



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **1351**
(51) **МПК: A61K 36/00;**
A23L 2/02; A23L 19/00

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения**

К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

(21) 2201733
(22) 23.09.2022
(46) Бюл. 193, 2023
(71)(73) Ахмедов Ф.А. (TJ)
(72) Ахмедов Ф.А. (TJ); Огай М.А. (TJ); Юсуфи С.Дж.
(TJ); Имомиён Р. (TJ)
(54) **ЛЕКАРСТВЕННОЕ СРЕДСТВО «ХОЛА-
РОН» С ЖЕЛЧЕГОННЫМ ЭФФЕКТОМ**
(56) 1. Патент RU № 2256463
2. Машковский М.Д. Лекарственные средства.
1993 г., ч.1

2

(57) Изобретение относится к медицине, а именно к созданию фармакологических средств растительного происхождения, который применяется для лечения и профилактики заболеваний желчевыводящей системы.

Целью изобретения является получение средств, на основе экологически чистых лекарственных растений произрастающих в Таджикистане.

В качестве основы полученного средства «Холарон», было взято 15г экстракт шиповника 85 г экстракта шелковицы с настаиванием в кипяченой воде в соотношении 1:1 в течение 24ч.

Изобретение относится к фармацевтической промышленности и медицине, а именно к созданию фармакологически средств растительного происхождения, которые применяются для лечения и профилактики заболеваний желчевыводящей системы.

В настоящее время для лечения заболеваний желчевыводящей системы число синтетических препаратов с каждым годом расширяется.

Однако, следует отметить, что препараты, полученные на основе природных средств, и по сей день из-за их практической безвредности и биодоступности, являются наиболее актуальными и экономически целесообразными.

Известен сбор лекарственных трав для комплексной терапии заболеваний желчевыводящих путей, которые содержит цветки бессмертника, траву горца птичьего (спорыша), траву душицы, траву тысячелистника, траву пустырника, плоды расторопши, плоды шиповника, семена льна, соплодия ольхи и чагу [1].

В качестве прототипа принят «сироп Холосас» - для лечения заболеваний желчевыводящих путей, который содержит плодов шиповника в виде концентрированного водного экстракта; вспомогательные компоненты – вода очищенная, сахар. [2].

Недостатки вышеуказанных сборов лекарственных средств в том, что проявляют высокую эффективность при лечении определенных заболеваний, но в качестве вспомогательного вещества содержат сахарозу или синтетические сахарозаменители, которые противопоказаны для определенных категорий больных.

Целью изобретения является получение средства на основе экологически чистых лекарственных растений, произрастающих в Таджикистане, более простого по технологии получения, которое может использоваться больными разных возрастных групп в тоже время, обладающего более широким спектром фармакологической активности.

Поставленная цель достигается тем, что в качестве основы полученного средства «Холарон» было взято 15 г. экстракта шиповника, 85 г. сгущенного сока шелковицы, полученного путём настаивания в кипяченой воде в соотношении 1:1 в течении 24 ч.

Такое сочетание основных и вспомогательных компонентов обеспечивает необходимые фармако-технологические характеристики: высокую биодоступность действующих веществ, оптимальную плотность и стабильность при хранении. Предлагаемый состав соответствует требованиям следующих физико-химических параметров:

Экстракт плодов шиповника - содержит витамины А, Е и С, каротиноиды, глицерин и много жирных кислот, насыщенных и ненасыщенных: линолевую, олеиновую, стеариновую, пальмитиновую и др. Экстракт шиповника снимает раздражение и шелушение кожи, увлажняет её и насыщает витаминами. Оживляет сухую и стареющую кожу, делает её мо-

ложе, смягчает и питает кожу разглаживает мелкие морщинки и предупреждает появление новых.

Описание: Сиропообразная жидкость темно-коричневого цвета, со специфическим запахом. При хранении возможно выпадение осадка.

Количественное определение

-содержание суммы органических кислот в пересчете

на яблочную кислоту: **не менее 1.35 %**

-содержание суммы катехинов в пересчете на танин: **не менее 1.7 %**

Показатель преломления: Не менее 1,440

Плотность: Не менее 1,25 г/см³(при 20°C)

Микробиологическая чистота

В испытуемом образце допускается наличие:

Общее число аэробных микроорганизмов – не более 10² КОЕ в 1 г (мл)

Общее число дрожжевых и плесневых грибов – не более 10¹ КОЕ в 1 г (мл)

Отсутствие *Escherichia coli* в 1 г (мл)

Экспериментально было доказано, что при хранении в течение 2-х лет физико-химические характеристики средство «Холарон» не изменяются и соответствуют требованию приведенному выше.

Таким образом, предлагаемый состав сиропа, содержащий водный экстракта шиповника и сгущенный сок шелковицы, обеспечивает высокие технологические характеристики, что позволяет его легко дозировать с большой точностью и имеет высокую стабильность при хранении.

Для лучшего понимания настоящего изобретения приводятся следующие конкретные примеры.

Пример 1.

Получения экстракта из плодов шиповника обыкновенного

2000 г. сухих плодов шиповника обыкновенного раздавливали до разрушения оболочки плодов. Осторожно мякоть отделяли от щетинок и орешков. Мякоть переносили в реактор с лопастей мешалкой и к нему добавляли 6000 мл. воды очищенной. Перемешивали в течении 2 часов при температуре 60 °С. Полученную массу осторожно сливали и переносили в приемник. К реактор повторно добавляем 3000 мл. воды очищенной и аналогично экстрагировали в течении 1 часа 30 мин. Экстракт собирали в приемник. Третий раз повторяли экстрагирование, добавляя к сырью 3000 мл. воды очищенной, через 1 часа 15 мин раствор из реактора полностью сливали в приемник и давали отстояться при температуре 10 °С в течение 24 часов. Экстракт после фильтрации выпаривали на роторном испарителе до получения экстракта шиповника, в котором соотношение сырье:экстрагент - 1:1.

Пример 2.

Компонентами для получения средства «Холарон», являются водный экстракт шиповника (1:1) с добавлением сгущенного сока шелковицы белой.

Таблица 1 - Состав 100 г сиропа «Холарон»

Наименование	Количество
Активное вещество	
Жидкий экстракт плодов шиповника обыкновенного (1:1)	15 г
Вспомогательное вещество	
Сгущенный сок плодов шелковицы белой	85 г

Перемешивание проводили в сироповарочном котле. Загружали 15 кг жидкого экстракта плодов шиповника обыкновенного (1:1), 85 кг сгущенного сока плодов шелковицы белой. Всю процедуру проводили в асептических условиях. Полученный сироп выдерживали при температуре 20 °С в течении 72 ч. и фильтровали через тройной слой марли и разливали во флаконы по 100 и 230 г.

Пример 3. Желчегонное действия сиропа «Холарон» у интактных морских свинок. Эксперименты проводили на 40 морских свинок, массой 420,0-600,0 г. Опытные животные (морские свинки) были распределены на следующие группы:

1-контрольные, морские свинки получавшие воду очищенную в дозе 5 мл/кг массы;

2 – животные, которым за 40 мин. до операции - конюлирования желчного протока, внутривенно (в/ж) по схеме вводили разведенный (1:10) в воде очищенной сироп «Холарон» в дозе 5 мл/кг массы тела (сироп «Холарон»);

3 – животные, которым за 40 мин. до операции - конюлирования желчного протока, внутривенно (в/ж) по схеме вводили разведенный (1:10) в воде очищенной экстракта плодов шиповника обыкновенного в дозе 5 мл/кг массы (ЭПШО);

4 - животные, которым за 40 мин. до операции - конюлирования желчного протока, внутривенно

но (в/ж) по схеме вводили разведенный (1:10) в воде очищенной сгущенный сок шелковицы белой в дозе 5 мл/кг массы тела (ССПШБ);

5 – сравнительная группа животных, которым за 40 мин. до операции - конюлирования желчного протока, внутривенно (в/ж) по схеме вводили разведенный (1:10) в воде очищенной сироп «Холосас» в дозе 5 мл/кг массы тела (сироп «Холосас»);

Официальный препарат сироп «Холосас» - фитопродукт (FitoProduct) 200 мл – 260 г., диетическая добавка. Состав в 100г (экстракт шиповник жидкий - 40г + сахар 60 г).

Как видно из табл. 2 у контрольных крыс после фистулирования желчного протока, количество собираемой каждый час желчи в среднем составляло от $1,3 \pm 0,20$ до $1,4 \pm 0,10$ и $1,20 \pm 0,20$ мг на 100 г массы животного. Общий объем желчи, собранной за 3 часа, составил $3,9 \pm 0,50$ мг/г массы.

Таблица 2 - Сравнительное желчегонное действие сиропа «Холарон», экстракта плодов шиповника обыкновенно, сгущенного сока плодов шелковицы белой, в сравнении с официальным препаратом «Холосас» в остром эксперименте у морских свинок (n=6, время эксперимента – 14 суток, внутривенно)

Группа, доза в мл/кг массы	Скорость секреции желчи в мг/100 г/кг			Общий объем желчи в г/кг 3 часа
	1 час	2 часа	3 часа	
1. Контрольная (не леченная) + вода очищенная 5,0	$1,30 \pm 0,2$ 0 100,0%	$1,40 \pm 0,10$ 100,0%	$1,20 \pm 0,2$ 20 100,0%	$3,90 \pm 0,50$ 100,0%
2. ЭПШО 5,0	$1,70 \pm 0,2$ 0 130,77%	$1,63 \pm 0,20$ 116,43%	$1,60 \pm 0,2$ 20 133,33%	$4,91 \pm 0,50$ 125,90%
3. ССПШБ 5,0	$2,10 \pm 0,3$ 5 161,53%	$1,48 \pm 0,30$ 105,71%	$1,38 \pm 0,2$ 20 115,00%	$4,96 \pm 0,46$ 127,18%
4. Сироп «Холарон» 5,0	$2,10 \pm 0,2$ 0 161,53%	$1,73 \pm 0,30$ 123,57%	$1,55 \pm 0,2$ 17 129,17%	$5,38 \pm 0,41$ 137,95%
5. Сироп «Холосас» 5,0	$1,89 \pm 0,2$ 145,38%	$1,23 \pm 0,15$ 87,85%	$1,06 \pm 0,2$ 20 88,33%	$4,18 \pm 0,20$ 107,20%

Примечание: * – Процент повышения секреции желчи опытных серий по сравнению с контрольными животными, ЭПШО – экстракт плодов шиповника обыкновенного, ССПШБ – сгущенный сок плодов шелковицы белой.

Анализируя полученные данные можно констатировать, что 2, 3 и 4 группа (ЭПШО, ССПШБ и Сироп «Холарон») по объему выделившейся желчи в течение трех часов эксперимента превосходят контрольную группу 1 – не леченную. Группа 5 (Сироп «Холосас») превосходит контрольную группу на 45,38% только в течение 1 часа эксперимента. Активность групп 1 и 2 – является доказательством правильности выбора основного и вспомогательного компонента в сиропе «Холарон». Группа 4 (Сироп «Холарон»). К третьему часу эксперимента наблюдали усиление эффекта по количеству выделившейся желчи, группа 4 активнее контрольной группы 1 на 37,95%, тогда как группа 5 активнее контрольной группы 1 лишь на 7,20%. При сравнении в этом же временном диапазоне групп 4 и 5, от группа 4 активнее группы 5 на 22,30. Желчегонный эффект препарата зависит от величины его изучаемых доз и

наиболее четко проявлялся в дозе 5,0 мл/кг массы. Под влиянием данной дозы общий объем секретироваемой желчи почти в 1,38 раза выше, чем в контрольной серии животных.

Установлено, что желчегонное действие сиропа «Холарон» проявляется у морских свинок, что имеет важное практическое значение в процессе всасывания жиров и в конце других биохимических процессов, идущих в гастроэнтеральной системе с участием желчи или компонентов её состава.

Холеретическое действие сиропа «Холосас» морским свинкам в дозе 5мл/кг массы на всех этапах исследования оказалось слабее (на 30,75%), чем соответствующий эффект сиропа «Холарон» (табл.2). По отношению к контролю. Если сравнивать эффективности сиропа Х «Холарон» по отношению «Холосас» то активное по желчегонному эффекту на 28,71%.

Таким образом, проведенные экспериментальные данные доказали, что сироп «Холарон», содержащий экстракт плодов шиповника обыкновенного, сгущенный сок плодов шелковицы белой обладает желчегонным эффектом.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

Лекарственное средство с желчегонным эффектом, включающее экстракт плодов шиповника, *отличающееся тем, что* дополнительно содержит

густой экстракт шелковицы при следующем соотношении компонентов, мас. %:

Экстракт плодов шиповника -15

Сгущенный сок плодов шелковицы – 85

Компьютерный набор: Нигораи А.

Заказ	Тираж	Подписное
Национальный патентно-информационный центр РТ 734042, г. Душанбе, ул. Айни, 14а		