

*Иркутский институт химии им. А.Е. Фаворского СО РАН*

**Организация высокотехнологичного  
промышленного производства субстанции и лекарственных  
форм *импортируемого препарата МЕЛОКСИКАМ* –  
высокоэффективного нестероидного препарата  
нового поколения**

*А.С. Медведева*

**МЕЛОКСИКАМ** – 4-гидрокси-2-метил-*N*-(5-метил-2-тиазолил)-2*H*-1,2-бензотиазин-3-карбоксамид-1,1-диоксид **высокоэффективное** противовоспалительное, жаропонижающее, болеутоляющее средство нового поколения

Препарат **Мелоксикам** предназначен для лечения **социально значимых заболеваний опорно-двигательного аппарата**, трудно поддающихся лечению другими НПВС:

- ревматоидного артрита
- остеоартритов
- анкилозирующего спондилита
- болезни Бехтерева
- подагры

**при лечении болезненных состояний**

после операций

травм

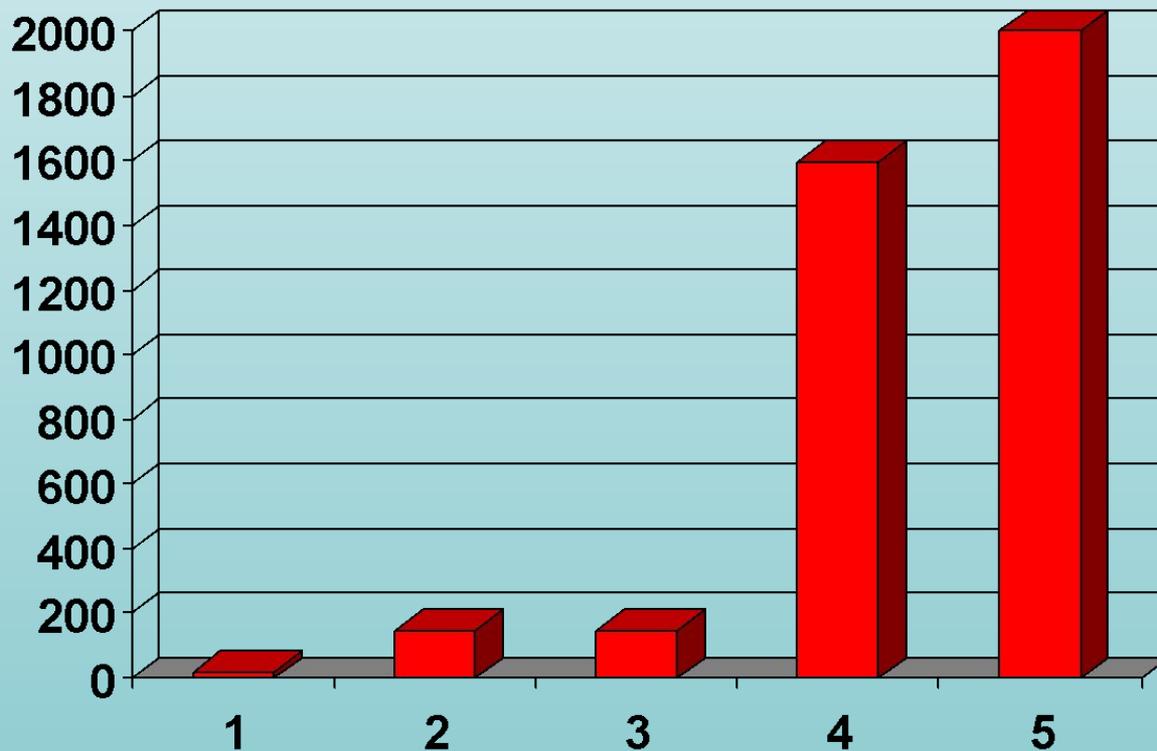
зубоврачебного вмешательства

в гинекологии

при заболеваниях верхних дыхательных путей

**В настоящее время расширяется использование пироксикама для замены опиоидных анальгетиков в послеоперационный период, а также в химиотерапии рака. Важно отметить перспективы использования мелоксикама в лечении трудно излечимых заболеваний, например, болезни Альцгеймера.**

## Сравнительная клиническая доза (суточная), мг НПВС

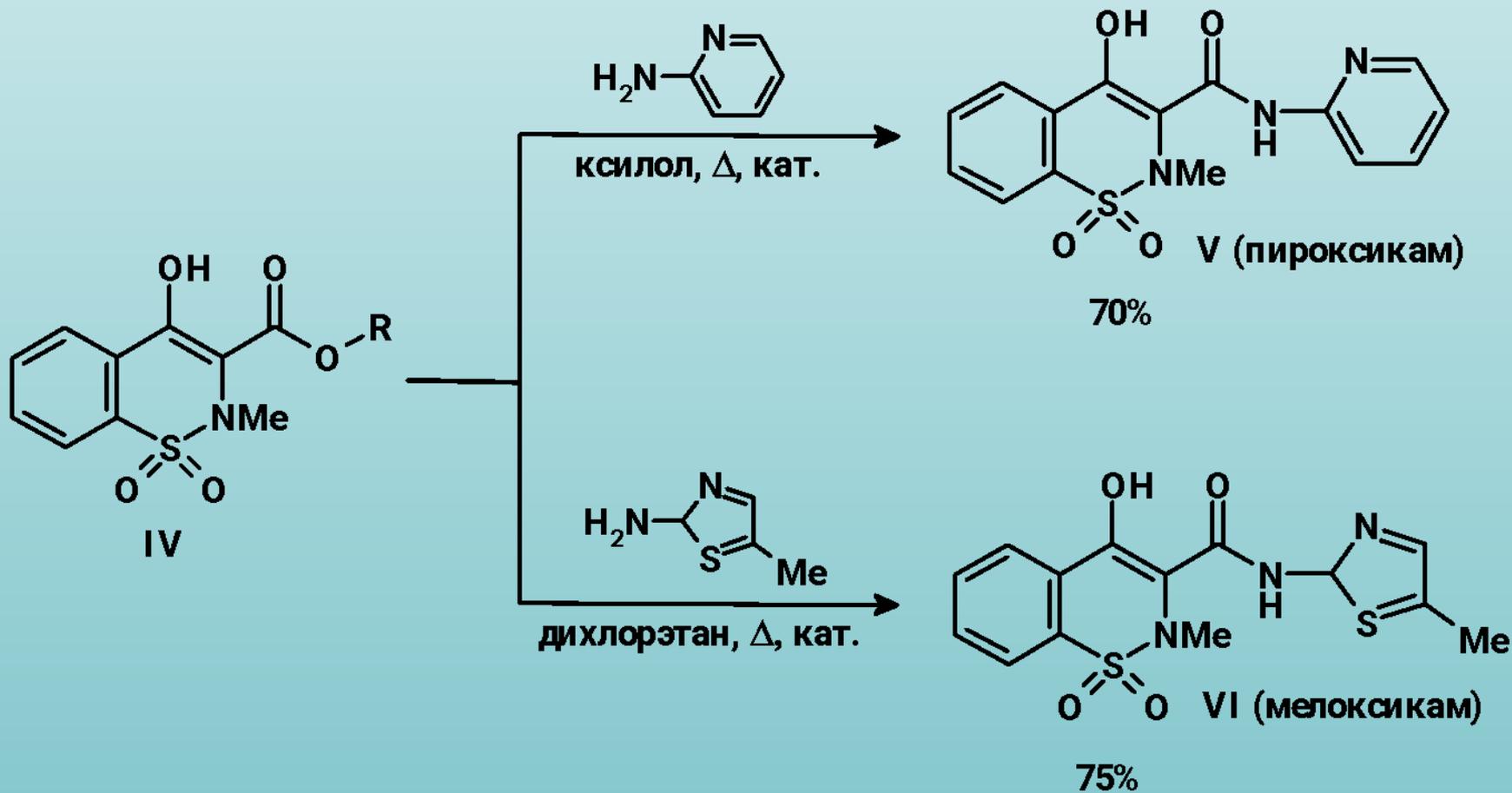


- 1 Мелоксикам (7.5 мг); Пироксикам (20 мг)
- 2 Вольтарен (Диклофенак) (150 мг)
- 3 Индометацин (150 мг)
- 4 Ибупрофен (1600 мг)
- 5 Ацетилсалициловая к-та (2000 мг)

# Актуальность создания отечественного Мелоксикама

- Мелоксикам - селективный ингибитор циклооксигеназы-2, отличается **достаточно высоким уровнем безопасности**, показан для длительного лечения больных старше 65 лет, имеющих наряду с заболеванием суставов патологии со стороны сердечно-сосудистой системы, печени, почек
- В отличие от мелоксикама **прием широко используемого Диклофенака приводит к существенному повышению риска развития кардиоваскулярных осложнений**. Установлен **достаточно высокий риск гепатотоксических реакций при использовании диклофенака** в сравнении с мелоксикамом и другими НПВП
- В РФ субстанция мелоксикама не производится. В России кроме ацетилсалициловой кислоты и анальгина на данный момент не выпускаются субстанции препаратов из группы НПВС
- За границей выпуск мелоксикама увеличивается, ежегодно растет объем его продаж. Объем закупок импортного мелоксикама значительно ниже его потребности. Острый дефицит в НПВС может быть возмещен производством отечественного мелоксикама
- Лекарственные формы производятся из субстанций КНР и Индии, имеющих низкое качество (по данным Департамента контроля качества лекарственных средств МЗ РФ)

# Синтез пироксикама и мелоксикама



# Разработка оригинальной ресурсосберегающей технологии получения отечественного препарата Мелоксикам (ИрИХ СО РАН)

---

## Преимущества перед зарубежными технологиями:

- сокращение процесса до двух стадий (вместо четырех или пяти стадий);
- удвоение общего выхода мелоксикама;
- значительное сокращение расхода реагентов;
- снижение расхода электроэнергии;
- существенное ускорение процесса;
- упрощение технологической схемы;
- улучшение экологических показателей;
- оптимизация экономических характеристик процесса в целом;
- снижение себестоимости мелоксикама.

(Патент РФ, А. с.)

# Состояние разработки

---

- **Выпуск опытной партии полупродукта субстанции мелоксикама (Усолье-Сибирский Химфармкомбинат)**
- **Выполнены доклинические исследования полученной субстанции и ГЛФ (сравнительное изучение острой и субхронической токсичности, специфической активности, гастротоксичности с мовалисом (Boehringer Ingelheim, Германия) (ОАО Медисорб, Пермь; Пермская государственная фармацевтическая академия (ПГФА)**
- **Разработаны технологии получения ГЛФ (таблетки) и Фармстатьи на субстанцию и ГЛФ**

## План проекта

---

- Разработка опытно-промышленного регламента (ОАО УсХФЗ)
- Изготовление опытной партии субстанции мелоксикама (ОАО УсХФЗ)
- Доклинические исследования *опытного образца* (сравнительное изучение острой и субхронической токсичности; специфической активности; гастротоксичности полученной субстанции с мовалисом (Boehringer Ingelheim, Германия). (ОАО Медисорб, Пермь; Пермская государственная фармацевтическая академия (ПГФА))
- Получение ГЛФ (таблетки) по разработанной ранее технологии

## Основные статьи планируемых затрат

- Разработка бизнес-плана
- Разработка ОПР
- Закупка реагентов
- Изготовление опытной партии субстанции мелоксикама
- Доклинические исследования *опытного образца*
- Получение ГЛФ (таблетки)

## Реализация проекта позволит

---

- Осуществить высокотехнологичное промышленное производство субстанции и лекарственных форм *импортируемого препарата МЕЛОКСИКАМ* - высокоэффективного нестероидного препарата нового поколения, полный цикл производства которых будет организован на территории России
- Существенно снизить зависимость от импорта социально значимых эффективных, безопасных противовоспалительных, болеутоляющих и жаропонижающих лекарственных средств, с **достаточно высоким уровнем безопасности**, более дешевых и качественных по сравнению с приобретаемыми по импорту
- Организация промышленного производства субстанции препарата Мелоксикам и его лекарственных форм согласована с администрацией ОАО Усолье-Сибирского Хим-фармзавода (ОАО УсХФЗ)

A scenic landscape featuring a wide river with several large, smooth, light-colored boulders protruding from the water. The river is surrounded by a dense forest of green trees. In the background, there are rolling mountains under a blue sky with scattered white clouds. The overall scene is peaceful and natural.

*Спасибо за внимание!*