



ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(19) KG (11) 51 (13) C1
(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ
 (5) Предварительная патенту Кыргызской Республики

(21) 940080.1

(22) 31.10.1994

(31) 5023041

(32) 22.01.1992

(33) SU

(46) 01.02.95, Бюл. №2, 1996

(71) (73) Вольвич В.И., Дубовик О.В. (KG)

(72) Вольвич В.И. (KG)

(56) А.с. №1002350, кл. A61K 35/78, 1983

(54) **Способ получения противовоспалительного и ранозаживляющего средства "Рубиксантина Вольвича"**

(57) Изобретение относится к области медицины, а именно к способам получения медицинских препаратов из растительного сырья. Поставленная задача улучшения ранозаживляющей активности и расширение спектра действия, а именно противовоспалительного, выполняется тем, что в качестве растительного сырья используется подмаренник цепкий (Galium aparine L), а экстракцию проводят дистиллированной водой с последующей отгонкой растворителя, 3 таб.

Изобретение относится к медицине, а именно к способам получения медицинских препаратов из растительного сырья.

Известен способ получения масла шиповника путем экстракции растительного сырья и отгонки растворителя, в качестве которого выступает дихлордифторметан. Способ направлен на улучшение качества масла и повышение его активности.

Однако, и в этом случае спектр его действия прежний. Органический растворитель - дихлордифторметан также токсичен, при перегонке он полностью не удаляется, остаются бластные продукты, например, высокомолекулярные углеводороды. Это влияет на активность и качество готового продукта, но снижает его свойства.

Задача изобретения - создать новую лекарственную форму с улучшенной ранозаживляющей активностью и расширенным спектром действия, а именно противовоспалительным.

Сущность изобретения в том, что впервые в качестве растительного сырья предлагается использовать траву подмаренника цепкого (*Galium aparine L.*), а экстракцию проводить дистиллированной водой.

При этом основные элементы способа получения нового средства совпадают со старым способом, а именно в экстракции сырья и последующей отгонки растворителя.

Существенным признаком изобретения является то, что в результате гидролитического расщепления триоксиан-трагликозида асперулозида (рубихлоровой кислоты) $C_9H_{17}O_{11}$ на гликон и аглюкон с последующей отгонкой растворителя, получают целевой продукт, основным компонентом которого является биологически активный аглюкон (гликон же в виде смолы остается в перегонном кубе).

Водный раствор на основе аглюкона имеет способность проникать в цитоплазму пораженных клеток, сужать поры лизосом и прекращать выброс лизосомных гидролаз в цитоплазму, активизировать репарацию ультраструктуры клетки, в результате чего повышается ранозаживляющая способность, вызывая активный рост грануляций. При этом полученное средство, как показали экспериментальные и клинические испытания, имеет и противовоспалительный эффект. Применение же в качестве растворителя дистиллированной воды, а не дихлордифторметана делает готовый продукт минимально токсичным, исключена дополнительная его очистка и многоэтапность получения, сокращаются затраты на производство.

Способ осуществляется следующим образом:

Берут 2.4 кг сухой измельченной травы и корни подмаренника цепкого, помещают в перегонный куб, заливают 100 л воды и выдерживают 2.5 - 3 ч при 60 - 65°C, затем проводят перегонку с водяным паром под вакуумом 100 - 150 мм рт. столба при температуре 90 - 160°C. Перегонку ведут до получения 80 л дистиллята - готового продукта. Оптимальное соотношение сырья и дистиллированной воды 1 : 33. Выход готового продукта 75 - 80 л.

Препарат применяют наружно методом невысыхающих аппликаций на раненную поверхность.

Препарат можно использовать в виде жидкости, а также для приготовления мазей, глобулей, кремов по известным технологиям.

Противопоказания: при тяжелых органических изменениях сердечно-сосудистой системы, индивидуальная непереносимость препарата.

Таблица 1
Сравнительные данные ранозаживляющего действия
прототипа и изобретения (трофические язвы).

Вещество	Язвенный дефект (см)	Терапевтический эффект (размеры трофической язвы и наличие гиперемии)			Срок полного заживления поражений (сут.)
		на 5 день	на 10 день	на 15 день	
Известное	3.2x2.8x0.8	3.2x2.8x0.8 см гиперемия уменьшена	2.1x2.0x0.07 см в стадии уменьшения	1.6x1.4x0.4 гиперемия отсутствует	на 25-30
Предлагаемое	3.5x3.5x1.0	3.5x3.0x0.3 см гиперемия отсутствует	1.8x1.5x0.1 см	Полное заживление, гиперемия отсутствует	на 10-15

Таблица 2

Сравнительные данные противовоспалительного эффекта прототипа и изобретения при послеоперационных ранах (гнойный аппендицит)

Вещество	На 3 день	На 6 день	На 12-15 день
Известное (а.с. №1002350)	Некротизация тканей, увеличение раны до 1.0-1.2 см, выраженная отечность окружающих тканей, по данным капилляроскопии спазм сосудов.	Начато формирование слабо выраженного струпа, сохранение отечности и спазмов сосудов, в экссудате лейкоциты, явление фагоцитоза.	Отечности нет, очаг грануляции.
Предлагаемое	Размер раны увеличен до 1 см, отечность тканей не выражена слабо, слабо выраженный спазм сосудов.	Отечность слабо выражена, спазм сосудов отсутствует, в экссудате выраженный фагоцитоз.	Выраженная грануляция тканей, появление рубцовой ткани и ее эпителилизации, экссудат в небольшом количестве, чистый.

В известном, полное заживление на 20 день.

В предлагаемом - на 12-15.

Клинические испытания препарата проводили на больных с заболеваниями: геморрой, послеоперационные раны (острый аппендицит, проникающее ранение поясничной области, брюшной полости и др.)

Таблица 3

Данные о применении препарата

Больные, ист.бол.	Заболевания	Применение средства	Терапевтический эффект
Ходуньков С.А. (Ист. №15, войск, медпункт 64479)	Геморрой	Глобулин с "Рубиксантином" 2р перректум + ватные тампоны с мазью прикладывались к воспаленным узлам	Улучшение состояния на 2-ые сутки, отечность узлов резко уменьшилась, боль уменьшилась. Геморрогидальные узлы на 3-сутки полностью рассосались.
Алимжанова Л. (ГКБ №2, хир. отделение. Ист.б. №4559 08.10.93 г.)	Послеоперационные раны (острый аппендицит)	Рана 0.5x0.3 см с гиперемией вокруг и инфильтрат с серогнойным выделением. Препарат стал применяться на 10 день	Со дня применения на третий сутки рана очистилась, гиперемия исчезла, эпителизация вокруг раны. Больная выписана.

		после операции, т.к. смачивание ее хлороксидином с наложением асептической повязки и физиолечен. результатов не дало.	
--	--	---	--

Таким образом, из таблиц видно подтверждение поставленной задачи, а именно ранозаживляющий эффект по сравнению с известным в 1.5-2 раза выше, а противовоспалительный эффект в 3-4 раза.

Формула изобретения

Способ получения противовоспалительного и ранозаживляющего средства путем экстракции растительного сырья и отгонки растворителя, отличающийся тем, что в качестве растительного сырья используют траву подмаренника цепкого, а экстракцию проводят дистиллированной водой.

Составитель описания
Ответственный за выпуск

Солобаева Э.А.
Ногай С.А.

Кыргызпатент, 720021, г. Бишкек, ул. Московская, 62, тел.: (312) 68 08 19, 68 16 41, факс: (312) 68 17 03