



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2755473 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A01N 25/00 (2006.01)
A61K 31/42 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.05.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.12.12
(86)	European Application Nr.	12772575.2
(86)	European Filing Date	2012.09.12
(87)	The European Application's Publication Date	2014.07.23
(30)	Priority	2011.09.12, US, 201161533308 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Merial, Inc., 3239 Satellite Boulevard Bldg. 500, Duluth, GA 30096, USA
(72)	Inventor	SOLL, Mark, D., 605 Newport Shore, Alpharetta, GA 30005, USA ROSENTEL, Joseph, K., 10675 Branham Fields Road, Johns Creek, GA 30097, USA PATE, James, 582 County Road 579, Hampton, NJ 08827, USA SHUB, Natalya, 2308 S. Front Street, Allentown, PA 18103, USA TEJWANI-MOTWANI, Monica, 575 Easton Avenue Suite 19e, Somerset, NJ 08873, USA BELANSKY, Carol, 292 West Colfax Ave, Roselle Park, NJ 07204, USA
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	PARASITICIDAL COMPOSITIONS COMPRISING AN ISOXAZOLINE ACTIVE AGENT, METHODS AND USES THEREOF
------	-------	--

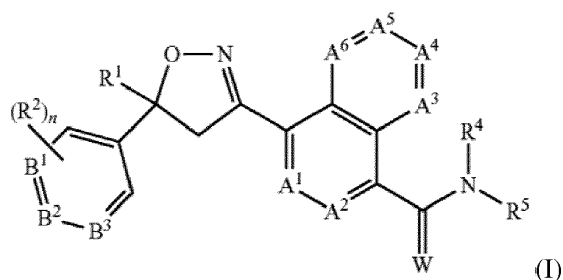
(56)	References Cited:	WO-A1-2007/079162 WO-A2-2009/002809 WO-A2-2011/157733 WO-A1-2012/038851 WO-A1-2011/149749
------	-------------------	---

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Topisk veterinærmedisinsk sammensetning i form av en spot-on-formulering for å behandle eller forebygge en parasittinfeksjon eller et parasittangrep hos et dyr, som omfatter:

a) minst ett isoksazolin-virkestoff på formelen (I):



der:

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ og A⁶ er uavhengig valgt fra gruppen som består av CR³ og N, såframnt maksimalt 3 av A¹, A², A³, A⁴, A⁵ og A⁶ er N;

B¹, B² og B³ er uavhengig valgt fra gruppen som består av CR² og N;

W er O eller S;

R¹ er C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₄-C₇-alkylsykloalkyl eller C₄-C₇-sykloalkylalkyl, hver opsjonelt substituert med én eller flere substituentter som er uavhengig valgt fra R⁶;

hver R² er uavhengig H, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoksy, C₁-C₆-haloalkoksy, C₁-C₆-alkyltio, C₁-C₆-haloalkyltio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-haloalkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-dialkylamino, C₂-C₄-alkoksykarbonyl, -CN eller -NO₂;

hver R³ er uavhengig H, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₃-C₆-halosykloalkyl, C₁-C₆-alkoksy, C₁-C₆-haloalkoksy, C₁-C₆-alkyltio, C₁-C₆-haloalkyltio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-haloalkylsulfinyl, C₁-C₆-

alkylsulfonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-dialkylamino, -CN eller -NO₂;

R⁴ er H, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₄-C₇-alkylsykloalkyl, C₄-C₇-sykloalkylalkyl, C₂-C₇-alkylkarbonyl eller C₂-C₇-alkoksykarbonyl;

R⁵ er H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² eller Q¹; eller C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₄-C₇-alkylsykloalkyl eller C₄-C₇-sykloalkylalkyl, hver opsjonelt substituert med én eller flere substituenten som er uavhengig valgt fra R⁷; eller

R⁴ og R⁵ tas sammen med nitrogenet de er festet til for å danne en ring som inneholder 2 til 6 atomer karbon og opsjonelt ett ekstra atom valgt fra gruppen som består av N, S og O, der ringen opsjonelt er substituert med 1 til 4 substituenten som er uavhengig valgt fra gruppen som består av C₁-C₂-alkyl, halogen, -CN, -NO₂ og C₁-C₂-alkoksy;

hver R⁶ er uavhengig halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoksy, C₁-C₆-alkyltio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, -CN eller -NO₂;

hver R⁷ er uavhengig halogen; C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₁-C₆-alkoksy, C₁-C₆-alkyltio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₈-dialkylamino, C₃-C₆-sykloalkylamino, C₂-C₇-alkylkarbonyl, C₂-C₇-alkoksykarbonyl, C₂-C₇-alkylaminokarbonyl, C₃-C₉-dialkylaminokarbonyl, C₂-C₇-haloalkylkarbonyl, C₂-C₇-haloalkoksykarbonyl, C₂-C₇-haloalkylaminokarbonyl, C₃-C₉-dihaloalkylaminokarbonyl, hydroksy, -NH₂, -CN eller -NO₂; eller Q²;

hver R⁸ er uavhengig halogen, C₁-C₆-alkoksy, C₁-C₆-haloalkoksy, C₁-C₆-alkyltio, C₁-C₆-haloalkyltio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-haloalkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-dialkylamino, C₂-C₄-alkoksykarbonyl, -CN eller -NO₂;

hver R⁹ er uavhengig halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₃-C₆-halosykloalkyl, C₁-C₆-alkoksy, C₁-C₆-haloalkoksy, C₁-C₆-alkyltio, C₁-C₆-

haloalkyltio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-haloalkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-dialkylamino, -CN, -NO₂, fenyl eller pyridinyl;

R¹⁰ er H; eller C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₄-C₇-alkylsykloalkyl eller C₄-C₇-sykloalkylalkyl, hver opsjonelt substituert med ett av flere halogen;

R¹¹ er H, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₄-C₇-alkylsykloalkyl, C₄-C₇-sykloalkylalkyl, C₂-C₇-alkylkarbonyl eller C₂-C₇-alkoksykarbonyl;

R¹² er H; Q³; eller C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₄-C₇-alkylsykloalkyl eller C₄-C₇-sykloalkylalkyl, hver opsjonelt substituert med én eller flere substituenten som er uavhengig valgt fra R⁷; eller

R¹¹ og R¹² tas sammen med nitrogenet de er festet til for å danne en ring som inneholder 2 til 6 atomer karbon og opsjonelt ett ekstra atom valgt fra gruppen som består av N, S og O, der ringen opsjonelt er substituert med 1 til 4 substituenten som er uavhengig valgt fra gruppen som består av C₁-C₂-alkyl, halogen, -CN, -NO₂ og C₁-C₂-alkoksy;

Q¹ er en fenyling, en 5- eller 6-leddet heterosyklisk ring, eller et 8-, 9- eller 10-leddet kondensert bisyklisk ringsystem som opsjonelt inneholder ett til tre heteroatomer valgt fra opp til 1 O, opp til 1 S og opp til 3 N, hver ring eller hvert ringsystem opsjonelt substituert med én eller flere substituenten som er uavhengig valgt fra R⁸;

hver Q² er uavhengig en fenyling eller en 5- eller 6-leddet heterosyklisk ring, hver ring opsjonelt substituert med én eller flere substituenten som er uavhengig valgt fra R⁹;

Q³ er en fenyling eller en 5- eller 6-leddet heterosyklisk ring, hver ring opsjonelt substituert med én eller flere substituenten som er uavhengig valgt fra R⁹; og

n er 0, 1 eller 2; og

b) en farmasøytisk akseptabel bærer som er egnet for påføring på huden av et dyr, der bæreren omfatter en dialkylester av en C₁₀-C₂₂-dikarboksytsyre.

2. Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 1, der:

W er O;

R⁴ er H eller C₁-C₆-alkyl;

R⁵ er -CH₂C(O)NHCH₂CF₃;

hver av A¹, A², A³, A⁴, A⁵ og A⁶ er CH;

R¹ er C₁-C₆-alkyl opsjonelt substituert med én eller flere substituenten som er uavhengig valgt fra R⁶;

R⁶ er halogen eller C₁-C₆-alkyl; og

B¹, B² og B³ er uavhengig CH, C-halogen, C-C₁-C₆-alkyl, C-C₁-C₆-haloalkyl, eller C-C₁-C₆-alkoksy.

3. Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 1, der isoksazolin-virkestoffet er 4-[5-[3-klor-5-(trifluormetyl)fenyl]-4,5-dihydro-5-(trifluormetyl)-3-isoksazoly]-N-[2-okso-2-[(2,2,2-trifluoretyl)amino]etyl]-1-naftalenkarboksamid.

4. Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 1, der bæreren omfatter en dialkylester av en C₈-C₁₂-dikarboksytsyre, mer foretrukket en dialkylester av en C₁₀-C₁₂-dikarboksytsyre.

- 5.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 1, der bærer en C₁-C₁₂-dialkylester av dikarboksylysyren.
- 6.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 1, der dialkylesteren av C₁₀-C₂₂-dikarboksylysyren er valgt blant dietylsebakat, dibutylsebakat og diisopropylsebakat.
- 7.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge et av kravene 1 til 6, som ytterligere omfatter minst et andre virkestoff.
- 8.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 7, der det minst andre virkestoffet er en insektvekstregulator, et neonikotinoid eller et avermektin eller milbemycin.
- 9.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 8, der isoksazolin-virkestoffet er 4-[5-[3-klor-5-(trifluormetyl)fenyl]-4,5-dihydro-5-(trifluormetyl)-3-isoksazolyl]-N-[2-okso-2-[(2,2,2-trifluoretyl)amino]etyl]-1-naftalenkarboksamid, og neonikotinoidet er nitenpyram.
- 10.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 8, der det minst andre virkestoffet er en insektvekstregulator.
- 11.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 10, der insektvekstregulatoren er (S)-metopren, pyriproksyfen, hydropren, cyromazin, fluazuron, lufenuron, eller novaluron.
- 12.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 8, der avermektin eller milbemycin er eprinomektin, ivermektin, selamektin, milbemektin, milbemycin D, milbemycinoksim, eller moksidektin
- 13.** Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge krav 7, der det minst andre virkestoffet er et antelmintisk virkestoff valgt blant tiabendazol, oksibendazol, mebendazol, fenbendazol, oksfendazol, albendazol, triklabendazol, febantel, levamisol, pyrantel, morantel, prazikvantel, klosantel, klorisulon, et aminoacetonnitril-

virkestoff, og et aryloazol-2-yl-cyanetylamino-virkestoff.

14. Topisk veterinærmedisinsk sammensetning ifølge et hvilket som helst foregående krav til bruk i å behandle eller forebygge et parasittangrep eller en parasittinfeksjon hos et dyr.

15. Topisk veterinærmedisinsk sammensetning til bruk ifølge krav 14, der isoksazolinet er 4-[5-[3-klor-5-(trifluormetyl)fenyl]-4,5-dihydro-5-(trifluormetyl)-3-isoksazolyl]-N-[2-okso-2-[(2,2,2-trifluoetyl)amino]etyl]-1-naftalenkarboksamid.