



Республика Таджикистан
A61K36/00;

(19) **TJ** (11) **973**
(51) **МПК**

A61P1/16

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения** К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

(21) 1801235
(22) 17.09.2018
(46) Бюл.145, 2018
(71) Самандаров Н.Ю. (ТJ).
(72) Самандаров Н.Ю. (ТJ); Махкамова Б.Х. (ТJ);
Давлатова Г.Х. (ТJ); Самандарова С.М. (ТJ);
Ганиев Х.А. (ТJ); Самандаров А.Ю. (ТJ);
Бобораджабова Н.Б. (ТJ)
(73) Самандаров Н.Ю. (ТJ)
(54) **СРЕДСТВО «ГЕПОСАФ», ОБЛАДАЮЩЕЕ
ГАПАТОПРОТЕКТОРНЫМ И ЖЕЛЧЕГОННЫМ
ДЕЙСТВИЕМ**
(56) 1 Большая российская энциклопедия
лекарственных средств. М., “Ремедиум”, 2001.
2. Машковский, “Лекарственные средства”, 2000
3. Гордеев М.В. Воронков Ю.В. Сбор лекарст-
венных растений для комплексной терапии
заболеваний печени и желчевыводящих путей при
хронических интоксикациях, связанных с
производственными (техногенными) и бытовыми
токсическими воздействиями. Патент РФ
№2256463.
4. Государственная фармакопея СССР.
Одиннадцатое издание, вып.2 - М., 1990.
(57) Изобретение относится к медицине, а именно
к фармакологии, и может быть использовано для
профилактики и лечения заболеваний печени и
желчевыводящих путей.

2

Сущность изобретение заключается в том, что
средство содержит биологические активные
вещества плоды расторопши, корня цикория
обыкновенного, корня солодки голой, корня
радиолы розовой, клубни топинамбура, кора
берёзы повислой, плоды шиповника, трава
зверобоя продырявленного, трава душицы
мелкоцветкового, трава мелиссы обыкновенного
при следующем содержании ингредиентов, масса.
в %.

плоды расторопши	15,0%
корни цикория обыкновенного	6,2%
корни солодки голой	2,2%
корни радиолы Розовой	2,1%
клубни топинамбура	6,1%
кора березы повислой	1,5%
плоды шиповника коричневого	1,9%
трава зверобоя продырявленного	3,2%
трава душицы мелкоцветкового	5%
трава мелиссы обыкновенного	6,6%
водная спиртовая жидкость	50,2%

Таким образом, предлагаемое изобретение
позволит расширить арсенал гепатозащитных
средств, и обладает широким спектром фармако-
логической активности, гепатозащитным, желче-
гонным, противовоспалительным действием.

Изобретение относится к медицине, а именно к фармакологии, и может быть использовано для профилактики и лечения заболеваний печени и желчевыводящих путей.

В Таджикистане произрастает более 5,5 тысяч растений, и огромное количество их составляют экологически чистые лекарственные растения, которые в народной медицине используют для лечения желчнокаменной, мочекаменной болезни, сахарного диабета, гастритов, гепатитов и других гастроэнтерологических заболеваний.

В фармакологии и практической медицине стоит задача увеличения активности лекарственных средств, как вновь создаваемых, так и уже применяемых в практической медицине.

Это задача решается, в частности, путём добавления к лекарственным средствам активной добавки в виде антиоксидантов синтетических или из природных растительных источников, однако синтетические антиоксиданты менее физиологичны для терапевтического применения, чем натуральные.

Многие лекарственные препараты, полученные химическим путём, либо токсически воздействуют на печеночные клетки, либо аллергизируют организм человека. Например, широко применяемый препарат холосас, обладая слабым желчегонным действием, не снимает интоксикации организма, не влияет на сокращение размеров печени и нормализацию печеночных проб.

Основным преимуществом препаратов растительного происхождения является многосторонность эффекта на организм человека, при отсутствии или незначительных побочных действий и как правильно хорошая, переносимость больными.

Препарат растительного происхождения составляет примерно 40% от общего числа, используемых в практической медицине.

Известен официальный сбор желчегонный №2 (ВФС 42-639-77) (цветки бессмертника 40%, трава тысячелистника 20%, листья мяты перечной 20%, плоды кориандра 20%), оказывает желчегонное, противовоспалительное и спазмолитическое действие [1]. Однако он имеет ряд недостатков, в частности не имеет показаний по гепатомембранопротекторным и антиоксидантным свойствам, что вынуждает в комплексной терапии использовать дополнительные препараты часто синтетические гепатопротекторы и антиоксиданты.

Известен препарат "Карсил" [2], представляющий собой препарат, содержащий действующие вещества плодов расторопши пятнистой и применяющийся при острых (токсических) гепатитах, для поддерживающей терапии при хронических заболеваниях печени и при циррозе печени. Гепатопротекторное действие "Карсила" объясняют антиоксидантной актив-

ностью, а также тем, что он стимулирует синтез белка, нормализует обмен фосфолипидов.

Однако, указанный препарат не обладает анализирующим, мембранопротекторным и противовоспалительным действием.

Прототипом изобретения является сбор лекарственных растений для комплексной терапии заболеваний печени и желчевыводящих путей при хронических интоксикациях, связанных с производственными (техногенными) и бытовыми токсическими воздействиями [3]. Данный лекарственный сбор, имеющий торговое наименование "Золотистый" (далее сбор) (в виде травяного сбора, в фильтр - пакетах, экстракт сухой, в виде сиропа специального назначения, в таблетированном виде), содержит цветки бессмертника, траву горца птичьего (спорыша), траву душицы, траву тысячелистника, траву пустырника, плоды расторопши, плоды шиповника, семена льна, соплодия ольхи, чагу при следующем соотношении компонентов, мас. %: цветки бессмертника 1.9; трава горца птичьего (спорыша) 3.2; трава душицы 6.3; трава тысячелистника 12.6; трава пустырника 3.2; плоды расторопши 12.6; плоды шиповника 19; семена льна 3.2; соплодия ольхи 19; чага 19.

Однако указанный препарат обладает слабым гепатопротекторным и желчегонным действием.

Задачей настоящего изобретения является расширение ассортимента средств, обладающих гепатопротекторным и желчегонным свойством за счёт комбинированного действия, содержащих сбор экологически чистых лекарственных растений, с учётом взаимосовместимости биологически активных химических соединений и отсутствием недостатков предлагаемых аналогов.

Сущность изобретения заключается в том, что средство содержит биологические активные вещества плоды расторопши, корни цикория обыкновенного, корни солодки голой, корни радиолы розовой, клубни топинамбура, кора берёзы повислой, плоды шиповника, трава зверобоя продырявленного, трава душицы мелкоцветкового, трава мелицы обыкновенного, водно-спиртового раствора при следующем содержании ингредиентов, масса. в %.

плоды расторопши	15,0%
корня цикория обыкновенного	6,2%
корня солодки голой	2,2%
корня радиолы Розовой	2,1%
клубни топинамбура	6,1%
кора березы повислой	1,5%
плоды шиповника коричневого	1,9%
трава зверобоя продырявленного	3,2%
трава душицы мелкоцветкового	5%
трава мелицы обыкновенного	6,6%
водно- спиртового раствора	50,2%

Предложенное соотношение лекарственного сырья и состав средства были обоснованы в

Такое соотношение ингредиентов является оптимальным, и наблюдается высоким гепатопротекторным действием данного средства.

В состав средства входят лекарственные растения, разрешенные к применению в медицинской практике [4].

Технология приготовления средства "Гепасоф" заключается в том, что 100 гр. воздушно-сухих и измельченных ингредиентов помешали в круглодонную колбу на 3 л с обратным холодильником заливали 660 мл дистиллированной водой, настаивали на кипящей водяной бане в течение 3-х ч., затем охлаждали до комнатной температуры и процеживали через трёхслойную марлю. Получили 500 мл отвара. К остатку ингредиентов заливали 660 мл 30%-ного водно-спиртового раствора и нагревали в течение 3-х ч., после охлаждения до комнатной температуры процеживали через трёхслойную марлю. Получили 590 мл экстракта. 500 мл полученного отвара и 590 мл экстракта объединили, а затем фильтровали через бумажный фильтр и это средство является фито настоек «Гепосаф» определяли на лабораторных животных.

Гепатозащитные свойства фито настойки «Гепосаф» определяют на модели подострого поражения печени четырёххлористого углеродом (CCl₄), которыми считается сильным гепатоксином. В качестве препарата сравнения был выбран растительный препарат сравнения Карсил, который широко используется в гепатологии.

О проявлении гепатозащитного действия фито настойки «Гепосаф» судили по следующим показателям:

- По проценту выживаемости животных в опытных и контрольных сериях.

- по состоянию активности ферментобразовательной функции печени, в том числе, по таким показателям, как АсАТ, АлАТ и ЩФ в состав сыворотке крови.

Пример:

Эксперименты были проведены на 80 беспородных белых крысах обоего пола весом 160-220 г. Животные были распределены на следующие серии:

- 1-здоровые или интактные;

- 2-контрольные (нелеченые) животные, которым подкожно вводили четырёххлористого углерода CCL в 0,2 мл. на 100 гр/масса. подкожное введение в течение 45 дней через день. Ежедневно в течение 3 месяцев внутрижелудочное (в/ж) вводили фито настойку «Гепосаф» в дозе 5 мл/кг массы.

Изучаемую фито настойку вводили в течение 3 месяцев. Как видно из приведенных данных серий животных получавших фитонастойку «Гепосаф» 5 мл/кг массы оказывает гепатопротекторное действие.

У нелеченых животных активность и АлАТ повышалась 68,7%, АсАТ на 58,8% более чем в 2,5 раза и билирубин на 72,5% более в 4 раза.

В серии животных получавших фитонастойку «Гепосаф» дозе 5 мл/кг вызывал статистически достоверное ($P < 0,003$) снижение образования всех изучаемых ферментов.

Таким образом, предложенное изобретение применяется для лечения печени и желчевыделительной системы. По сравнению известных препаратов изобретение в составе растительных лекарств содержатся биологические активные вещества и вторичные метаболиты, эфирные масла, микроэлементы, витамины.

Предлагаемая фито настойка "Гепосаф" позволит расширить арсенал гепатозащитных средств, и обладает широким спектром фармакологической активности, гепатозащитным, желчегонным, противовоспалительным действием.

Пример 2. В данном эксперименте, приготовленный препарат вводился перорально экспериментальным животным. Для исследования были выбраны 32 золотых хомячка, весом от 150 до 200 гр. Животные были распределены на четыре группы: (1) интактные животные, получающие рацион вивария; (2) животные кормились холилитогенной гиперлипидимической (ХГЛД) диетой; (3) экспериментальные животные получали как средства «Гепосаф» в дозе 50 мг/кг, так и диету ХГЛД; (4) группа животных, помещённых с диетой ХГЛД и известным препаратом Ursofalk® 50 мг/кг от массы животных.

Холелитолитический эффект наблюдался по количеству секретируемой желчи, которая собиралась в течение 1, 2, 3 и 4 часов.

О проявлении желчегонного эффекта баллажа в третьей группе животных судили по объёму секретируемой желчи, собранной за 1, 2, 3 и 4 часа после конюлирования желчного протока.

С целью выяснения характера действия баллажа на химизм желчи в опытных и контрольных группах до и после введения испытуемых доз препаратов определяли концентрацию холестерина, билирубина, желчных кислот, фосфолипидов, а также величину холато-холестеринового коэффициента во всех группах.

Влияние сухой ХГЛД диеты на химизм желчи, и возможном развитии у подопытных животных желчнокаменной болезни и гиперлипидемии, наблюдали у животных второй группы по следующим показателям:

- 1. прирост массы тела опытных и контрольных хомячков, который определялся через 1, 2, 3, 4, 5, и 6 месяцев от начала эксперимента;

- 2. по образованию среднего количества конкрементов;

- 3. по изменению концентрации холестерина, билирубина, желчных кислот фосфолипидов в желчи хомячков, и сравнивали с такими показателями у других полученных групп.

С этой, целью после забоя животных методом декапитации, вскрывали брюшную

7

В результате проведенных экспериментов было установлено: в желчном пузыре у (75%) из 6 хомяков, получавших в течение 6 месяцев сухую ХГЛД диету были обнаружены конкременты разного размера их среднее число на первое животное составляло в среднем 5 штук, против мелких песочных камней, у интактных животных и животных опытных групп, получивших бальзам и Ursofalk, что составил 0.25 части обычных камней, в желчном пузыре интактных животных.

При изучении желчного пузыря хомяков, получавших целебный бальзам, только в одном случае выявлено наличие камней размером 2-6 мм, среднее число которых составляло четверть частей. Данное содержание концентрации холестерина, билирубина, желчных кислот, фосфолипидов, а также величину холато-

полость, затем после сбора желчи производили подсчёт и измерение конкрементов.

973

8

холестеринового коэффициента [5-6] показывает, что очевидно активные компоненты бальзама участвуют в нормализации химизма желчи, которое проявляется в снижении уровня холестерина на 31%, увеличение количества желчных кислот на 45%, увеличение содержания фосфолипидов до нормы на 99%, снижение уровня билирубина и увеличение количества холестерина в два раза.

Таким образом, выбранный целебный фито настой Гепосаф принимает активное терапевтическое действие при экспериментальном холелитиазе, возможно благодаря высокой гидрофильности и их способности к снижению мицелл образования в желчи, а степень эффективности не уступает активности известных лекарственных препаратов.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

Средство, обладающее гепатопротекторным и желчегонным действием содержащее плоды расторопши, плоды шиповника, трава душицы, **отличающееся тем что**, дополнительно содержит корни цикория обыкновенного, корни солодки голой, корни радиолы розовой, клубни топинамбура, кора берёзы повислой, трава зверобоя продырявленного, трава мелиссы обыкновенного и водно-спиртового раствора при следующем содержании ингредиентов, мас. в %:

плоды расторопши	15,0%
------------------	-------

корни цикория обыкновенного	6,2%
корни солодки голой	2,2%
корни радиолы Розовой	2,1%
клубни топинамбура	6,1%
кора березы повислой	1,5%
плоды шиповника коричневого	1,9%
трава зверобоя продырявленного	3,2%
трава душицы мелкоцветкового	5%
трава мелиссы обыкновенного	6,6%
водно- спиртового раствора	50,2%

Национальный патентно-информационный центр РТ734042, г. Душанбе,
ул. Айни, 14а