



# Самарский государственный технический университет

## Технология производства дженериковой формы противоэпилептического препарата (S)-ПРЕГАБАЛИН

В мире более 30 млн. зарегистрированных случаев заболеваемости эпилепсией. В среднем в странах Европы и США заболеваемость эпилепсией составляет около 50-ти случаев на 100 тыс. населения в год. В России 800 тыс. детей и подростков, больных эпилепсией.

За последние 15 лет количество больных эпилепсией удвоилось. В связи со старением населения прогнозируется рост заболеваемости эпилепсией.

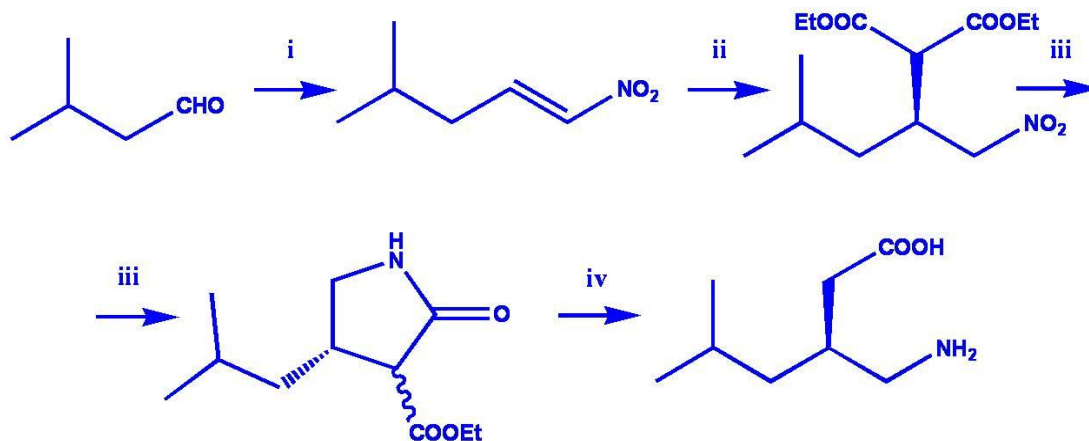
Исключительными правами на производство прегабалина обладает Pfizer (США). Однако срок действия патента на препарат Лирика™ истекает в 2018 г., в связи, с чем актуальной является разработка технологии, обеспечивающей создание конкурентных дженериковых форм первого поколения.



В Самарском государственном техническом университете создана инновационная технология производства (S)-прегабалина, демонстрирующая конкурентоспособность по сравнению с зарубежными аналогами в части:

- существенного снижения себестоимости производства субстанции;
- энантиомерной чистоты полученной фармацевтической субстанции;
- использования энантиоселективного металлокомплексного катализа, что позволяет избежать процедуры разделения рацемических смесей и связанных с этим как минимум 50%-ных потерь целевого продукта;
- использования промышленно доступного сырья и упрощения технологического процесса;
- экологической безопасности производства.

### Предлагаемая технология



**Общий выход: 44 %  
96.2 % ee**

(i)  $\text{CH}_3\text{NO}_2$ , NaOH; (ii)  $\text{CH}_2(\text{COOEt})_2$ , катализатор;  
(iii)  $\text{H}_2$ , Ni-Ra; (iv) 1) HCl,  $\text{H}_2\text{O}$ ; 2) NaOH

Заявка на патент РФ № 2012144244

Разработан лабораторно-технологический регламент  
и проект временной фармстатьи на препарат

