювання протягом 20 хв. 3. Фільтрація отриманого екстракту, одержання кінцевого продукту - настою	1. Екстракція з одночасним подрібненням суміші рослинної сировини гарячою водою протягом 40 хв. 2. Фільтрація отриманого екстракту 3. Упарювання екстракту 4. Фільтрація упареного екстракту 5. Сушка екстракту 6. Змішування сухого екстракту з цукровою пудрою 7. Зволоження суміші 85-94% спиртом етиловим 8. Гранулювання вологої маси 9. Сушка гранул

Таким чином, даний спосіб одержання лікувально-профілактичного фіточаю проносної дії у вигляді швидкорозчинних гранул є ресурсозберігаючою технологією, завдяки якій підвищується вихід і стабільність біологічно активних речовин готового продукту, а також забезпечуються норми мікробної чистоти і значно збільшується термін його зберігання та застосування.

## Джерела інформації.

1. Авторское свидетельство СССР № 235916, кл. А 61 К 2/03. Оpubл. Бюл. "Открытия, изобретения, промышленные образцы, товарные знаки", 1969. - № 6.

2. Авторское свидетельство СССР № 1237211, кл. А 61 К 35/78. Оpubл. Бюл. "Открытия, изобретения", 1986. - № 22.

3. Авторское свидетельство СССР № 797101, кл. А 61 К 35/78. Оpubл. Бюл. "Открытия, изобретения, промышленные образцы, товарные знаки", 1981. - № 2.

4. Авторское свидетельство СССР № 1145911 А, кл. А 61 К 35/78. Оpubл. Бюл. «Открытия, изобретения», 1985. - № 10.

5. Машковский М.Д. Лекарственные средства. - Харьков: Торсинг, 1997. - Т. 1. - С. 334 (прототип).

ДП "Український інститут промислової власності" (Укрпатент)  
 Україна, 01133, Київ-133, бульв. Лесі Українки, 26  
 (044) 295-81-42, 295-61-97

Підписано до друку \_\_\_\_\_ 2001 р. Формат 60х84 1/8.  
 Обсяг \_\_\_\_\_ обл.-вид. арк. Тираж 50 прим. Зам. \_\_\_\_\_

УкрІНТЕІ, 03680, Київ-39 МСП, вул. Горького, 180.  
 (044) 268-25-22