



СОЮЗ СОВЕТСКИХ  
СОЦИАЛИСТИЧЕСКИХ  
РЕСПУБЛИК

ДЛЯ СЛУЖЕБНОГО ПОЛЬЗОВАНИЯ ЭКЗ. №

000132

(19) SU (11) 1098114 A

3(51) A 61 K 35/78

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ СССР  
ПО ДЕЛАМ ИЗОБРЕТЕНИЙ И ОТКРЫТИЙ

## ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

(21) 3375430/28-13

(22) 04.01.82

(71) Харьковский государственный фармацев-  
тический институт

(72) В. Н. Ковалев, В. И. Дихтярев,  
Н. Ф. Комиссаренко, Л. Д. Халеева  
и И. Н. Тимашева

(53) 615.45:615.7 (088.8)

(56) Заявка СССР № 3966130/28-13 с  
приоритетом от 16.12.81, кл. А 61 К 35/78  
(прототип).

(54) (57) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ КОМПЛЕКСА  
БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ СОЕДИНЕНИЙ,  
ОБЛАДАЮЩЕГО САХАРОСНИЖАЮЩИМ ДЕЙ-  
СТВИЕМ путем экстракции растительного  
сырья водным этанолом, упаривания и очистки  
целевого продукта этанолом с последующей  
сушкой, отличающийся тем, что,  
с целью упрощения способа и повышения ак-  
тивности целевого продукта, экстракции подвер-  
гают траву фасоли обыкновенной (*Phaseolus*  
*vulgaris* L.) при соотношении сырье -  
экстрагент 1:2,5-1:3, полученный экстракт упаривают до 1/10-1/11 части первоначального  
объема.

(19) SU (11) 1098114 A

Рис.

Изобретение относится к фармацевтической промышленности, а именно к получению лекарственных препаратов из растительного сырья.

Известен способ получения комплекса веществ, обладающего гипогликемическим действием, из травы гороха посевного (*Pisum sativum* L.) путем экстракции измельченного сырья 40–50%-ным этанолом при соотношении сырье-экстрагент 1:4–1:6, упаривания полученного экстракта до 1/12–1/14 первоначального объема, обработки равным объемом 96%-ного этанола, упаривания, очистки хлористым метилом и сушкой под вакуумом [1].

Недостатками данного способа являются трудоемкость процесса за счет стадии очистки хлористым метилом и недостаточно высокое сахароснижающее действие целевого продукта, полученного данным способом.

Целью изобретения является упрощение способа и повышение активности целевого продукта.

Поставленная цель достигается способом получения комплекса биологически активных соединений, обладающего сахароснижающим действием путем экстракции растительного сырья водным этанолом, упаривания и очистки целевого продукта этанолом с последующей сушкой, в котором отличие состоит в том, что экстракции подвергают траву фасоли обыкновенной (*Phaseolus vulgaris* L.) при соотношении сырье: экстрагент 1:2,5–1:3, полученный экстракт упаривают до 1/10–1/11 части первоначального объема. Выход 4,5–5,1% от веса воздушно-сухого сырья.

Конкретный пример осуществления способа. 2 кг измельченной до размера частиц 1,5–2 мм сухой травы зерновых сортов фасоли обыкновенной (*Phaseolus vulgaris* L.), например сорта "Днепрова-8", собранной после уборки семян, экстрагируют 50%-ным этанолом в соотношении 1:3 при комнатной температуре в течение 24 ч, затем перкодируют (выдерживая соотношение сырье-растворитель) до получения 21 л экстракта, который упаривают до 1,9 л водного остатка и оставляют на 4–5 ч при 5–10°C для осаждения смолистых веществ, осадок которых отфильтровывают, а надосадочную жидкость смешивают с 3,8 л 96%-ного спирта. Выделившийся аморфный осадок (белки, полисахариды) отделяют, а фильтрат упаривают в вакуум-циркуляционном аппарате с остаточным давлением 15 мм рт. ст. до получения сухого продукта. Получают 0,102 кг порошка. Выход — 5,1%.

Полученный продукт представляет собой желто-коричневый негигроскопичный порошок очищенного комплекса биологически активных

соединений, в состав которого входят флавоноиды, изофлавоноиды, фенолкарбоновые кислоты, оксикумарины, гаунидины и аминокислоты. Очищенный комплекс хорошо растворим в воде, водных растворах низших спиртов (концентрация спирта до 80%), плохо растворим в чистых низших спиртах, не растворим в эфире и хлороформе.

Гипогликемическая активность изучалась на здоровых кроликах породы Шиншилла весом 2,5–3,0 кг. Рацион животных состоял из сена, овса и воды.

Оптимальной дозой, проявляющей сахароснижающее действие для изучаемого препарата, является 100 мг/кг.

Кровь для анализа брали из ушной вены через 2,4,6,8,10 и 24 ч после однократного введения препарата в указанной дозе. Контролем служили кролики-аналоги, не получавшие исследуемого комплекса. Содержание сахара в крови контрольных кроликов определялось через те же промежутки времени.

Параллельно, для сравнения, исследовалась гипогликемическая активность перорального ангидабетического препарата "Бутамид", широко применяемого в клинической практике, в оптимальной для него дозе — 50 мг/кг.

Комплекс исследовался на 6 кроликах. Количество сахара в крови определялось ортотолуидиновым методом. Полученные экспериментальные данные приведены в таблице.

Проведенные биологические испытания показали ярко выраженное сахароснижающее действие, превышающее специфическую активность прототипа и бутамида — широко применяемого перорального ангидабетического средства. Полученный комплекс достигает максимального действия в течение первых 6 ч и снижает уровень сахара в крови в 1,5 раза сильнее, чем прототип, и в 1,6 раза, чем бутамид (см. таблицу).

Положительный эффект изобретения заключается в упрощении технологии за счет исключения стадии очистки галогенпроизводным, сокращения времени получения конечного продукта с 55 до 39,5 ч, снижении себестоимости, расширении арсенала сахароснижающих лекарственных средств, использовании доступного и дешевого сырья и растворителей, высоком выходе очищенного конечного продукта с ярко выраженной сахароснижающей активностью.

Фасоль обыкновенная возделывается в СССР и других странах как пищевая культура на значительных площадях. Трава после обмолота семян является бросовым отходом производства и может быть использована для получения сахароснижающего препарата растительного происхождения.

Сравнительная характеристика прототипа, синтетического аналога (бутаамид)  
и изобретения

Показатели	Прототип	Синтетический аналог	Изобретение
Соотношение сырье-растворитель	1:4-1:6	—	1:2,5-1:3
Упаривание до объема	1/12-1/14	—	1/10-1/11
Соотношение объемов осаждае- мого спирта	1:1	—	1:2
Очистка галогенпроизводным	Имеется	—	Отсутствует
Выход, %	7,5-8,5	—	4,5-5,1
Снижение уровня сахара в кро- ви,%, за 4 ч	34,4	25,3	44,7
за 6 ч	33,6	30,0	48,8
за 24 ч	15,68	4,9	21,2
за 48 ч	—	—	18,0
Токсичность LD <sub>50</sub> , мг/кг	5643	750	5300

Редактор Е. Ходакова

Составитель Е. Волкова  
Техред М. Парошай

Корректор О. Луговая

Заказ 5165/ДСП

Тираж 448

Подписное

ВНИИПИ Государственного комитета СССР  
по делам изобретений и открытий  
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Филиал ППП "Патент", г. Ужгород, ул. Проектная, 4

