INSTITUTO NACIONAL
DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL

(11) *Número de Publicação:* **PT 877598 E**

(51) *Classificação Internacional:* (Ed. 6)
A61K009/00 A A01N025/00 B
A23L001/0522 B

(12) *FASCÍCULO DE PATENTE DE INVENÇÃO*

(22) *Data de depósito:* 1997.01.03

(30) *Prioridade:* 1996.01.16 DE 19601263

(43) *Data de publicação do pedido:*
1998.11.18

(45) *Data e BPI da concessão:*
2001.06.15

(73) *Titular(es):*
BAYER AG
- 51368 LEVERKUSEN DE

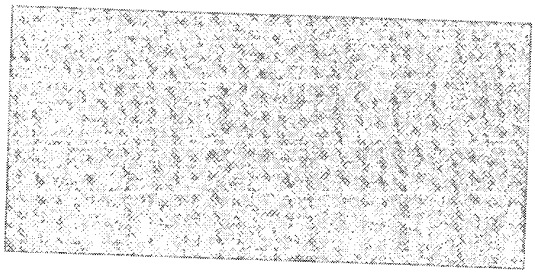
(72) *Inventor(es):*
JOCHEN KALBE DE
HELMUT SCHNABEL DE

(74) *Mandatário(s):*
MARIA SILVINA VIEIRA PEREIRA FERREIRA
RUA CASTILHO 50, 5º AND. 1269-163 LISBOA PT

(54) *Epígrafe:* PASTAS ANTI-HELMÍNTICAS

(57) *Resumo:*

PASTAS ANTI-HELMÍTICAS



DESCRIÇÃO

"PASTAS ANTI-HELMÍNTICAS"

A presente invenção diz respeito a pastas anti-helmínticas para cavalos, cães e gatos, com base em derivados de hexa-hidropirazina.

As pastas contendo praziquantel são conhecidas da EP-A 279 343. Contudo, a desvantagem destas pastas é o seu elevado teor de água. As pastas têm, por conseguinte, de ser protegidas de ataques de bactérias patogénicas, por meio de agentes conservantes. Do mesmo modo, a mistura homogénea das substâncias activas, dificilmente solúveis em água, causa frequentemente dificuldades.

A presente invenção diz respeito a pastas anti-helmínticas para cavalos, cães e gatos, com base em derivados de hexa-hidropirazina, que são caracterizadas pelo facto de, para além da substância activa, conterem amido de milho e glicerina, como substâncias auxiliares para a formação da pasta.

Trata-se de uma formulação que

1. apenas é constituída por poucos componentes,

2. é constituída por componentes económicos,

3. subsiste sem conservantes especiais,

4. é de fácil preparação.

Preferidas são as misturas de acordo com a invenção que, como derivados de hexa-hidropirazina, contêm praziquantel e epsiprantel. Especialmente preferido é o praziquantel.

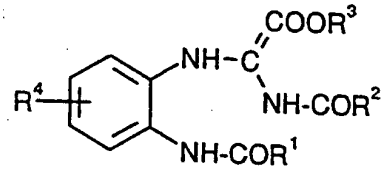
Nas formulações de acordo com a invenção, a substância activa está presente numa concentração por peso de 5 a 30%, preferencialmente de 10 a 20%.

Nas formulações de acordo com a invenção, o amido de milho está presente numa concentração por peso de 10 a 30%, preferencialmente de 15 a 25%.

Nas formulações de acordo com a invenção, a glicerina está presente numa concentração por peso de 40 a 80%, de preferência, de 55 a 75%. Os componentes individualmente completam-se para 100%. A relação de amido de milho para glicerina é escolhida, de forma a que resulte uma formulação que possa ser facilmente processada, embalada e capaz de ser aplicada.

As formulações de acordo com a invenção podem, para além, das hexa-hidropirazinonas, conter outras substâncias activas. Para estas contam fenilguanidinas, benzimidazóis ou tetra-hidropirimidinas.

Como fenilguanidinas são mencionadas aquelas de fórmula (I):



(I)

na qual

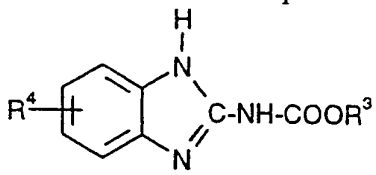
R^1 representa hidrogénio, alquilo, cicloalquilo, alcoxi, arilo ou amino, eventualmente substituído,

R^2 representa hidrogénio, alquilo, cicloalquilo, alcenilo, alcinilo, arilo, alcoxi, alcenoxi, eventualmente substituído,

R^3 representa hidrogénio alquilo, cicloalquilo, alcenilo, alcinilo, arilo, eventualmente substituído,

R^4 representa alquilo, alcoxi, fenoxi, alquiltio, feniltio, fenilsulfinilo, fenilsulfonilo, benzoilo, que eventualmente são substituídos por halogéneo, alcoxi, alquiltio, halogenalcoxi, halogenalquiltio.

Como benzimidazóis são mencionados aqueles de fórmula (II):

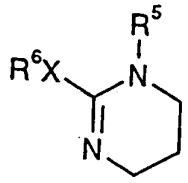


(II)

na qual

R^3 e R^4 possuem o significado indicado para os compostos de fórmula (I).

Como tetra-hidropirimidinas são mencionadas aquelas de fórmula (III):



(III)

na qual

R^3 representa hidrogénio ou alquilo,

R^6 representa fenilo ou tienilo eventualmente substituído,

X representa $-(CH_2)_{2-3}$-, -CH=CH-.

Às fenilguanidinas pertencem, por exemplo, febantel, netobimina.

Aos benzimidazóis pertencem, por exemplo, fenbendazol, albendazol, oxibendazol, oxfendazol, mebendazol, flubendazol, parbendazol, luxabendazol.

Às tetra-hidropirimidinas pertencem, por exemplo, pirantel, morantel, oxantel.

As pastas de acordo com a invenção, são apropriadas, com uma toxicidade para animais de sangue quente favorável, para o combate a endoparasitas patogénicos, que surgem na manutenção e criação de cavalos. Assim, são eficazes contra todos os estádios de desenvolvimento dos parasitas ou contra um em particular, bem como contra espécies

resistentes e normalmente sensíveis. Entre os endoparasitas patogénicos contam-se Cestodas, Trematodas, Nematodas, Acantocefalos, em especial:

Da ordem dos *Pseudophyllidea*, por exemplo: *Diphyllobothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp..

Da ordem dos *Cyclophyllidae*, por exemplo: *Mesocestoides* spp., *Anoplocephala* spp., *Paranoplocephala* spp., *Moniezia* spp., *Taenia* spp., *Echinococcus* spp., *Hydatigera* spp., *Diorchis* spp., *Dipylidium* spp., *Joyeuxiella* spp., *Spyrometra* spp..

Da subclasse dos *Digenea*, por exemplo: *Schistosoma* spp., *Fasciola* spp., *Dicrocoelium* spp., *Opisthorchis* spp..

Da ordem dos *Enoplida*, por exemplo: *Trichuris* spp., *Capillaria* spp., *Trichinella* spp..

Da ordem dos *Rhabditia*, por exemplo: *Micronema* spp., *Strongyloides* spp..

Da ordem dos *Strongylida*, por exemplo: *Stronylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Poteriostomum* spp., *Cyclicocyclus* spp., *Stephanurus* spp., *Ancyclostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Cyathostomum* spp., *Metastrongylus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Marshallagia* spp., *Hyostrongylus* spp., *Ollulanus* spp., *Craterostomum* spp., *Cyclicodontophorus* spp., *Hyalocephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Caballonema* spp., *Elaeophorus* spp., *Dirofilaria* spp., *Onchocerca* spp., *Setaria* spp..

Da ordem dos *Oxyrida*, por exemplo: *Oxyuris* spp., *Enterobius* spp..

Da ordem dos *Ascaridia*, por exemplo, *Ascaris* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Parascaris* spp., *Probstmangria* spp..

Da ordem dos *Spirurida*, por exemplo: *Thelazia* spp., *Habronema* spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp..

A utilização pode ocorrer quer a nível profilático, quer a nível terapêutico.

A concentração de utilização preferida da mistura de acordo com a invenção é, por kg de peso corporal, de 1 a 300 mg, preferencialmente de 5 a 50 mg de hexa-hidropirazina.

Outras substâncias activas anti-helmínticas podem ser adicionadas, numa quantidade de utilização de 0,1 a 20 mg, de preferência 1 a 10 mg, com especial preferência de aproximadamente 5 mg por kg.

Exemplo 1

Pastas para aplicação oral ou para misturar com a comida para animais

Composição:

Praziquantel	20,0 g
Amido de milho	15,0 g
Glicerina	65,0 g

Preparação:

Os componentes são misturados. Resulta uma pasta que pode ser enchida em aplicadores correspondentes.

Lisboa, 14 AGO. 2001

Dra. Maria Silvina Ferreira
Agente Oficial ... Industrial
R. Co... 1... LISBOA
Telefs. 213 851 359 - 21 381 50 50

REIVINDICAÇÕES

1. Pastas anti-helmínticas para cavalos, cães e gatos com base em derivados de hexa-hidropirazina, caracterizadas pelo facto de, para além da substância activa, conterem amido de milho e glicerina, como substâncias auxiliares para a formação da pasta.

2. Pastas anti-helmínticas para cavalos, cães e gatos, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas pelo facto de, a substância activa estar presente numa concentração por peso de 5 a 30%, o amido de milho numa concentração por peso de 10 a 30%, a glicerina numa concentração por peso de 40 a 80%.

Lisboa, 14 AGO. 2001

Dra. Maria Silvina Ferreira
Agente Oficial ... de Industrial
R. Castilho, 50 - ... - 1250 LISBOA
Telefs. 213 851 359 - 213 815 050