



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ OPIS PATENTOWY

Nr 45231

Kl. 30 h, 2/30

VEB Arzneimittelwerk Dresden
Radebeul, Niemiecka Republika Demokratyczna

Sposób wytwarzania ekstraktów do iniekcji zawierających flawony z nasion dzikiego kasztana

Patent dodatkowy do patentu nr 43878

Patent trwa od dnia 4 czerwca 1959 r.

Pierwszeństwo: 19 lutego 1959 r. (Niemiecka Republika Demokratyczna).

Wynalazek dotyczy dalszego rozwinięcia sposobu wytwarzania ekstraktów do iniekcji zawierających flawony z nasion dzikiego kasztana według patentu głównego Nr 43878, zwłaszcza w celu zwiększenia odporności kapilarnej ekstraktów wytworzonych sposobem według wynalazku.

Patent główny Nr 43878 opisuje sposób wytwarzania ekstraktów do iniekcji zawierających flawony z nasion dzikiego kasztana, polegający na tym, że hemolitycznie działającą i dlatego trującą saponinę dzikiego kasztana, aescynę, przeprowadza się w nierozpuszczalny w wodzie aescynol przez krótkie traktowanie ługiem, korzystnie przy wartości $\text{pH} = 10$ w temperaturze 50°C , a następnie oziębia do temperatury

poniżej 20°C i zakwasza, po czym usuwa się wydzielony aescynol z wodnego roztworu przez odsączenie lub odwirowanie i otrzymuje ekstrakt zawierający flawony.

Można także postępować w ten sposób, że żółty osad, wytrącający się korzystnie z alkoholowego roztworu ekstraktu po oddaniu ługu i składający się z soli alkalicznej aescynolu, flawonów i cukru, uwalnia się od saponiny przez wprowadzenie osadu do wody, zakwaszenie i w końcu oddzielenie wolnego, nierozpuszczalnego w wodzie kwasu aescynolowego.

Stwierdzono, że można znacznie zwiększyć działanie odporności kapilarnej ekstraktów zawierających flawony i całkowicie wolnych od saponin, jeżeli pozostawi się w nich ślad sa-

poniny rodzimej (aescyny, rodzimej) albo wprowadzi ją dodatkowo.

Jako odpowiednie okazały się również ekstrakty zawierające dodatek witaminy B₁. Zamiast saponiny rodzimej można wprowadzić równoważną ilość ekstraktów z nasion zawierających saponiny. Jako szczególnie odpowiednia okazała się całkowicie nieuszkodzona saponina, którą otrzymuje się z ekstraktów, np. w znany sposób przez frakcjonowanie wytrącanie eterem, a następnie przez oczyszczanie na drodze dializy.

W taki sam sposób można zastosować krystaliczną saponinę (skrystalizowaną aescynę), lub sól sodową aescyny, lub saponinę rodzimą, którą wytwarza się np. z odpowiedniego saponinocholesterydu przez ogrzewanie do wrzenia z ksylenem albo podobnym węglowodorem.

Zwiększenie odporności kapilarnej ekstraktów zawierających flawony i nadających się do iniekcji nie jest związane z formą bezpostaciową albo krystaliczną saponiny z dzikiego kasztana.

Również inne saponiny, jak np. saponina Gypsophyla z korzenia mydlika (saponinum purum album), wykazują podobne działanie.

Wzmocnienie działania, zwłaszcza odporności kapilarnej, występuje optymalnie jednak tylko wtedy, jeżeli dodatek saponiny będzie wynosił 2 mg % — 8 mg %. Mniejszy lub większy dodatek saponiny ewentualnie równoważnej ilości ekstraktu zawierającego saponiny nie działa wcale lub działa hamująco.

Krzywe na wykresie podają w sposób porównawczy działanie odporności kapilarnej ekstraktu zawierającego flawony nadającego się do zastrzyków, do którego dodano ślad saponiny (krzywa 1), i działanie ekstraktu bez dodatku saponiny (krzywa 2). Podane na wykresie podciśnienia wywołujące wybroczyny stanowią różnice między stwierdzonymi wartościami testowymi (po zastosowaniu leku) i odpowiednimi wartościami normalnymi (bez podawania leku). Wartości testowe oznaczono na odwłosionej skórze brzucha normalnych białych szczurów samców po iniekcji 0,1 ml/100 g wagi szczura ekstraktu (1) przygotowanego według przykładu IV opisu w porównaniu z ekstraktem bez dodatku saponiny (2). Przygotowanie ekstraktów objaśniają następujące przykłady:

Przykład I. 3,5%-owy ekstrakt z nasion dzikiego kasztana wolny od saponin zadaje się 8 mg % rodzimej saponiny (rodzimej aescyny).

Przykład II. 3,5%-owy ekstrakt z nasion dzikiego kasztana wolny od saponin zadaje się 4 mg % krystalicznej saponiny lub soli sodowej aescyny.

Przykład III. 3,5%-owy ekstrakt z nasion dzikiego kasztana wolny od saponin zadaje się 17 mg % oczyszczonego ekstraktu saponinowego, odpowiadającymi mniej więcej 4 mg % rodzimej saponiny.

Przykład IV. Do 3,5%-owego ekstraktu z nasion dzikiego kasztana wolnego od saponin, zawierającego dodatek witaminy B₁, dodaje się saponinę w ilościach, wymienionych w przykładach I, II i III.

Przykład V. Znane sposoby usuwania saponiny ekstraktów dzikiego kasztana prowadzi się przy odpowiednim analitycznym badaniu kontrolnym, tak, że pozostaje ekstrakt, który zawiera jeszcze 8 mg % rodzimej saponiny, albo odpowiednią chemicznie ewentualnie biologicznie równoważną ilość aescyny lub soli sodowej aescyny.

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania ekstraktów do iniekcji zawierających flawony z nasion dzikiego kasztana według patentu Nr 43878, znamienny tym, że do ekstraktu wolnego od saponin dodaje się dozowaną, określoną przez górną i dolną wartość graniczną małą ilość rodzimej saponiny, np. 8 mg %, albo chemicznie lub biologicznie równoważną ilość skrystalizowanej saponiny (skrystalizowanej aescyny lub soli sodowej aescyny), albo ekstraktu z dzikiego kasztana zawierającego saponiny, albo saponinę usuwa się tylko tak dalece, że w ekstrakcie pozostaje wyżej podana mała ilość saponiny.
2. Sposób według zastrz. 1, znamienny tym, że stosuje się ekstrakt, który zawiera dodatek witaminy B₁.

VEB Arzneimittelwerk Dresden

Zastępca: mgr Józef Kamiński
rzecznik patentowy

