



En
S. m. e. ap.

Industria y Comercio

S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

1. EXPEDIENTE No. **06-128575**

1. TÍTULO ELEMENTOS MOLDEADOS SOLIDOS CON CONTENIDO EN
PRINCIPIO ACTIVO PARA USO EXTERNO CONTRA PARASITOS
EN ANIMALES

2. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL A01N025/034. // A01N47/22
A01N53/00 // A61N51/00.

1. SOLICITANTE BAYER HEALTHCARE AG

DOMICILIO LEVERKUSEN 51368, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

4. APODERADO EMILIO FERRERO

C.C. 438.029 de Usaquén

2. BOGOTÁ, D. C., 22/12/2006.

SS

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 06-128575-00000-0000

Fec: 2006-12-22 11:30:09 Dep: 2020 NUEVE AÑOS

Lib: 11 PATENTE

Evo: 3/8 FASE NACIONAL

Act 411 PRESENTACIÓN

Folios: 55

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL****SOLICITUD DE:**

1

☒ Patente de Invención.☐ Patente de Modelo de Utilidad☒ Capítulo I.☐ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**Nombre **BAYER HEALTHCARE AG**
sociedad constituida y existente bajo las leyes
de República Federal de AlemaniaDirección 51368 Leverkusen,
República Federal de AlemaniaDomicilio 51368 Leverkusen,
República Federal de Alemania**IDENTIFICACIÓN**

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**Nombre **EMILIO FERRERO**
Dirección Carrera 4ª No 72-35
Teléfono 347 36 11
Fax 211 86 50
E-mail clientes@camyp.com
Domicilio Bogotá, Colombia.**IDENTIFICACIÓN**

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 438 019 T.P. 31.929

4

**INVENTOR (ES)
(72)**1. **Kirkor SIRINYAN**
Humperdinckstrasse 12,
51467 Bergisch Gladbach,
República Federal de Alemania2. **Reinhold LÖHR**
Steinenkamp 7,
51469 Bergisch Gladbach,
República Federal de Alemania

5

PCT (86)Solicitud Internacional No. PCT/EP2005/006465Fecha: 16 de junio de 2005Publicación Internacional No WO 2006/000335 A1Fecha: 5 de enero de 2006

6

TÍTULO (54)**ELEMENTOS MOLDEADOS SÓLIDOS CON CONTENIDO EN PRINCIPIO ACTIVO
PARA USO EXTERNO CONTRA PARÁSITOS EN ANIMALES**

7

Clasificación Internacional (51) A01N 025/034 // A01N47/12 // A01N53/00
A01N51/00

8

PrioridadSI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

DE

(32) Fecha

29 de junio de 2004

(31) Número de Solicitud

102004031325 3

9

Comprobante de pago No.: 06-89,332**Fecha:** 21 de noviembre de 2006

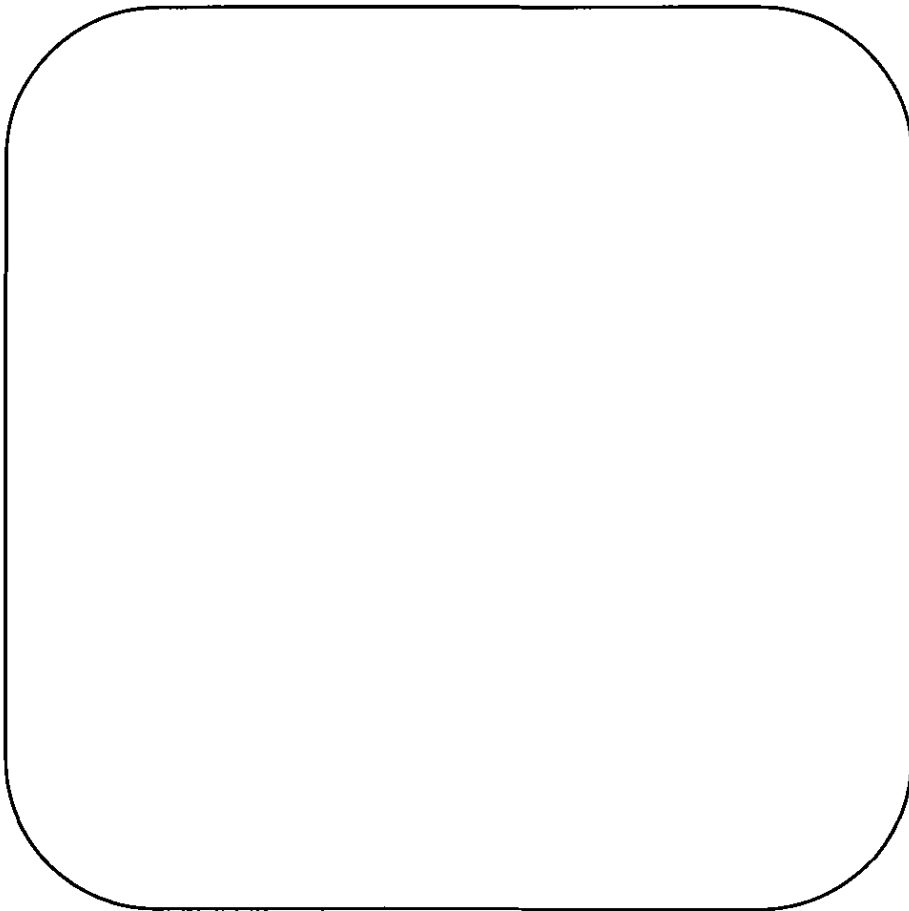
2

10

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463 000 oo
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes, si fuere el caso
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☐ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA

12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :

C C 438 019 de Usaquén T P 31.929

NNJ

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2006/000335 A1

Descripción:

Páginas 18 en el idioma original

Páginas 25 en español

Reivindicaciones: Número (s) 6

Figuras: Número (s)

2. ☒ Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA
FASE INTERNACIONAL**

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4a N° 72-35

BOGOTÁ 8 - COLOMBIA

179

Representación y Poder con autenticación notarial y Apostille para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseññas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias.

Representation and Power-of- Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER OF ATTORNEY

Yo (nosotros), abajo firmado (s)/I (we), the undersigned

Bayer HealthCare AG

domiciliado (s) en/of

51368 Leverkusen, Germany , hereby ratify the patent

application No, 05,029,757 filed by EMILIO FERRERO on April 5, 2005 and

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa 31929, GONZALO PERDOMO, tpa 831, LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa 832, domiciliados en la Carrera 4a N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararan su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero, y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en

in due compliance with the terms of paragraph 1st of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa 31929, GONZALO PERDOMO, tpa 831, LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa 832, domiciled at Carrera 4a N° 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Functionary in Colombia, or before a Notary or another Public Functionary in a Colombian Consulate abroad, and in case of impediment, of the appropriate Certificate. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact of its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys at law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all

© CAVELIER ABOGADOS

WPP0DE01-179 (MINUTA 12 | 1 | 2.5)

le A 36242-CO

lo concerniente a los siguientes asuntos a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad y diseños industriales, el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, marcas comerciales, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de origen, su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria, y el registro de licencias de uso de esos derechos, b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos, acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos

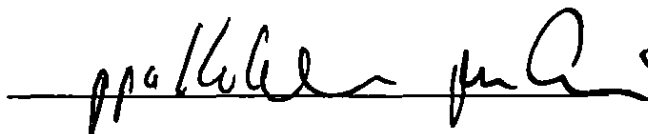
matters concerning the following a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs, the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, domain names, vegetal varieties and denominations of origin, its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation, and the registration of licenses of use of the above rights, b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights, actions and suits instituted by me (us) or against me (us) And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney

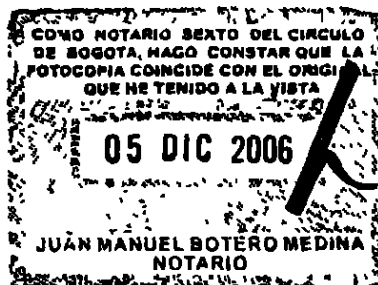
Dado y firmado hoy/Given and signed this _____

en/in _____

por/by _____

Firma/Signature





NOTARIAL CERTIFICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies:

That the preceding signature of

(name of legal representative)

Dr. Ferdinand Köhler business address: D - 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany

Dr. Wolfgang Ehrenstein business address: D - 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany

is authentic, that the signatory currently acts in the position of

(position)

of the company

Bayer HealthCare AG

a company currently existing and organized under the laws of

Germany

that the address is

**51368 Leverkusen,
Germany**

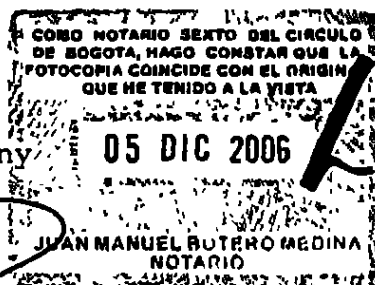
and that the signatory has the power to grant this document.

The Notary Public is aware and attests to the above facts upon examination of the Commercial Register of the legal court in Cologne, Section B 49894.

The Notary Public verifies that the company **Bayer HealthCare AG**, involved in this Certificate is active and exists as legal entity.

Given and signed in (City) , (Country)
Leverkusen, Germany

On (Date) 6. July 2005



7

URNr. 1085/2005

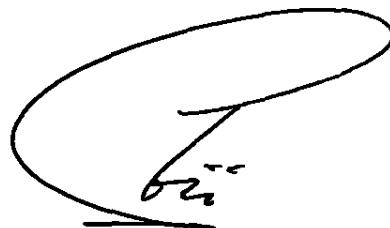
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften der Herren :

1. Dr. Wolfgang Ehrenstein, geschäftsansässig
in D - 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. Dr. Ferdinand Köhler, geschäftsansässig in
D - 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany

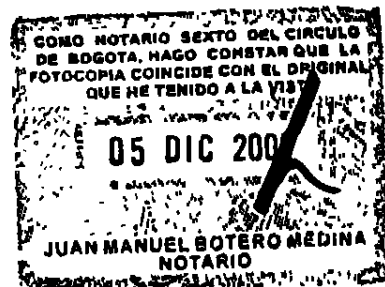
- bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht vom heutigen Tage in das Handelsregister des Amtsgerichts Köln - HRB 49894 -, dass die zu 1. und 2. genannten Herren berechtigt sind, die Bayer HealthCare Aktiengesellschaft in Leverkusen als Prokuristen einzeln zu vertreten.

Leverkusen, den 6. Juli 2005.



Notar





APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1 Land Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2 ist unterschrieben von Klaus Striewski

3 in seiner Eigenschaft als Notar

4 Sie ist versehen mit dem Siegel ^{u. Mängel} des
Notars Klaus Striewski in Leverkusen

Bestätigt

5. in Köln

6 am 12 07 2005

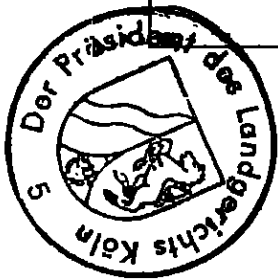
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln

8. unter Nr 2507/05

9. Stempel

10 Unterschrift

Calebe
Calebe



Kostenberechnung

§§ 121, 151 Kost.O.

Wort: EUR 0,00,-

Geb. § 121, 4b (1) EUR

Geb. § 151 EUR

Umsatzsteuer

§ 151a, 16

% EUR

Zus. EUR

gez.: Striewski, Notar

8

TRADUCCIÓN OFICIAL 171/2005 DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL APROBADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE LA REPÚBLICA DE COLOMBIA Y MEDIANTE EL CUAL BAYER HEALTHCARE AG EMPRESA DOMICILIADA EN 51368 LEVERKUSEN, ALEMANIA, POR LA PRESENTE RATIFICA LA SOLICITUD DE PATENTE NÚMERO 05,029,757 PRESENTADA POR EMILIO FERRERO EL 5 DE ABRIL DE 2005 y OTORGA PODER A EMILIO FERRERO, TPA 31929, GONZALO PERDOMO, TPA 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ TPA 23555 Y A GERMÁN CAVELIER, TPA 832. EXPEDIDO Y FIRMADO (DATO EN BLANCO). FIRMA ILEGIBLE. CERTIFICACIÓN NOTARIAL (EMPRESA)

El notario abajo firmante certifica que la firma precedente de FERDINAND KÖHLER, DIRECCIÓN COMERCIAL : D-51368 LEVERKUSEN, BAYERWERK, ALEMANIA Y DE WOLFGANG EHRENSTEIN, DIRECCIÓN COMERCIAL: D-51368 LEVERKUSEN, BAYERWERK, ALEMANIA son auténticas, y que el signatario actúa en el cargo de (dato en blanco) de la compañía BAYER HEALTHCARE AG, una empresa actualmente existente y constituida de acuerdo con las leyes de ALEMANIA y que su dirección es 51368 LEVERKUSEN, ALEMANIA. Además que el signatario tiene la facultad para otorgar este documento.

El notario público está enterado y certifica los datos anteriores Después de examinar el registro comercial del Juzgado de Colonia, Sección B 49894.

El notario público certifica que la compañía BAYER HEALTHCARE AG, a que se refiere este certificado es empresa activa y es una persona jurídica actualmente existente.

Expedido y firmado en Leverkusen, Alemania, el 6 de julio de 2005. Nota de apostilla número 2507/05 del 12 de julio de 2005.

Firmado (ilegible)

COLO-14033-841-014-9

WPCL002G ID 6941

Bogotá, 22 de julio de 2005.

Eduardo Calado N.
Eduardo Calado Noguera
TRADUCTOR OFICIAL
COLOMBIA - ESPAÑA
Res. 541. Febrero de 1976

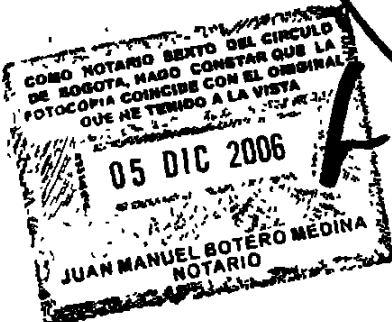
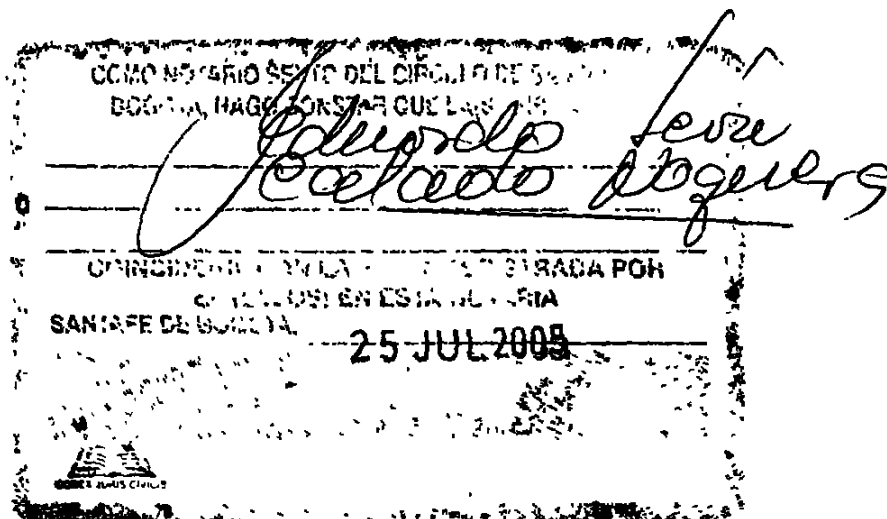
NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 JUL 25 P 12:13

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

137176
Eduardo Cebalado
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DE SEMPENA
LAS FUNCIONES DELEGADAS



1

TRADUCCION OFICIAL No. 10859

de un documento escrito en Alemán, efectuada por Luz Arriaga de Herber, resolución del Ministerio de Justicia 599 del 6 de marzo 1978.-

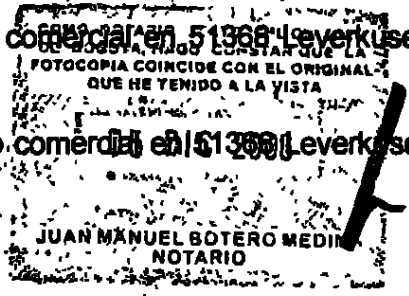
A continuación de un documento de Traspaso, Representación y Poder, escrito en español e inglés, por medio del cual Bayer HealthCare AG, domiciliada en 51368 Leverkusen, Alemania, ratifica la solicitud de patente No. 05.029.757 presentada por EMILIO FERRERO el 5 de abril 2005, y nombra a EMILIO FERRERO tpa 31929, GONZALO PERDOMO tpa 831, LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa 832, domiciliados en la Carrera 4. No. 72-35, Bogotá. Hay dos firmas ilegibles.

Sigue certificación en español e inglés de la existencia de la compañía y de las firmas de los señores Köhler y Ehrenstein, representantes legales de Bayer HealthCare AG, domiciliada en Leverkusen, Alemania. Dada y firmada en Leverkusen, Alemania, el 06.julio 2005 por el notario de Leverkusen, Klaus Striewski . Hilo y oblea notarial.

Protocolo notarial No. 1085/2005

Certifico la autenticidad de las firmas antecedentes puestas ante mí por los señores

1. Wolfgang Ehrensten, con domicilio comercial en 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Alemania
 2. Dr Ferdinand Köhler, con domicilio comercial en 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Alemania
- a quienes conozco en persona-



Certifico por haber tenido a la vista el día de hoy el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Colonia - HRB 49894-, que los señores mencionados en los puntos 1 y 2 están facultados, en calidad de apoderados, para representar a la firma Bayer HealthCare Aktiengesellschaft domiciliada en Leverkusen.

LUZ ARRIAGA DE HERBER
C. M. J. 1085/2005 OFICIAL

Fdo.: firma ilegible

Notario

Leverkusen, 6 de julio 2005

(hilo y oblea notarial)

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por el notario Klaus Striewski

3. Actuando en calidad de notario

4. Lleva el sello del notario Klaus Striewski, notario en Leverkusen

Certificado

5. en Colonia

6 el 12.07 2005

7 por el Presidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 2507/05

9. Sello

10 Firma

El Presidente del Tribunal Regional de Colonia

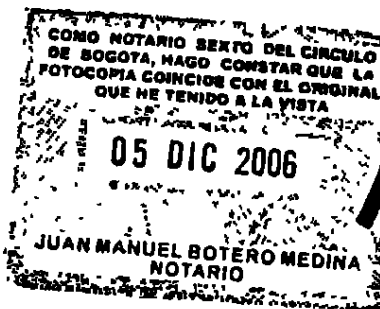
Fdo.: firma ilegible

Costas

(ilegible)

Total 38,28

Fdo: Striewski



Caliebe

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 22 de julio 2005

C 1983

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCCION FIEL Y COMPLETA
Luz Arriaga de Herber

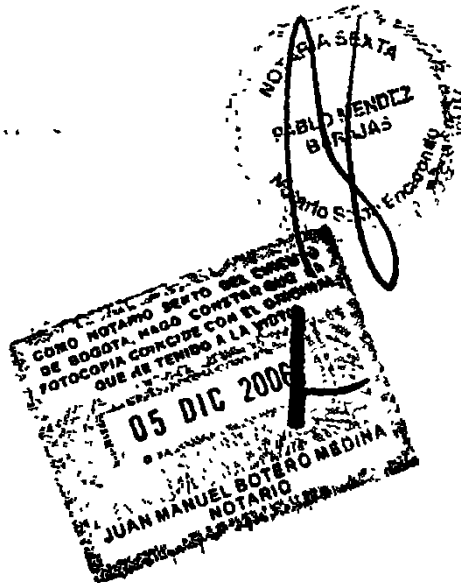
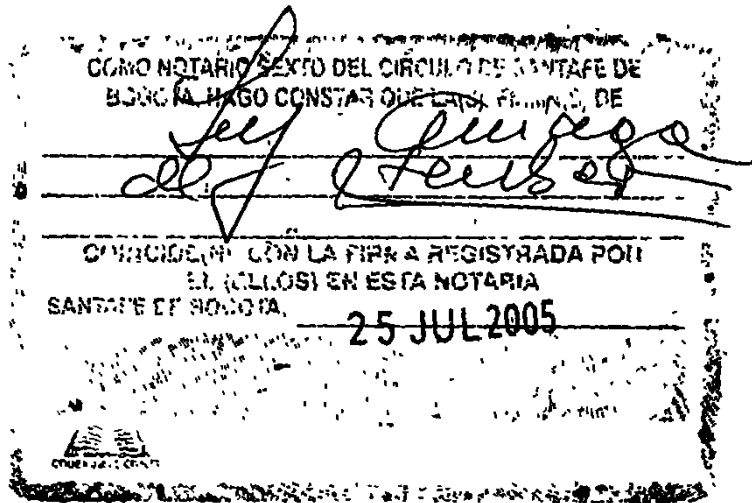
NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2005 JUL 25 P 12-13

1000
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

ADMINISTRACION DE RELACIONES
PÚBLICAS

1371175
Luz Amagosa
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DE EMPEÑO
LAS FUNCIONES INCULCADAS



(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



INTERNATIONAL PATENT COOPERATION TREATY (PCT) AND THE HAVANA PATENT COOPERATION TREATY (HAPCT)

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
5. Januar 2006 (05.01.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 2006/000335 A1 not. JS

(51) Internationale Patentklassifikation: A01N 25/34, 47/22, 53/00, 51/00 // (A01N 53/00, 51 00, 47 22, 25 34) (A01N 51/00, 25 34) (A01N 47/22, 25 34)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/006465

(22) Internationales Anmeldedatum:
16. Juni 2005 (16 06 2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 031 325 3 29 Juni 2004 (29 06 2004) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE], 51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SIRINYAN, Kirkor' [TR/DE], Humperdinckstr. 12, 51467 Bergisch Gladbach (DE). LÖHR, Reinhold [DE/DE], Steinenkamp 7, 51469 Bergisch Gladbach (DE)

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG, Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist, Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen

(54) Title: ACTIVE SUBSTANCE-CONTAINING SOLID SHAPED BODIES FOR EXTERNAL USE AGAINST PARASITES IN ANIMALS

(54) Bezeichnung: WIRKSTOFFHALTIGE FESTE FORMKÖRPER ZUR AUßERLICHEN ANWENDUNG GEGEN PARASITEN AN TIEREN

(57) Abstract: Solid shaped bodies for external use against parasites in animals, based on a polyolefin matrix and containing one or more esters of a di- or trivalent alcohol, with up to three carbon atoms with fatty acids with 6 to 18 carbon atoms, one or more active substances, and optionally further auxiliary substances and additives

(57) Zusammenfassung: Feste Fremdkörper zur ausserlichen Anwendung gegen Parasiten an Tieren auf Basis einer Polyolefin-Matrix, enthaltend einen oder mehrere Ester eines zwei- oder dreiwertigen Alkohols mit bis zu drei Kohlenstoffatomen mit Fettsäuren mit 6 bis 18 Kohlenstoffatomen, einen oder mehrere Wirkstoffe, sowie ggf. weitere Hilfs- und Zusatzstoffe.

BHC 041192

WO 2006/000335 A1

Wirkstoffhaltige feste Formkörper zur äußerlichen Anwendung gegen Parasiten an Tieren

Die vorliegende Erfindung betrifft wirkstoffhaltige Formkörper zur äußerlichen Anwendung gegen Parasiten an Tieren.

Wirkstoffhaltige Formkörper zur Bekämpfung von Parasiten bei Tieren sind seit langem bekannt.

- 5 Derartige Formkörper werden beispielsweise in WO 2002/78443, EP-A 539295, EP-A 763325, EP-A 1289363, EP-A 211207, EP-A 124404, EP-A 979605, FR 2729833, US 5620696, EP-A 576267, EP-A 569791, EP-A 542078, EP-A 470467, EP-A 251472, EP-A 50782, US 5858387 und EP-A 542080 beschrieben. Der Nachteil der bislang beschriebenen Verfahren sowie Abmischun-
- 10 konventionellen Polyolefin- oder Vinylharz-Matrices den zusätzlichen Einsatz von Phthalsäureestern, wie Dimethylphthalat und Dioctylphthalat (siehe beispielsweise WO 01/787065, EP-A-0 211 207 und EP-A-0 569 791) erfordern. Die hierzu eingesetzten, aus technologischer Sicht brauchbaren Phthalate sind bekannterweise toxikologisch nicht ganz unbedenklich. Sie können bei nicht sachgerechter Handhabung zu Risiken bei der Herstellung der Formkörper und bei deren
- 15 Anwendung führen, darüber hinaus besteht die Gefahr der Umweltkontamination.

- Es ist daher wünschenswert, die besagten Phthalate durch weniger toxische, umweltverträgliche Einsatzstoffe zu ersetzen. Vorzugsweise sollen diese neuen Einsatzstoffe die Migration der Wirkstoffe aus der Polymermatrix erhöhen und somit die Wirksamkeit (Residual- und Knock-down-Wirkung) der Formkörper verbessern, ohne die guten physikalisch-chemischen Eigenschaften der
- 20 Polyolefinmatrix negativ zu beeinflussen.

Überraschenderweise wurde nun gefunden, dass dieses Ziel mittels bestimmter Fettsäureester mehrwertiger Alkohole (z.B. Di- und Triglyceride oder Propylenglykol-Ester) erreicht werden kann.

- Aufgrund ihres physikalisch-chemischen Aufbaues sind solche Fettsäureester polare Verbindungen während die genannten Polyolefine und Vinylharze relativ unpolare Kunststoffe sind. Der Fachmann erwartet, dass polare Verbindungen und unpolare Kunststoffe unverträglich sind. Solche Kombinationen führen in vielen Fällen zu Entmischung/Phasentrennung, was wiederum zur erheblichen Verschlechterung der physikalisch-chemischen Eigenschaften der Polymermatrix, wie E-Modul, Duktilität, Zug-Dehnung, Entnehmbarkeit aus der jeweiligen Formmasse, sowie zu spon-
- 25 taner Wirkstoff-Migration aus der Kunststoffmatrix und somit zu erheblicher Verschlechterung der Langzeitwirksamkeit führt. Es war daher überraschend, dass der Einsatz der genannten, polaren Fettsäureester mehrwertiger Alkohole weder die physikalisch-chemischen Eigenschaften noch die
- 30

Langzeitwirksamkeit der Formkörper negativ beeinflusst. In vielen Fällen wurde sogar, entgegen der Lehrmeinung, eine Verbesserung in Verarbeitbarkeit und Langzeitwirkung beobachtet.

Die Erfindung betrifft:

Feste Formkörper zur äußerlichen Anwendung gegen Parasiten an Tieren auf Basis einer Polyolefin-Matrix, enthaltend

- einen oder mehrere Ester eines zwei- oder dreiwertigen Alkohols mit bis zu drei Kohlenstoffatomen mit Fettsäuren mit 6 bis 18 Kohlenstoffatomen
 - einen oder mehrere Wirkstoffe
 - sowie ggf. weitere Hilfs- und Zusatzstoffe.
- 10 Die erfindungsgemäß eingesetzten Ester enthalten als Alkoholkomponente einen zwei- oder dreiwertigen Alkohol mit bis zu drei Kohlenstoffatomen, wie z.B. Ethylenglykol, Propylenglykol oder Glycerin. In der Regel sind mindestens zwei, vorzugsweise alle Hydroxylgruppen des Alkohols verestert. Säurekomponente der Ester sind Fettsäuren mit 6 bis 18 Kohlenstoffatomen, die geradkettig, verzweigt sowie ein- oder mehrfach ungesättigt sein können. Es können gemischte Ester
- 15 oder auch Mischungen verschiedener Estertypen eingesetzt werden. Als Glyceride kommen Di- und Triglyceride, bevorzugt Triglyceride in Frage, wie zum Beispiel Capryl-Caprinsäure-Triglyceride oder Capryl-Caprin-Linolsäure-Triglyceride. In gleicher Weise bevorzugt sind Ester des Propylenglykols mit Capryl- und/oder Caprinsäure (Propylenglykoloctanoatdecanoat). Besonders bevorzugt weisen diese Glycerin- bzw. Propylenglykolester der Capryl-/Caprinsäure einen Viskositätsbereich (20°C) von 5 bis 40, bevorzugt 8 bis 35, besonders bevorzugt 9 bis 13 mPa.s auf.
- 20 Diese Ester sind unter der Handelsbezeichnung Miglyol 840 (Propylenglykoloctanoatdecanoat, CAS-Nr. 68583-51-7) und Miglyol 812 (Capryl-Caprinsäure-Triglyceride, CAS-Nr. 73398-61-5) der Fa. Sasol Germany GmbH/Witten erhältlich. Ebenfalls eingesetzt werden können deren Polyethylenoxid-, Polypropylenoxid- und/oder Propylencarbonat-modifizierte Derivate mit dem ge-
- 25 nannten Viskositätsbereich.

Die erfindungsgemäßen Formkörper enthalten die Fettsäureester in Anteilen von 1 bis 25 Gew.-%, bevorzugt 5 bis 17,5 Gew.-%, besonders bevorzugt 5 bis 12,5 Gew.-% (bezogen auf die jeweilige Gesamtabmischungsmasse).

Bei den erfindungsgemäßen festen Formkörpern handelt es sich z.B. um Halsbänder, Anhänger für Halsbänder (Medaillons), Ohrmarken, Bänder zur Befestigung an Gliedmaßen oder Körperteilen,

- 3 -

Klebestreifen und -folien oder Abziehfolien. Besonders bevorzugt sind Medallions und insbesondere Halsbänder.

Als Trägersubstanz oder Basis für die Formkörper kommen thermoplastische und flexible thermoplastische Polyolefine und Elastomere in Frage. Als solche seien genannt Polyvinylharze, EPDM
5 (Ethylen-/Propylen-Dien-Terpolymer), Polyethylen (z.B. HDPE oder LLDPE), Polypropylen, die mit den oben genannten Wirkstoffen ausreichend verträglich sind.

Die Polymeren müssen eine ausreichende Festigkeit und Biegsamkeit haben, um beim Formen nicht zu reißen oder brüchig zu werden. Sie müssen von ausreichender Haltbarkeit sein, um gegen normale Abnutzung beständig zu sein. Außerdem müssen die Polymere eine ausreichende Migration des
10 Wirkstoffs an die Oberfläche des Formkörpers zulassen.

Zu den Polyvinylharzen gehören Polyvinylhalogenide, wie Polyvinylchlorid, Polyvinylchlorid-Vinylacetat und Polyvinylfluorid; Polyvinylbenzole, wie Polystyrol und Polyvinyltoluol.

Weitere als Matrix der erfindungsgemäßen Formkörper geeignete Kunststoffe sind thermoplastische Elastomere. Dies sind Werkstoffe, die elastomere Phasen in thermoplastisch verarbeitbaren Polymeren entweder physikalisch eingemischt oder chemisch eingebunden enthalten. Man unterscheidet
15 Polymerblends, in denen die elastomeren Phasen Bestandteil des polymeren Gerüsts sind. Durch den Aufbau der thermoplastischen Elastomere liegen harte und weiche Bereiche nebeneinander vor. Die harten Bereiche bilden dabei eine kristalline Netzstruktur oder eine kontinuierliche Phase deren Zwischenräume von elastomeren Segmenten ausgefüllt sind. Aufgrund dieses Aufbaus haben diese
20 Werkstoffe kautschukähnliche Eigenschaften. In diesem Zusammenhang sei auf Thermoplastische Polyolefine (TPO) und auf Styrol-Block Copolymere (s. beispielsweise EP 542078) hingewiesen.

Erfindungsgemäß bevorzugt sind Polyvinylchlorid, Polypropylen, Polyethylen und EPDM; ganz besonders bevorzugt ist Polyvinylchlorid.

Für die Herstellung der Formkörper auf der Basis von Polyolefinen, insbesondere von Polyvinylharzen können in besonderen Fällen zusätzlich übliche Weichmacher, die bekannterweise zum
25 Weichmachen von festen Vinylharzen verwendet werden, eingesetzt werden. Der zu verwendende Weichmacher hängt von dem Harz und seiner Verträglichkeit mit dem Weichmacher ab. Geeignete zusätzliche Weichmacher sind beispielsweise Phosphorsäureester, Adipinsäureester, wie z.B. Diiso- und n-Butyladipat. Es können auch andere Ester, wie die Ester von Azelainsäure, Maleinsäure,
30 Ricinolsäure, Myristinsäure, Palmitinsäure, Ölsäure, Sebacinsäure, Stearinsäure und Trimellithsäure, sowie komplexe lineare Polyester, polymere Weichmacher und epoxydierte Sojabohnenöle verwendet werden.

Zusätzliche Weichmacher werden ggf. in Mengen von etwa 5 bis 50 Gew.-%, vorzugsweise etwa 15 bis 45 Gew.-% der gesamten Zusammensetzung eingesetzt.

In den Formkörpern können noch weitere übliche Bestandteile, wie Stabilisierungsmittel, Schmiermittel, Formtrennmittel, Füllstoffe und Färbematerialien, enthalten sein; in der Regel werden dadurch
5 die grundlegenden Eigenschaften der Zusammensetzung nicht wesentlich verändert.

Geeignete Stabilisierungsmittel sind Antioxidationsmittel und Mittel, welche die Bänder vor ultravioletter Strahlung und unerwünschtem Abbau während der Bearbeitung, wie Strangpressen schützen. Einige Stabilisierungsmittel, wie epoxidierte Sojabohnenöle, dienen außerdem als sekundäre Weichmacher.

10 Als Schmiermittel können beispielsweise Stearate, Stearinsäure und Polyethylene mit niedrigem Molekulargewicht verwendet werden. Diese Bestandteile werden üblicherweise in einer Konzentration bis zu etwa 5 Gew.-% der gesamten Zusammensetzung verwendet.

Bei der Herstellung der Formkörper werden vorzugsweise die verschiedenen Bestandteile nach bekannten Verfahren gemischt und nach bekannten Strangpress- oder Spritzgussverfahren form-
15 gepresst.

Die Wahl des Verarbeitungsverfahrens zur Herstellung der Formkörper richtet sich technisch grundsätzlich nach den rheologischen Eigenschaften des polymeren Trägermaterials und der Form des gewünschten Formkörpers. Die Verarbeitungsverfahren können nach der Verarbeitungstechnologie oder nach der Art der Formgebung eingestellt werden. Bei der Verfahrenstechnologie
20 kann man die Verfahren nach den bei ihnen durchlaufenden rheologischen Zuständen unterteilen. Danach kommen für viskose polymere Trägermaterialien Gießen, Pressen, Spritzgießen und Auftragen und für elastoviskose Polymere Spritzgießen, Strangpressen (Extrudieren), Kalandrieren, Walzen und gegebenenfalls Kneten in Frage. Nach Art der Formgebung eingeteilt, lassen sich die erfindungsgemäßen Formkörper durch Gießen, Tauchen, Pressen, Spritzgießen, Extrudieren,
25 Kalandrieren, Prägen, Biegen, Tiefziehen etc. herstellen. Ein Beschichten von festen Grundträgern kommt ebenfalls in Frage.

Diese Verarbeitungsverfahren sind an sich bekannt und bedürfen keiner näheren Erklärung. Im Prinzip gelten für andere Polymere die Erläuterungen, die oben beispielhaft für Polyvinylharze gemacht wurden.

30 Die erfindungsgemäßen festen Formkörper eignen sich bei günstiger Warmblüttoxizität zur Bekämpfung von Parasiten, die in der Tierhaltung und Tierzucht bei Haus- und Nutztieren sowie

76-

Zoo-, Labor-, Versuchs- und Hobbytieren vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien der genannten Tiere wirksam.

Parasiten sind insbesondere Arthropoden. Bevorzugt werden die erfindungsgemäßen festen Formulierungen eingesetzt zur Bekämpfung von Ektoparasiten.

- 5 Zu den oben erwähnten Ektoparasiten gehören: Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge, Zecken und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp..

- 10 Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp..

- Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..
- 15

- 20 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp..

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp..

- Aus der Ordnung der Blattellidae z.B. *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp..
- 25

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Ixodes Holocyclus*, *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp..

- Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp.,
- 5 Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

- Die Formkörper eignen sich generell für die Bekämpfung von Parasiten bei den meisten Tierarten, bevorzugt bei Warmblütern, insbesondere Säugetieren. Zu den Nutz- und Zuchttieren gehören Säugetiere wie z.B. Rinder, Pferde, Schafe, Schweine, Ziegen, Kamele, Wasserbüffel, Esel, Kaninchen, Damwild, Rentiere; Pelztier wie z. B. Nerze, Chinchilla, Waschbär; Geflügel wie z.B.
- 10 Hühner, Gänse, Puten, Enten.

Zu Labor- und Versuchstieren gehören Rinder, Mäuse, Ratten, Meerschweinchen, Goldhamster, Hunde und Katzen.

Zu den Hobbytieren gehören Pferde, Hunde, Katzen, Mäuse, Ratten, Meerschweinchen, Goldhamster, Hasen und Kaninchen.

- 15 Die erfindungsgemäßen Mittel eignen sich insbesondere zur Behandlung von Rind, Hund und Katze, und zwar vorzugsweise zur Bekämpfung von Zecken und/oder Flöhen.

Die Anwendung kann sowohl prophylaktisch als auch therapeutisch erfolgen.

- Die Formkörper enthalten üblicherweise den Wirkstoff in Konzentrationen von jeweils 0,1 bis 30 Gew.-%, bevorzugt von 1 bis 20 Gew.-%, besonders bevorzugt von 2 bis 15,0 Gew.-%, bezogen
- 20 auf die Gesamtmasse der festen Formulierung.

Die Formkörper enthalten üblicherweise Wirkstoffkombinationen in Gesamtkonzentrationen von 1 bis 35 Gew.-%, bevorzugt 2 bis 25 Gew.-%, besonders bevorzugt von 2,5 bis 17,5 Gew.-% bezogen auf die Gesamtmasse der festen Formulierung.

- Die neuen festen Formkörper können Wirkstoffe, wie Insektizide, Akarizide, Lockstoffe, Sterilantien, Bakterizide, Nematizide, Fungizide etc. enthalten. Zu den Insektiziden, Akaridiziden sowie Wachstumsinhibitoren zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, synthetische oder natürliche Pyrethroide, Neonicotinoide (auch als Chlornicotinyle bezeichnet; dazu gehören z.B. Chlorpyridin-, Chlorthiazol- und Tetrahydrofuran-Verbindungen), Pyroximate, Phenylether, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a..
- 25

- 30 Günstige Wirkstoffe und Cowirkstoffe sind z.B. die folgenden:

-A-

Insektizide / Akarizide / Nematizide /Wachstuminhibitoren:

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alphacypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

- 5 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-cyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

- 10 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

- 15 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusatsodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopftora spp., Eprinomectin, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

- 20 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocyrthrin, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

- 25 Kernpolyederviren

Lambdacyhalothrin, Lufenuron

Malathion, Mecarbarn, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos, Moxidectin,

- Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron
- Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M
- Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
- Quinalphos,
- Ribavirin
- Salithion, Sebufos, Selamectin, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos,
- 10 Taufluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thetacypermethrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Ti 435, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,
- 15 Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii
- YI 5302
- YRC 2894
- Zetacypermethrin, Zolaprofos
- (1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat
- 20 dimethylcyclopropanecarboxylat
- (3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat
- 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin
- 2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
- 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
- 25 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

3-Methylphenyl-propylcarbamate

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon

5 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon

4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon

Bacillus thuringiensis strain BG-2348

Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-ester

10 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid

Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamate

N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid

15 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitroguanidin

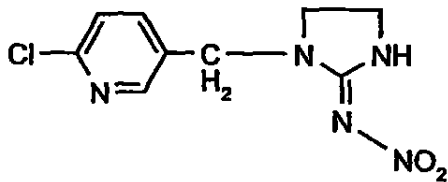
N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

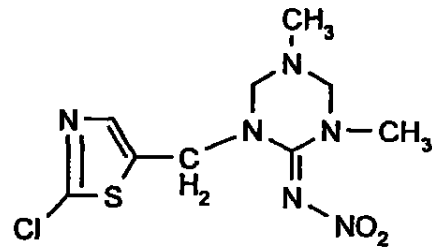
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

Bevorzugte Pyrethroide sind Cyfluthrin, β -Cyfluthrin, Flumethrin.

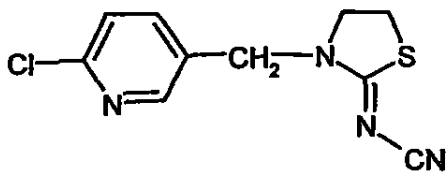
20 Bevorzugte Neonicotinoide (Chloronicotinyle) sind:



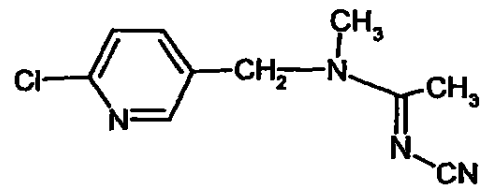
Imidacloprid



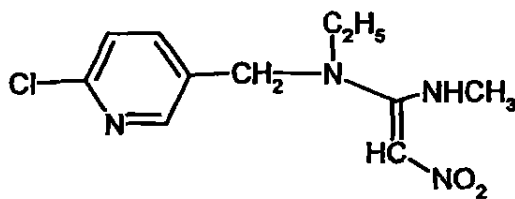
AKD 1022



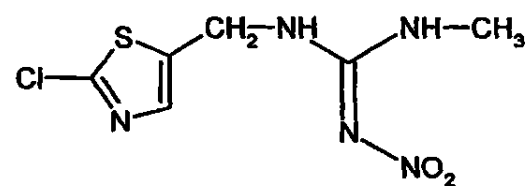
Thiacloprid



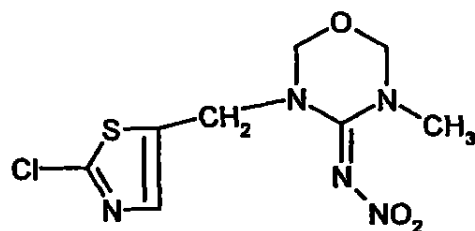
Acetamiprid



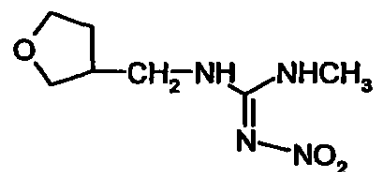
Nitenpyram (Ti 304)



Clothianidin (Ti 435)



Thiamethoxam



Dinotefuran

Imidacloprid, Thiacloprid, Acetamiprid und Nitenpyram sind Vertreter der Chlorpyridin-Neonicotinoide; Thiametoxam, Clothianidin und AKD 1022 sind Vertreter der Chlorthiazol-Neonicotinoide und Dinotefuran ist ein Vertreter der Tetrahydrofuran-Neonicotinoide.

Als weiteres bevorzugtes Insektizid sei Propoxur genannt.

Bevorzugte Wachstumsinhibitoren sind Pyriproxyfen, Methopren und Triflumuron, sie eignen sich insbesondere für die Anwendung in Kombination mit einem anderen Insektizid/Akarizid

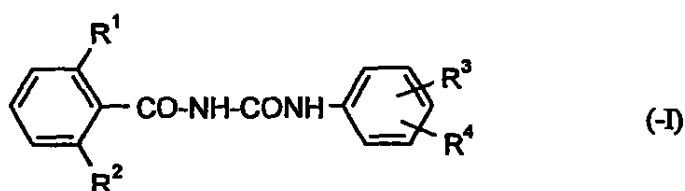
Bevorzugter Synergist ist Piperonylbutoxid; auch die Synergisten werden selbstverständlich in Kombination mit entsprechenden Wirkstoffen eingesetzt.

Die Verwendung der genannten Cowirkstoffe und Synergisten mit den genannten Wirkstoffen ist prinzipiell bekannt, siehe z. B. WO 00/02453, WO 95/33380, WO 95/07615, EP-A 569791, EP-A 0 736 252, EP-A 470467 und EP-A 251472.

Als weitere Wirkstoffe seien Pyrazoloxime und Benzoylharnstoffe genannt.

Geeignete Pyrazoloxime mit insektizider und akarizider Wirkung werden z.B. in der EP-A-0 234 045 beschrieben auf die hiermit ausdrücklich Bezug genommen wird.

Zu den Benzoylharnstoffen gehören Verbindungen der Formel (I):



10

wobei

R¹ für Halogen steht,

R² für Wasserstoff oder Halogen steht,

R³ für Wasserstoff, Halogen oder C₁₋₄-Alkyl steht,

15 R⁴ für Halogen, 1-5-Halogen-C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-Alkoxy, 1-5-Halogen-C₁₋₄-alkoxy, C₁₋₄-Alkylthio, 1-5-Halogen-C₁₋₄-alkylthio, Phenoxy oder Pyridyloxy die gegebenenfalls substituiert sein können durch Halogen, C₁₋₄-Alkyl, 1-5-Halogen-C₁₋₄-alkyl, C₄-Alkoxy, 1-5-Halogen-C₁₋₄-alkoxy, C₁₋₄-Alkylthio, 1-5-Halogen-C₁₋₄-alkylthio.

20 Die genannten Verbindungen können in Abhängigkeit von dem Substitutionsmuster in stereoisomeren Formen, die sich entweder wie Bild und Spiegelbild (Enantiomere), oder die sich nicht wie Bild und Spiegelbild (Diastereomere) verhalten, existieren. Die Erfindung betrifft sowohl die Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren jeweilige Mischungen. Die Racemate lassen sich ebenso wie die Diastereomeren in bekannter Weise in die stereoisomer einheitlichen Bestandteile trennen.

Weiterhin können bestimmte Verbindungen in tautomeren Formen vorliegen. Dies ist dem Fachmann bekannt, und derartige Verbindungen sind ebenfalls vom Umfang der Erfindung umfasst.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls sowohl als cis- als auch als trans-Isomere vorliegen. Auch wenn nur eines der Isomere dargestellt ist, sind erfindungsgemäß immer
5 das cis- und das trans-Isomere gemeint.

Die erfindungsgemäßen Formkörper eignen sich hervorragend zur Durchführung von äußerlichen bzw. dermalen Behandlungen an Tieren, insbesondere Hunden, Katzen und Rindern. Sie weisen üblicherweise eine Dicke von 0,25 - 3,5 mm, vorzugsweise 0,75 - 2,5 mm auf. Sie zeichnen sich aus durch ihre ganz hervorragende Lagerungsstabilität von 3-5 Jahren in allen Klimazonen. Sie
10 zeichnen sich weiterhin durch ihre einfache Applizierbarkeit, sehr gute biologische Langzeitwirksamkeit von üblicherweise bis zu neun Monaten sowie ihre gute Umwelt- insbesondere Gewässer- und Warmblüterverträglichkeit aus.

Beispiele**Beispiel 1****Zusammensetzung:**

5	2-Isopropoxyphenyl-N-methylcarbammat (Propoxur)	10 g
	Di-n-butyladipat	21 g
	Propylenglycoloctanoatdecanoat	9 g
	(Handelsbezeichnung: Miglyol 840, Fa. Sasol/Witten)	
	Epoxidiertes Sojabohnenöl	2 g
10	Stearinsäure	1 g
	PVC	56 g
	Pigmentmischung	1 g

Herstellung: Die Mischung aus 2-Isopropoxyphenyl-N-methylcarbammat, Pigmentmischung und PVC wird in einem Mischer mit dem Gemisch aus Di-n-butyladipat, Propylenglycoloctanoatdecanoat und epoxidiertem Sojabohnenöl gemischt. Man mischt unter Wärme solange, bis die Mischung homogen ist. Das Erwärmen fördert das Einziehen der Weichmachermischung in das PVC. Nach der anschließenden homogenen Verteilung der Stearinsäure wird die Mischung im Spritzguss zu Halsbändern geformt.

20 Beispiel 2**Zusammensetzung:**

25	2-Isopropoxyphenyl-N-methylcarbammat	10 g
	Flumethrin	2,5 g
	Di-n-butyladipat	21 g
	Propylenglycoloctanoatdecanoat	9 g
	Epoxidiertes Sojabohnenöl	2 g
	Stearinsäure	1 g
	PVC	54 g
30	Pigmentmischung	0,5 g

Herstellung: Die Mischung aus 2-Isopropoxyphenyl-N-methylcarbammat, Pigmentmischung und PVC wird in einem Mischer mit dem Gemisch aus Di-n-butyladipat, Propylenglycoloctanoatdecanoat, epoxidiertem Sojabohnenöl und Flumethrin gemischt. Man mischt unter Wärme solange, bis die Mischung homogen ist. Das Erwärmen fördert das Einziehen der Wirkstoff-Weichmachermischung in das PVC. Nach der anschließenden homogenen Verteilung der Stearinsäure wird die Mischung im Spritzguss zu Halsbändern geformt. Gleiche Mischung wird im Extruder zu Endlosbändern oder Platten extrudiert, die vom Hersteller oder Anwender auf eine der Applikationsform gemäße Länge konfektioniert wird. Aus dem Extrudat werden Formkörper geschnitten oder gestanzt, die in einer Medaillonform eng an das Tier gehängt wird.

Beispiel 3

Zusammensetzung:

	Flumethrin	2,5 g
	Di-n-butyladipat	21 g
15	Propylenglycoloctanoatdecanoat	9 g
	Epoxidiertes Sojabohnenöl	2 g
	Stearinsäure	1 g
	PVC	64 g
	Pigmentmischung	0,5 g

20 Herstellung:

Die Mischung aus Pigmentmischung und PVC wird in einem Mischer mit dem Gemisch aus Di-n-butyladipat, Propylenglycoloctanoatdecanoat, epoxidiertem Sojabohnenöl und Flumethrin gemischt. Man mischt unter Wärme solange, bis die Mischung homogen ist. Das Erwärmen fördert das Einziehen der Wirkstoff-Weichmachermischung in das PVC. Nach der anschließenden homogenen Verteilung der Stearinsäure wird die Mischung zu Endlosbändern und Platten extrudiert, die vom Hersteller oder Anwender auf eine der Applikationsform gemäße Länge konfektioniert wird. Aus dem Extrudat werden Formkörper geschnitten oder gestanzt, die in einer Medaillon- bzw. Ohrmarkenform eng an das Tier gehängt wird.

Beispiel 4**Zusammensetzung:**

	Imidacloprid	10 g
	Flumethrin	5 g
5	Di-n-butyladipat	21 g
	Propylenglycoloctanoatdecanoat	9 g
	Epoxidiertes Sojabohnenöl	2 g
	Stearinsäure	1 g
	PVC	51 g
10	Pigmentmischung	1 g

Herstellung: Die Mischung aus Imidacloprid, Pigmentmischung und PVC wird in einem Mischer mit dem Gemisch aus Di-n-butyladipat, Propylenglycoloctanoatdecanoat, epoxidiertem Sojabohnenöl und Flumethrin gemischt. Man mischt unter Wärme solange, bis die Mischung homogen ist. Das Erwärmen fördert das Einziehen der Wirkstoff-Weichmachermischung in das PVC. Nach der anschließenden homogenen Verteilung der Stearinsäure wird die Mischung im Spritzguss zu Halsbändern und Medallions geformt.

Bei den in den Beispielen genannten Pigmentmischungen handelt es sich in den Beispielen 1 und 4 um eine Mischung aus handelsüblichen Eisenoxiden, in den Beispielen 2 und 3 um ein Gemisch aus handelsüblichem Titandioxid und Eisenoxid.

Wirksamkeitsversuche

Zur Durchführung von Wirksamkeitsversuchen gegen Flöhe und Zecken wurden Hunde mit Halsbändern bzw. Rinder mit einem ihrer Körpergröße angepassten Extrudat gemäß den Beispielen 1, 2, 3, 4, behandelt. Die Behandlung erfolgte über die Befestigung eines Formkörpers in Form eines Halsbandes (ca. 1,4cm breiter Streifen) am Hals der Tiere. Die Streifen wurden möglichst eng (mit einem fingerbreit Zwischenraum) an den Hals der Tiere angepasst. Medaillons wurden perforiert und an einem herkömmlichen, Wirkstoff-freien Halsband befestigt. Das Medaillon wurde so platziert, dass es im vorderen Halsbereich Kontakt mit dem Fell des Tieres hatte.

Beispiel A: Wirksamkeit gegen Flöhe (*Ctenocephalides felis*) am Hund

An den Tagen -4 und -1 werden Hunde mit ca. 100 adulten, nüchternen *Ctenocephalides felis* pro Hund infestiert. Dabei werden die Flöhe auf den Nacken des Tieres ausgebracht.

Am Tag 0 wird der Infestationserfolg am Hund überprüft, indem am wachen Tier nach Flöhen
5 gesucht wird. Die Zahl der lebenden Flöhe wird protokolliert.

Nach der Zählung der Flöhe werden die Tiere behandelt. Die Hunde der Kontrollgruppe werden nicht behandelt. Die zu prüfenden Arzneimittel werden den Tieren als Halsband oder als Medaillon verabreicht. Halsbänder und Medaillon verbleiben am Tier bis zum Versuchsende am Tag 170. Es wird pro Tier jeweils nur 1 Halsband oder 1 Medaillon appliziert. Es werden nur klinisch ge-
10 sunde Tiere verwendet.

Am Tag 1 und Tag 2 werden alle Hunde auf lebende Flöhe und Zecken überprüft. Die Ergebnisse werden in den Rohdaten festgehalten.

An den Tagen 14, 28, 56, 84, 112, 140 und 168 werden alle Hunde mit ca. 100 adulten, nüchternen *Ctenocephalides felis* pro Hund reinfestiert. Jeweils einen und zwei Tage nach Reinfestation wer-
15 den alle Hunde auf lebende Flöhe kontrolliert. Die Ergebnisse werden in den Rohdaten protokolliert.

Für die Berechnung der Wirksamkeit wird eine modifizierte Formel nach Abbott benutzt:

$$\text{Wirksamkeit \%} = \frac{\text{Ø Anzahl Flöhe KG} - \text{Ø Anzahl Flöhe BG}}{\text{Ø Anzahl Flöhe KG}} \times 100$$

KG: Kontrollgruppe

BG: Behandlungsgruppe

20 Mit den gemäß der in den Formulierungsbeispielen 1, 2, 3, 4 hergestellten, als Halsband und als Medaillon applizierten, wirkstoffhaltigen Formkörpern können Wirksamkeiten >90% gegen *Ctenocephalides felis* über 5-6 Monate erzielt werden.

Beispiel B: Wirksamkeit gegen Zecken (*Ixodes ricinus*) am Hund

Am Tag -1 werden Hunde mit 2% Rompun® (Bayer AG) (0,1ml/kg Körpergewicht) sediert. Nach-
25 dem alle Hunde sediert sind (nach ca. 10-15 Minuten) werden sie in Transportboxen überführt und 50 *Ixodes ricinus* (25♀, 25♂) pro Hund auf den Nacken des Tieres ausgebracht. Die Tiere werden nach ca. 1 ½ Stunden wieder aus der Transportkiste in den Käfig gesetzt.

Am Tag 0 wird der Infestationserfolg am Hund überprüft, indem am wachen Tier nach Zecken gesucht wird. Intensiv wird dabei gesucht im Kopf- und Ohrenbereich inkl. Ohrenfalte, im Bereich des Nackens, am Unterbauch, an der Unterbrust, an der seitlichen Flanke sowie zwischen den Zehen und an den Gliedmaßen. Die Zahl der angesogenen lebenden Zecken wird protokolliert. Tote Zecken werden entfernt.

Nach der Zählung der Zecken werden die Tiere behandelt. Die Hunde der Kontrollgruppe werden nicht behandelt. Die zu prüfenden Arzneimittel werden den Tieren als Halsband oder als Medaillon verabreicht. Halsbänder und Medaillon verbleiben am Tier bis zum Versuchsende am Tag 170. Es wird pro Tier jeweils nur 1 Halsband oder 1 Medaillon appliziert. Es werden nur klinisch gesunde Tiere verwendet.

Am Tag 1 und Tag 2 werden alle Hunde auf lebende und tote angesogene Zecken überprüft. Die Ergebnisse werden in den Rohdaten festgehalten. Am Tag 2 werden alle lebenden und toten Zecken vom Hund entfernt.

An den Tagen 14, 28, 56, 84, 112, 140 und 168 werden alle Hunde mit jeweils 50 *Ixodes ricinus* (25♀, 25♂) pro Hund reinfestiert. Jeweils einen und zwei Tage nach Reinfestation werden alle Hunde auf lebende und tote angesogene Zecken kontrolliert. Die Ergebnisse werden in den Rohdaten protokolliert. Am 2.ten Tag nach Reinfestation werden alle lebenden und toten Zecken vom Hund entfernt.

Für die Berechnung der Wirksamkeit wird eine modifizierte Formel nach Abbott benutzt:

$$\text{Wirksamkeit \%} = \frac{\text{Ø Anzahl Zecken KG} - \text{Ø Anzahl Zecken BG}}{\text{Ø Anzahl Zecken KG}} \times 100$$

20 KG: Kontrollgruppe
BG: Behandlungsgruppe

Mit den gemäß der in den Formulierungsbeispielen 1, 2, 3, 4 hergestellten, als Halsband und als Medaillon applizierten, wirkstoffhaltigen Formkörpern

können Wirksamkeiten >90% gegen *Ixodes ricinus* über 5-6 Monate erzielt werden.

Beispiel C: Wirksamkeit gegen den australischen Zecken (*Ixodes holocyclus*) am Rind

Am Tag -1 werden Hunde mit 2% Rompun® (Bayer AG) (0,1ml/kg Körpergewicht) sediert. Nachdem alle Rinder sediert sind (nach ca. 10-15 Minuten) und 10 *Ixodes holocyclus* (5♀, 5♂) pro Rind auf den Nacken des Tieres ausgebracht.

- 5 Am Tag 0 wird der Infestationserfolg am Rind überprüft, indem am wachen Tier nach Zecken gesucht wird. Intensiv wird dabei gesucht im Kopf- und Ohrenbereich inkl. Ohrenfalte, im Bereich des Nackens, am Unterbauch, an der Unterbrust, an der seitlichen Flanke sowie zwischen den Zehen und an den Gliedmaßen. Die Zahl der angesogenen lebenden Zecken wird protokolliert. Tote Zecken werden entfernt.
- 10 Nach der Zählung der Zecken werden die Tiere behandelt. Die Rinder der Kontrollgruppe werden nicht behandelt. Die zu prüfenden Arzneimittel werden den Tieren als Halsband verabreicht. Halsbänder verbleiben am Tier bis zum Versuchsende am Tag 170. Es wird pro Tier jeweils nur 1 Halsband appliziert. Es werden nur klinisch gesunde Tiere verwendet.

- Am Tag 1 und Tag 2 werden alle Hunde auf lebende und tote angesogene Zecken überprüft. Die
- 15 Ergebnisse werden in den Rohdaten festgehalten. Am Tag 2 werden alle lebenden und toten Zecken vom Hund entfernt.

- An den Tagen 14, 28, 56, 84, 112, 140 und 168 werden alle Rinder mit jeweils 50 *Ixodes holocyclus* (5♀, 5♂) pro Rind reinfestiert. Jeweils einen und zwei Tage nach Reinfestation werden alle Hunde auf lebende und tote angesogene Zecken kontrolliert. Die Ergebnisse werden in den Rohda-
- 20 ten protokolliert. Am 2.ten Tag nach Reinfestation werden alle lebenden und toten Zecken vom Rind entfernt.

Für die Berechnung der Wirksamkeit wird eine modifizierte Formel nach Abbott benutzt:

$$\text{Wirksamkeit \%} = \frac{\emptyset \text{ Anzahl Zecken KG} - \emptyset \text{ Anzahl Zecken BG}}{\emptyset \text{ Anzahl Zecken KG}} \times 100$$

KG: Kontrollgruppe

BG: Behandlungsgruppe

- 25 Mit den gemäß der in den Formulierungsbeispielen 1, 2, 3, 4 hergestellten, als Halsband-applizierten, wirkstoffhaltigen Formkörpern können Wirksamkeiten >90% gegen *Ixodes holocyclus* über 5-6 Monate erzielt werden.

21

- 18 -

Patentansprüche

1. Feste Formkörper zur äußerlichen Anwendung gegen Parasiten an Tieren auf Basis einer Polyolefin-Matrix, enthaltend
 - einen oder mehrere Ester eines zwei- oder dreiwertigen Alkohols mit bis zu drei Kohlenstoffatomen mit Fettsäuren mit 6 bis 18 Kohlenstoffatomen
 - einen oder mehrere Wirkstoffe
 - sowie ggf. weitere Hilfs- und Zusatzstoffe.
2. Feste Formkörper gemäß Anspruch 1 auf Basis einer Polyvinylharz-Matrix.
3. Feste Formkörper gemäß Anspruch 1 auf Basis einer Polyvinylchlorid-Matrix.
- 10 4. Feste Formkörper gemäß einem der vorstehenden Ansprüche enthaltend einen oder mehrere Ethylenglykol-, Propylenglykol- oder Glycerinester mit Fettsäuren mit 6 bis 18 Kohlenstoffatomen.
5. Feste Formkörper gemäß Anspruch 4 enthaltend ein Capryl-/Caprinsäuretriglycerid und/oder Propylenglykoldicaprylat/-dicaprat.
- 15 6. Verwendung der festen Formkörper gemäß Anspruch 1 zur dermalen Bekämpfung von Parasiten an Tieren.

22

/

ELEMENTOS MOLDEADOS SÓLIDOS CON CONTENIDO EN PRINCIPIO
ACTIVO PARA USO EXTERNO CONTRA PARÁSITOS EN ANIMALES

La presente invención se refiere a elementos moldeados con contenido
5 en principio activo para uso externo contra parásitos en animales

Los elementos moldeados con contenido en principio activo para el
combate de parásitos en animales se conocen desde hace mucho tiempo. Este
tipo de elementos moldeados se describe, por ejemplo, en los documentos WO
2002/78443, EP-A 539295, EP-A 763325, EP-A 1289363, EP-A 211207, EP-
10 A124404, EP-A 979605, FR 2729833, US 5620696, EP-A 576267, EP-A
569791, EP-A 542078, EP-A 470467, EP-A 251472, EP-A 50782, US 5858387
y EP-A 542080. El inconveniente de los procedimientos y mezclas descritos
hasta la fecha para la preparación de los elementos moldeados con contenido
en principio activo reside en que cuando se usan las matrices convencionales
15 de poliolefina o de resina de vinilo, se requiere el uso adicional de ésteres del
ácido ftálico, tales como ftalato de dimetilo y ftalato de dioctilo (véanse, por
ejemplo, los documentos WO 01/787065, EP-A 0211207 y EP-A 0569791). Se
sabe que los ftalatos usados para ello y útiles desde el punto de vista
tecnológico no son del todo inocuos toxicológicamente. Si no se manipulan
20 correctamente, pueden suponer un riesgo durante la preparación de los
elementos moldeados y durante su uso, y, además, existe el riesgo de la
contaminación del medio ambiente.

Por lo tanto, resulta deseable sustituir dichos ftalatos por sustancias de
uso menos tóxicas y compatibles con el medio ambiente. Estas nuevas
25 sustancias de uso preferentemente deben aumentar la migración de los

principios activos desde la matriz polimérica y mejorar de este modo la eficacia (efecto residual y de derribo) de los elementos moldeados sin influir negativamente en las buenas propiedades físico-químicas de la matriz polimérica.

- 5 Sorprendentemente se descubrió ahora que este objetivo se puede alcanzar mediante determinados ésteres de ácidos grasos con alcoholes polifuncionales (por ejemplo, di- y triglicéridos o ésteres de propilenglicol).

Estos ésteres de ácidos grasos, por su estructura físico-química, son compuestos polares, mientras que las poliolefinas y las resinas de vinilo
10 mencionadas son plásticos relativamente apolares. El experto da por sentado que los compuestos polares y los plásticos apolares son incompatibles. En muchos casos, tales combinaciones conducen a una disgregación/separación de fases, lo que a su vez conduce a un considerable empeoramiento de las propiedades físico-químicas de la matriz polimérica, tales como el módulo de
15 elasticidad, la ductilidad, la deformación por tracción, la facilidad de extracción de la masa moldeada correspondiente, así como a una migración espontánea del principio activo desde la matriz plástica y, de este modo, a un considerable empeoramiento de la eficacia a largo plazo. Por lo tanto, resultó sorprendente que el uso de los ésteres polares mencionados de ácidos grasos y alcoholes
20 polifuncionales no influyese negativamente en las propiedades físico-químicas ni en la eficacia a largo plazo de los elementos moldeados. En muchos casos se observó incluso, en contra de la doctrina, una mejora en la procesabilidad y en el efecto a largo plazo.

La invención se refiere a:

- 25 Elementos moldeados sólidos para uso externo contra parásitos en

animales, que están basados en una matriz de poliolefina y contienen

- uno o varios ésteres de un alcohol di- o trifuncional con hasta tres átomos de carbono con ácidos grasos con 6 a 18 átomos de carbono,
- uno o varios principios activos,

- 5 - así como, dado el caso, coadyuvantes y aditivos adicionales.

Los ésteres usados de acuerdo con la invención contienen como componente alcohólico un alcohol di- o trifuncional con hasta tres átomos de carbono, como, por ejemplo, etilenglicol, propilenglicol o glicerol. En general están esterificados al menos dos, preferentemente todos los grupos hidroxilo

10 del alcohol. El componente ácido de los ésteres lo forman ácidos grasos con 6 a 18 átomos de carbono que pueden ser de cadena lineal, ramificados, así como mono- o poliinsaturados. Se pueden usar ésteres mixtos o también mezclas de diferentes tipos de ésteres. Como glicéridos se consideran di- y triglicéridos, preferentemente triglicéridos, como, por ejemplo, triglicéridos de

15 los ácidos caprílico y cáprico o triglicéridos de los ácidos caprílico, cáprico y linoleico. Del mismo modo se prefieren ésteres del propilenglicol con el ácido caprílico y/o cáprico (octanoato-decanoato de propilenglicol). Con especial preferencia, estos ésteres de glicerol y/o de propilenglicol con el ácido caprílico/cáprico presentan una viscosidad (20°C) comprendida en el intervalo

20 de 5 a 40, preferentemente de 8 a 35, muy preferentemente de 9 a 13 mPa·s. Estos ésteres se pueden adquirir bajo el nombre comercial Miglyol 840 (octanoato-decanoato de propilenglicol, n° CAS 68583-51-7) y Miglyol 812 (triglicéridos de los ácidos caprílico y cáprico, n° CAS 73398-61-5) de la empresa Sasol Germany GmbH/Witten. Asimismo se pueden usar sus

25 derivados modificados con poli(óxido de etileno), poli(óxido de propileno) y/o

carbonato de propileno con viscosidades comprendidas en el intervalo mencionado.

Los elementos moldeados de acuerdo con la invención contienen los ésteres de ácidos grasos en proporciones del 1 al 25%, preferentemente del 5 al 17,5% en peso, muy preferentemente del 5 al 12,5% en peso (respecto a la masa correspondiente de la mezcla total).

En el caso de los elementos moldeados sólidos de acuerdo con la invención se trata, por ejemplo, de collares, colgantes para collares (medallones), marcas orejeras, cintas que se sujetan a los miembros o a otras partes del cuerpo, tiras y hojas adhesivas u hojas desprendibles. Se prefieren especialmente los medallones y, en particular, los collares.

Como sustancia portadora o base para los elementos moldeados se consideran poliolefinas y elastómeros termoplásticos y termoplásticos flexibles. Como tales son de mencionar resinas de polivinilo, EPDM (terpolímero de etileno/propileno/dieno), polietileno (por ejemplo, HDPE o LLDPE) y polipropileno que sean suficientemente compatibles con los principios activos antes mencionados.

Los polímeros deben presentar una resistencia y flexibilidad suficientes para no desgarrarse o quebrarse durante el moldeo. Deben poseer una durabilidad suficiente para resistir el desgaste normal. Además, los polímeros deben permitir una migración suficiente del principio activo hacia la superficie del elemento moldeado.

Entre las resinas de polivinilo se encuentran los poli(halogenuros de vinilo), tales como el poli(cloruro de vinilo), el poli(cloruro de vinilo)- acetato de vinilo y el poli(fluoruro de vinilo); y los polivinilbencenos, tales como el

26

poliestireno y el poliviniltolueno.

Otros plásticos adecuados como matriz para los elementos moldeados de acuerdo con la invención son los elastómeros termoplásticos. Estos son materiales que contienen fases elastoméricas mezcladas físicamente o ligadas químicamente en polímeros procesables termoplásticamente. Se distinguen mezclas de polímeros en las que las fases elastoméricas forman parte del esqueleto polimérico. Por la estructura de los elastómeros termoplásticos coexisten regiones rígidas y blandas. Las regiones rígidas forman una estructura reticular cristalina o una fase continua cuyos intersticios están rellenos de segmentos elastoméricos. Debido a esta estructura, estos materiales poseen propiedades similares al caucho. En este contexto se remite a poliolefinas termoplásticas (TPO) y copolímeros de bloques de estireno (véase, por ejemplo, el documento EP 542078).

De acuerdo con la invención se prefieren el poli(cloruro de vinilo), el polipropileno, el polietileno y el EPDM; se prefiere muy especialmente el poli(cloruro de vinilo).

Para la preparación de los elementos moldeados basados en poliolefinas, en especial en resinas de polivinilo, se pueden usar además en casos especiales plastificantes habituales que, como se sabe, se usan para plastificar las resinas de vinilo sólidas. El plastificante que se va a usar depende de la resina y de su compatibilidad con el plastificante. Los plastificantes adicionales adecuados son, por ejemplo, ésteres del ácido fosfónico y ésteres del ácido adípico, como, por ejemplo, adipato de diisobutilo y de n-butilo. También se pueden usar otros ésteres, tales como los ésteres del ácido aceláico, del ácido maleico, del ácido ricinoleico, del ácido mirístico, del

ácido palmítico, del ácido oleico, del ácido sebácico, del ácido esteárico y del ácido trimelítico, así como poliésteres lineales complejos, plastificantes poliméricos y aceites de semilla de soja epoxidados

Los plastificantes adicionales se usan, dado el caso, en cantidades de
5 aproximadamente 5 a 50% en peso, preferentemente de aproximadamente 15 a 45% en peso de la composición total.

Los elementos moldeados pueden contener también otros componentes habituales, tales como estabilizantes, lubricantes, agentes de desmoldeo, cargas y materiales colorantes; en general, éstos esencialmente no alteran las
10 propiedades básicas de la composición.

Los estabilizantes adecuados son antioxidantes y agentes que protegen los collares contra la radiación ultravioleta y la degradación no deseada durante un procesamiento como la extrusión. Algunos estabilizantes, como los aceites de semilla de soja epoxidados, sirven además de plastificante secundario.

15 Como lubricantes se pueden usar, por ejemplo, estearatos, ácido esteárico y polietilenos de bajo peso molecular. Estos componentes se usan habitualmente en una concentración de hasta aproximadamente 5% en peso de la composición total.

En la preparación de los elementos moldeados preferentemente se
20 mezclan los diferentes componentes según procedimientos conocidos y se moldean por compresión según procedimientos conocidos de extrusión o moldeo por inyección.

La elección del procedimiento de procesamiento para la preparación de los elementos moldeados se rige, desde el punto de vista técnico, básicamente
25 por las propiedades reológicas del material portador polimérico y por la forma

del elemento moldeado deseado. Los procedimientos de procesamiento se pueden ajustar en función de la tecnología de procesamiento o en función del tipo de conformación. En el caso de la tecnología de procedimientos, los procedimientos se pueden subdividir en función de los estados reológicos por los que pasan los materiales. Por lo tanto, para los materiales portadores 5 poliméricos viscosos se consideran la colada, la compresión, el moldeo por inyección y la aplicación, y para los polímeros viscoelásticos el moldeo por inyección, la extrusión, el calandrado, el laminado y, dado el caso, el amasado. Dependiendo del tipo de conformación, los elementos moldeados de acuerdo 10 con la invención se pueden preparar por colada, inmersión, compresión, moldeo por inyección, extrusión, calandrado, estampado, plegado, embutición profunda, etc. También se considera el recubrimiento de sustratos sólidos.

Estos procedimientos de procesamiento son conocidos en sí y no precisan de una explicación más detallada. Para los demás polímeros en 15 principio son válidas las aclaraciones hechas anteriormente a modo de ejemplo para las resinas de polivinilo.

Los elementos moldeados sólidos de acuerdo con la invención son adecuados para combatir parásitos que están relacionados con la posesión y cría de animales domésticos y útiles, así como en animales de zoológico, de 20 laboratorio, de experimentación y de compañía, al mismo tiempo que poseen una toxicidad favorable en animales de sangre caliente. Son eficaces frente a especies de sensibilidad normal y resistentes, así como frente a todos o determinados estadios de desarrollo de los animales mencionados.

Los parásitos son especialmente artrópodos. Las formulaciones sólidas 25 de acuerdo con la invención se usan preferentemente para combatir

ectoparásitos.

Entre los ectoparásitos antes mencionados se encuentran: Garrapatas duras, ácaros blandos, acarnos de la sarna, trombiculas, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, malófagos, garrapatas y

5 pulgas Entre estos parásitos se encuentran:

Del orden de los anopluros por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus*, spp., *Solenopotes* spp.

Del orden de los malófagos y de los subórdenes *amplycera* e *ischnocera* por ejemplo *Trimenopon* spp, *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp.,
10 *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp..

Del orden de los dípteros y de los subórdenes nematóceros y braquíceros por ejemplo *Aedes* spp, *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp, *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp.,
15 *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp, *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp, *Haematobia* spp., *Morellia* spp, *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp, *Wohlfahrtia* spp, *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp, *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp.,
Melophagus spp..

20 Del orden de los sifonápteros por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp..

Del orden de los heterópteros por ejemplo *Cimex* spp, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp..

Del orden de los blatarios por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta*
25 *americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp

De la subclase de los ácaros (acáridos) y de los órdenes *meta-* y *mesostigmata* por ejemplo *Argas spp* , *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp* , *Ixodes holocyclus spp.*, *Amblyomma spp.*, *Boophilus spp* , *Dermacentor spp.*, *Haemophysalis spp.*, *Hyalomma spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus*
5 *spp.*, *Raillietia spp.*, *Pneumonyssus spp.*, *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*

Del orden de los *actiniedida* (*prostigmata*) y *acaridida* (*astigmata*) por ejemplo *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp* , *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*, *Acarus spp.*, *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp* ,
10 *Psoroptes spp* , *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp* , *Sarcoptes spp.*, *Notoedres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp* , *Laminosioptes spp.*.

En general, los elementos moldeados son adecuados para combatir parásitos en la mayoría de las especies animales, preferentemente en animales de sangre caliente, en particular en mamíferos. Entre los animales útiles y de
15 ganado se encuentran mamíferos como, por ejemplo, ganado vacuno, caballos, ovejas, cerdos, cabras, camellos, búfalos arni, burros, conejos, gamos, renos; animales de pieles finas como, por ejemplo, visones, chinchilla, mapaches, aves de corral como, por ejemplo, pollos, gansos, pavos, patos.

Entre los animales de laboratorio y de experimentación se encuentran
20 bóvidos, ratones, ratas, cobayas, hámsters dorados, perros y gatos.

Entre los animales de compañía se encuentran caballos, perros, gatos, ratones, ratas, cobayas, hámsters dorados, liebres y conejos.

Los agentes de acuerdo con la invención son especialmente adecuados para el tratamiento de bóvidos, perros y gatos, y preferentemente para combatir
25 garrapatas y/o pulgas.

La administración se puede realizar tanto de forma profiláctica como terapéutica

Los elementos moldeados contienen el principio activo habitualmente en concentraciones del 0,1 al 30% en peso, preferentemente del 1 al 20% en peso, muy preferentemente del 2 al 15,0% en peso, respecto a la masa total de la formulación sólida.

Los elementos moldeados contienen habitualmente combinaciones de principios activos en concentraciones totales de hasta el 35% en peso, preferentemente del 2 al 25% en peso, muy preferentemente del 2,5 al 17,5% en peso, respecto a la masa total de la formulación sólida.

Los nuevos elementos moldeados sólidos pueden contener principios activos tales como insecticidas, acaricidas, sustancias atrayentes, esterilizantes, bactericidas, nematocidas, fungicidas, etc.. Entre los insecticidas, acaricidas e inhibidores del crecimiento se cuentan, por ejemplo, ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, ésteres de ácidos carboxílicos, piretroides sintéticos o naturales, neonicotinoides (denominados también cloronicotinilos; entre ellos se encuentran, por ejemplo, compuestos de cloropiridina, clorotiazol y tetrahidrofurano), piroximatós, éteres fenílicos, fenilureas, sustancias producidas por microorganismos, entre otros.

Los principios activos y principios activos utilizados apropiados son, por ejemplo, los siguientes:

Insecticidas/acaricidas/nematocidas/inhibidores del crecimiento:

Abamectina, acefato, acetamiprid, acrinatrin, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alfacipermetrin, alfa metrin, amitraz, avermectina, AZ 60541, azadiractina, azametifos, azinfos A, azinfos M, azociclotin,

- Bacillus popilliae*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, bendiocarb, benfuracarb, bensultap, benzoximato, betaciflutrin, bifenazato, bifentrin, bioetanometrin, biopermetrin, BPMC, bromofos A, bufencarb, buprofezina,
- 5 butatiofos, butocarboxima, butilpiridaben,
- cadusafos, carbanilo, carbofurano, carbofenotión, carbosulfan, cartap, cloetocarb, cloretoxifos, clorfenapir, clorfenvinfos, clorfluazuron, clormefos, clorpinfos, clorpinfos M, clovaportrin, *cis*-resmetrin, cispermetrin, clotrin, cloetocarb, clofentezina, cianofos, ciclopreno, cicloprotrin, ciflutrin, cihalotrin,
- 10 chexatin, cipermetrin, ciromazina,
- deltametrin, demetón M, demetón S, demetón-S-metilo, diafentiuron, diazinona, diclorvós, diflubenzuron, dimetoato, dimetilvinfos, diofenolan, disulfotón, docusato sódico, dofenapin,
- eflusilanato, emamectina, empentrin, endosulfan, *Entomorphthora spp.*,
- 15 eprinomectina, esfenvalerato, etiofencarb, etión, etoprofos, etofenfos, etoxazol, etrimfos,
- fenamifos, fenazaquin, fenbutatín óxido, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxicarb, fenpropatrin, fenpirad, fenpiritrin, fenvalerato, fipronil, fluazinam, fluazuron, flubrocitrinato, flucicloخورon, flucitrinato, flufenoxuron,
- 20 flumetrin, flutenzina, fluvalinato, fonofos, fosmetilan, fostiazato, fubfenprox, furatiocarb,
- virus granulosis,
- halofenocida, HCH, heptenofos, hexaflumuron, hexitiazox, hidropreno, imidacloprid, isazofos, isofenfos, isoxatión, ivermectina,
- 25 virus poliédricos nucleares,

- lambdacihalotrin, lufenuron,
 malatión, mecarbam, metaldehído, metamidofos, *Metharhizium*
anisopliae, *Metharhizium flavoviride*, metidatión, metiocarb, metomilo,
 metoxifenocida, metolcarb, metoxadiazona, mevinfos, milbemectina,
 5 monocrotofos, moxidectina,
 naled, nitenpiram, nitiacina, novaluron,
 ometoato, oxamilo, oxidemetón M,
Paecilomyces fumosoroseus, paratión A, paratión M, permetrin, fentoato,
 forato, fosalon, fosmet, fosfamidon, foxima, primicarb, pirimifos A, pirimifos M,
 10 profenfos, promecarb, propoxur, protiofos, protoato, pimetrocina, piraclofos,
 piresmetrin, pelitre, piridaben, pindatión, pirimidifén, pirproxifén,
 quinalfos,
 ribavirina,
 salitión, sebufos, selamectina, silafluofén, espinosad, sulfotep, sulprofos,
 15 taufluvalinato, tebufenozida, tebifenpirad, tebupirrimifos, teflubenzuron,
 teflutrin, temefos, temivinfos, terbufos, tetraclorovinfos, tetacipermetrin,
 tiametoxam, tiapronil, tiatrifos, hidrogeno-oxalato de tiociclam, tiodicarb,
 tiofanox, thuringiensina, Ti 435, tralocitrin, tralometrin, triaranteno, triazamato,
 tnazofos, triazuron, triclorofenidina, triclorfon, tnflumuron, tnmetacarb,
 20 vamidotión, vaniliprol, *Verticillium lecanii*,
 YI 5302,
 YRC 2894,
 zetacipermetrin, zolaprofos,
 2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de (1R-cis)-[5-(fenilmetil)-3-furanil]-
 25 metil-3-[(dihidro-2-oxo-3(2H)-furaniliden)-metilo],

- 2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato de (3-fenoxifenil)-metilo,
1-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]tetrahidro-3,5-dimetil-N-nitro-1,3,5-triazin-
2(1H)-imina,
- 5 2-(2-cloro-6-fluorofenil)-4-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]-4,5-dihidro-oxazol,
2-(acetiloxi)-3-dodecil-1,4-naftalenodiona,
2-cloro-N-[[[4-(1-feniletoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida,
2-cloro-N-[[[4-(2,2-dicloro-1,1-difluoroetoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-
benzamida,
carbamato de 3-metilfenilpropilo,
- 10 4-[4-(4-etoxifenil)-4-metilpentil]-1-fluoro-2-fenoxibenceno,
4-cloro-2-(1,1-dimetiletil)-5-[[2-(2,6-dimetil-4-fenoxifenoxi)etil]-tio]-3(2H)-
pindazinona,
4-cloro-2-(2-cloro-2-metilpropil)-5-[(6-yodo-3-pindinil)-metoxi]-3(2H)-
piridazinona,
- 15 4-cloro-5-[(6-cloro-3-piridinil)metoxi]-2-(3,4-diclorofenil)-3(2H)-
piridazinona,
Bacillus thuringiensis, cepa EG-2348,
[2-benzoil-1-(1,1-dimetiletil)-hidazida del ácido benzoico,
éster 2,2-dimetil-3-(2,4-diclorofenil)-2-oxo-1-oxaespиро[4.5]dec-3-en-4-
20 llico del ácido butanoico,
[3-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2-tiazolidiniliden]-cianamida,
dihidro-2-(nitrometilen)-2H-1,3-tiazina-3(4H)-carboxialdehído,
[2-[[1,6-dihidro-6-oxo-1-(fenilmetil)-4-piridazinil]oxi]etil]-carbamato de
etilo,
- 25 N-(3,3,4-trifluoro-1-oxo-3-butenil)-glicina,

N-(4-clorofenil)-3-[4-(difluorometoxi)fenil]-4,5-dihidro-4-fenil-1H-pirazol-1-carboxiamida,

N-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]-N'-metil-N''-nitroguanidina,

N-metil-N'-(1-metil-2-propenil)-1,2-hidrazindicarbotioamida,

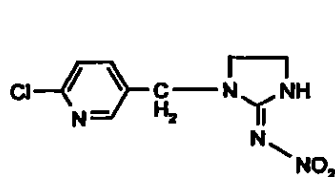
5

N-metil-N'-2-propenil-1,2-hidrazindicarbotioamida,

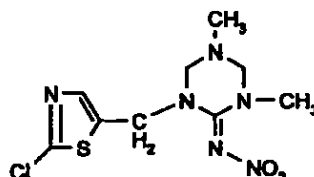
fosfoamidotoato de O,O-dietyl-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilo.

Los piretroides preferidos son ciflutrin, β -ciflutrin, flumetrin.

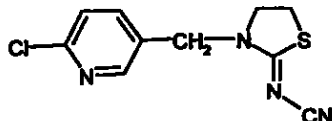
Los neonicotinoides (cloronicotinilos) preferidos son.



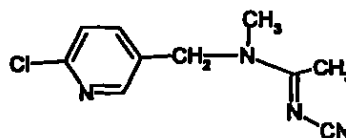
imidacloprid



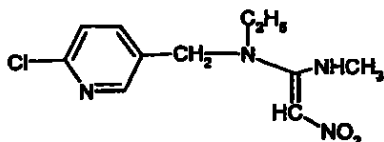
AKD 1022



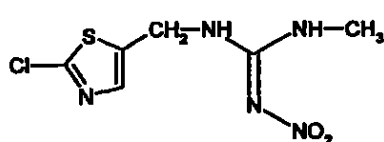
tiacloprid



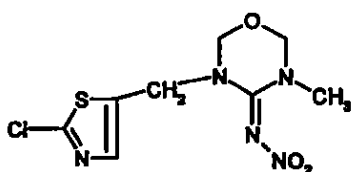
acetamiprid



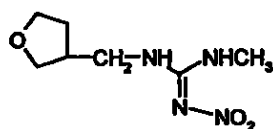
nitenpiram (Ti 304)



clotianidina (Ti 435)



tiametoxam



dinotefurano

Imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid y nitenpiram son representantes de los neonicotinoides de cloropiridina, tiametoxam, clotianidina y AKD 1022 son representantes de los neonicotinoides de clorotiazol, y dinotefurano es un representante de los neonicotinoides de tetrahidrofurano.

5 Como otro insecticida preferido es de mencionar propoxur.

Los inhibidores del crecimiento preferidos son pinproxifen, metopreno y triflumuron, que son especialmente adecuados para la administración en combinación con otro insecticida/acaricida.

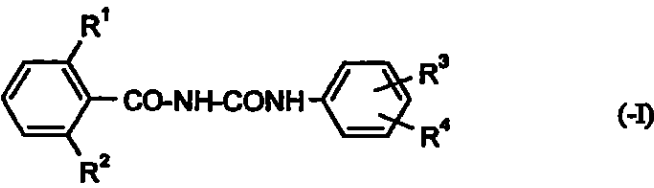
El compuesto sinérgico preferido es butóxido de piperonilo; naturalmente
10 también los compuestos sinérgicos se usan en combinación con principios activos correspondientes

El uso de los principios activos utilizados y compuestos sinérgicos mencionados es conocido en principio; véanse, por ejemplo, los documentos WO 00/02453, WO 95/33380, WO 95/07615, EP-A 569791, EP-A 0736252, EP-
15 A 470467 y EP-A 251472.

Como principios activos adicionales son de mencionar pirazoloximas y benzoilureas

En el documento EP-A-0234045, por ejemplo, al que se hace referencia expresa en esta memoria, se describen pirazoloximas adecuadas con efecto
20 insecticida y acaricida

Entre las benzoilureas se encuentran compuestos de fórmula (I):



en la que

- R¹ representa halógeno,
 R² representa hidrógeno o halógeno,
 R³ representa hidrógeno, halógeno o alquilo C₁₋₄,
 R⁴ representa halógeno, 1-5-haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, 1-5-haloalcoxi C₁₋₄,
 5 alquiltío C₁₋₄, 1-5-haloalquiltío C₁₋₄, fenoxi o piridiloxi, que, dado el caso, pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C₁₋₄, 1-5-haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, 1-5-haloalcoxi C₁₋₄, alquiltío C₁₋₄, 1-5-haloalquiltío C₁₋₄

Los compuestos mencionados pueden existir, dependiendo del patrón de sustitución, en formas estereoisoméricas que se comportan como imagen e
 10 imagen especular (enantiómeros) o bien no se comportan como imagen e imagen especular (diaestereómeros). La invención se refiere tanto a los enantiómeros o diaestereómeros como también a sus mezclas correspondientes. Los racematos, al igual que los diaestereómeros, se pueden separar de manera conocida en los componentes estereoisoméricos uniformes.

15 Determinados compuestos también pueden estar presentes en formas tautoméricas. Esto es conocido para el experto, y el alcance de la invención también comprende este tipo de compuestos.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden estar presentes, dado el caso, en forma de los isómeros *cis* y *trans*. Aún cuando se represente
 20 sólo uno de los isómeros, siempre se incluyen de acuerdo con la invención los isómeros *cis* y *trans*.

Los elementos moldeados de acuerdo con la invención son excelentemente adecuados para la realización de tratamientos externos y/o dérmicos en animales, en particular en perros, gatos y bóvidos. Normalmente
 25 presentan un grosor de 0,25 a 3,5 mm, preferentemente de 0,75 a 2,5 mm. Se

caracterizan por su excelente estabilidad al almacenamiento, de 3 a 5 años, en todas las zonas climáticas. Asimismo se caracterizan por su fácil administración, su muy buena eficacia biológica a largo plazo, habitualmente de hasta nueve meses, así como por su buena compatibilidad con el medio ambiente, en particular con el agua, y tolerabilidad en animales de sangre caliente.

Ejemplos

Ejemplo 1

Composición:

Carbamato de 2-isopropoxifenil-N-metilo (Propoxur)	10 g
Adipato de di-n-butilo	21 g
Octanoato-decanoato de propilenglicol (nombre comercial: Miglyol 840, empresa Sasol/Witten)	9 g
Aceite de semilla de soja epoxidado	2 g
Ácido esteárico	1 g
PVC	56 g
Mezcla de pigmentos	1 g

10 Preparación:

En un mezclador se mezcla la mezcla formada por carbamato de 2-isopropoxifenil-N-metilo, la mezcla de pigmentos y PVC con la mezcla de adipato de di-n-butilo, octanoato-decanoato de propilenglicol y aceite de semilla de soja epoxidado. Se mezcla con calor hasta que la mezcla es homogénea. El calentamiento fomenta la infiltración de la mezcla plastificante en el PVC. Después de distribuir homogéneamente el ácido esteárico, la mezcla se conforma mediante moldeo por inyección para dar collares.

Ejemplo 2**Composición:**

Carbamato de 2-isopropoxifenil-N-metilo	10 g
Flumetrin	2,5 g
Adipato de di-n-butilo	21 g
Octanoato-decanoato de propilenglicol	9 g
Aceite de semilla de soja epoxidado	2 g
Ácido esteárico	1 g
PVC	54 g
Mezcla de pigmentos	0,5 g

Preparación

- En un mezclador se mezcla la mezcla formada por carbamato de 2-isopropoxifenil-N-metilo, la mezcla de pigmentos y PVC con la mezcla de adipato de di-n-butilo, octanoato-decanoato de propilenglicol, aceite de semilla de soja epoxidado y flumetrin. Se mezcla con calor hasta que la mezcla es homogénea. El calentamiento fomenta la infiltración de la mezcla de principio activo/plastificante en el PVC. Después de distribuir homogéneamente el ácido esteárico, la mezcla se conforma mediante moldeo por inyección para dar collares. La misma mezcla se extruye en la extrusora para dar cintas sin fin o placas que son confeccionadas por el fabricante o usuario a una longitud adecuada para la forma de administración. A partir del producto extruido se cortan o estampan elementos moldeados que se colocan ajustadamente al animal en forma de medallón.

Ejemplo 3**Composición:**

50
40

Flumetrin	2,5 g
Adipato de di-n-butilo	21 g
Octanoato-decanoato de propilenglicol	9 g
Aceite de semilla de soja epoxidado	2 g
Ácido esteárico	1 g
PVC	64 g
Mezcla de pigmentos	0,5 g

Preparación.

En un mezclador se mezcla la mezcla formada por la mezcla de pigmentos y PVC con la mezcla de adipato de di-n-butilo, octanoato-decanoato de propilenglicol, aceite de semilla de soja epoxidado y flumetrin. Se mezcla con calor hasta que la mezcla es homogénea. El calentamiento fomenta la infiltración de la mezcla de principio activo/plastificante en el PVC. Después de distribuir homogéneamente el ácido esteárico, la mezcla se extruye para dar cintas sin fin o placas que son confeccionadas por el fabricante o usuario a una longitud adecuada para la forma de administración. A partir del producto extruido se cortan o estampan elementos moldeados que se colocan ajustadamente al animal en forma de medallón o marca orejera.

Ejemplo 4

Composición:

Imidacloprid	10 g
Flumetrin	5 g
Adipato de di-n-butilo	21 g
Octanoato-decanoato de propilenglicol	9 g
Aceite de semilla de soja epoxidado	2 g

st
41

Ácido esteárico	1 g
PVC	51 g
Mezcla de pigmentos	1 g

Preparación:

En un mezclador se mezcla la mezcla formada por imidacloprid, la mezcla de pigmentos y PVC con la mezcla de adipato de di-n-butilo, octanoato-decanoato de propilenglicol, aceite de semilla de soja epoxidado y flumetrin. Se
5 mezcla con calor hasta que la mezcla es homogénea. El calentamiento fomenta la infiltración de la mezcla de principio activo/plastificante en el PVC. Después de distribuir homogéneamente el ácido esteárico, la mezcla se conforma mediante moldeo por inyección para dar collares y medallones.

En el caso de las mezclas de pigmentos mencionadas en los ejemplos
10 se trata de una mezcla de óxidos de hierro comerciales (ejemplos 1 y 4) y de una mezcla de dióxido de titanio y óxido de hierro comerciales (ejemplos 2 y 3).

Ensayos de eficacia

Para la realización de los ensayos de eficacia frente a pulgas y garrapatas se trataron perros con collares y bóvidos con un producto extruido
15 adaptado a su tamaño corporal de acuerdo con los ejemplos 1, 2, 3 y 4. El tratamiento se llevó a cabo sujetando un elemento moldeado en forma de collar (tira con una anchura de aproximadamente 1,4 cm) alrededor del cuello de los animales. Las tiras se ajustaron al máximo posible (con un dedo de espacio) al cuello de los animales. Los medallones se perforaron y se sujetaron a un collar
20 convencional sin principio activo. El medallón se colocó de manera que estuviera en contacto con el pelaje del animal en la zona anterior del cuello.

Ejemplo A: Eficacia frente a pulgas (*Ctenocephalides felis*) en perros

Los días -4 y -1 se infestan perros con aproximadamente 100 *Ctenocephalides felis* adultos en ayunas por perro. Las pulgas se aplican en la nuca del animal.

El día 0 se comprueba el éxito de la infestación en el perro buscando pulgas en el animal despierto. Se registra el número de pulgas vivas.

Una vez contadas las pulgas se tratan los animales. Los perros del grupo control no se tratan. Los medicamentos que se han de estudiar se administran a los animales en forma de collar o medallón. Los collares y medallones permanecen en el animal hasta que finaliza el ensayo el día 170.

Se coloca sólo 1 collar o 1 medallón por animal. Se usan únicamente animales clínicamente sanos.

El día 1 y el día 2 se analizan todos los perros en cuanto a la presencia de pulgas y garrapatas vivas. Los resultados se protocolan en los datos brutos.

Los días 14, 28, 56, 84, 112, 140 y 168 se vuelven a infestar todos los perros con aproximadamente 100 *Ctenocephalides felis* adultos en ayunas por perro. Todos los perros se controlan uno y dos días después de la reinfestación en cuanto a la presencia de pulgas vivas. Los resultados se protocolan en los datos brutos.

Para el cálculo de la eficacia se usa una fórmula modificada según Abbott:

$$\% \text{ de eficacia} = \frac{\text{Ø número de pulgas en GC} - \text{Ø número de pulgas en GT}}{\text{Ø número de pulgas en GC}} \times 100$$

GC: Grupo control

GT: Grupo tratado

Con los elementos moldeados con contenido en principio activo,

preparados de acuerdo con los ejemplos de formulación 1, 2, 3 y 4 y usados en forma de collar y medallón se pueden lograr unas eficacias frente a *Ctenocephalides felis* >90% durante 5 a 6 meses.

Ejemplo B: Eficacia frente a garrapatas (*Ixodes ricinus*) en perros

5 El día -1 se sedan perros con Rompun® al 2% (Bayer AG) (0,1 ml/kg de peso corporal). Una vez sedados todos los perros (después de aproximadamente 10 a 15 minutos), éstos se trasladan a cajas de transporte y se aplican 50 *Ixodes ricinus* (25♀, 25♂) por perro en la nuca del animal. Después de aproximadamente 1 ½ horas los animales se vuelven a colocar de
10 la caja de transporte a la jaula.

El día 0 se comprueba el éxito de la infestación en el perro buscando garrapatas en el animal despierto. Se busca intensamente en la zona de la cabeza y de las orejas, incluido el pliegue orejero, en la zona de la nuca, en el hipogastrio, en la parte inferior del pecho, en el costado lateral, así como entre
15 los dedos y en las extremidades. Se registra el número de garrapatas vivas adheridas. Las garrapatas muertas se eliminan.

Una vez contadas las garrapatas se tratan los animales. Los perros del grupo control no se tratan. Los medicamentos que se han de estudiar se administran a los animales en forma de collar o medallón. Los collares y
20 medallones permanecen en el animal hasta que finaliza el ensayo el día 170. Se coloca sólo 1 collar o 1 medallón por animal. Se usan únicamente animales clínicamente sanos.

El día 1 y el día 2 se analizan todos los perros en cuanto a la presencia de garrapatas vivas y muertas adheridas. Los resultados se protocolan en los
25 datos brutos. El día 2 se eliminan del perro todas las garrapatas vivas y

muertas

Los días 14, 28, 56, 84, 112, 140 y 168 se vuelven a infestar todos los perros con 50 *Ixodes ricinus* (25♀, 25♂) por perro. Todos los perros se controlan uno y dos días después de la reinfestación en cuanto a la presencia de garrapatas vivas y muertas adheridas. Los resultados se protocolan en los datos brutos. El 2º día después de la reinfestación se eliminan del perro todas las garrapatas vivas y muertas.

Para el cálculo de la eficacia se usa una fórmula modificada según Abbott.

$$10 \quad \% \text{ de eficacia} = \frac{\text{Ø número de garrapatas en GC} - \text{Ø número de garrapatas en GT}}{\text{Ø número de garrapatas en GC}} \times 100$$

GC: Grupo control

GT: Grupo tratado

Con los elementos moldeados con contenido en principio activo, preparados de acuerdo con los ejemplos de formulación 1, 2, 3 y 4 y usados en forma de collar y medallón se pueden lograr unas eficacias frente a *Ixodes ricinus* >90% durante 5 a 6 meses

Ejemplo C: Eficacia frente a la garrapata australiana (*Ixodes holocyclus*) en bóvidos

El día -1 se sedan bóvidos con Rompun® al 2% (Bayer AG) (0,1 ml/kg de peso corporal). Una vez sedados todos los bóvidos (después de aproximadamente 10 a 15 minutos) se aplican 10 *Ixodes holocyclus* (5♀, 5♂) por bóvido en la nuca del animal.

El día 0 se comprueba el éxito de la infestación en el bóvido buscando garrapatas en el animal despierto. Se busca intensamente en la zona de la cabeza y de las orejas, incluido el pliegue orejero, en la zona de la nuca, en el

hipogastrio, en la parte inferior del pecho, en el costado lateral, así como entre los dedos y en las extremidades. Se registra el número de garrapatas vivas adheridas. Las garrapatas muertas se eliminan.

Una vez contadas las garrapatas se tratan los animales. Los bóvidos del grupo control no se tratan. Los medicamentos que se han de estudiar se administran a los animales en forma de collar. Los collares permanecen en el animal hasta que finaliza el ensayo el día 170. Se coloca sólo 1 collar por animal. Se usan únicamente animales clínicamente sanos.

El día 1 y el día 2 se analizan todos los bóvidos en cuanto a la presencia de garrapatas vivas y muertas adheridas. Los resultados se protocolan en los datos brutos. El día 2 se eliminan del bóvido todas las garrapatas vivas y muertas.

Los días 14, 28, 56, 84, 112, 140 y 168 se vuelven a infestar todos los bóvidos con 50 *Ixodes holocyclus* (5♀, 5♂) por bóvido. Todos los bóvidos se controlan uno y dos días después de la reinfestación en cuanto a la presencia de garrapatas vivas y muertas adheridas. Los resultados se protocolan en los datos brutos. El 2º día después de la reinfestación se eliminan del bóvido todas las garrapatas vivas y muertas.

Para el cálculo de la eficacia se usa una fórmula modificada según Abbott:

$$\% \text{ de eficacia} = \frac{\text{Ø número de garrapatas en GC} - \text{Ø número de garrapatas en GT}}{\text{Ø número de garrapatas en GC}} \times 100$$

GC: Grupo control

GT. Grupo tratado

Con los elementos moldeados con contenido en principio activo, preparados de acuerdo con los ejemplos de formulación 1, 2, 3 y 4 y usados en

forma de collar se pueden lograr unas eficacias frente a *Ixodes holocyclus*
>90% durante 5 a 6 meses

,

47

Habiendo descrito la invención como antecede se declara como propiedad lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES

- 5 1 Elementos moldeados sólidos para uso externo contra parásitos en animales, que están basados en una matriz de poliolefina que contienen
- uno o varios ésteres de un alcohol di- o trifuncional con hasta tres átomos de carbono con ácidos grasos con 6 a 18 átomos de carbono,
 - uno o varios principios activos,
- 10 - así como, dado el caso, coadyuvantes y aditivos adicionales.
2. Elementos moldeados sólidos de acuerdo con la reivindicación 1 basados en una matriz de resina de polivinilo.
- 15 3 Elementos moldeados sólidos de acuerdo con la reivindicación 1 basados en una matriz de poli(cloruro de vinilo).
4. Elementos moldeados sólidos de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes que contienen uno o varios ésteres de etilenglicol,
- 20 de propilenglicol o de glicerol con ácidos grasos con 6 a 18 átomos de carbono.
5. Elementos moldeados de acuerdo con la reivindicación 4 que contienen un glicérido de los ácidos caprílico y cáprico y/o dicaprilato y dicaprato de propilenglicol.

6. Uso de los elementos moldeados sólidos de acuerdo con la reivindicación 1 para combatir parásitos en animales por vía dérmica.

ELEMENTOS MOLDEADOS SÓLIDOS CON CONTENIDO EN PRINCIPIO**ACTIVO PARA USO EXTERNO CONTRA PARÁSITOS EN ANIMALES****Resumen**

5 Elementos moldeados sólidos para uso externo contra parásitos en animales, que están basados en una matriz de poliolefina que contienen: uno o varios ésteres de un alcohol di- o trifuncional con hasta tres átomos de carbono con ácidos grasos con 6 a 18 átomos de carbono, uno o varios principios activos, así como, dado el caso, otros coadyuvantes y aditivos.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/006465

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A01N25/34 A01N47/22 A01N53/00 A01N51/00
/(A01N53/00,51:00,47:22,25:34),(A01N51/00,25:34),(A01N47/22,25:34)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 - A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
X	DE 25 19 126 A1 (DICK, PIERRE RICHARD GEORGES; ROMBI, MAX) 20 November 1975 (1975-11-20)	1-4, 6
Y	page 2, paragraph 1 page 3, paragraph 2 - paragraph 3 page 5, paragraphs 2, 4	1-6
Y	US 4 536 388 A (PEARCE, III ET AL) 20 August 1985 (1985-08-20) abstract page 6, paragraph 1 - paragraph 2	1-6
Y	FR 2 746 585 A (RHONE MERIEUX) 3 October 1997 (1997-10-03) abstract column 2, line 46 - line 49	1-6
-/-		

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

25 October 2005

Date of mailing of the international search report

31/10/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Molina de Alba, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/006465

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE 2519126	A1	20-11-1975	AU 8085175 A CA 1017946 A1 GB 1475466 A	11-11-1976 27-09-1977 01-06-1977
US 4536388	A	20-08-1985	NONE	-
FR 2746585	A	03-10-1997	ZA 9702542 A	25-09-1998
WO 0249436	A	27-06-2002	AU 2194602 A DE 10063864 A1	01-07-2002 27-06-2002
EP 0537998	A	21-04-1993	AT 147621 T AU 656815 B2 AU 2701792 A CA 2080574 A1 DE 69216755 D1 DE 69216755 T2 FI 924640 A JP 2649002 B2 JP 5194187 A NO 923986 A US 5411737 A ZA 9207908 A	15-02-1997 16-02-1995 22-04-1993 16-04-1993 27-02-1997 24-07-1997 16-04-1993 03-09-1997 03-08-1993 16-04-1993 02-05-1995 14-07-1993
US 6001382	A	14-12-1999	AT 301395 T AU 689716 B2 AU 5364096 A CA 2215377 A1 DE 69635045 D1 EP 0814659 A1 JP 11502229 T WO 9628973 A1 US RE37890 E1 US 5858384 A US 5902596 A US 5846553 A US 5858386 A US 5885605 A	15-08-2005 02-04-1998 08-10-1996 26-09-1996 15-09-2005 07-01-1998 23-02-1999 26-09-1996 22-10-2002 12-01-1999 11-05-1999 08-12-1998 12-01-1999 23-03-1999

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/006465

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
Y	WO 02/49436 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; SIRINYAN, KIRKOR; HANSEN, OLAF; TURBERG, AND) 27 June 2002 (2002-06-27) abstract page 9, line 13 - line 28	1-6
Y	EP 0 537 998 A (MERCK & CO. INC; MERCK & CO., INC) 21 April 1993 (1993-04-21) abstract page 3, line 30 - line 35 page 3, line 52 - line 56	1-6
Y	US 6 001 382 A (LEVY ET AL) 14 December 1999 (1999-12-14) abstract column 11, line 13 - column 15, line 32	1-6

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/006465

A KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 A01N25/34 A01N47/22 A01N53/00 A01N51/00
//(A01N53/00,51:00,47:22,25:34),(A01N51/00,25:34),(A01N47/22,25:34)

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B RESEARCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitrag Anspruch Nr.
X	DE 25 19 126 A1 (DICK, PIERRE RICHARD GEORGES; ROMBI, MAX) 20. November 1975 (1975-11-20)	1-4, 6
Y	Seite 2, Absatz 1 Seite 3, Absatz 2 - Absatz 3 Seite 5, Absätze 2, 4	1-6
Y	US 4 536 388 A (PEARCE, III ET AL) 20. August 1985 (1985-08-20) Zusammenfassung Seite 6, Absatz 1 - Absatz 2	1-6
Y	FR 2 746 585 A (RHONE MERIEUX) 3. Oktober 1997 (1997-10-03) Zusammenfassung Spalte 2, Zeile 46 - Zeile 49	1-6
	-/-	



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E Älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann nahelegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

25. Oktober 2005

Abschließdatum des internationalen Recherchenberichts

31/10/2005

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentkanal 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Molina de Alba, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/006465

C (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beiz. Anspruch Nr.
Y	WO 02/49436 A (BAYER AKTIENGESellschaft; SIRINYAN, KIRKOR; HANSEN, OLAF; TURBERG, AND) 27. Juni 2002 (2002-06-27) Zusammenfassung Seite 9, Zeile 13 - Zeile 28	1-6
Y	EP 0 537 998 A (MERCK & CO. INC; MERCK & CO., INC) 21. April 1993 (1993-04-21) Zusammenfassung Seite 3, Zeile 30 - Zeile 35 Seite 3, Zeile 52 - Zeile 56	1-6
Y	US 6 001 382 A (LEVY ET AL) 14. Dezember 1999 (1999-12-14) Zusammenfassung Spalte 11, Zeile 13 - Spalte 15, Zeile 32	1-6

INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abdruckzeichen

PCT/EP2005/006465

53

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
DE 2519126	A1	20-11-1975	AU 8085175 A CA 1017946 A1 GB 1475466 A	11-11-1976 27-09-1977 01-06-1977
US 4536388	A	20-08-1985	KEINE	
FR 2746585	A	03-10-1997	ZA 9702542 A	25-09-1998
WO 0249436	A	27-06-2002	AU 2194602 A DE 10063864 A1	01-07-2002 27-06-2002
EP 0537998	A	21-04-1993	AT 147621 T AU 656815 B2 AU 2701792 A CA 2080574 A1 DE 69216755 D1 DE 69216755 T2 FI 924640 A JP 2649002 B2 JP 5194187 A NO 923986 A US 5411737 A ZA 9207908 A	15-02-1997 16-02-1995 22-04-1993 16-04-1993 27-02-1997 24-07-1997 16-04-1993 03-09-1997 03-08-1993 16-04-1993 02-05-1995 14-07-1993
US 6001382	A	14-12-1999	AT 301395 T AU 689716 B2 AU 5364096 A CA 2215377 A1 DE 69635045 D1 EP 0814659 A1 JP 11502229 T WO 9628973 A1 US RE37890 E1 US 5858384 A US 5902596 A US 5846553 A US 5858386 A US 5885605 A	15-08-2005 02-04-1998 08-10-1996 26-09-1996 15-09-2005 07-01-1998 23-02-1999 26-09-1996 22-10-2002 12-01-1999 11-05-1999 08-12-1998 12-01-1999 23-03-1999

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCTd3		
(21) N° de solicitud 22) Fecha de solicitud. (30) Prioridad (31) No. Prioridad (32) Fecha (33) País 102004031325.3 29/06/04 DE		(51) Int Cl (71) Solicitante(s) (72) Inventor(es) (74) Apoderado. A01N 025/034 BAYER HEALTHCARE AG KIRKOR SIRINYAN REINHOLD LÖHR EMILIO FERRERO
(85) Fecha límite inicio fase nacional (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud No de solicitud PCT/EP2005/006465 29/01/2007 16/06/2005		(87) Publicación internacional Fecha N° publicación. 05/01/2006 WO 2006/000335 A1
(54) Título ELEMENTOS MOLDEADOS SÓLIDOS CON CONTENIDO EN PRINCIPIO ACTIVO PARA USO EXTERNO CONTRA PARÁSITOS EN ANIMALES.		

REIVINDICACIONES

- 1
- Elementos moldeados sólidos para uso externo contra parásitos en animales, que están basados en una matriz de poliolefina que contienen
- uno o varios ésteres de un alcohol di- o trifuncional con hasta tres átomos de carbono con ácidos grasos con 6 a 18 átomos de carbono,

- uno o varios principios activos,

- así como, dado el caso, coadyuvantes y aditivos adicionales
- 2
- Elementos moldeados sólidos de acuerdo con la reivindicación 1 basados en una matriz de resina de polivinilo
3.
- Elementos moldeados sólidos de acuerdo con la reivindicación 1 basados en una matriz de poli(cloruro de vinilo)
- 4
- Elementos moldeados sólidos de acuerdo con

una de las reivindicaciones precedentes que contienen uno o varios ésteres de etilenglicol, de propilenglicol o de glicerol con ácidos grasos con 6 a 18 átomos de carbono.

5. Elementos moldeados de acuerdo con la reivindicación 4 que contienen un glicéndo de los ácidos caprílico y cáprico y/o dicaprilato y dicaprato de propilenglicol

55

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 08-128575-00000-0000
Fec 2008-12-22 11:30:00 Dep. 2020 NUEVECELEACIONES
Lib. 11 PATENTE
Evo: 3/8 FASENACIONAL
Act 411 PRESENTACION Fotos: 55

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 89,332
FECHA : NOVIEMBRE 21 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	59936392	21/11/2006	33,115,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	1
		TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
		TOTAL :	\$ 463,000.00

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO 14033 841 031 3

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

PATENTE DE INVENCION

[☒]

MODELO DE UTILIDAD []

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente [☒]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [☒]
- ◆ Descripción de la invención [☒]
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas [☒]

COMPLETA [☒]

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA [☒]

INCOMPLETA []

Firma Responsable 

Fecha _____

Carrera 13 No 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

57

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Bogotá,
2020

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER HEALTHCARE AG.

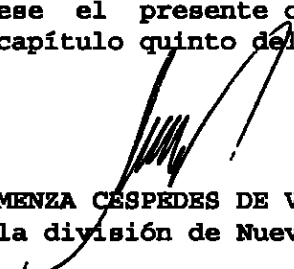
REFERENCIA	Radicación No.	06 128575
	Solicitud internacional	PCT/EP2005/006465
	Fecha inicio fase nacional	29/01/2007
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	872

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 26 ENE. 2007
adpa10