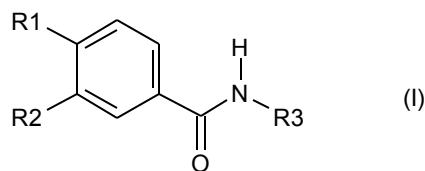


1. Дозована лікарська форма у вигляді таблетки або пелети, призначена для перорального введення в організм інгібітора PDE 4, що містить інгібітор PDE 4 разом з полівінілпіролідом (ПВП) як сполучним й одну або декілька інших прийнятних фармацевтичних допоміжних речовин, у якій інгібітор PDE 4 являє собою сполуку, вибрану з групи сполук формули (I)



у якій R1 означає дифторометоксигрупу,

R2 означає циклопропілметоксигрупу і

R3 означає 3,5-дихлоропірид-4-ил,

солі цієї сполуки та N-оксид піридину та його солі,

де згадана дозована лікарська форма з негайним вивільненням інгібітора PDE 4.

2. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій інгібітор PDE 4 являє собою N-(3,5-дихлоропірид-4-ил)-3-циклопропілметокси-4-дифторометоксибензамід (рофлуміласт).

3. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій інгібітор PDE 4 являє собою N-оксид піридину сполуки формули (I).

4. Дозована лікарська форма за п. 2, що містить рофлуміласт у разовій дозі від 0,01 мг до 5 мг, від 0,05 мг до 2,5 мг рофлуміласту або від 0,1 мг до 0,5 мг рофлуміласту.

5. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій вміст у масових відсотках в перерахунку на масу остаточної дозованої лікарської форми ПВП становить від 1 до 5 %.

6. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій вміст у масових відсотках в перерахунку на масу остаточної дозованої лікарської форми ПВП становить від 2 до 3 %.

7. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій ПВП вибирають з групи, що містить колідон 25 з молекулярною масою 28000-34000, колідон 30 з молекулярною масою 44000-54000 та колідон 90 F з молекулярною масою 1000000-1500000.

8. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій фармацевтичні допоміжні речовини являють собою допоміжні речовини з групи наповнювачів, додаткових сполучних, розпушувачів для таблеток, змащувальних речовин або антиадгезивів, коригентів, буферних речовин, консервантів, барвників та емульгаторів.

9. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій вміст у масових відсотках в перерахунку на

масу остаточної дозованої лікарської форми сполучного (ПВП та, при необхідності, інші сполучні) становить від 0,5 до 20 %.

10. Дозована лікарська форма за п. 8, яка являє собою таблетку, та де вміст у масових відсотках в перерахунку на масу остаточної дозованої лікарської форми наповнювача становить від 40 до 99 %.

11. Дозована лікарська форма за п. 8, у якій наповнювач вибирають з групи: карбонат кальцію, карбонат натрію, цукроспирти, такі як маніт, сорбіт, ксиліт або мальтит, крохмалі, такі як кукурудзяний крохмаль, картопляний крохмаль та крохмаль пшениці, мікрокристалічна целюлоза, сахариди, такі як глюкоза, лактоза, моногідрат лактози, левулоза, сахароза, декстроза та їх суміші.

12. Дозована лікарська форма за п. 11, у якій наповнювач вибирають з групи: кукурудзяний крохмаль, мікрокристалічна целюлоза, лактоза та їх суміші.

13. Дозована лікарська форма за п. 8, у якій змащувальні речовини або антиадгезиви вибирають з групи: стеарилфумарат натрію, стеарат магнію, стеарат кальцію, стеаринова кислота, тальк та колоїдний безводний діоксид кремнію.

14. Дозована лікарська форма за п. 1, яка являє собою таблетку.

15. Дозована лікарська форма за п. 14, у якій фармацевтичні допоміжні речовини являють собою щонайменше один наповнювач та щонайменше одну змащувальну речовину або антиадгезив.

16. Дозована лікарська форма за п. 14, яка містить:

рофлуміласт	0,125 мг
моногідрат лактози	49,660 мг
кукурудзяний крохмаль	13,390 мг
полівідон K90	1,300 мг
стеарат магнію (рослинний)	0,650 мг.

17. Дозована лікарська форма за п. 14, яка містить:

рофлуміласт	0,250 мг
моногідрат лактози	49,660 мг
кукурудзяний крохмаль	13,390 мг
полівідон K90	1,300 мг
стеарат магнію (рослинний)	0,650 мг.

18. Дозована лікарська форма за п. 14, яка містить:

рофлуміласт	0,500 мг
моногідрат лактози	49,660 мг
кукурудзяний крохмаль	13,390 мг
полівідон K90	1,300 мг
стеарат магнію (рослинний)	0,650 мг.

19. Дозована лікарська форма за п. 1, яка містить твердий розчин інгібітора PDE 4 в сполучному ПВП як носії.

20. Дозована лікарська форма за п. 1, у якій твердий розчин являє собою твердий розчин з аморфною структурою, у якій інгібітор PDE 4 присутній у вигляді молекулярної дисперсії в матеріалі носія.

21. Спосіб одержання дозованої лікарської форми за п. 1, який полягає в тому, що (а) одержують суміш інгібітора PDE 4 формули (I) за п. 1 та фармацевтичних і допоміжних речовин і (б) отриману на стадії (а) суміш гранулюють з водним розчином ПВП.

22. Спосіб за п. 21, який додатково включає висушування гранул та, необов'язково, домішування інших фармацевтичних допоміжних речовин, змішування з антиадгезивом та пресування в таблетувальному пресі.

23. Спосіб за п. 21, який додатково включає переробку вологих продуктів, отриманих після гранулювання, в пелети.

24. Спосіб за п. 21, в якому процес гранулювання здійснюють в грануляторі з псевдорозрідженим шаром у відповідних умовах.

25. Спосіб за п. 21, який полягає в тому, що (а) інгібітор PDE 4 домішують до інших фармацевтичних допоміжних речовин у вигляді тритурації з фармацевтичними допоміжними речовинами.

26. Спосіб за п. 25, в якому тритурацію одержують подрібненням інгібітора PDE 4 разом з фармацевтичними допоміжними речовинами.

27. Спосіб за пп. 25 або 26, в якому фармацевтична допоміжна речовина являє собою наповнювач.

28. Спосіб за п. 21, який включає гранулювання суміші (а) інгібітора PDE 4 формули (I) за п. 1 або тритурації інгібітора PDE 4 формули (I) за п. 1 з кукурудзяним крохмалем, (б) кукурудзяного крохмалю та (с) моногідрату лактози з водним розчином ПВП, висушування гранул, змішування гранул з антиадгезивом та

пресування в таблетувальному пресі.

29. Спосіб за п. 21, який включає гранулювання суміші (а) інгібітора PDE 4 формули (I) за п. 1 або тритурації інгібітора PDE 4 формули (I) за п. 1 з кукурудзяним крохмалем, (б) кукурудзяного крохмалю, (с) мікрокристалічної целюлози та (д) натрійкарбоксиметилкрохмалю з водним розчином ПВП, висушування гранул, змішування гранул з антиадгезивом та пресування в таблетувальному пресі.

30. Спосіб одержання дозованої лікарської форми за п. 1, який полягає в тому, що (а) одержують суміш фармацевтичних допоміжних речовин і (б) отриману на стадії (а) суміш гранулюють із суспензією інгібітора PDE 4 формули (I) за п. 1 у водному розчині ПВП.

31. Спосіб за п. 30, який включає гранулювання суміші кукурудзяного крохмалю та моногідрату лактози з суспензією інгібітора PDE 4 формули (I) за п. 1 у водному розчині ПВП, висушування гранул, змішування гранул з антиадгезивом та пресування в таблетувальному пресі.

32. Спосіб одержання дозованої лікарської форми за п. 1, який полягає в тому, що одержують твердий розчин ПВП і інгібітора PDE 4.

33. Спосіб за п. 32, в якому твердий розчин являє собою твердий розчин з аморфною структурою, у якій інгібітор PDE 4 формули (I) за п. 1 присутній у вигляді молекулярної дисперсії в ПВП.

34. Спосіб за п. 32, у якому твердий розчин виготовляють методом, що оснований на застосуванні розчинника, який полягає в розчиненні ПВП, інгібітора PDE 4 та, за необхідності, інших фармацевтичних допоміжних речовин у прийнятному розчиннику, з наступним видаленням розчинника шляхом розпилювального висушування, звичайного висушування, вакуумного висушування або висушування виморожуванням.

35. Спосіб за п. 32, у якому твердий розчин виготовляють методом змішування, де інгібітор PDE 4 та, за необхідності, інші фармацевтичні допоміжні речовини інтенсивно перемішують разом з ПВП.

36. Застосування сполуки формули (I) за п. 1 у виробництві дозованої лікарської форми за п. 1 для лікування або профілактики захворювання, яке розцінюється як таке, що можна вилікувати або попередити за допомогою інгібіторів PDE 4.

37. Застосування за п. 36, де захворювання вибирають з групи: астма або обструкції дихальних шляхів.

38. Застосування за п. 37, де захворювання являє собою ХОЗЛ (хронічне обструктивне захворювання легень).