

Винахід відноситься до фармації та медицини, а саме до лікарських засобів рослинного походження з вираженою діуретичною активністю.

Відомо, що сучасний ринок діуретичних засобів представлений переважно препаратами синтетичного походження, а також комплексними та моно препаратами рослинного походження.

Моно препарати рослинного походження мають значно менше обмежень при їх застосуванні, ніж синтетичні препарати та комплексні фітопрепарати. Тому актуальною є проблема створення нового ефективного лікарського моно засобу на основі рослинної субстанції.

Найбільш відомими препаратами синтетичного походження є тіазидові діуретики - гіпотіазид, оксодолін, циклометіазид та петлеві діуретики - фуросемід, урегін [1].

Ці препарати виявляють ряд небажаних побічних ефектів: гіпокаліємія, гіпохлоремічний алкалоз, слабкість, диспепсичні явлення, затримка кальцію в організмі, підвищення рівню глюкози в крові, затримка сечової кислоти, та протипоказань: тяжка ниркова недостатність, ураження печінки, цукровий діабет та подагра тяжкого ступіня [1,2].

Відомі комплексні препарати рослинного походження канефрон, урофлюкс, пілозуріл, уролесан, фітолізін [1].

Зазначені комплексні препарати рослинного походження теж мають ряд недоліків: багатокомпонентність складу, внаслідок чого важко передбачити взаємний вплив компонентів; підвищення можливості виникнення алергічних реакцій на компоненти препарату; складність забезпечення сировинної бази та необхідність спеціального обладнання та спеціальних технологічних прийомів при виробництві.

Відомі такі моно засоби діуретичної дії рослинного походження, як листя мучниці, плоди яловицю, трава хвощу, квіти волошки [1,3].

Моно засоби рослинного походження не впливають на електролітний баланс та практично не мають побічних дій, але присутні обмеження при їх використанні: плоди яловицю протипоказані вагітним і можуть як і трава хвощу та листя мучниці викликати подразнення нирок, що обмежує їх використання при гострому запаленні нирок, а квіти волошки можуть викликати кумуляцію ціанідних сполук [3].

Найближчим за хімічним складом та фармакологічною дією до заявленого засобу є моно засіб - ортосифону тичинкового листя [1] з вираженою діуретичною активністю. Засіб вживають у вигляді водного настою.

Даний засіб практично не має обмежень при застосуванні [3], проте листя ортосифону тичинкового не є вітчизняною сировиною. Він культивується лише у тропічних та субтропічних країнах.

Відомий також сумарний поліфенольний комплекс грінделії розчепіреної, який є супутнім продуктом при здійсненні способу одержання ліофільного екстракту грінделії розчепіреної з протимікробною та репаративною активністю [4].

Задачею винаходу є розширення арсеналу вітчизняних діуретичних моно засобів рослинного походження з вираженою діуретичною активністю, які характеризуються практичною відсутністю побічних ефектів та протипоказань при застосуванні.

Поставлена задача вирішується шляхом використання сумарного поліфенольного комплексу грінделії розчепіреної у якості діуретичного засобу.

Заявлений діуретичний засіб невідомий з джерел інформації.

Засіб одержують шляхом вичерпної екстракції повітряно - сухої надземної частини грінделії розчепіреної 50% етанолом в співвідношенні сировина - екстрагент 1:9-11. Отриманий екстракт упарюють до водного залишку у вакуумі при температурі 85-90°C, та обробляють 6-8 разів порціями хлорорганічного розчинника для видалення ліпофільних речовин. Водний залишок впарюють та висушують. Вихід готового продукту 14-15%. Одержаний продукт є сумарним поліфенольним комплексом грінделії розчепіреної.

Винахід ілюструється прикладами.

Приклад 1. Спосіб отримання діуретичного засобу: 1,7кг подрібненої повітряно - сухої надземної частини грінделії розчепіреної, зібраної в фазі середини квітіння, вичерпно екстрагували 50% етанолом в співвідношенні сировина - екстрагент 1:10. Отриманий екстракт (25,74л) упарювали до водного залишку (1,5л) у вакуумі при температурі 85-90°C, обробляли 7 разів порціями хлороформу 3 рази по 500мл, потім по 200мл для видалення ліпофільних сполук. Водний залишок використовували для одержання діуретичного засобу шляхом упарювання та сушіння. Вихід ютового продукту склав 14,68%.

Приклад 2. Діуретичну активність заявленого засобу вивчали у дослідях за методом Є.Б. Берхіна [5]

Дослідження проводили на білих нелінійних щурах чоловічої та жіночої статі масою 120-230гр. Щурів утримували на постійному харчовому раціоні при необмеженому доступі до води.

До експерименту тварин на протязі 2-3 годин залишали без їжі та води. Досліджуваний діуретичний засіб вводили перорально внутрішньошлунково у вигляді водного розчину. Як препарати порівняння використовували настій листя ортосифону тичинкового у дозі 21мг/кг. Водне навантаження складало 3% від маси тіла тварини. Після цього тварин поміщали в окремі клітки, пристосовані для збору сечі. Через 4 години після введення препаратів вимірювали кількість сечі.

За показник інтенсивності сечовиділення приймали кількість сечі, виділеної твариною за 4 години в перерахунок на 1000г їх маси. Кількість сечі, виділена контрольною групою, що одержувала тільки водне навантаження, приймали за 100%.

Діуретичну активність розраховували за формулою:

$$X = \frac{V_{\text{ср}} * 100\%}{V_{\text{к}}} - 100\%,$$

Де X - діуретична активність, %;

$V_{\text{ср}}$  - середній об'єм сечі, виділений досліджуваною групою тварин, мл на 1кг маси;

$V_{\text{к}}$  - середній об'єм сечі, виділений контрольною групою тварин, мл на 1кг маси.

Метою цього досліду було дослідження діуретичної активності екстракту в дозі 150мг/кг у порівнянні з

рослинним препаратом - настоєм листя ортосифону тичинкового, що виявляє виражену діуретичну активність.

Таблиця 1

Вивчення діуретичної активності заявленого засобу  
у порівнянні з настоєм листя ортосифону тичинкового (прототипом)

Досліджуваний зразок	Об'єм сечі, мл	Об'єм сечі, мл на 1кг маси	Діуретична активність %
Заявлений засіб (150) мг/кг	5±0,63	26,2±1	31
Настій листя ортосифону тичинкового(прототип)	4,2±0,48	21,86±1,2	9
Контроль (водне навантаження 3%)	2,6±0,88	20±6	-

Дані таблиці 1 підтвердили виражену діуретичну активність поліфенольного комплексу грінделії розчепіреної в дозі 150мг/кг у порівнянні з контролем і рослинним препаратом порівняння.

Діуретична активність заявленого засобу в дозі 150мг/кг склала 31%, тоді як активність настою листя ортосифону тичинкового у порівнянні з контролем склала 9%.

Таким чином, заявлено діуретичний засіб рослинного походження з вираженою фармакологічною активністю, який поповнює недостатній арсенал вітчизняних рослинних діуретичних моно препаратів з високою фармакологічною активністю, який є ефективним, нетоксичним, практично не має протипоказань, стабільний, не розшаровується при зберіганні, простий у виробництві. Заявлений засіб одержують з вітчизняної сировини простим економічним способом на стандартному промисловому обладнанні.

Джерела інформації

1. Крыжановский С.А., Вититнова М.Б. Полный современный справочник лекарственных препаратов. Практическое руководство. 2-е изд., перераб. и доп.-М.: РИПОЛ КЛАССИК, 2002.-С. 456-464; 456-464; 464-469; 464-466; 465.

2. Курс лекций по фармакологии для самостоятельной работы студентов. Часть 2 (Препараты, регулирующие функции органов и систем. Антиаллергические и антимикробные средства) / Под. Ред. Проф. СМ. Дроговоз - Х.: Основа, 1990.-С.4-12.

3. Фітотерапія алергічних проявів / В.С. Кисличенко, Л.В. Яковлева. В.О. Заболотний і др. - Х.: "Харків", 1998.- С.88-94.

4. Заявка на винахід №2002086897, Україна, заявл. 21.08.2002, МПК 7А61К 9/06, 35/78, рішення про видачу деклараційного патенту від 06.11.2003.

5. Берхин Е.Б. Методы изучения влияния новых химических соединений на функцию почек // Хим.-фармац. журн. - 1977. -Т.11. - №5.-С.3-11.