



Patent dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 03.X.1964 (P 105 925)

Pierwszeństwo: _____

Opublikowano: 11.IV.1967

Kl. 30 h, 2/03

MKP A 61 k

27/14

UKD

Współtwórcy wynalazku: mgr Bolesław Adamczewski, dr Feliks Kaczmarek, dr Piotr Żurawski

Właściciel patentu: Instytut Przemysłu Żelarskiego, Poznań (Polska)

Sposób wytwarzania bezwonnego leku z cebulek czosnku

1

Wynalazek dotyczy sposobu wytwarzania bezwonnego doustnego leku z wonnych świeżych surowców roślinnych, zwłaszcza czosnku.

Niektóre rośliny w stanie naturalnym, między innymi cebulki czosnku są od dawna znanymi i cenionymi lekami stosowanymi w medycynie ludowej.

Naukowo stwierdzono w czasach najdawniejszych, że cebulki czosnku względnie preparaty z nich sporządzone, obok działania wzmagającego apetyt posiadają silne właściwości bakterio-bójcze i bakterioostatyczne, a także bardzo cenną zdolność poważnego obniżania ciśnienia krwi. Z tego względu sam surowiec, względnie preparaty z niego sporządzone — mają zastosowanie przy leczeniu miażdżycy naczyń (arteriosklerozy), chorobie nadciśnieniowej, zaburzeniach i chorobach przewodu pokarmowego i przemiany materii, stanach septycznych organizmu, zaburzeniach klimakterycznych, oraz jako środek zwiększający naturalną odporność organizmu.

Na przeszkodzie w szerszym stosowaniu tego cennego leczniczo surowca lub jego przetworów — stoi specyficzny, przykry zapach, towarzyszący jego użyciu do wewnątrz.

Istotą tego zapachu jest zapach dwusiarczku dwuallilu, związku wydzielającego się z organizmu poprzez płuca wraz z wydychanym powietrzem. Związek ten powstaje w wyniku hydrolizy allicyny, wytworzonej z alliiny, substancji

2

pierwotnej, występującej w surowcu świeżym, pod wpływem działania enzymu — alliinazy.

Z czosnku wytworzono już preparaty lecznicze w postaci tabletek, drażetek, kapsulek, wyciągów itp., przy czym w preparatach tych starano się zmniejszyć przykry ich zapach przez dodanie substancji dezodoryzacyjnych, najczęściej chlorofilu lub chlorofiliny. Nie osiągnano jednak dotąd zadowalających rezultatów głównie z tego względu, że zespół substancji czynnych zawarty w roślinie ulegał w czasie przetwórczych procesów technologicznych daleko idącym zmianom.

W przypadku czosnku, cebulki rozdrabniano i bądź to suszono uzyskaną masę na drodze termicznej bądź też poddawano ją różnym procesom maceracji, ekstrakcji, perkolacji itp. Podczas tych procesów przetwórczych układ enzymatyczny wyzwolony przez uszkodzenie tkanki roślinnej powodował rozkład labilnego układu substancji czynnych, na skutek czego z jednej strony zmniejszały się wydatnie właściwości lecznicze preparatu, a z drugiej strony wzrastała jego wonność, gdyż olejki eteryczne i inne lotne substancje zapachowe były uwalniane ze struktury komórkowej mogąc łatwiej uchodzić do atmosfery.

Aby w znacznej mierze zmniejszyć te niepożądane zjawiska występujące w znanych procesach przetwórczych według wynalazku nierozdrobnione cebulki czosnku zamraża się, rozdrabnia uzyskaną

mrożonkę i liofilizuje w temperaturze od -10 do -40°C , korzystnie od -15 do -30°C przy ciśnieniu $0,1-1$ tor, korzystnie $0,4-0,6$ tor, z uzyskanego liofilizatu oddziela się łuski, zwłaszcza na drodze pneumatycznej, a produkt proszkuje i przetwarza w znany sposób na drażetki, tabletki, granulki lub kapsułki z dodatkiem substancji przeciwpachowych, zwłaszcza chlorofiliny, po czym powleka warstwą izolującą przeciw wilgoci.

Uzyskany produkt zawiera susz roślinny, w którym układ ciał czynnych jest praktycznie taki sam jak w świeżej roślinie, gdyż jak wiadomo podczas liofilizacji nawet bardzo wrażliwe układy biochemiczne zostają wysuszone bez większych zmian poza odwodnieniem. Zmieszanie z chlorofiliną zapobiega wydzielaniu się przykrego zapachu po spożyciu leku, a przez zaopatrzenie drażetek lub kapsułek w warstwę ftalanu acetylocelulozy doprowadza się w praktyce do tego, że lek w stanie suchym i niezmiennym na skutek działania enzymów doprowadza się wprost do dwunastnicy, gdzie dopiero kapsułki lub drażetki, ulegają rozpuszczeniu, substancja roślinna nawadnia się i może być wchłonięta bez szkodliwych zmian degradacyjnych przez organizm. Efektu takiego nie uzyskano dotychczas jeszcze przy zastosowaniu żadnego ze znanych procesów technologicznych uzyskiwania leków na podstawie roślinnej.

Wynalazek polega więc na połączeniu w jeden proces technologiczny szeregu znanych w zasadzie operacji, które pozwalają na osiągnięcie produktu o znacznie lepszej niż dotychczas jakości.

Przykład I. Z czystych, zdrowych cebulek czosnku odkrawa się ręcznie nożem korzonki oraz resztę łodygi odrzucając równocześnie luźne łuski. Tak przygotowany surowiec (całe cebulki) po zamrożeniu w chłodni w temperaturze około -30°C rozdrabnia się na wilku, przeprowadzając tę operację również w chłodni. Rozdrobniony surowiec poddaje się natychmiast liofilizacji w temperaturze od -15°C do -30°C , przy ciśnieniu od $0,6$ do $0,4$ tor. Po zakończeniu liofilizacji oddmuchuje się z liofilizatu łuski za pomocą dmuchawy suchym, zimnym powietrzem, a sam liofilizat proszkuje się do wielkości ziarn o średnicy około $0,5$ milimetra. Tak otrzymany proszek miesza się w szczelnym, suchym mieszalniku z masą tabletkową w następującej proporcji:

100 części wagowych liofilizatu

42,5 części wagowych formaldehydo-kazeiny

7,5 wagowych mieszaniny talku i stearynianu magnezu w stosunku $19:1$.

Otrzymane tabletki powleka się natychmiast przez natrysk w wirującym bębnie drażetkarskim około 6%-owym roztworem acetonowym ftalanu acetylocelulozy w ilości 40% objętościowych na wagę tabletek, odpędzając aceton przez dmuchanie zimnym powietrzem. Powleczone tabletki suszy się 24 godziny od resztek acetonu w pomiesz-

czeniu suchym, chłodnym i przewiewnym, p drażuje.

Powlekanie wstępne przeprowadza się syropem drażowym o składzie:

1,5 części wagowych talku

5,5 części wagowych skrobii ziemniaczanej

50,0 części wagowych cukru buraczanego

10,0 części wagowych gumy arabskiej

0,5 części wagowych gliceryny

100,0 części wagowych wody destylowanej

Powlekanie zasadnicze przeprowadza się przy użyciu syropu przygotowanego w następujący sposób: 86 części wagowych cukru buraczanego rozpuszcza się na ciepło w 48 częściach wagowych wody. Osobno miesza się 7 części wagowych mąki pszennej, 2 części wagowe talku, 20 ml wody, po czym zawiesinę ogrzewa się do wrzenia w ciągu 1 minuty. Otrzymaną zawiesinę miesza się z roztworem cukru. W całości rozpuszcza się 5 części wagowych chlorofiliny.

W procesie drażowania stosuje się proszek do przesypywania, o składzie:

10 części wagowych talku

45 części wagowych cukru pudrowego

45 części wagowych skrobii ziemniaczanej.

Otrzymane drażetki suszy się dokładnie, po czym poleruje.

Przykład II. Liofilizat z cebulek czosnku sporządza się analogicznie jak w przykładzie I. Po oddzieleniu łusek przez nadmuch zimnego powietrza i rozdrobnieniu liofilizatu dodaje się do otrzymanego proszku 5% wagowych chlorofiliny, całość dokładnie miesza, po czym napełnia w kapsułki żelatynowe wybranego rozmiaru. Napełnione kapsułki powleka się natychmiast przez natrysk w wirującym bębnie drażetkarskim około 6%-owym roztworem acetonowym ftalanu acetylocelulozy w ilości 40% objętościowych roztworu w stosunku do wagi kapsułek odpędzając aceton przez dmuchanie zimnym powietrzem. Powleczone kapsułki suszy się 24 godziny od resztek acetonu w pomieszczeniu suchym, chłodnym i przewiewnym, po czym poleruje na drodze zwyczajnej i opakuje.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania bezwonnego leku z cebulek czosnku przez rozdrobnienie, wysuszenie i przerób suszu na drażetki, kapsułki, tabletki, granulki itp., **znamienny tym**, że nierozdrobnione cebulki czosnku zamraża się, rozdrabnia uzyskaną mrożonkę i liofilizuje w temperaturze od -10°C do -40°C , korzystnie od -15°C do -30°C przy ciśnieniu $0,1-1$ tor, korzystnie $0,4-0,6$ tor, z uzyskanego liofilizatu oddziela się łuski, zwłaszcza na drodze pneumatycznej, a produkt proszkuje i przetwarza w znany sposób na drażetki, tabletki, granulki lub kapsułki z dodatkiem substancji przeciwpachowych, zwłaszcza chlorofiliny, po czym powleka warstwą izolującą przeciw wilgoci.