

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Postupak za pripremu postojan farmaceutske formulacije koja sadrži od 70 do 95%, poželjno od 80 do 90%, mesalazina i/ili njegove soli, **naznačen time** da navedeni postupak uključuje:
 - (i) pripremu sloja praha koji sadrži mesalazin i/ili njegovu sol i po izboru također najmanje jedan farmakološki prihvatljiv ekscipijens;
 - (ii) dodavanje prašku prema koraku (i) vodene otopine koja sadrži od 10 do 20% vezivnog sredstva tako da se dobije granulat smjese karakteriziran sadržajem vlage u rasponu od 20 do 40%;
 - (iii) sušenje granulata dobivenog iz koraka (ii) do postizanja sadržaja vlage nižeg ili jednakog 3,0%, poželjno nižeg ili jednakog 2,5;
 - (iv) miješanje granulata osušenog prema koraku (iii) s najmanje jednim sredstvom za dezintegraciju;
 - (v) dodavanje vode u granulat dobiven u koraku (iv) dok se ne postigne sadržaj vlage u rasponu od 3,0 do 3,5%;
 - (vi) zbijanje granulata, poželjno nakon dodavanja najmanje jednog sredstva za podmazivanje.
2. Postupak prema zahtjevu 1, **naznačen time** što je navedeni ekscipijens prema koraku (i) sredstvo za razrjeđivanje i/ili sredstvo za dezintegraciju, gdje je navedeno sredstvo za razrjeđivanje odabrano između: celuloze, poliola, derivata škroba i njihovih smjesa, poželjnije između: manitola, škroba, kukuruznog škroba, mikrokristalne celuloze, maltodekstrina i njihovih smjesa; i/ili navedeno sredstvo za dezintegraciju je odabrano između: derivata škroba, celuloze i derivata polivinilpirolidona, poželjno natrij karboksimetil škroba, kroskarmeloze ili krosppovidona.
3. Postupak prema zahtjevu 1 ili 2, **naznačen time** da je navedeno vezivno sredstvo prema koraku (ii) odabrano između: polivinilpirolidona, povidona, poželjno PVP K30, i derivata celuloze, poželjno: hidroksipropil metilceluloze, hidroksipropil celuloze, karboksimetilceluloze ili mješavine toga
4. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1-3, **naznačen time**, da se sušenje prema koraku (iii) provodi u vakuumskoj ili ventiliranoj statičkoj pećnici, poželjno na temperaturi u rasponu od 45 do 70°C, ili u tekućini krevetu, poželjno s ulaznim zrakom u rasponu od 65 do 85°C, poželjno od 70 do 80°C.
5. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-4, **naznačen time** što je navedeno sredstvo za podmazivanje odabrano između: bezvodnog koloidnog silicija, talka, magnezijevog stearata, gliceril behenata, natrijevog stearil fumarata i njihovih smjesa.
6. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-5, **naznačen time**, da uključuje korak kalibracije granulata, poželjno s metalnom mrežom veličine u rasponu od 0,85 do 1,5 mm.
7. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-6, **naznačen time** da sadrži postupak miješanja granulata, poželjno kalibriranog prema zahtjevu 6, s najmanje jednim mazivom i/ili sredstvom za klizanje.
8. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-7, **naznačen time**, da obuhvaća daljnji korak komprimiranja granulata kako bi se dobile tablete.
9. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1-8, **naznačen time**, da tablete sadrže najmanje jednu prevlaku za gastrozastojnost i/ili za kontrolirano otpuštanje lijeka.
10. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1-9, **naznačen time**, da mesalazin ima najmanje jednu od sljedećih karakteristika:
 - prividna gustoća u rasponu od 0,15 do 0,35 g/ml, poželjno od 0,20 do 0,30 g/ml, gdje prividna gustoća znači gustoću praška u izlivenom obliku; i/ili
 - gustoća pakiranja $\geq 0,4$ g/ml, pri čemu gustoća pakiranja označava gustoću praha koji je podvrgnut pakiranju određenim ispitivanjem; i/ili
 - Raspodjela veličine čestica (PSD) za 100 % čestica ≤ 90 mm, gdje PSD znači statističku raspodjelu veličine čestica praha/granulata; i/ili
 - D90, tj. veličina ispod koje se nalazi 90% populacije, koja se nalazi između 30 i 45 mm, po mogućnosti između 35 i 40 mm; i/ili
 - D50, tj. veličina ispod koje se nalazi 50% populacije, između 5 i 20 mm, po mogućnosti između 10 i 15 mm.
11. Granulat koji se može dobiti postupkom prema bilo kojem od zahtjeva 1-7 i 10, **naznačen time** što je količina mesalazina i/ili njegove soli i/ili derivata u rasponu od 70 do 95%, poželjno 80 do 90%, i/ili prosječnu gustoću u rasponu od 0,60 do 0,85 g/ml, poželjno prividnu gustoću u rasponu od 0,60 do 0,75 i/ili gustoću pakiranja u rasponu od 0,70 do 0,85 g/ml i/ili prosječnu veličinu manju od 1,5 mm za 100 %.
12. Tableta koja se može dobiti postupkom prema bilo kojem od zahtjeva 9 i 11, **naznačen time** što je količina mesalazina i/ili njegove soli i/ili derivata u rasponu od 70 do 95%, poželjno od 80 do 90%, posebno od 1000 a 1600 mg, i prema najmanje jednom od sljedećih fizičkih parametara: lomljivost poželjno u rasponu od 0,000% do 1,000%, poželjnije u rasponu od 0,000% do 0,250%; i/ili tvrdoće poželjno veće od 6 Kp, poželjnije od 10 Kp do 30 Kp; i/ili dezintegraciju poželjno za manje od 15 minuta.
13. Granulat prema zahtjevu 11, i/ili tablete prema zahtjevu 12, **naznačen time**, da se koristi lijek.
14. Granulat i/ili tableta prema zahtjevu 13, **naznačen time** da se koristi u liječenju bolesti temeljenih na upalama, poželjno kroničnog tipa, poželjno kroničnih upalnih bolesti probavnog trakta, najpoželjnije odabranih između: ulceroznog kolitisa i Crohnove bolesti.