



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 117547530 A

(43) 申请公布日 2024. 02. 13

(21) 申请号 202311565322.6

(22) 申请日 2023.11.22

(71) 申请人 江西博莱大药厂有限公司

地址 332000 江西省九江市柴桑区庐山东
路12号

(72) 发明人 王贤卓 胡国彬 陈俞庆 陈齐杰
肖兴丽 姜恒 李艳梅 朱迎

(74) 专利代理机构 南京上止正知识产权代理事
务所(普通合伙) 32758

专利代理师 陈国强

(51) Int. Cl.

A61K 31/42 (2006.01)

A61K 9/12 (2006.01)

A61P 33/14 (2006.01)

A61P 37/08 (2006.01)

权利要求书1页 说明书5页

(54) 发明名称

一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂及其制备方法
和应用

(57) 摘要

本发明提供了一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂及其制备方法和应用,所述氟雷拉纳喷雾剂包括氟雷拉纳、有机溶剂、抗氧化剂、透皮剂和驱味剂;所述抗氧化剂包括BHT、BHA和没食子酸丙酯中的一种或多种;所述透皮剂包括碳酸丙烯酯、二乙二醇单乙醚和肉豆蔻酸异丙酯中的一种或多种;所述驱味剂包括芬多精精油、柠檬精油和檀香精油中的一种或多种;有机溶剂较好溶解氟雷拉纳,与抗氧化剂形成良好的溶液稳定性,增加产品保质期;合适的透皮剂能够促进提高药物快速吸收,减少使用量;本发明成分简单安全,促进广泛使用,对环境污染危害大大降低,添加天然提取精油,能够驱赶宠物异味。

1. 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,其特征在于:所述氟雷拉纳喷雾剂包括氟雷拉纳、有机溶剂、抗氧化剂、透皮剂和驱味剂;所述抗氧化剂包括BHT、BHA和没食子酸丙酯中的一种或多种;所述透皮剂包括碳酸丙烯酯、二乙二醇单乙醚和肉豆蔻酸异丙酯中的一种或多种;所述驱味剂包括芬多精精油、柠檬精油和檀香精油中的一种或多种。

2. 根据权利要求1所述的一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,其特征在于:以所述氟雷拉纳喷雾剂的体积为1L计,所述氟雷拉纳5-25g/L,所述抗氧化剂0.1-0.5g/L;透皮剂25-125g/L和驱味剂50-100g/L,所述有机溶剂补齐到1L。

3. 根据权利要求1所述的一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,其特征在于:所述有机溶剂包括乙醇、苯甲醇和异丙醇中的至少一种。

4. 根据权利要求1所述的一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,其特征在于:所述氟雷拉纳0.5-2.5g,所述抗氧化剂0.01-0.05g;透皮剂2.5-12.5g和驱味剂5-10g,所述有机溶剂补齐到100ml。

5. 根据权利要求1所述的一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,其特征在于:所述氟雷拉纳1g,所述抗氧化剂0.03g;透皮剂7.5g和驱味剂7.5g,所述有机溶剂补齐到100ml。

6. 根据权利要求1-5任一项所述氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂的制备方法,其特征在于:所述制备方法包括如下步骤:步骤一、移取适量的有机溶剂至于干净的玻璃容器,称取适量的氟雷拉纳原料药逐步加入,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

步骤二、依次称取适量的抗氧化剂、透皮剂、驱味剂,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

步骤三、冷却至室温,再移取有机溶剂定容,超声溶解,即得所述氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂。

7. 根据权利要求1-5任一项所述的氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂在治疗犬体表的跳蚤和蜱感染,辅助治疗因跳蚤引起的过敏性皮炎的应用。

一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂及其制备方法和应用

技术领域

[0001] 本发明涉及杀虫剂制备技术领域,具体为一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂及其制备方法和应用。

背景技术

[0002] 氟雷拉纳(Fluralaner)属于异噁唑啉类杀虫剂,最早是应用于农业杀虫,近年来被国内外研究者关注并开发制备成新型宠物驱体外寄生虫长效药。对 γ -氨基丁酸(GABA-)和谷氨酸门控的氯通道具有活性,对蜱虫、跳蚤、螨虫等寄生虫的抗虫效果良好,并且对哺乳动物无明显的毒性影响。具有高亲脂性、易吸收、中度至高度分布、清除率低和半衰期长的药代特征,并具有一定的长效性,且药物在动物体内的吸收、分布、代谢和消除存种间差异。

[0003] 专利申请号:CN202210137143.1,发明名称:氟雷拉纳软咀嚼组合物、软咀嚼片及其制备方法与应用,本发明用于犬口服外部驱虫,成分包括氟雷拉纳、玉米淀粉、大豆蛋白粉、鸡肝粉、羟丙基纤维素、聚乙二醇3350、聚乙二醇15羟基硬脂酸酯、甘油、大豆油。氟雷拉纳软咀嚼组合物,特别是软咀嚼片,性质稳定,临床应用广泛,但不能满足所有犬类适口性,成分复杂,成本较高,还可引起呕吐、食欲下降、肠胃胀气等不良反应。

[0004] 专利申请号:CN202310791213.X,发明名称:一种氟雷拉纳组合物,本发明可实现氟雷拉纳做成注射剂,并且在给药的同时补铁,提高免疫力,成分包括有葡庚糖酐铁溶液和氟雷拉纳,存在注射不便,不利于使用。

[0005] 专利申请号:202111631718.7,发明名称:一种氟雷拉纳杀虫剂及其制备方法和应用,本发明包括氟雷拉纳、助溶剂、复合稀释剂和有机溶剂,稳定性、水溶性良好,适合大生产,但存在溶液使用量大,用后产生废液对环境污染大。

[0006] 专利申请号:202010850355.5,发明名称:一种复方氟雷拉纳混悬液及其制备和应用,本发明每100ml复方氟雷拉纳混悬液中含有氟雷拉纳0.5-5g、吡喹酮0.05-2g、吐温80 5-30g、乙醇2-15ml、二甲基亚砜10-50g、余量为水,有效解决了氟雷拉纳溶于水后的稳定性,扩大了氟雷拉纳的驱虫谱,但复方制剂不适用所有客户,跟溶液剂型一样存在污染环境的问题。

[0007] 目前上市获批的氟雷拉纳产品来自英特威国际有限公司,剂型包括咀嚼片、滴剂、溶液。上市产品存在售价高,使用剂量大等系列问题。国内极少数企业掌握产品制剂技术,局限于原料厂家的剂型。

发明内容

[0008] 本发明提供一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂及其制备方法和应用,旨在解决上述背景技术提出的问题。

[0009] 本发明是这样实现的,一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,所述氟雷拉纳喷雾剂包括氟雷拉纳、有机溶剂、抗氧化剂、透皮剂和驱味剂;所述抗氧化剂包括BHT、BHA和没食子酸丙

酯中的一种或多种;所述透皮剂包括碳酸丙烯酯、二乙二醇单乙醚和肉豆蔻酸异丙酯中的一种或多种;所述驱味剂包括芬多精精油、柠檬精油和檀香精油中的一种或多种。

[0010] 优选的,以所述氟雷拉纳喷雾剂的体积为1L计,所述氟雷拉纳5-25g/L,所述抗氧化剂0.1-0.5g/L;透皮剂25-125g/L和驱味剂50-100g/L,所述有机溶剂补齐到1L。

[0011] 优选的,所述有机溶剂包括乙醇、苯甲醇和异丙醇中的至少一种。

[0012] 优选的,所述氟雷拉纳0.5-2.5g,所述抗氧化剂0.01-0.05g;透皮剂2.5-12.5g和驱味剂5-10g,所述有机溶剂补齐到100ml。

[0013] 优选的,所述氟雷拉纳1g,所述抗氧化剂0.03g;透皮剂7.5g和驱味剂7.5g,所述有机溶剂补齐到100ml。

[0014] 优先的,所述制备方法包括如下步骤:步骤一、移取适量的有机溶剂至于干净的玻璃容器,称取适量的氟雷拉纳原料药逐步加入,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

[0015] 步骤二、依次称取适量的抗氧化剂、透皮剂、驱味剂,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

[0016] 步骤三、冷却至室温,再移取有机溶剂定容,超声溶解,即得所述氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂。

[0017] 由于采用上述方案,本发明的有益效果是:有机溶剂较好溶解氟雷拉纳,与抗氧化剂形成良好的溶液稳定性,增加产品保质期;合适的透皮剂能够促进提高药物快速吸收,减少使用量;本发明成分简单安全,促进广泛使用,对环境污染危害大大降低,添加天然精油,能够驱赶宠物异味。

具体实施方式

[0018] 为了使本发明的目的、技术方案及优点更加清楚明白,以下结合实施例,对本发明进行进一步详细说明。应当理解,此处所描述的具体实施例仅仅用以解释本发明,并不用于限定本发明。

[0019] 氟雷拉纳喷雾剂包括氟雷拉纳、有机溶剂、抗氧化剂、透皮剂和驱味剂;所述抗氧化剂包括BHT、BHA和没食子酸丙酯中的一种或多种;所述透皮剂包括碳酸丙烯酯、二乙二醇单乙醚和肉豆蔻酸异丙酯中的一种或多种;所述驱味剂包括芬多精精油、柠檬精油和檀香精油中的一种或多种。

[0020] 实施例1

[0021] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳0.5g、BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油5g,乙醇补齐至100ml。

[0022] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳0.5g,,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

[0023] (2) 称取BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油5g;

[0024] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

[0025] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。

[0026] 实施例2

[0027] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳0.5g、BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油6g,乙醇补齐至100ml。

[0028] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳0.5g,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

- [0029] (2) 称取BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油6g;
- [0030] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0031] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。
- [0032] 实施例3
- [0033] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳0.5g、BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油7g,乙醇补齐至100ml。
- [0034] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳0.5g,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0035] (2) 称取BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油7g;
- [0036] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0037] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。
- [0038] 实施例4
- [0039] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳0.5g、BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油8g,乙醇补齐至100ml。
- [0040] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳0.5g,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0041] (2) 称取BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油8g;
- [0042] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0043] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。
- [0044] 实施例5
- [0045] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳0.5g、BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油9g,乙醇补齐至100ml。
- [0046] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳0.5g,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0047] (2) 称取BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油9g;
- [0048] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0049] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。
- [0050] 实施例6
- [0051] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳0.5g、BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油10g,乙醇补齐至100ml。
- [0052] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳0.5g,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0053] (2) 称取BHT 0.01g、碳酸丙烯酯2.5g、芬多精精油10g;
- [0054] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0055] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。
- [0056] 实施例7
- [0057] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳1g、BHT 0.03g、碳酸丙烯酯7.5g、芬多精精油7.5g,乙醇补齐至100ml。
- [0058] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳1g,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0059] (2) 称取BHT 0.03g、碳酸丙烯酯7.5g、芬多精精油7.5g;
- [0060] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;
- [0061] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。
- [0062] 实施例8

[0063] 一种氟雷拉纳杀虫驱味喷雾剂,组成为氟雷拉纳2.5g、BHT 0.05g、碳酸丙烯酯12.5g、芬多精精油10g,乙醇补齐至100ml。

[0064] (1) 移取少量乙醇,加入氟雷拉纳2.5g,于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

[0065] (2) 称取BHT 0.05g、碳酸丙烯酯12.5g、芬多精精油10g;

[0066] (3) 将(2)加入(1),再加入适量乙醇于60℃水浴加热溶解,快速搅拌均匀;

[0067] (4) 冷却至室温,再用乙醇定容至100ml。

[0068] 稳定性试验

[0069] 1、长期试验

[0070] 将本发明实施例1-8制备的溶液,放置在常温条件6个月,取样测定主含量及杂质,观察性状。

实施例	主含量 (%)		总杂质 (%)		性状	
	0 天	6 个月	0 天	6 个月	0 天	6 个月
1	100	98	0.021	0.025	无色澄明液体	无色澄明液体
2	101	99	0.025	0.031	无色澄明液体	无色澄明液体
3	99	96	0.026	0.032	无色澄明液体	无色澄明液体
4	98	97	0.031	0.035	无色澄明液体	无色澄明液体
5	102	100	0.035	0.041	无色澄明液体	无色澄明液体
6	103	102	0.029	0.030	无色澄明液体	无色澄明液体
7	100	99	0.021	0.023	无色澄明液体	无色澄明液体
8	98	95	0.027	0.030	无色澄明液体	无色澄明液体

[0072] 2、高温试验

[0073] 将本发明实施例1-8制备的溶液,在40℃条件下放置10天,分别于当天、5天、10天,检测相关指标:

实施例	主含量 (%)			总杂质 (%)			性状		
	0 天	5 天	10 天	0 天	5 天	10 天	0 天	5 天	10 天
1	100	100	99	0.021	0.021	0.022	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体
2	101	101	100	0.025	0.025	0.026	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体
3	99	99	99	0.026	0.026	0.027	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体
4	98	98	97	0.031	0.031	0.032	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体
5	102	102	102	0.035	0.036	0.037	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体
6	103	103	102	0.029	0.029	0.031	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体
7	100	100	100	0.021	0.021	0.021	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体
8	98	98	97	0.027	0.027	0.028	无色澄明液体	无色澄明液体	无色澄明液体

[0075] 3. 药效评价

[0076] 在江西省九江市某流浪狗基地,选取自然感染病例32只(每实施例4只),用于药效评价。本发明药效评价以皮肤(或耳部)中体外寄生虫数量变化指标和临床症状为判断标准。依次检查每只犬的外寄生虫数(及虫卵数),计算虫体(虫卵)减少率,按如下原则判断各组的药效:

[0077] 1. 有效:用药结束后,皮肤(或耳部)的体外寄生虫(及虫卵)数量平均减少率>90%,患部无瘙痒,无红疹、皮屑或试验动物自我啃咬的损伤。

[0078] 2. 无效:用药结束后,皮肤(或耳部)的体外寄生虫(及虫)数量平均减少率<90%,患部仍有瘙痒,红疹、皮屑等,动物自我啃咬性损伤明显存在。

实施例	有效性	临床反应
1	有	无明显瘙痒、红疹等现象

2	有	无明显瘙痒、红疹等现象
3	有	无明显瘙痒、红疹等现象
4	有	无明显瘙痒、红疹等现象
5	有	无明显瘙痒、红疹等现象
6	有	无明显瘙痒、红疹等现象
7	有	无明显瘙痒、红疹等现象
8	有	无明显瘙痒、红疹等现象

[0080] 通过上述实施1-8可知,通过上述实施例,在实施例7的效果最为明显,在治疗犬体表的跳蚤和蜱感染,辅助治疗因跳蚤引起的过敏性皮炎的应用中的效果最为明显,且产品稳定性更强,杂质最少。

[0081] 上述对实施例的描述是为了便于该技术领域的普通技术人员能理解和使用本发明。熟悉本领域技术人员显然可以容易的对这些实施例做出各种修改,并把在此说明的一般原理应用到其他实施例中,而不必经过创造性的劳动。因此,本发明不限于上述实施例。本领域技术人员根据本发明的原理,不脱离本发明的范畴所做出的改进和修改都应该在本发明的保护范围之内以上所述仅为本发明的较佳实施例而已,并不用以限制本发明,凡在本发明的精神和原则之内所作的任何修改、等同替换和改进等,均应包含在本发明的保护范围之内。