



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **111802** (13) **U**  
(51) МПК (2016.01)  
**A61K 36/00**  
**A61K 35/00**  
**A61P 1/00**

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

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

<p>(21) Номер заявки: <b>u 2016 04565</b></p> <p>(22) Дата подання заявки: <b>25.04.2016</b></p> <p>(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: <b>25.11.2016</b></p> <p>(46) Публікація відомостей про видачу патенту: <b>25.11.2016, Бюл.№ 22</b></p>	<p>(72) Винахідник(и): <b>Мезенцев Денис Олегович (UA), Кисличенко Вікторія Сергіївна (UA)</b></p> <p>(73) Власник(и): <b>НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ,</b> вул. Пушкінська, 53, м. Харків, 61002 (UA), <b>Мезенцев Денис Олегович,</b> площа Конституції, 3, кв. 4, м. Харків, 61003 (UA)</p> <p>(74) Представник: <b>Лерантович Еліна Томашівна, реєстр. №285</b></p>
--	--

**(54) ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ ПРОТИЗАПАЛЬНОЇ ДІЇ НА ОСНОВІ ПРИРОДНИХ КОМПОНЕНТІВ**

**(57) Реферат:**

Лікарський засіб протизапальної дії на основі природних компонентів, що містить витяжки з лікарських рослин, причому як витяжки з лікарських рослин використовують сухий екстракт десмодіуму канадського на 96 % спирті етиловому при співвідношенні сировини і екстрагенту 1:5.

**UA 111802 U**



Корисна модель належить до хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема до лікарських засобів на основі природних компонентів, яка б забезпечувала комплексну лікувальну дію на організм хворого.

5 На сьогоднішній день асортимент офіційних протизапальних фітозасобів не достатній для вирішення проблеми терапії запальних захворювань. Складність полягає в тому, що, по-перше, запалення - вельми динамічний процес з безліччю альтернативних і перехресних шляхів, на які вплинути системно досить складно. По-друге, тривале призначення синтетичних протизапальних препаратів сприяє виникненню побічних ефектів. Вирішальним критерієм при виборі протизапальних препаратів є не тільки їх ефективність, але й безпека. Тому альтернативою синтетичним препаратам з протизапальною активністю можуть служити препарати рослинного походження, які виявляють широкий спектр біологічної активності, м'який вплив на організм, добре переносяться, відсутні токсичні прояви при тривалому застосуванні і мають обмежений діапазон протипоказань.

15 Відома настоянка ехінацеї - найбільш широко використовуваний в даний час рослинний препарат, що має імуностимулюючу і протизапальну дію. Відомо, що біологічно активні речовини (БАР), що входять до складу ехінацеї, здатні знижувати синтез прозапальних цитокінів, пригнічувати ліпоксигеназний і циклооксигеназний шлях метаболізму арахідонової кислоти, а також можуть виступати в ролі антиоксидантів і тим самим зменшувати процеси запалення в тканинах.

20 Однак її недоліком є те, що це концентрована витяжка з лікарської рослинної сировини, комплекс біологічно активних компонентів, для отримання необхідного лікувального ефекту яких потрібен ретельний підбір і коригування дози та тривалість застосування, але можливі алергічні реакції. До того ж спиртові настоянки можуть бути протипоказанням для осіб, які керують транспортними засобами, осіб, які мають алкогольну залежність, дітей, підлітків.

25 Найбільш близьким аналогом запропонованого засобу є засоби рослинного походження "Кападол", "Колхурі", "Каланхін" (<http://mozdocs.kiev.ua>). Однак відомі засоби в основному є сумарними лікарськими засобами, для отримання необхідного лікувального ефекту яких потрібен ретельний підбір і коригування дози, тривалість застосування використовуваного препарату. На дані препарати (їх компоненти) можливі алергічні реакції. У разі використання водно-спиртових настоянок і екстрактів є протипоказання для осіб з непереносимістю алкоголю, осіб, які потребують підвищеної уваги на робочих місцях.

30 В основу корисної моделі поставлено задачу, удосконалити засіб протизапальної дії, шляхом використання комплексу поліфенольних сполук, щоб отримати засіб комплексної дії, який може бути використаний при лікуванні запальних та протівірусних захворювань різної етіології.

35 Поставлена задача вирішується тим, що у відомому лікарському засобі, що містить витяжку лікарських рослин, згідно з корисною моделлю, як витяжку лікарських рослин використовують сухий екстракт з трави десмодіуму канадського сорту *Persei* на 96 % спирті етиловому при співвідношенні сировини і екстрагенту 1:5.

40 Перспективними БАР, що мають протизапальні властивості, можуть бути поліфенольні сполуки (ПФС), виділені з трави десмодіуму канадського сорту *Persei*. Завдяки багатому комплексу БАР широко застосовуються в народній медицині. Останні дослідження механізмів дії природних поліфенолів показали, що їх фармакологічна активність зумовлена здатністю впливати на активність багатьох регуляторних білків, тим самим знижувати запальну реакцію.

45 Для підвищення ефективності лікування і зменшення ризику розвитку побічних ефектів пропонується засіб, в якому вплив посилюється за рахунок застосування ПФК лікарської сировини, виділеної з водно-спиртового екстракту трави десмодіуму канадського сорту *Persei* шляхом очищення від білково-полісахаридного комплексу 96 % етиловим спиртом.

50 Технічний результат полягає в створенні нового біоактивного засобу, що має протизапальний ефект на основі фармакологічно активних речовин з трави десмодіуму канадського сорту *Persei*. Лікарські засоби десмодіуму канадського проявляють протизапальну, антимікробну та протівірусну активності.

Як протизапальний фітозасіб запропоновано комплекс поліфенольних сполук з трави десмодіуму канадського сорту *Persei*.

55 Опис схеми технологічного процесу засобу, що має протизапальну дію.

Для одержання комплексу поліфенольних сполук подрібнену сировину трави десмодіуму канадського сорту *Persei* екстрагували 96 % етанолом у співвідношенні сировина:екстрагент 1:5 з наступним очищенням одержаного екстракту від ліпофільних речовин хлороформом, концентруванням та сушінням до повного видалення вологи. Одержаний комплекс являє собою аморфний порошок. Вихід по сировині становить до 3 %. Вміст діючих речовин не менше 40 %.

Запропонований комплекс поліфенольних сполук містить С-глікозиди флавоноїдів, зокрема сапонаретин, гомоорієнтин.

ПФС мають широкий спектр фармакологічної активності - антиоксидантну, антигіпоксичну, протівірусну, протипухлинну дію. Вони не викликають звикання, ефекту "відміни препарату" і можуть застосовуватися протягом тривалого часу. Біологічна активність ПФС дозволяє застосовувати їх і як лікарських засобів.

#### Приклад

Вивчено вплив комплексу поліфенольних сполук на ексудативну фазу запальної реакції на моделі декстранового набряку стопи у щурів і на проліферативні процеси по утворенню грануляційної тканини в осередку ушкодження шкіри щурів.

Були проведені досліді на білих щурах обох статей масою 180,0-200,0. Місцеве запалення стопи викликали субплантарним введенням 0,1 мл 6 % водного розчину декстрану. Розвиток набряку виражався у збільшенні об'єму лапки, яку вимірювали онкометрично. Динаміку набряку реєстрували протягом 4-х годин (максимальний час розвитку декстранового набряку), вимірюючи об'єм стопи за кожну годину. Кожен вимір робили тричі. Остаточною цифрою величини набряку служила середня з трьох вимірів. Субстанцію вводили внутрішньочеревинно в дозі 15 % LD50-240 мг/кг за 0,5 годин, 1 година, 2 години до ін'єкції декстрану, а також профілактично протягом 4-х днів до викликання запалення. Результати показали, що об'єм стопи у щурів контрольної групи вже через 1 годину після введення декстрану збільшувався в порівнянні з вихідним рівнем в середньому в 2,2 разу. Максимальний набряк розвивався до другої години досліді, коли об'єм стопи збільшувався в порівнянні з вихідним в середньому майже на 130 %. У наступні 2 години досліді набряк спостерігався приблизно на такому ж рівні з незначним зниженням.

Досліді показали, що комплекс поліфенольних сполук надавав протизапальну дію в різних варіантах введення. Найбільш виражений ефект спостерігали при введенні комплексу за 0,5 години до відтворення набряку. У цьому випадку об'єм стопи був менше в середньому на 40 % на рівні максимального контрольного набряку. У наступні 2 години об'єм стопи практично відповідав нормальному рівню.

Введення субстанції за 1 годину до введення декстрану знижувало набряк стопи в середньому також на 40 %, але протягом 3-ї і 4-ї години досліді відновлення об'єму стопи у щурів не спостерігалось. Введення субстанції за 2 години до введення декстрану виявилось найменш ефективним. На рівні максимального набряку протизапальний ефект комплексу практично був відсутній і тільки на 4-ій годині досліді відзначалося деяке зменшення об'єму стопи в середньому на 13 % в порівнянні з відповідним строком в контролі.

Таким чином, комплекс поліфенольних сполук практично повністю запобігав розвитку запалення стопи у щурів при багатоденному попередньому введенні.

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

1. Лікарський засіб протизапальної дії на основі природних компонентів, що містить витяжки з лікарських рослин, який **відрізняється** тим, що як витяжки з лікарських рослин використовують сухий екстракт десмодіуму канадського на 96 % спирті етиловому при співвідношенні сировини і екстрагенту 1:5.
2. Лікарський засіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що як вихідну сировину використовують траву десмодіуму канадського.
3. Лікарський засіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що як десмодіум канадський використовують сорт Persei.

---

Комп'ютерна верстка В. Мацело

---

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

---

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