



УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **82981**

(13) **U**

(51) МПК

**A61K 36/67** (2006.01)

**A61P 25/08** (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ**

(21) Номер заявки: **u 2013 01607**

(22) Дата подання заявки: **11.02.2013**

(24) Дата, з якої є чинними  
права на корисну  
модель: **27.08.2013**

(46) Публікація відомостей  
про видачу патенту: **27.08.2013, Бюл.№ 16**

(72) Винахідник(и):

**Прокопенко Юлія Сергіївна (UA),  
Міщенко Володимир Анатолійович (UA),  
Георгіянц Вікторія Акопівна (UA)**

(73) Власник(и):

**НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ  
УНІВЕРСИТЕТ,  
вул. Пушкінська, 53, м. Харків, 61002 (UA)**

**(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ СУХОГО ЕКСТРАКТУ З ТРАВИ ПЕРЦЮ ОДНОРІЧНОГО З  
ПРОТИСУДОМНОЮ ДІЄЮ**

**(57) Реферат:**

Спосіб одержання сухого екстракту з трави перцю однорічного з протисудомною дією шляхом екстракції рослинної сировини спиртом етиловим протягом 2,0 годин з подальшою фільтрацією, упарюванням та сушінням. Як рослинну сировину використовують траву перцю однорічного *Capsicum annuum*. Екстракцію проводять 40 % етанолом при температурі 60-80 °C і співвідношенні сировина-етанол 1:20.

**UA 82981 U**



Корисна модель належить до фармації та медицини, а саме до способу одержання засобу рослинного походження з протисудомною дією, який може бути використаний як активна субстанція при створенні лікарських препаратів для лікування та профілактики захворювання на епілепсію.

Терапія епілептичних захворювань передбачає тривале застосування лікувальних засобів. У цьому випадку доцільне використання препаратів рослинного походження, які, на відміну від синтетичних, практично не мають побічної дії, як правило не викликають алергічної реакції, є не токсичними і придатними до тривалого застосування без формування залежності. Сучасний ринок протисудомних засобів представлений переважно препаратами синтетичного походження. Перелік препаратів рослинного походження досить обмежений. Тому проблеми створення нового комплексу біологічно активних речовин з протисудомною дією є достатньо актуальною.

Існують різні способи одержання з рослинної сировини комплексу біологічно активних речовин, які мають протисудомну дію у комплексі з іншими видами фармакологічної активності.

Найближчим до заявленого способу за сукупністю ознак є спосіб одержання препарату з трави водяники чорної, що має протисудомну дію (патент РФ № 1312777, БИ 19, 1987) [1]. Суть способу полягає в екстракції рослинної сировини 70 %-ним етанолом при температурі 75-85 °С протягом 120-180 хвилин при співвідношенні сировина - етанол 1:10 з подальшим упарюванням витягу насухо.

Однак засіб, отриманий за цим способом, має невисоку протисудомну дію: ЕД<sub>50</sub> по тесту максимального електрошоку (МЕШ) становить 776 мг/кг.

Задачею корисної моделі є створення нового способу одержання біологічно активних речовин з протисудомною дією, який завдяки використанню як сировини трави перцю однорічного і проведення процесу при заданих параметрах забезпечує одержання ефективного засобу у формі сухого рослинного екстракту з вираженою протисудомною дією, а заявлений спосіб є простим і економічно доцільним при промисловому здійсненні.

Поставлена задача вирішується таким чином, що у способі одержання сухого екстракту з трави перцю однорічного з протисудомною дією шляхом екстракції рослинної сировини спиртом етиловим 40 % протягом 2,0 годин з подальшою фільтрацією, упарюванням та сушінням, згідно з корисною моделлю, як рослинну сировину використовують траву перцю однорічного *Capsicum annuum*, а екстракцію проводять 40 % етанолом при температурі 60-80 °С і співвідношенні сировина-екстрагент 1:20.

Всі параметри заявленого способу визначено експериментальним шляхом з урахуванням біологічної активності одержаних комплексів, ефективності, доступності та нешкідливості реактивів, практичного відтворення способу у промислових умовах.

Дослідним шляхом було визначено, що оптимальним екстрагентом для трави перцю однорічного є етанол. Саме такий екстрагент у сукупності з рештою параметрів заявленого способу, забезпечує інтенсифікування процесу екстрагування, що дозволяє максимально витягати з сировини комплекс БАР, який має протисудомну дію. Крім цього, такий екстрагент вигідний з боку технологічних вимог до здійснення способу, бо є доступним та екологічно безпечним.

Сумарне співвідношення сировини до екстрагенту 1:20 встановлено експериментально та є оптимальним для вибраної сировини.

Загальна тривалість усіх етапів екстракції складає 6,0 годин і є достатньою для вичерпного витягнення з сировини комплексу біологічно активних сполук з протисудомною дією.

Крім цього одержаний екстракт у сухому вигляді якісно відрізняється за своїми фармако-технологічними параметрами: характеризується задовільними сипкими властивостями, а також меншою гігроскопічністю, що забезпечує стійкість засобу при зберіганні.

Авторами вперше запропоновано використання трави перцю однорічного *Capsicum annuum* для одержання комплексу біологічно активних сполук з протисудомною дією.

Перець однорічний (*Capsicum annuum* L.) - трав'яниста рослина родини Пасльонових (*Solanaceae*). Перець однорічний добре розповсюджений по всій території України, тому на сьогоднішній день відсутня проблема пошуку сировинної бази даної рослини.

Плоди перцю однорічного широко застосовуються у харчовій промисловості. У фармацевтичній промисловості існує ряд лікарських засобів з екстрактом плодів перцю однорічного, що призначені для лікування запальних захворювань м'язів та суглобів, обморожень, для розігрівання м'язів до або після фізичних тренувань, профілактики алопецій, тощо [2, 3].

Трава перцю однорічного не використовується через її недостатньо вивчений хімічний склад. В літературних джерелах відсутні дані про наявність протисудомної активності

препаратів трави перцю однорічного. Заявлений засіб отримують простим, доступним способом.

Повітряно-суху лікарську рослинну сировину подрібнювали на порошок до розміру часток, що проходять крізь сито з отворами розміром 0,5 мм. Після чого її вміщували в екстрактор та додавали спирт етиловий 40 % при співвідношенні сировина-екстрагент 1:20. Екстракцію проводили при температурі 80 °С протягом 2 годин. Процес повторювали 2 рази. Отримані екстракти об'єднували, фільтрували і концентрували у вакуум-випарному апараті, при температурі 55-60 °С і тиску 80-87 кПа, до густої консистенції.

Отриманий напівпродукт піддавали сушці у вакуум-сушильній шафі до залишкової вологості 5 %.

Отриманий кінцевий продукт - порошок зелено-коричневого кольору та однорідного складу, із слабким специфічним запахом.

Протисудомна активність отриманого сухого екстракту з трави перцю однорічного ілюструється прикладом.

Приклад 1.

1,0 кг подрібненої повітряно-сухої трави перцю однорічного заливають 20,0 л етанолу 40 % і екстрагують при перемішуванні та постійно підтримуваній температурі 80 °С протягом 2,0 годин. Екстракцію повторюють 20,0 л етанолу 40 % протягом 2 годин. Одержані екстракти 17,5 л та 19,7 л, відповідно, об'єднують, відфільтровують та упарюють до повного висушування. Сухий екстракт подрібнюють. Вихід сухого екстракту становить 238,0 г, тобто 23,8 %.

Приклад 2.

Вивчення протисудомної дії сухого екстракту з трави перцю однорічного проводили на моделі коразолових (пентилентетразолових) судом у білих щурів. Для дослідження було відібрано 18 нелінійних білих щурів масою 160-210 грамів, яких розподілили на наступні групи відповідно до препарату, що вони його одержували:

1. Контроль (коразол), n=6.

2. Заявлений засіб (30 мг/кг) + коразол, n=6.

3. Діазепам (0,5 мг/кг) + коразол, n=6.

З метою визначення протисудомної активності використано режим профілактичного введення заявленого засобу.

Заявлений засіб у вигляді водного розчину сухого екстракту з трави перцю однорічного у дозі 30 мг/кг, а також препарат порівняння - діазепам у дозі 0,5 мг/кг - вводили інтраперитонеально протягом 4 днів, за 30 хвилин до введення конвульсанту.

Щурам групи контрольної патології у такому ж режимі вводили інтраперитонеально конвульсант у дозі 70 мг/кг.

Оцінку протисудомної дії проводили за такими показниками: латентний період клонічних або тонічних судом, кількість клоніко-тонічних пароксизмів на 1 щура, кількість тварин із клонічними та тонічними нападами, тяжкість пароксизмів у балах, тривалість судомного періоду, час загибелі та летальність. Якщо судоми не спостерігались протягом 1 год., то вважали, що латентний період дорівнює 60 хв.

Інтенсивність судомного нападу оцінювали за допомогою 6-бальної шкали: 0 - відсутність судомної активності, 1 - гіперкінезія, 2 - тремтіння, посмикування, 3 - клонічні судоми передніх кінцівок з підйомом на задні кінцівки, 4 - виражені клоніко-тонічні судоми з падінням тварини на бік, наявна фаза тонічної екстензії, 5 - повторні клоніко-тонічні судоми, втрата пози, загибель тварини.

Результати дослідження наведені в таблиці.

Таблиця

Вплив заявленого засобу та препарату порівняння на перебіг коразолових судом у щурів

Показники	Контроль (коразол), n=6	Заявлений засіб (30 мг/кг) + коразол, n=6	Діазепам (0,5 мг/кг) + коразол, n=6
Латентний період, хв.	1,20	9,04	60,05
Тяжкість судом, бали	5,00	1,00-2,00	1,00
Тривалість судомного періоду, хв.	14,20	1,85	6,80
Час загибелі, хв.	20,70	13,31	12,50

Аналіз даних таблиці свідчить, що сухому екстракту з трави перцю однорічного притаманна протисудомна дія. За вираженістю антиконвульсивного ефекту сухий екстракт з трави перцю однорічного в дозі 30 мг/кг є близьким до препарату порівняння діазепам в дозі 0,5 мг/кг. На тлі застосування сухого екстракту з трави перцю однорічного в дозі 30 мг/кг відбувалося достовірне

5 подовження латентного періоду судом, зменшення кількості конвульсій на 1 щура, а також зниження кількості шурів як з клонічними, так і з тонічними пароксизмами, зменшення тяжкості нападів та тривалості судомного періоду.

Таким чином, заявлено спосіб одержання комплексу біологічно активних речовин рослинного походження з вираженою протисудомною дією. Спосіб є простим у відтворенні, економічним, екологічно безпечним та може бути здійснений в умовах промислового

10 виробництва з використанням стандартного обладнання. Екстракт, одержаний за заявленим способом, проявляє вираженою протисудомною дією, є ефективним, нетоксичним, практично не має протипоказань і є перспективним для створення нових лікарських засобів для лікування та профілактики захворювання на епілепсію.

15 Джерела інформації:

1. Патент РФ № 1312777 "Способ получения средства, обладающего противосудорожной активностью". БИ, 1987. - № 19.

2. Ковальов В. М. Фармакогнозія з основами біохімії рослин. - Х.: МТК - Книга, 2004.-704 с.

3. Орловецкая Н.Ф., Шрамко А.И., Гарбуз А.Е. Жгучее лекарство. Применение перца стручкового однолетнего в гомеопатической медицине // Провизор.-2011. - № 1.

20

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

Спосіб одержання сухого екстракту з трави перцю однорічного з протисудомною дією шляхом екстракції рослинної сировини спиртом етиловим протягом 2,0 годин з подальшою фільтрацією, упарюванням та сушінням, який **відрізняється** тим, що як рослинну сировину використовують

25 траву перцю однорічного *Capsicum annuum*, а екстракцію проводять 40 % етанолом при температурі 60-80 °С і співвідношенні сировина-етанол 1:20.

---

Комп'ютерна верстка І. Мироненко

---

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

---

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601