



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **12228** (13) **U**
(51) МПК (2006)
A61K 36/00МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС

ДО ДЕКЛАРАЦІЙНОГО ПАТЕНТУ
НА КОРИСНУ МОДЕЛЬвидається під
відповідальність
власника
патенту

(54) ПРЕПАРАТ СЕДАТИВНОЇ ДІЇ "СЕДАВІТ"

(21) u200508602
(22) 08.09.2005
(24) 16.01.2006
(46) 16.01.2006, Бюл. № 1, 2006 р.
(72) Дячок Василь Володимирович
(73) АКЦІОНЕРНЕ ТОВАРИСТВО ВІДКРИТОГО
ТИПУ "ГАЛИЧФАРМ"
(57) Препарат седативної дії, що містить корене-
вище та корені валеріани, листя м'яти перцевої та
спирт етиловий, який **відрізняється** тим, що до-
датково містить плоди глоду, траву звіробою, ши-
шки хмелю, піридоксин гідрохлорид, нікотинамід,

сорбіт та воду при наступному співвідношенні ком-
понентів, г/л:

кореневище та корені валеріани	33,84-41,36
плоди глоду	33,84-41,36
трава звіробою	16,92-20,68
листя м'яти перцевої	33,84-41,36
шишки хмелю	33,84-41,36
піридоксин гідрохлорид	0,54-0,66
нікотинамід	2,7-3,3
сорбіт	90,0-110,0
спирт етиловий	233,0-285,0
вода	решта.

Корисна модель відноситься до медицини, зо-
крема, до фітотерапії, і може бути використана в
хіміко-фармацевтичній галузі при одержанні рідкої
форми лікарського препарату на основі рослинної
сировини, який має заспокійливу дію.

Підвищення рівня невротичних та серцево-
судинних захворювань, які є негативним проявом
розвитку цивілізації, потребує удосконалення та
розробки нових форм лікарських засобів, орієнто-
ваних на упередження та лікування різного роду
психогенних та серцево-судинних розладів. На
сьогоднішній день найбільш ефективними засоба-
ми є седативні, які широко представлені на фар-
мацевтичному ринку. Існує широкий спектр дієвих
препаратів, вироблених на основі синтетичної си-
ровини, до яких, наприклад, можна віднести похід-
ні піридину, бензодіазепіну, барбітурової кислоти
(циклобарбітал, нітрозепам (радедорм), матаквал-
лон та ін. [Машковский М.Д. Лекарственные средс-
тва, М.: Медицина, т.1, с.31-36, 1982].

Всі ці препарати об'єднує один спільний недо-
лік - негативні побічні прояви після вживання, які
позначаються на здоров'ї людини. Як правило, це
проявляється у появі важкості в голові, тривожно-
му та сонливому стані, тахікардії, тощо. Препарати
протипоказані особам, діяльність яких потребує
швидкої психічної та фізичної реакції.

На фоні цих проявів вигідно вирізняються пре-
парати, виготовлені не на синтетичній, а на рос-
линній сировині, тому що негативні наслідки від їх
вживання практично відсутні або ж зведені до мі-

німуму. Через це розробка седативних рослинних
засобів має важливе медико-соціальне значення.

Але сучасна фармацевтична галузь потребує
від седативних препаратів ще й властивостей за-
гальнозміцнюючих, які б окрім основної, заспокій-
ливої дії, були б в змозі підвищити опірність орга-
нізму до різноманітних захворювань.

В патенті Росії №2012347 [МПК⁷:A61K35/78,
опубл. в Бюл. №9, 1994р.] описаний засіб, який
здебільшого застосовується для лікування без-
соння і має в своєму складі листя м'яти перцевої,
траву пустинника, кореневища з коренями валері-
ани, суцвіття хмелю, траву душиці, листя трилис-
ника водяного, плоди глоду, траву фіалки та плоди
хмелю.

Інгредієнти, що входять до складу цього пре-
парату, мають вузьконаправлену, суто лікувальну
дію - вони є спазмолітичними та заспокійливими.
Тобто, цей засіб не містить компонентів, які можна
було б віднести до ряду загальнозміцнюючих. І хоч
деякі з них багаті на цілющі мікроелементи та ві-
таміни, масова доля цих інгредієнтів в загальній
масі препарату є недостатньою для виявлення
впливу корисних речовин на організм людини.

Окрім цього, препарат являє собою водний
настій збору вищезазначених трав, і, як і будь-який
водний настій, є нестабільним та має низький тер-
мін придатності - декілька діб.

Відомий седативний засіб, що має назву "Фі-
тосед", виготовлений на основі екстракту суміші
лікарської сировини - шишок хмелю, квітів глоду,

(13) **U**
(11) **12228**
(19) **UA**

листя меліси, кореневищ та коренів ехінацеї та синюхи, трави полину та трави кропиви собачої [Патент України №28670, МПК⁷:A61K35/78, опубл. в Бюл. №5, 2000р.]. У порівнянні з вищезгаданим цей засіб може зберігатись досить довго, але він також має вузьконаправлену, суто специфічну дію.

Більш розширений спектр впливу на організм людини має описаний в патенті України №22666 (МПК⁷:A61K35/78, опубл. в Бюл. №3, 1998р.) препарат, до складу якого входить хміль, пустинник, овес, глід, меліса або м'ята, коріандр та донник. Цей препарат збагачений вітамінами за рахунок наявності в ньому вівса та плодів коріандру, він позитивно впливає на осіб із захворюваннями печінки, кишково-шлункового тракту та астеної. Але все ж кількісний склад біологічно-активних інгредієнтів препарату є недостатнім для багатоманітного позитивного впливу на організм.

Відомий седативний та анксиолітичний засіб під назвою "Новопасит", який широко застосовується при лікуванні неврастенії, головного болю, мігрені, підвищенні нервово-м'язової збуджуваності, нейроциркуляторній дистонії тощо (Виробництво Чеської республіки, реєстраційне посвідчення № UA /1830/01/01, Рекламний проспект МОЗ України). Фармакологічно активним компонентом "Новопаситу" є гвайфенезин та екстракт із лікарських трав - валеріани, меліси, звіробою, глоду, пасифлори, хмелю та бузини чорної. Крім цього, до складу "Новопаситу" входить цілий ряд допоміжних речовин, як-то: пропіленгліколь, натрію цикламат, камедь ксантонова, інвертоза, натрію бензоат, натрію сахаринат моногідрат, етанол, ароматизатор апельсиновий, натрію цитрат дигідрат та мальтодекстрин).

Склад "Новопаситу" свідчить про те, що він не може бути віднесений до ряду препаратів, виготовлених на основі лікарської сировини, адже його основою, окрім рослинного екстракту, є синтетична речовина - гвайфенезин, причому її масова частка в готовому продукті складає більше половини маси рослинного екстракту. Крім цього, допоміжні речовини теж не рослинного походження. До того ж препарат "Новопасит" має багато протипоказань - він може викликати запаморочення, втому, сонливість, свербіж, печію, пронос, запор, м'язову слабкість.

За прототип запропонованої корисної моделі прийнятий препарат седативної дії, що включає кореневище та корені валеріани, листя м'яти перцевої та спирт етиловий [Патент Росії №2137496, МПК⁷:A61K35/78, опубл. в Бюл. №26, 1999р.].

Цей препарат має назву "Кардіофіт" і є широко відомим як засіб для лікування серцево-судинних захворювань. До складу "Кардіофіту" входить (в мас. %):

квіти глоду	0,6-0,8;
чорної	0,6-0,8;
листя м'яти перцевої	0,6-0,8;
листя кропиви	0,3-0,5;
листя омели білої	0,5-0,6;
трава горицвіту	0,6-0,8;
трава донника	0,6-0,8;
трава конвалії	0,6-0,8;
трава пустинника	0,6-0,8;

трава чебрецю	0,6-0,8;
плоди аморфи	0,6-0,8;
кореневища з коренями	
валеріани	0,9-1,1;
кореневища з коренями солодки	0,6-0,8;
насіння кінського каштану	0,9-1,1;
спирт	решта..

Але зазначений якісний і кількісний склад "Кардіофіту" не дозволяє забезпечити достатньо високий і багатоманітний вплив діючих речовин на організм. Через це препарат не поєднує в собі властивостей лікувального і загальнозміцнюючого одночасно, і є, скоріше, суто лікувальним, з вузько направленою дією. Крім цього, "Кардіофіт" є багатоконпонентним розчином, до складу якого входить 15 інгредієнтів, що позначається на його собівартості.

В основу корисної моделі поставлена задача підвищення ефективності препарату седативної дії "Седавіт" шляхом збалансованості якісного і кількісного складу його інгредієнтів, зокрема об'єднання в ньому екстрактів лікарської сировини і вітамінів, що забезпечує комплексний вплив препарату на організм людини, результатом якого є високий терапевтичний ефект, що виражається у стабілізації психо-емоціонального стану, зменшенні проявів тривоги і психічної напруги при одночасному підвищенні загального тону організму та здатності його протистояння тривалим фізичним та нервовим перевантаженням.

Поставлена задача досягається за рахунок того, що препарат седативної дії, що включає кореневище та корені валеріани, листя м'яти перцевої та спирт етиловий, згідно до запропонованої корисної моделі, додатково містить плоди глоду, траву звіробою, шишки хмелю, піридоксин гідрохлорид, нікотинамід, сорбіт та воду при наступному співвідношенні компонентів (г/л):

кореневище та корені валеріани	33,84-41,36;
плоди глоду	33,84-41,36;
трава звіробою	16,92-20,68;
листя м'яти перцевої	33,84-41,36;
шишки хмелю	33,84-41,36;
піридоксин гідрохлорид	0,54-0,66;
нікотинамід	2,7-3,3;
сорбіт	90,0-110,0;
спирт етиловий	233,0-285,0;
вода	решта.

Ознаки запропонованого препарату "Седавіт", які відрізняють його від ознак подібних седативних засобів, що були розглянуті раніше, дозволяють досягти вказаний вище технічний результат.

"Седавіт" містить комплекс лікарських рослин, до складу яких входять біологічно активні речовини, які в передбаченому даним технічним рішенням якісному і кількісному поєднанні підсилюють дію один одного, виявляючи фітокінетичну синергетику. Препарат діє не за принципом сумарного ефекту, а виявляє синергетичний ефект, при якому кожен з інгредієнтів потенціює дію іншого, справляючи на організм ефективну седативну та анксиолітичну дію. Рослини підібрані таким чином, щоб окрім свого основного фармацевтичного впливу (седативного), вони зосереджували б в собі діючі речовини, здатні підвищувати можливо-

сті організму щодо перенесення фізичних і емоціональних перевантажень. А введені до складу "Седавіту" вітаміни РР (нікотинамід) та Ве (піридоксин) каталізують процеси окислення, підсилюють дію цих речовин, відновлюють сили та зміцнюють організм.

Важливою перевагою запропонованого препарату є його високі смакові якості, які вигідно вирізняють "Седавіт" серед загалу седативних лікарських засобів. "Седавіт" містить сорбіт, який не тільки надає йому приємного солодкуватого присмаку, а і значно розширює коло споживачів - такий препарат є безпечним для людей, хворих на цукровий діабет. Взагалі седативна дія "Седавіту" збалансована, м'яка і помірно виражена, з низьким ступенем пригнічення центральної нервової системи і мінімальним впливом на рухову та розумову функції. При цьому він сприяє збереженню активної працездатності та спричиняє загальнозміцнюючий, вегетостабілізуючий, антиаритмічний та спазмолітичний вплив на організм.

Уведення до складу "Седавіту" етилового спирту надає препарату стійкості та збільшує термін придатності, при цьому відпадає потреба у додаванні до препарату будь-яких додаткових синтетичних консервантів.

Кореневища та корені валеріани, що входять до складу запропонованого засобу, спричиняють заспокійливий і спазмолітичний ефект. Її дія обумовлена вмістом ефірного масла, вона є легким снодійним, розслаблює гладку мускулатуру, знижує збудливість центральної нервової системи. Комплекс біологічно активних речовин валеріани спричиняє жовчогінну дію, посилює секреторну активність слизистої оболонки шлунку, уповільнює серцевий ритм і розширює коронарні судини.

Плоди глоду мають седативну, судиннорозширюючу, коронароділатуючу, кардіотонічну, антиаритмічну, спазмолітичну, жовчогінну та противірусну дію.

Терапевтичний вплив глоду пояснюється наявністю в ньому поліфенольних сполучень.

Листя м'яти перцевої спричиняють спазмолітичну, анестезійну, антиангінальну, обезболюючу, кармінативну, антитоксичну дію. Її ефірні масла є жовчогінними. М'ята виділяється з організму із жовчю, завдяки чому спричинює антисептичну дію на жовч та жовчні протоки.

Шишки хмелю містять гірку речовину лупулін, яка має седативний вплив. Комплекс біологічно активних речовин шишок хмелю обумовлює протизапальну, капіляроукріплюючу, гіпосенсибілізуючу дію. Шишки діють заспокійливо на центральну нервову систему, а також викликають легкий білєвгамовуючий та антиспастичний ефект.

Трава звіробою містить діючу речовину гіперіцин, який покращує функціональний стан центральної нервової системи, спричиняє м'який антидепресивний ефект та помірно виражену седативну і анксиолітичну дію.

Вітамінний комплекс, що входить до складу "Седавіту", представлений вітаміном В₆ (піридоксин) та вітаміном РР (нікотинамід).

Піридоксин відіграє важливу роль в обміні речовин, необхідний для нормального функціону-

вання центральної та периферичної нервової системи. Піридоксин є коферментом більшої кількості ферментів, які діють на окисний обмін амінокислот. Піридоксин бере участь в обміні триптофану, метіоніну, цистеїну, глутамінової та інших амінокислот. Відіграє важливу роль в обміні гістаміну, сприяє нормалізації ліпідного обміну.

Нікотинамід бере участь в процесах дихання тканин, жирового та вуглеводного обміну. Механізм дії вітаміну РР пов'язаний з його роллю як складової частини коферментів, що каталізують процеси дихання тканин шляхом перенесення водню від субстрату до відновлюваної речовини. Амід нікотинової кислоти є складовою таких коферментів, як нікотинаміддинуклеотид і нікотинаміддинуклеотидфосфат, які каталізують процеси окислення і відновлення шляхом приєднання або віддачі водню.

Кількісне співвідношення інгредієнтів препарату "Седавіт" вибрано за умови забезпечення їх синергетичної дії, яка виражається в забезпеченні стабільного психоемоційного та фізичного стану людини. При зниженні кількісного вмісту інгредієнтів до величин, менших обумовлених даним технічним рішенням (тобто кореневищ та коренів валеріани менше 33,84г/л, плодів глоду менше 33,84г/л, трави звіробою менше 16,92г/л, листя м'яти перцевої менше 33,84г/л, шишок хмелю менше 33,84г/л, піридоксину гідрохлориду менше 0,54г/л, нікотинамиду менше 2,7г/л, сорбіту менше 90,0г/л, спирту етилового менше 233,0г/л) седативні та анксиолітичні властивості препарату різко знизяться, і він втратить свою заспокійливу дію.

Перевищення цього вмісту за межі максимальних величин, передбачених технічним рішенням (тобто коренів валеріани більше 41,36г/л, плодів глоду більше 41,36г/л, трави звіробою більше 20,68г/л, листя м'яти перцевої більше 41,36г/л, шишок хмелю більше 41,36г/л, піридоксину гідрохлориду більше 0,66г/л, нікотинамиду більше 3,3г/л, сорбіту більше 110г/л, спирту етилового більше 285г/л) є нераціональним, тому що в цьому випадку через підвищений вміст біологічно активних речовин препарат спричинятиме негативні побічні наслідки, які виражаються у виникненні втоми, сонливості, головокружінні, нудоті, загальмованості реакцій тощо. Саме в межах інтервалу від мінімально до максимально допустимого кількісного вмісту кожного з інгредієнтів запропонований препарат проявляє свою заспокійливу та оздоровчу дію.

В наведеній нижче таблиці показані конкретні приклади впливу "Седавіту" на організм людини. Приклад 1 - препарат, у якому вміст кожного інгредієнту менший, ніж це передбачено запропонованим технічним рішенням. Приклад 2 - інгредієнти присутні в мінімально допустимій кількості, приклад 3 і 4 - вміст інгредієнтів укладається в передбачений технічним рішенням інтервал від мінімального до максимального значення. Приклад 5 передбачає максимально допустимий вміст інгредієнтів, Приклад 6 - вміст інгредієнтів перевищує максимально допустиму величину, передбачену рішенням.

Таблиця

№	Інгредієнти, г/л										Характеристика впливу препарату
	кореневище та корені валеріани	плоди глоду	трава звіробою	листя м'яти перцевої	шишки хмелю	піридоксин гідрохлорид	нікотинамід	сорбіт	спирт	вода	
1	30,84	30,84	13,92	30,84	30,84	0,50	2,0	75	50	решта	Препарат має слабо виражені седативні властивості. За смаковими якостями подібний до слабого рослинного чаю. Має нейтральний вплив на організм людини
2	33,84	33,84	16,92	33,84	33,84	0,54	2,7	90,0	233	решта	Седативні та ансіолітичні властивості препарату задовільні, але дещо знижені.
3	37,6	37,6	18,8	37,6	37,6	0,6	3,0	100	259	решта	Препарат діє заспокійливо, стабілізує психоемоційний стан людини, зменшує прояви тривоги, усуває безсоння і одночасно підвищує тонус
4	35,6	35,6	17,8	35,6	35,6	0,56	2,9	105	250	решта	Препарат діє заспокійливо, стабілізує психоемоційний стан людини, зменшує прояви тривоги, усуває безсоння і одночасно підвищує тонус
5	41,36	41,36	20,68	41,36	41,36	0,66	3,3	110	285	решта	Після вживання препарату спостерігається помірно виражена загальмованість реакцій. Працездатність при цьому не знижується
6	44,36	44,36	23,68	44,36	44,36	0,96	5,3	130	290	решта	Вживання препарату викликає сонливість і загальмованість реакцій.

Як видно з таблиці, найбільш оптимальними є композиції, наведені в прикладах №3 і 4, інгредієнти яких вміщуються в обумовлений винаходом кількісний інтервал. Такі композиції проявляють свою заспокійливу та оздоровчу дію найбільш ефективно і не мають побічних наслідків..

Приготування препарату "Седавіт" здійснюють наступним чином:

Подрібнену рослинну сировину подають в приміщення екстракції. Спирт етиловий 35%-ний готують в реакторі об'ємом 1 м³. Для цього в мірник подають розраховану кількість 226,32л спирту етилового 96%-ного, з них 220,0л подають з мірника по спиртопроводу насосом і 6,32л з мірного циліндру, щоб було приготовлено 760,0л 35%-ного спирту, враховуючи залишок екстракту, злитий зі шроту. Мірник і реактор перед початком роботи продувають інертним газом. В підготовлений реактор самопливом подають спирт з мірників кількості 226,32л. Зі збірника за допомогою вакууму подають в реактор залишок екстракту, злитий зі шроту в кількості близько 136,0л. В мірник вакуумом подають воду очищену в кількості 413,5л (з них 3,5л

подають мірним циліндром) з відділення водопідготовки. З мірника воду очищену самопливом подають в реактор. Перемішують масу протягом 10-15 хв. Після цього визначають концентрацію спирту. Тривалість проведення цієї стадії 2 години.

Приготовлений 35%-ний спирт в кількості 760,0л одразу ж перетискують інертним газом в мірник і з нього по потребі передають на наступну операцію -екстракцію.

Екстракцію рослинної сировини проводять в приміщенні екстракції паралельно в двох екстракторах ємністю 0,25м³, обладнаних оболонкою для обігріву паром, верхнім і нижнім лотком для завантажування і вивантажування сировини.

Подрібнену сировину - кореневища з коренями валеріани, плоди глоду, листя м'яти перцевої, шишки хмелю двічі зважують в кількості по 10,34 кг, траву звіробою подрібнену двічі в кількості по 5,17 кг. Перед завантажуванням на дно екстракторів вкладають обшите бавовняною тканиною несправжнє днище. В екстрактори завантажують рослинну сировину порціями, чередуючи і трамбуєчи, одночасно зволожуючи її приготівленим 35%-ним

етиловим спиртом, який самопливом надходить із мірника. На зволоження витрачається до 100,0л спирту (в кожний екстрактор). На зволожену сировину для запобігання її спливання кладуть решітку. По трубопроводу з мірника в кожен екстрактор перетискують інертним газом 35%-ний спирт в кількості 100л до утворення "дзеркала" екстрагенту, тобто висота шару його над сировиною повинна бути 15-20см.

Настоювання здійснюють протягом 24год при температурі не нижче 18-20°C. При необхідності вміст екстракторів прогрівають, подаючи пар в оболонку екстракторів. По закінченні цього часу самопливом зливають перший екстракт в кількості 100кг/103,4л (з кожного екстрактора) в проградуйований збірник, зважуючи його. Отриманий екстракт вакуумом збирають із першого збірника в другий. Після зливання першого екстракту в обидва екстрактори, аналогічно вищеописаному етапу, подають 35%-ний спирт в кількості 90л до утворення "дзеркала" екстрагенту. Настоювання проводять 2 години при температурі не нижче 18-20°C. При необхідності вміст екстракторів прогрівають. По проходженні цього часу з обох екстракторів самопливом зливають другий екстракт в кількості 90 кг/93,06л. в проградуйований збірник, зважуючи його. Отриманий екстракт вакуумом забирають із першого збірника в другий. Після зливання другого екстракту в обидва екстрактори, аналогічно вищеописаному етапу, подають 35%-ний спирт в кількості 90л до утворення "дзеркала". Настоювання проводять протягом 2 годин при температурі не нижче 18-20°C, при необхідності вміст екстрактора прогрівають. Після цього з кожного екстрактора зливають третій екстракт в кількості 60,0 кг/62,04л. Отриманий екстракт вакуумом забирають із першого збірника в другий. Зібрані екстракти забирають вакуумом із другого збірника

через фільтр-грибок в реактор для проведення наступної операції. Після збирання третього екстракту зливають в перший збірник залишок екстракту із шроту в кількості близько 68,0л (з кожного екстрактора). Отриманий залишок екстракту аналізують на вміст спирту, відібравши для цього 100 мл екстракту, і використовують його для наступних завантажень. Після зливання залишку екстракту з екстракторів вивантажують відпрацьований шрот. Тривалість проведення операції - 45 годин.

Відстоювання екстрактів проводять в реакторі. Після отримання в реакторі трьох екстрактів (з двох екстракторів в кількості 500кг) екстракти змішують протягом 30хв. Одержаний комплексний екстракт для "Седавіту" відстоюють 48 годин при температурі 10±2°C. Температуру контролюють особливо ретельно, не допускаючи переохолодження екстракту. Для одержання заданої температури в оболонку реактора подають охолоджуючий розчин з холодильної установки.

Після відстоювання отриманий екстракт перетискують на пуч-фільтр. Після фільтрації відбирають пробу на аналіз і при одержанні позитивного результату профільтрований екстракт вакуумом забирають в реактор для проведення наступної стадії - змішування компонентів препарату.

Змішування компонентів препарату проводять в реакторі, обладнаному перемішувачем і оболонкою, в якому знаходиться профільтрований комплексний екстракт для "Седавіту" в кількості близько 499,34 кг.

Серія препарату формується в реакторі і складається з двох завантажень комплексного екстракту по 249,67кг і відповідної кількості вітамінів і сорбіту. "Седавіт" вивантажують з реактора порціями, подаючи на фільтр, після чого його фасують, пакують та маркують.