



(19) **UA** (11) **36 446** (13) **C2**  
(51)МПК <sup>7</sup> **A 61K 35/78, A 61P 1/00**

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ  
УКРАИНЫ

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ УКРАИНЫ

(21), (22) Заявка: 99126907, 17.12.1999

(24) Дата начала действия патента: 15.10.2003

(46) Дата публикации: 15.10.2003

(72) Изобретатель:

Белоконь Иоанна Федоровна, UA,  
Спиридонов Владимир Николаевич, UA,  
Маслова Наталья Федоровна, UA,  
Носальская Татьяна Николаевна, UA,  
Рыбаченко Анатолий Иванович, UA,  
Бобкова Людмила Николаевна, UA,  
Кобзарь Анна Ивановна, UA

(73) Патентовладелец:

Государственный научный центр  
лекарственных средств, UA

(54) СРЕДСТВО "ЭРИНАТИД" ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ЗАБОЛЕВАНИЙ ЖЕЛУДОЧНО-КИШЕЧНОГО ТРАКТА

(57) Реферат:

Изобретение относится к медицине, ветеринарии и фармацевтической промышленности, и предназначено для лечения заболеваний желудочно-кишечного тракта. Средство содержит экстракт *Erigeron*, декаметоксин, кислоту сорбиновую и другие вспомогательные вещества.

Официальный бюлетень "Промышленная собственность". Книга 1 "Изобретения, полезные модели, топографии интегральных микросхем", 2003, N 10, 15.10.2003. Государственный департамент интеллектуальной собственности Министерства образования и науки Украины.

У А 3 6 4 4 6 С 2

У А 3 6 4 4 6 С 2



(19) **UA** <sup>(11)</sup> **36 446** <sup>(13)</sup> **C2**  
(51) Int. Cl.<sup>7</sup> **A 61K 35/78, A 61P 1/00**

MINISTRY OF EDUCATION AND SCIENCE OF  
UKRAINE

STATE DEPARTMENT OF INTELLECTUAL  
PROPERTY

(12) **DESCRIPTION OF PATENT OF UKRAINE FOR INVENTION**

(21), (22) Application: 99126907, 17.12.1999

(24) Effective date for property rights: 15.10.2003

(46) Publication date: 15.10.2003

(72) Inventor:

Bilokin Ioanna Fedorivna, UA,  
Spyrydonov Volodymyr Mykolaiovych, UA,  
Maslova Natalia Fedorivna, UA,  
Nosalska Tetiana Mykolaivna, UA,  
Rybachenko Anatolii Ivanovych, UA,  
Bobkova Liudmyla Mykolaivna, UA,  
Kobzar Hanna Ivanivna, UA

(73) Proprietor:

State Research Center of Pharmaceuticals, UA

(54) **ERINATID – REMEDY FOR TREATING GASTROINTESTINAL DISEASES**

(57) Abstract:

The invention relates to the medicine, veterinary and pharmaceutical industry, and is intended for treating the gastrointestinal diseases. The composition contains Erigeron extract, decametoxin, sorbic acid and the excipients.

Official bulletin "Industrial property". Book 1 "Inventions, utility models, topographies of integrated circuits", 2003, N 10, 15.10.2003. State Department of Intellectual Property of the Ministry of Education and Science of Ukraine.

U A 3 6 4 4 6 C 2

U A 3 6 4 4 6 C 2



(19) **UA** <sup>(11)</sup> **36 446** <sup>(13)</sup> **C2**  
(51)МПК <sup>7</sup> **A 61K 35/78, A 61P 1/00**

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ

(12) ОПИС ВІНАХОДУ ДО ПАТЕНТУ УКРАЇНИ

(21), (22) Дані стосовно заявки:  
99126907, 17.12.1999

(24) Дата набуття чинності: 15.10.2003

(46) Публікація відомостей про видачу патенту  
(декларційного патенту): 15.10.2003

(72) Винахідник(и):

Білоконь Іоана Федорівна, UA,  
Спиридонов Володимир Миколайович, UA,  
Маслова Наталія Федорівна, UA,  
Носальська Тетяна Миколаївна, UA,  
Рибаченко Анатолій Іванович, UA,  
Бобкова Людмила Миколаївна, UA,  
Кобзар Ганна Іванівна, UA

(73) Власник(и):

Державний науковий центр лікарських засобів,  
UA

(54) ЗАСІБ "ЕРИНАТИД" ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЗАХВОРЮВАНЬ ШЛУНКОВО-КИШКОВОГО ТРАКТУ

(57) Реферат:

Винахід відноситься до медицини та фармацевтичної промисловості і призначений для лікування захворювань шлунково-кишкового

тракту. Засіб містить екстракт трави злинки канадської, кислоту лимонну, кислоту сорбінову та інші допоміжні речовини.

U  
A  
3  
6  
4  
4  
6  
C  
2

U  
A  
3  
6  
4  
4  
6  
C  
2

## Опис винаходу

Винахід відноситься до медицини і хіміко-фармацевтичної промисловості, зокрема, до створення, виробництва і застосування засобів на основі рослинної сировини для лікування захворювань шлунково-кишкового тракту.

Відоме застосування відварів та настоїв з рослинної сировини, зокрема, алтеї лікарської, айви довгастої, айру тростинового, астрагалу солодколистого та шерстистоквіткового, брусниці, калгану, перстачу сріблястого та ін., для лікування шлунково-кишкових захворювань, що супроводжуються проносами. Але при їх створенні і застосуванні виникають проблеми відносно точності дозування, неможливості зберігання протягом достатньо довгих термінів, невідповідності нормам мікробної чистоти [1].

Відоме застосування магнію перекису у вигляді порошку при диспепсії, бродінні в шлунку і кишечнику, проносах [2].

Відомий лікарський засіб "Капект" (Єгипет., фірма "Eipico") на основі речовин природного походження, що містить каолін і пектин (965г каоліну і 21,5г пектину в 5мл суспензії). Засіб має обволікаючу і адсорбуючу дію і застосовується для лікування гострих і хронічних діарей [3].

Відомий засіб "Імодіум" на основі лоперамиду у вигляді капсул по 0,002г і 0,002% розчину, який застосовують для лікування гострих і хронічних діарей. При застосуванні "Імодіуму" можливі побічні явища у вигляді нудоти, запаморочення і запорів [4].

Відомий лікарський засіб "Танальбин" на основі продукту взаємодії дубильних речовин з листя скумпії і сумаху з білком (казеїном). Застосовують як в'язучий засіб при гострих і хронічних захворюваннях кишечника (проносу), причому як допоміжний засіб на додаток до специфічних методів лікування [5].

Відомий лікарський засіб "Левоміцетин", який використовують для лікування кишкових інфекційних діарей. Обов'язковий курс лікування передбачає прийом внутрішньо по 0,5г чотири рази на день протягом 5 - 7 днів. Можливим ускладненням такої інтенсивної терапії антибіотиком є розвиток дисбактеріозів, які супроводжуються настійливими проносами, виснаженням, зниженням імунного статусу організму [6].

Відомий засіб для лікування діарейних інфекцій людини і тварин, який являє собою пектин, розчинений у воді або фізіологічному розчині [7].

Відоме застосування настою трави злинки канадської як протидезинтерійного засобу, при лікуванні запалень сечового міхура і передміхурової залози та ін. [8].

Найбільш близьким до заявляемого є антидіарейний засіб "Ерікан", що містить (мас.%) екстракт трави злинки канадської (9,0 - 11,0); пектин (1,2 - 1,5); кислоту лимонну (0,3 - 0,6); кислоту сорбінову (0,3 - 0,6); цукор - рещта. Застосовують у вигляді гранул, які розчиняють у воді, одержуючи суспензію [9].

До недоліків прототипу слід віднести те, що його якісний та кількісний склад не дозволяє досягти більш високого рівня і широкого спектра специфічної активності, скоротити термін проведення курсу лікування, зменшити добову дозу і кількість прийомів препарату. До того ж вміст великої кількості цукру в складі засобу-прототипу (до 90%) є небажаним фактором при призначенні цього засобу для лікування гострих кишкових захворювань, що супроводжуються профузними діареями.

В основу винаходу поставлено завдання створення засобу для лікування захворювань шлунково-кишкового тракту шляхом такого підбору якісного та кількісного складу компонентів, який би забезпечив високий рівень та широкий спектр специфічної активності, скоротив терміни проведення курсу лікування, зменшив добову дозу і кількість прийомів препарату.

Поставлене завдання вирішується тим, що засіб для лікування захворювань шлунково-кишкового тракту, що містить екстракт трави злинки канадської (*Erigeron canadensis*), кислоту лимонну, кислоту сорбінову, пектин і цукор, у відповідності з винаходом додатково містить натрію хлорид, мікрокристалічну целюлозу і крохмаль при таких співвідношеннях компонентів, мас. %:

Екстракт трави злинки канадської (ФС 42У-4/37-1144-99)	7,0 - 13,0
Кислота сорбінова (ТУ 6-14-358-76)	0,2 - 0,6
Кислота лимонна (ГОСТ 908-79)	0,2 - 0,6
Натрію хлорид (ГФ Х, от. 311)	0,7-1,1
Пектин (ГОСТ 111-3-84)	7,0 - 13,0
Мікрокристалічна целюлоза (ВФС 42-2185-93)	7,0 - 13,0
Крохмаль (ГОСТ 7697-82)	14,0 - 26,0
Цукор (ГОСТ 22-94)	Рещта

Технічний результат, який одержують при здійсненні винаходу, полягає у досягненні високого рівня та широкого спектра специфічної активності, скороченні термінів проведення курсу лікування, зменшенні добової дози і кількості прийомів препарату.

Заявляемий засіб "Ерінатид", який застосовують у вигляді водної суспензії, рекомендовано для лікування захворювань шлунково-кишкового тракту, які супроводжуються діарейним синдромом: ентерити, коліти, ентероколіти, хронічний панкреатит, неспецифічні виразкові коліти та ін. Можливе застосування "Ерінатиду" у комплексі з лікарськими засобами, які входять в базисну терапію шлунково-кишкових захворювань: ферментні засоби, антибіотики, противиразкові та ін.

Наводимо конкретні приклади здійснення винаходу.

Приклад 1. Відповідні кількості сухого екстракту трави злинки канадської, пектину, мікрокристалічної

целюлози, натрію хлориду, крохмалю та цукру перемішують до однорідності. Одержану суміш зволожують при перемішуванні спиртоводним розчином кислоти сорбінової і кислоти лимонної, потім масу гранулюють і сушать при температурі не вище 40-50°C. Одержані гранули розфасовують в однодозові пакети по 2,4г.

Заявляемий засіб має таке співвідношення компонентів, мас. %:

Екстракт трави злинки канадської	7,0
Кислота сорбінова	0,2
Кислота лимонна	0,2
Натрію хлорид	0,7
Пектин	7,0
Мікрокристалічна целюлоза	7,0
Крохмаль	14,0
Цукор	Решта

Приклад 2. Заявляемий засіб одержують аналогічно прикладу 1 при такому співвідношенні компонентів, мас. %:

Екстракт трави злинки канадської	8,0
Кислота сорбінова	0,3
Кислота лимонна	0,3
Натрію хлорид	0,8
Пектин	8,0
Мікрокристалічна целюлоза	8,0
Крохмаль	16,0
Цукор	Решта

Приклад 3. Заявляемий засіб одержують аналогічно прикладу 1 при такому співвідношенні компонентів, мас. %:

Екстракт трави злинки канадської	10,0
Кислота сорбінова	0,4
Кислота лимонна	0,4
Натрію хлорид	0,8
Пектин	10,0
Мікрокристалічна целюлоза	10,0
Крохмаль	20,0
Цукор	Решта

Приклад 4. Заявляемий засіб одержують аналогічно прикладу 1 при такому співвідношенні компонентів, мас. %:

Екстракт трави злинки канадської	12,0
Кислота сорбінова	0,5
Кислота лимонна	0,5
Натрію хлорид	1,0
Пектин	12,0
Мікрокристалічна целюлоза	12,0
Крохмаль	24,0
Цукор	Решта

Приклад 5. Заявляемий засіб одержують аналогічно прикладу 1 при такому співвідношенні компонентів, мас. %:

Екстракт трави злинки канадської	13,0
Кислота сорбінова	0,6
Кислота лимонна	0,6
Натрію хлорид	1,1
Пектин	13,0
Мікрокристалічна целюлоза	13,0
Крохмаль	26,0
Цукор	Решта

Захворювання шлунково-кишкового тракту, що супроводжуються діарейним синдромом, відносяться до найбільш значних медикосоціальних проблем багатьох країн світу. По даним ВОЗ в останні десять років реєструється щороку до 1,5 млрд. випадків захворювань діареями різної етіології, що ставить їх на друге місце у світі після захворювань серцево-судинної системи.

Складність лікування діарейного синдрому обумовлена, головним чином, його змішаним характером (секреторний, моторний, осмотичний, ексудативний), що викликає необхідність створення комбінованих препаратів, які впливають на різні механізми діарей. Якісний та кількісний склад заявляемого засобу повністю вирішує завдання по створенню високоефективного препарату для лікування шлунково-кишкових захворювань з діарейним синдромом.

Основна діюча речовина заявляемого засобу - екстракт трави злинки канадської, до складу якого входить комплекс речовин: полісахариди, оксикоричні кислоти, флавоноїди, дубильні речовини, амінокислоти, вітаміни, а також мікроелементи (магній, залізо, кобальт, мідь, натрій, кальцій та ін.). В народній медицині здавна відвари і настої трави злинки канадської застосовують як протидіарейний засіб [8]. В засобі-прототипі екстракт трави злинки канадської також є основною діючою речовиною, але в заявляемому засобі цей компонент набуває більш високого рівня і широкого спектра специфічної активності завдяки синергійній взаємодії з комплексом допоміжних речовин, який відрізняється якісним і кількісним складом від прототипу. Кількість екстракту менше заявляемим значень не забезпечує необхідний рівень специфічної активності. Застосування ж екстракту у кількості більше заявляемим значень недоцільно, бо хоча він і виявляє дозозалежний характер, але його ефективність, наприклад, у дозах 0,5г/кг і 1,0г/кг не має вірогідних відмін. До того ж великі кількості сухого екстракту можуть викликати труднощі технологічного характеру при гранулюванні.

Пектин, мікрокристалічна целюлоза і крохмаль в заявляемому складі поліфункціональні, бо виконують роль стабілізаторів суспензії і наповнювачів при гранулюванні. Окрім того, вони адсорбують токсичні речовини з шлунково-кишкового тракту (ЖКТ), нормалізують осмотичний стан вмісту кишечника, формують і збільшують об'єм калових мас. Збільшення кількості пектину у 8 разів у порівнянні з прототипом, забезпечує оптимальний рівень обволікаючої і пом'якшувальної дії, зменшує подразнення слизової ЖКТ при гострих діареях.

Застосування натрію хлориду і цукру забезпечує в заявляемому складі наявність регідратаційних властивостей, що виявляється у посиленні пристінкового травлення і всмоктування моносахаридів. Окрім того, застосування натрію хлориду забезпечує нормалізацію електролітного складу крові, глюкоза підвищує її осмотичні властивості, чим сприяє утриманню електролітів, гальмує їх виділення.

Кислоту сорбінову застосовують як консервант для забезпечення норм мікробної чистоти; лимонну кислоту і цукор - як коригенти смаку.

Порушення якісного і кількісного складу заявляемого засобу призводить до суттєвого зниження рівня і звуження спектра специфічної активності, погіршує технологічні характеристики лікарської форми: суміш компонентів при зволоженні цементується, одержані гранули погано розпадаються при розчиненні у воді.

Проведені фармакологічні дослідження підтвердили раціональність складу заявляемого засобу, про що свідчать приведені нижче результати експериментів. При вивченні протидіарейної дії заявляемого засобу використовували різні варіанти кількісного складу заявляемого засобу у порівнянні з засобом-прототипом.

Порівняльний аналіз протидіарейної дії заявляемого засобу і засобу-прототипу									
Досліджувані засоби	Компоненти досліджуваних засобів (мас.%)								Термін настання першої дефекації (хв)
	Екстракт і трави злинки канадської	Кислота сорбінова	Кислота лимонна	Натрію хлорид	Пектин	МКЦ	Крохмаль	Цукор	
1*	7,0	0,2	0,2	0,7	7,0	7,0	14,0	63,9	140
2*	8,0	0,2	0,3	0,8	8,0	8,0	16,0	58,7	170
3*	10,0	0,4	0,4	10,0	10,0	10,0	20,0	48,3	180
4*	12,0	0,5	0,5	1,0	12,0	12,0	24,0	38,0	180
5*	13,0	0,6	0,6	1,1	13,0	13,0	26,0	32,7	185
Ерікан**	10,0	0,4	0,4	-	1,25	-	-	87,95	100

\* - склади заявляемого засобу (приклади №1 - 5)  
\*\* - склад прототипу

Результати дослідів, наведені в таблиці 1, свідчать про значні переваги заявляемого засобу, який перевершує у 1,4 - 1,8 рази засіб-прототип по одному з показників оцінки протидіарейної дії - терміну настання першого акту дефекації.

Порівняльний аналіз протидіарейної дії заявляемого засобу і засобу-прототипу на моделі касторової діареї					
Умови дослідів	Доза, г/кг	Кількість прийомів на добу	Термін настання акту першої дефекації (хв)	Кількість актів дефекації	Тривалість курсу лікування (доба)
Інтактні тварини	-	-	122,5±1,4	2,3±0,2	-
Касторова олія (КО)			43,7±8,0	4,4±0,3	-
КО + заявляемий засіб	0,25	3 рази	180,8±19,4	1,5±0,2	2-4
КО + засіб-прототип	0,50	4-5 разів	104,2±14,2	2,9±0,32	7-10

Результати порівняльного аналізу, наведені в таблиці 2, свідчать про переваги заявляемого засобу перед засобом-прототипом: при вдвічі меншій його дозі скорочується кількість прийомів на добу і тривалість курсу лікування, збільшується термін настання акту першої дефекації.

Таблиця 3			
Порівняльний аналіз впливу допоміжних речовин на протидіарейну дію заявляемого засобу і засобу-прототипу			
Досліджувані засоби	Доза, г/кг	Термін настання першої дефекації.	Кількість актів дефекацій
Екстракт трави злинки канадської (субстанція заявляемого засобу і засобу-прототипу)	0,125	64,2 ± 3,8	6,4 ± 0,5
	0,25	65,0 ± 2,9	5,3 ± 0,5
	0,5	71,8 ± 3,5	2,2 ± 0,4
	1,0	73,1 ± 1,2	2,5 ± 0,1
Ерінатид (заявляемий засіб)	0,25	180,8 ± 19,4	1,5 ± 0,2
Ерікан (засіб-прототип)	0,5	104,2 ± 14,2	2,9 ± 0,32
Склад допоміжних речовин заявляемого засобу	0,25	109,0 ± 10,0	3,5 ± 0,38
Склад допоміжних речовин засобу-прототипу	0,25	60,1 ± 12,3	4,2 ± 0,8

Результати дослідів, наведені в таблиці 3, свідчать про оптимальність складу допоміжних речовин заявляемого засобу, комплекс яких виявляє протидіарейну дію на рівні засобу-прототипу. Так, термін настання акту першої дефекації при застосуванні комплексу допоміжних речовин "Ерінатиду" подовжується на 81% у порівнянні з комплексом допоміжних речовин "Ерікану"; на 36% зменшується кількість актів дефекацій і на 56% ущільнюється консистенція калових мас.

В таблиці 4 наведені дані досліджень, які свідчать про наявність у заявляемого засобу адсорбційної активності достатньо високого рівня, яка відсутня у засобі-прототипі.

Таблиця 4		
Сорбційна здатність заявляемого засобу		
Досліджувані засоби	Середня кількість мікроорганізмів (КОЕ/мл),	
	Escherichia coli	Salmonella typhimurium
Контроль	717	998
Заявляемий засіб	597	781
Засіб-прототип	877	982

Як видно з наведених даних, застосування засобу "Ерінатиду" зменшує кількість мікробних тіл Escherichia coli на 17%, а Salmonella typhimurium - на 22%. Засіб "Ерікан" адсорбційної активності не проявляє, бо зменшення кількості мікробних тіл не спостерігається.

Дослідження по розширенню спектра специфічної активності заявляемого засобу продовжуються.

Таким чином, у винаході вирішується поставлене завдання по створенню високоефективного засобу для лікування захворювань шлунково-кишкового тракту з високим рівнем і широким спектром специфічної активності, застосування якого дозволяє скоротити терміни курсу лікування, зменшити добову дозу прийому препарату.

#### ЛІТЕРАТУРА:

1. Лікарські рослини: Енциклопедичний довідник / Відп. ред. А.М. Гродзинський. - К.: 1991.
2. Машковский М.Д. Лекарственные средства. Т.1 - Харьков: Торсинг, 1997. - с. 316.
3. Vidal, 1997, с. Б-247.
4. Машковский М.Д. Лекарственные средства. Т.1 - Харьков: Торсинг, 1997. - С. 155-156.
5. Машковский М.Д. Лекарственные средства. Т.1. - Харьков: Торсинг, 1997. - с. 305.
6. Машковский М.Д. Лекарственные средства. - М., "Медицина", 1977, т.2. - с. 177.
7. Патент Российской Федерации №2108106. Кл. А61К35/78. Оpubл. БИ 1998, №10.
8. Лікарські рослини: Енциклопедичний довідник / Відп. ред. А.М. Гродзинський. - К.: 1991. - с. 176.
9. Патент України №23168А Кл. А61К9/14. Оpubл. Бюл. "Промислова власність", 1998, №4 (прототип).

#### Формула винаходу

Засіб для лікування захворювань шлунково-кишкового тракту, що містить екстракт трави злинки канадської (Erigeron canadenses), кислоту лимонну, кислоту сорбінову, пектин і цукор, який відрізняється тим, що додатково містить натрію хлорид, мікрокристалічну целюлозу і крохмаль при таких співвідношеннях компонентів, мас. %:

- екстракт трави злинки канадської 7,0 - 13,0
- кислота сорбінова 0,2 - 0,6
- кислота лимонна 0,2 - 0,6
- натрію хлорид 0,7 - 1,1
- пектин 7,0 - 13,0
- мікрокристалічна целюлоза 7,0 - 13,0
- крохмаль 14,0 - 26,0
- цукор решта.

Офіційний бюлетень "Промислова власність". Книга 1 "Винаходи, корисні моделі, топографії інтегральних мікросхем", 2003, N 10, 15.10.2003. Державний департамент інтелектуальної власності Міністерства освіти і

науки України.

5

10

15

20

25

30

35

40

**U A**

45

**3 6 4 4 6**

50

**3 6 4 4 6**

55

**C 2**

60

65

**C 2**

**3 6 4 4 6**

**3 6 4 4 6**

**U A**