



Patent dodatkowy
do patentu nr ———

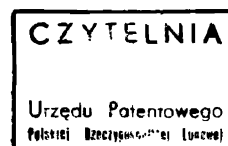
Zgłoszono: 86 09 09 (P. 261338)

Int. Cl.⁴ A61K 35/78

Pierwszeństwo ———

Zgłoszenie ogłoszono: 88 06 09

Opis patentowy opublikowano: 1990 03 31



Twórcy wynalazku: Halina Strzelecka, Jadwiga Nartowska

Uprawniony z patentu: Akademia Medyczna,
Warszawa (Polska)

Sposób otrzymywania saponin z ziela przelotu pospolitego (*Anthyllis vulneraria* L.)

Przedmiotem wynalazku jest sposób otrzymywania saponin z ziela przelotu pospolitego (*Anthyllis vulneraria* L.) rozpuszczalnych i nierozpuszczalnych w wodzie, zwłaszcza saponin o działaniu uspakajającym.

Znane są metody otrzymywania saponin z publikacji Z. Jerzmanowskiej „Substancje roślinne - metody wyodrębniania” z 1967 r., które polegają na ekstrakcji roślinnej substancji eterem w celu oczyszczania od żywicy, wosku, substancji tłuszczowej i chlorofilu. Ponowne ekstrahowanie rozpuszczalnikami na gorąco, oziębianie lub zatężenie i oziębianie ma na celu otrzymanie osadu saponin. Celem wynalazku jest wyodrębnienie saponin o niskiej toksyczności i silnym działaniu na ośrodkowy układ nerwowy.

Istotą wynalazku jest otrzymanie saponin rozpuszczalnych i nierozpuszczalnych w wodzie z przelotu pospolitego. Rozdrobniony surowiec ziela poddaje się maceracji na zimno mieszaniną etanolu z wodą. Otrzymane wyciągi przepuszcza się przez rozdrobniony poliamid, zagęszcza pod zmniejszonym ciśnieniem do 1/3 objętości, po czym ochładza się do temp. pokojowej, a otrzymany osad saponin nierozpuszczalnych po przemyciu wodą rozpuszcza się w alkoholu etylowym i oczyszcza tlenkiem glinu.

W celu rozpuszczalnych w wodzie saponin surowiec poddaje się maceracji na zimno 50°C etanolem, a otrzymany wyciąg pierwotny przepuszcza się przez rozdrobniony poliamid, po czym zagęszcza się do 1/3 objętości pod zmniejszonym ciśnieniem, następnie ochładza do temp. pokojowej, odsącza osad i przemycia wodą. Przesącze ekstrahuje się pięciokrotnie n-butanolem wysyconym wodą. Następnie odparowuje się butanol i suchą pozostałość rozpuszcza się w 50° alkoholu etylowym, po czym oczyszcza się przez dodanie tlenku glinu.

Otrzymany wyciąg po maceracji zagęszcza się pod zmniejszonym ciśnieniem do objętości 1/3 w celu odparowania części wody i całkowicie alkoholu. Zagęszczony wyciąg zawiera saponiny o różnej polarności - saponiny rozpuszczalne i nierozpuszczalne w wodzie. We frakcji butanolowej występuje zespół saponin rozpuszczalnych w wodzie bardziej aktywnych farmakologicznie a mniej

toksycznych. We frakcji etanolowej znajduje się zespół saponin nierozpuszczalnych w wodzie, mniej aktywnych farmakologicznie a bardziej toksycznych. Niżej podane przykłady bliżej objaśniają wynalazek.

Przykład I. 700 g Kwiatów przelotu pospolitego macerowano 3-krotnie 50° alkoholem etylowym, biorąc jednorazowo 5l alkoholu. Otrzymano 15l wyciągu, który oczyszczono od chlorofilu przez przepuszczenie go przez warstwę poliamidu przygotowanego wg publikacji Z. Jerzmanowskiej pt. „Substancje roślinne - metody wyodrębniania r. 1967 str. 214. Tak oczyszczony wyciąg, zagęszczono pod zmniejszonym ciśnieniem do 1/3 objętości. Po odparowaniu alkoholu etylowego i oziębieniu do temp. 10°C-0°C wytrąca się osad nierozpuszczalny w wodzie w ilości około 6g. Osad przemyto wodą, a następnie rozpuszczono w etanolu otrzymując w ten sposób frakcję etanolową saponin.

W celu oczyszczenia substancji od zanieczyszczeń związkami flawonoidowymi stosuje się tlenek glinu (w ilości ok. 0,5 kg) po odsączeniu i przemyciu tlenku glinu wyciągi odparowano do sucha, otrzymując 4,5 substancji aktywnej. Dla otrzymania czystego produktu o działaniu farmakologicznym można oczyścić go dodatkowo jednym ze znanych sposobów, a następnie rozdzielić na drodze żmudnych procesów chromatografii kolumnowej, uzyskując jednorodne składniki.

Przykład II. 700 g ziela przelotu pospolitego macerowano 3-krotnie 60° alkoholem etylowym, biorąc jednorazowo 5l alkoholu. Otrzymano 15l wyciągu, który oczyszczono od chlorofilu przez przepuszczanie go przez warstwę poliamidu spreparowanego tak jak w przykładzie I. Tak oczyszczony wyciąg zagęszczono pod zmniejszonym ciśnieniem do 1/3 objętości. Po odparowaniu alkoholu i oziębieniu do temp. 10° wytrącony osad odsączono, a wodny przesącz ekstrahowano pięciokrotnie n-butanolem wysyconym wodą. Wszystkie ekstrakty butanolowe połączono i odparowano. Suchą pozostałość w ilości 17 g rozpuszczono w 60° etanolu, otrzymując frakcję butanolową. W celu oczyszczenia substancji od zanieczyszczeń postępuje się jak w przykładzie I. Otrzymano produkt końcowy w ilości ok 15 g.

Związki aktywne otrzymane według wynalazku wykazują działanie farmakologiczne. Saponiny z ziela przelotu pospolitego charakteryzując się wyraźnym wpływem sedatywnym na ośrodkowy układ nerwowy szczura, powodują także skrócenie działania uspakajającego oraz zmniejszenie natężenia drgawek klonicznych w teście Makseymalnego Elektrowstrząsu tj. działa przeciw drgawkowo (MES). W żadnych z zastosowanych stężeń nie zaobserwowano efektów toksycznych, a w szczególności depresyjnego działania na układ krążenia, układ oddechowy lub nieodwracalnych zaburzeń ośrodkowego układu nerwowego.

Z a s t r z e ż e n i a p a t e n t o w e

1. Sposób otrzymywania saponin z ziela przelotu pospolitego (*Anthyllis vulneraria* L.) nierozpuszczalnych w wodzie, **znamienny tym**, że rozdrobniony surowiec poddaje się maceracji na zimno etanolem 50° otrzymany wyciąg przepuszcza się przez rozdrobniony poliamid, po czym zagęszcza się do 1/3 objętości pod zmniejszonym ciśnieniem ochładza się do temperatury pokojowej i tak otrzymany osad po przemyciu wodą rozpuszcza się w alkoholu etylowym i oczyszcza przez dodanie tlenku glinu.

2. Sposób otrzymywania saponin z ziela przelotu pospolitego (*Anthyllis vulneraria* L.) rozpuszczalnych w wodzie, **znamienny tym**, że rozdrobniony surowiec poddaje się maceracji na zimno alkoholem etylowym 50° i otrzymany wyciąg przepuszcza się przez rozdrobniony poliamid, po czym zagęszcza się do 1/3 objętości pod zmniejszonym ciśnieniem, ochładza do temperatury pokojowej, osad odsącza się i przemyci wodą, przesącze ekstrahuje się pięciokrotnie n-butanolem wysyconym wodą następnie odparowuje się i suchą pozostałość rozpuszcza w alkoholu etylowym 50°, po czym oczyszcza przez dodanie tlenku glinu.