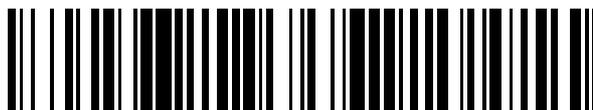


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 370 708**

51 Int. Cl.:  
**A61Q 11/00** (2006.01)  
**A61K 8/25** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **02741422 .6**  
96 Fecha de presentación: **05.07.2002**  
97 Número de publicación de la solicitud: **1410789**  
97 Fecha de publicación de la solicitud: **21.04.2004**

54 Título: **PREPARACIÓN ORAL.**

30 Prioridad:  
**05.07.2001 JP 2001204791**  
**05.07.2001 JP 2001204792**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**22.12.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**22.12.2011**

73 Titular/es:  
**SUNSTAR INC.**  
**3-1, ASAHIMACHI**  
**TAKATSUKI-SHI, OSAKA 569-1195, JP**

72 Inventor/es:  
**FUJISAWA, Koichi**

74 Agente: **Curell Aguilá, Marcelino**

**ES 2 370 708 T3**

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

**DESCRIPCIÓN**

Preparación oral.

**5 Campo técnico**

La presente invención se refiere a una composición oral que contiene un surfactante de sulfosuccinato.

**Antecedentes de la invención**

10 La decoloración dental proviene de la formación de sustancias cromogénicas, y su depósito sobre la superficie de los dientes, denominada "mancha", provoca un grave problema de apreciación estética. La mancha puede atribuirse al contacto de los dientes con bactericidas, tales como la clorhexidina; tanino y sustancias análogas contenidas en el té, etc.; y metales como el hierro. Se han sugerido procedimientos para inhibir la formación de las manchas y la supresión del depósito dental, con el fin de prevenir de modo eficiente la decoloración de los dientes.

15 Como procedimiento para inhibir la formación de las manchas, la publicación de patente japonesa no examinada nº 1989-125315 da a conocer la inhibición, mediante el sulfonato de poliestireno, de la presencia de manchas debida a sustancias basadas en los taninos; La publicación de patente japonesa no examinada nº 1990-56413 da a conocer la inhibición de la formación de las manchas mediante el bloqueo de reacciones no enzimáticas de oscurecimiento. Sin embargo, estos procedimientos se dirigen sólo a una mancha específica y por tanto, no son efectivos contra todos los tipos de manchas. La publicación de patente japonesa no examinada nº 1998-17443 da a conocer la utilización, como inhibidor de la formación de las manchas, de un surfactante de sulfosuccinato para composiciones orales. Para los procedimientos de supresión del depósito de éstas, las publicaciones de patente japonesas no examinadas nº 1990-200618, nº 1990-209805 y nº 1990-223512, dan a conocer la supresión del depósito de las manchas revistiendo una superficie dental con una silicona aminoalquílica, y las publicaciones de patente japonesas no examinadas nº 1991-38517 y nº 1993-163126 dan a conocer la utilización de ésteres fluoroalquil fosfóricos para obtener el mismo efecto. Sin embargo, estas referencias dan a conocer procedimientos que inhiben la formación de las manchas o suprimen su depósito, no habiéndose producido hallazgos con respecto a composiciones orales que pudieran inhibir, tanto la formación de las manchas como la supresión de su depósito.

20 El documento EP-A-0 518 608 describe una composición higiénica oral que no contiene sulfato lauril sódico y que comprende un derivado proteico. El documento JP 2000 319148 A describe una composición para el cuidado oral que comprende componentes que inhiben las manchas dentales, que incluyen un surfactante que está basado en el ácido sulfosuccínico, uno que está basado en un aminoácido y uno que está basado en el ácido alquilsulfúrico. El documento JP 2000 053547 A describe una composición para la cavidad oral que comprende un surfactante que está basado en el ácido sulfosuccínico, una sal metálica bivalente soluble en agua y opcionalmente, un surfactante no iónico. El documento JP 10 017 443 A describe una composición capaz de inhibir el desarrollo de las manchas, que incluye un surfactante que está basado en el ácido sulfosuccínico. La patente US nº 5.932.191 describe sílices precipitadas que pueden utilizarse como agentes de abrasión en composiciones para pastas de dientes.

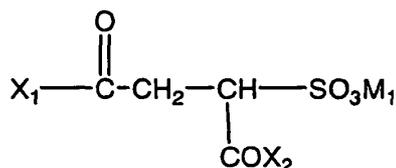
35 Un objetivo de la presente invención consiste en proporcionar una composición oral que esté provista de unos efectos inhibidores de la formación de las manchas y de supresión de su depósito, y que, por tanto, prevenga efectivamente la decoloración dental.

**45 Exposición de la invención**

50 En vista de las circunstancias actuales que se han descrito anteriormente, se realizó una exhaustiva investigación, y se descubrió una composición oral específica que presentaba unos efectos inhibidores de la formación de manchas y de efectos supresores del depósito de éstas. Más específicamente, la composición oral comprende de 0,5 a 10% en peso de sílice precipitada abrasiva, que muestra un percentil 50 del diámetro de la partícula ( $d_{50}$ ) de 5  $\mu\text{m}$  o menor, un percentil 90 ( $d_{90}$ ) del diámetro de la partícula de 15  $\mu\text{m}$  o menor, y un valor RDA de 120 o más y de 0,01 a 5% en peso de un surfactante de sulfosuccinato. De acuerdo con esto, se realizó la presente invención.

55 Más específicamente, la presente invención proporciona una composición oral a la que se hace referencia en los apartados siguientes:

60 1. Composición oral que comprende de 0,5 a 10% en peso de una sílice precipitada abrasiva, que muestra un percentil 50 del diámetro de la partícula ( $d_{50}$ ) de 5  $\mu\text{m}$  o menor, un percentil 90 ( $d_{90}$ ) del diámetro de la partícula de 15  $\mu\text{m}$  o menor, y un valor RDA de 120 o más, de 3 a 25% en peso de una sílice precipitada abrasiva, con un valor de abrasión de la dentina radioactiva de 40 a 110 y de 0,01 a 5% en peso de, por lo menos, un surfactante de sulfosuccinato, representado por la fórmula general (1):



5 en la que  $X_1$  o  $X_2$  es  $R_1\text{O}-(\text{AO})_n-$  o  $R_1\text{CO}-\text{B}-(\text{AO})_n-$  y el otro es  $\text{M}_2\text{O}-$ ;  $\text{M}_1$  y  $\text{M}_2$  son los mismos o distintos, representando cada uno hidrógeno, metales alcalinos, metales alcalinotérreos, amonio o alcanolamina;  $R_1$  es alquilo o alquenilo con 8 a 22 carbonos; AO es oxialquileo con 2 ó 3 carbonos y el número promedio de moles de la polimerización de adición de AO, "n", es 0 a 20; y B es  $-\text{NH}-$  o un residuo de monoalcanolamina con 2 ó 3 carbonos.

10 2. Composición oral según el apartado 1, en la que el número promedio de moles de la polimerización de adición de AO, "n", del surfactante de sulfosuccinato representado por la fórmula general (1), es de 0 a 7.

15 3. Composición oral según el apartado 1, en la que un número de carbonos de un grupo alquilo o de un grupo alquenilo del surfactante de sulfosuccinato representado por la fórmula general (1), es de 10 a 14.

4. Composición oral según el apartado 1, en la que  $\text{M}_1$  y  $\text{M}_2$  del surfactante de sulfosuccinato representado por la fórmula general (1), son sodio.

5. Composición oral según el apartado 1, en la que un valor de RDA de la sílice precipitada abrasiva es de 130 a 200.

20 6. Composición oral según el apartado 1, en la que la cantidad de la sílice precipitada abrasiva es de 1 a 5% en peso.

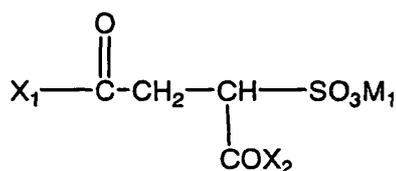
25 7. Composición oral según el apartado 1, en la que la sacarina sódica y el esteviósido están contenidos además en la proporción ponderal sacarina sódica a esteviósido de 1:1 a 8:1, siendo su cantidad total de 0,01 a 1% en peso.

8. Composición oral según el apartado 1, que comprende, además, por lo menos, un elemento seleccionado de entre el grupo constituido por vainilla, anetol y bencilsuccinato.

A continuación, la presente invención es descrita con mayor detalle.

El surfactante de sulfosuccinato que se utiliza en la presente invención no está limitado, hasta el punto de que es un monoéster sulfosuccinato representado por la fórmula general siguiente (1).

Fórmula general (1):



40 [en la que  $X_1$  o  $X_2$  es  $R_1\text{O}-(\text{AO})_n-$  o  $R_1\text{CO}-\text{B}-(\text{AO})_n-$  y el otro es  $\text{M}_2\text{O}-$ ;  $\text{M}_1$  y  $\text{M}_2$  son los mismos o distintos, representando cada uno hidrógeno, metales alcalinos, metales alcalinotérreos, amonio o alcanolamina;  $R_1$  es alquilo o alquenilo con 8 a 22 carbonos; AO es oxialquileo con 2 ó 3 carbonos y el número promedio de moles de la polimerización de adición de AO, "n", es 0 a 20; y B es  $-\text{NH}-$  o un residuo de monoalcanolamina con 2 ó 3 carbonos.]

45 En el monoéster de sulfosuccinato representado por la fórmula general (1),  $R_1$  es un grupo alquilo o alquenilo sintético lineal o ramificado, o derivado naturalmente, que presenta de 8 a 22 carbonos. Por ejemplo, pueden mencionarse laurilo, cocoilo, miristilo, estearilo,  $\text{C}_{12}-\text{C}_{14}$  alquilo sintético, isononilo, isododecilo, octenilo, dodecenilo, etc. Cuanto más larga es la cadena de carbonos de  $R_1$ , más se reducen el amargor y el estímulo, y cuanto más corta es la cadena de carbonos de  $R_1$ , más intenso es el efecto inhibitor de la formación de las manchas. De este modo, el número de carbonos de  $R_1$  es preferentemente de 10 a 16, y más preferentemente, de 12 a 14. Resulta particularmente preferido el  $\text{C}_{12}-\text{C}_{14}$  alquilo sintético o una combinación de laurilo y miristilo.

55  $\text{M}_1$  y  $\text{M}_2$  pueden ser los mismos o distintos, y sus ejemplos incluyen hidrógeno, metales alcalinos, metales alcalinotérreos, amonio o alcanolaminas. Los ejemplos de metales alcalinos comprenden sodio, potasio, etc. Los ejemplos de metales alcalinotérreos incluyen magnesio, etc. Los ejemplos de alcanolaminas incluyen monoetanolamina, dietanolamina, trietanolamina, etc. Entre éstos, resultan preferidos el sodio y el magnesio como  $\text{M}_1$  y  $\text{M}_2$ , siendo el sodio el más preferido.

- 5 El grupo AO es un grupo oxialquileno con 2 ó 3 carbonos, y es preferentemente un grupo oxietilénico. El número promedio de moles de la polimerización de adición de AO, "n", es preferentemente, de aproximadamente 0 a 20. El efecto inhibitor de la formación de las manchas aumenta y el amargor también disminuye, pues el número promedio de moles de la polimerización de adición de AO, "n", disminuye, y de este modo, "n" es preferentemente de 0 a 7, aproximadamente, y muy preferentemente, de aproximadamente 0 a 2. Cuando el número promedio de moles de la polimerización de adición de AO es 0, el monoéster de sulfosuccinato no contiene ningún grupo oxialquilénico.
- 10 Los ejemplos de monoésteres de sulfosuccinato representados por la fórmula general (1), son el polioxietilén disodio (7 moles) lauril sulfosuccinato, polioxietilén disodio (2 moles) lauril sulfosuccinato, polioxilén disodio (1 mol) lauril sulfosuccinato, sulfosuccinato lauril disódico, polioxietilén disodio (7 moles) miristil sulfosuccinato, polioxietilén disodio (2 moles) alquil (C<sub>12-14</sub>) sulfosuccinato, polioxietilén disodio (1 mol) alquil (C<sub>12-14</sub>) sulfosuccinato, alquil disodio (C<sub>12-14</sub>) sulfosuccinato, polioxietilén magnésico (2 moles) lauril sulfosuccinato, polioxietilén magnésico (2 moles) alquil (C<sub>12-14</sub>) sulfosuccinato, polioxietilén ditrietanolamina (7 moles) miristil sulfosuccinato, etc. Los ejemplos de monoésteres de sulfosuccinato representados por la fórmula general (2) son el sulfosuccinato oleamida disódico, el sulfosuccinato polioxietilén lauramida disódico (5 moles), el polioxietilén disodio (2 moles) cocoil isopropanol amida sulfosuccinato, etc.
- 15 El monoéster sulfosuccinato más apropiado es una sal sódica de la fórmula general (1), en la que R<sub>1</sub> es un grupo alquilo con 12 a 14 carbonos, siendo el grupo AO el grupo oxietilénico, y el número promedio de moles de la polimerización de adición de AO, "n", de 0 a 2 aproximadamente. Sus ejemplos son el polioxietilén disodio (2 moles) alquil (C<sub>12-14</sub>) sulfosuccinato, el polioxietilén disodio (1 mol) alquil (C<sub>12-14</sub>) sulfosuccinato, y el alquil (C<sub>12-14</sub>) disodio sulfosuccinato.
- 20 Los sulfosuccinatos representados por la fórmula general (1) pueden utilizarse solos o en combinación de dos o más.
- 25 En general, la cantidad de monoéster sulfosuccinato representado por la fórmula general (1) es preferentemente de aproximadamente 0,01 a 5%, basado en el peso total de la composición, y más preferentemente de 0,1 a 2% en peso. El efecto inhibitor de la formación de las manchas no puede obtenerse suficientemente cuando la cantidad es inferior a 0,01% en peso, mientras que la capacidad de apreciar los sabores resulta afectada si la cantidad excede de aproximadamente 5% del peso aproximadamente.
- 30 La presente invención requiere la utilización de aproximadamente 0,5 a 10% que se basa en el peso total de la composición, de una sílice abrasiva precipitada, en la que d<sub>50</sub> es de aproximadamente 5 µm o inferior, d<sub>90</sub> es de 15 µm o inferior, y que presenta un valor RDA de 120 o más (la sílice precipitada es denominada a continuación en la presente memoria, ocasionalmente, "primera sílice").
- 35 Generalmente, la sílice precipitada se obtiene de la forma siguiente: Un silicato metálico alcalino diluido (por ejemplo, silicato sódico) se hace reaccionar con un ácido fuerte (por ejemplo, ácido sulfúrico), bajo condiciones que impiden la agregación para formar la solución coloidal y el gel, habitualmente bajo condiciones ácidas. El reactivo se somete entonces a filtración, lavado y secado, y entonces, se pulveriza para conseguir un producto en polvo con el diámetro deseado. La presente invención puede utilizar una sílice que se prepara según un procedimiento conocido. La sílice precipitada se utiliza como un agente abrasivo en la presente invención, ya que es más favorable que el gel de sílice en términos de higroscopicidad baja, fácil de manejo y de bajo coste.
- 40 Una sílice abrasiva precipitada, preparada según los procedimientos conocidos, puede utilizarse como primera sílice de la presente invención.
- 45 La cantidad de la primera sílice es de 0,5 a 10% en peso en la composición, preferentemente, de 0,5 a 6% en peso, más preferentemente, de 1 a 5% en peso, y todavía más preferentemente, de 2 a 4% en peso. Cuando la cantidad es inferior a 0,5% en peso, el depósito de las manchas puede no resultar suficientemente suprimido; cuando la cantidad es superior a 10% en peso, los dientes pueden dañarse.
- 50 Los valores de d<sub>50</sub> y de d<sub>90</sub> se midieron con un Calibrador patrón Malvern del tamaño, provisto de una salida de escasa energía láser He/Ne y basado en el principio de difracción de Fraunhofer. El valor de d<sub>50</sub> es preferentemente de 4,5 µm o inferior, y más preferentemente, de 4 µm o inferior. La cota más baja de d<sub>50</sub> no está limitada, hasta el punto de que los efectos deseados de la presente invención no resultan afectados adversamente, pero es habitualmente de 3 µm o inferior, y preferentemente, de 1 µm aproximadamente. El valor de d<sub>90</sub> es preferentemente de 13 µm aproximadamente, o inferior, y más preferentemente, de 10 µm aproximadamente, o inferior. La cota más baja de d<sub>90</sub> no está limitada, hasta el punto de que los efectos deseados de la presente invención no disminuyen, pero es habitualmente de 8 µm o inferior, y preferentemente, de 5 µm aproximadamente.
- 55 El valor RDA es una abreviatura de "valor de abrasión de la dentina radioactiva", pudiendo determinarse, por ejemplo, mediante el procedimiento de Hefferen et al (J. Dent. Res., Vol 55, nº 4, 563-573, 1976). El valor RDA es preferentemente de 130 o superior, aproximadamente, y más preferentemente de aproximadamente 150 o superior.
- 60
- 65

La cota superior del valor RDA no está especialmente limitada, pero es habitualmente de aproximadamente 250, y, preferentemente de aproximadamente 200. Por tanto, el intervalo preferido de los valores RDA es de aproximadamente 120 a aproximadamente 250, más preferentemente de aproximadamente 130 a aproximadamente 200, y todavía más preferentemente, de aproximadamente 150 a aproximadamente 200.

5 La composición oral de la presente invención contiene, además de la primera sílice, una sílice precipitada abrasiva, con un valor RDA de aproximadamente 40 a aproximadamente 110 (a la que se hará referencia a continuación, a veces, en la presente memoria, como "segunda sílice").

10 La utilización de la segunda sílice en combinación con la primera, mejora los efectos inhibidores de la composición sobre la formación de las manchas, siendo, por lo tanto, ventajosa.

15 El valor RDA de la segunda sílice es de aproximadamente 40 a aproximadamente 110, preferentemente de aproximadamente 60 a aproximadamente 110, más preferentemente de aproximadamente 80 a aproximadamente 110, y todavía más preferentemente, de aproximadamente 85 a aproximadamente 110.

20 La segunda sílice no está limitada, hasta el punto de que el valor RDA está comprendido en los intervalos descritos anteriormente. Resulta preferido que la  $d_{50}$  del diámetro de partícula de la segunda sílice sea de aproximadamente 20  $\mu\text{m}$  o inferior, y más preferentemente de aproximadamente 15  $\mu\text{m}$  o inferior. La cota más baja de  $d_{50}$  no está limitada, y es habitualmente de aproximadamente 10  $\mu\text{m}$  o inferior, y preferentemente de aproximadamente 8  $\mu\text{m}$  o inferior.

25 La cantidad de la segunda sílice es de aproximadamente 3 a aproximadamente 25%, basándose en el peso total de la composición, más preferentemente de aproximadamente 8 a aproximadamente 20% en peso, más preferentemente, todavía, de aproximadamente 10 a aproximadamente 20% en peso, y muy preferentemente de aproximadamente 15 a aproximadamente 20% en peso.

30 La cantidad total de la primera sílice y de la segunda sílice en la composición oral de la invención, es preferentemente de entre aproximadamente 5 y aproximadamente 30% en peso, más preferentemente de entre aproximadamente 10 y aproximadamente 25% en peso, y más preferentemente, todavía, entre aproximadamente 12 y aproximadamente 23% en peso, y muy preferentemente, entre aproximadamente 17 y aproximadamente 23% en peso. La proporción ponderal de la primera sílice a la segunda sílice es, preferentemente, de aproximadamente 1:20 a aproximadamente 1:1, más preferentemente de aproximadamente 1:10 a aproximadamente 1:2, y todavía más preferentemente, de 1:10 a aproximadamente 1:3.

35 Los ejemplos de los contenidos de sílice en la composición de la invención, son tal como se mencionan a continuación:

40 Aproximadamente 1 a 5% basado en el peso total de la composición de la primera sílice, con un valor RDA de aproximadamente 150 a aproximadamente 200, y de aproximadamente 10 a aproximadamente 20% basado en el peso total de la composición de la segunda sílice, con un valor RDA de aproximadamente 85 a aproximadamente 110, se mezclaron, de forma que la cantidad total de la primera sílice y de la segunda sílice fuera de 12 a 23%, basada en el peso total de la composición, siendo la proporción ponderal de la primera a la segunda sílice de 1:10 a 1:2.

45 Aproximadamente 2 a 4% basado en el peso total de la composición de la primera sílice, con un valor RDA de aproximadamente 150 a aproximadamente 200,  $d_{50}$  de 3 a 4  $\mu\text{m}$  y  $d_{90}$  de aproximadamente 8 a aproximadamente 10  $\mu\text{m}$ , y de aproximadamente 15 a aproximadamente 20%, basado en el peso total de la composición de la segunda sílice, con un valor RDA de 85% a 110% aproximadamente, y  $d_{50}$  de aproximadamente 10 a aproximadamente 15  $\mu\text{m}$ , se mezclaron, de forma que el peso total de la primera sílice y de la segunda sílice fuera de 17 a 23%, basado en el peso total de la composición, siendo la proporción ponderal de la primera a la segunda sílice de 1:8 a 1:3.

50 La composición oral de la primera invención puede formularse en formas tales como un polvo dental, pasta dental, gel, pasta profiláctica, pasta, chicle, comprimido, etc., según los procedimientos conocidos. Un dentífrico es particularmente preferido desde un punto de vista práctico.

55 Además del surfactante sulfosuccinato descrito anteriormente y de la sílice precipitada abrasiva, la composición según la invención puede contener, dependiendo de su forma, agua, alcoholes inferiores, alcoholes superiores, y otros aditivos que se utilizan habitualmente en la técnica. Dichos aditivos incluyen abrasivos distintos a las primera y segunda sílices precipitadas abrasivas, vehículos, agentes espumosos, aglomerantes, agentes que ajustan el pH, surfactantes distintos que los surfactantes de sulfosuccinato representados por las fórmulas generales (1) y (2), humectantes, edulcorantes, saborizantes, antisépticos, colorantes y varios principios activos. La cantidad de los aditivos puede determinarse apropiadamente, hasta el punto de que no afecten a los efectos de la presente invención.

65 La cantidad de agua puede determinarse apropiadamente dependiendo de la forma del agente, etc., y se encuentra

habitualmente entre 0 y 70%, y preferentemente entre aproximadamente 10 y aproximadamente 50%, basándose en el peso total de la composición. La cantidad de alcoholes inferiores se encuentra habitualmente entre aproximadamente 0 y aproximadamente 10%, y preferentemente, entre 0 y 5%, basada en el peso total de la composición. La cantidad de alcoholes superiores es habitualmente de 0 a 70% en peso, y preferentemente, de entre aproximadamente 10 y aproximadamente 50%, en peso.

Otros abrasivos distintos de las primera y segunda sílices precipitadas abrasivas, descritas anteriormente, incluyen dihidrato fosfato dicálcico, fosfato dicálcico anhidro, fosfato cálcico, fosfato tricálcico, carbonato cálcico, pirofosfato cálcico, hidróxido aluminico, óxido de aluminio, gel silíceo, silicato de aluminio, sílices precipitadas abrasivas distintas de las primera y segunda sílices precipitadas abrasivas mencionadas anteriormente, metafosfato sódico insoluble, fosfato trimagnésico, carbonato de magnesio, sulfato cálcico, polimetilmetacrilato, bentonita, silicato de circonio, hidroxiapatito, resinas sintéticas, etc. Estos abrasivos pueden utilizarse solos o en combinación de dos o más. La cantidad de abrasivo distinto de la primera y segunda sílices precipitadas abrasivas, mencionadas anteriormente, es habitualmente de aproximadamente 5 a aproximadamente 90%, basada en el peso total de la composición, y de aproximadamente 5 a aproximadamente 50% en el caso de una pasta dental.

Los ejemplos de vehículos incluyen sílice ahumada, sílice de engrosamiento (generalmente con un valor RDA de aproximadamente 30 o menos.), y polvo de celulosa, tal como celulosa cristalina, etc. Entre estas, se prefieren la sílice ahumada y la sílice de engrosamiento. La cantidad de vehículo es habitualmente de entre aproximadamente 0,1 y aproximadamente 30%, y preferentemente, de entre aproximadamente 0,5 y aproximadamente 10%, basado en el peso total de la composición.

Los ejemplos de agentes espumantes, incluyen surfactantes aniónicos distintos a los surfactantes de sulfosuccinato representados por la fórmula general (1). Por ejemplo, pueden mencionarse los siguientes: sales superiores de sulfato de alquilo, con grupos alquilo que incluyen de 8 a 18 carbonos, tales como sulfato lauril sódico, sulfato miristil sódico, etc; sales ácidas N-acilamino de cadena larga, sales sulfonato  $\alpha$ -olefinicas, monosulfato monoglicérido sódico de ácidos grasos superiores, N-metil-N-palmitoil taurinatos, N-acilsarcosinatos de sodio, N-acetilglutamatos, N-metil-N-acil taurinato sódico, N-metil-N-acilalanato sódico, Sulfonato sódico  $\alpha$ -olefínico, etc. Muchos de estos surfactantes aniónicos pueden eliminar manchas en un alto grado, mediante disolución química. En particular, el sulfato lauril sódico potencia sinérgicamente el efecto de la supresión de la formación de las manchas cuando se mezcla, y resulta por tanto, preferido. Dichos surfactantes aniónicos pueden utilizarse solos o en combinación de dos o tres. La cantidad de los surfactantes aniónicos distintos a los surfactantes de sulfosuccinato representados por la fórmula general (1), es habitualmente de 0,001 a 5%, y preferentemente de 0,01 a 2% aproximadamente, basada en el peso total de la composición.

Aparte de los surfactantes aniónicos, la composición de la presente invención puede contener además surfactantes no iónicos, surfactantes anfotéricos, y surfactantes catiónicos, tal como se utilizan habitualmente para las composiciones orales. Los ejemplos de dichos surfactantes incluyen surfactantes no iónicos tales como ésteres grasos polioxietilénicos (por ejemplo, un éster graso de sorbitan polioxietileno tal como el monolaurato de sorbitan polioxietileno, etc), el aceite de ricino hidrogenado, monoetanolamida del ácido laúrico, monoetanolamida del ácido mirístico, éteres polioxietilénicos de alcoholes superiores, copolímeros polioxipropilen polioxietilénicos, glicósidos alquílicos de ésteres grasos polioxipropilen polioxietilénicos (por ejemplo, cadena alquílica: de C<sub>8</sub> a C<sub>16</sub> aproximadamente), ésteres grasos poliglicéricos (por ejemplo, cadena alquílica de la mitad ácido graso; de C<sub>8</sub> a C<sub>16</sub>), ésteres grasos de sacarosa (por ejemplo, cadena alquílica de la mitad ácido graso: de C<sub>8</sub> a C<sub>16</sub>), etc; surfactantes anfotéricos, tal como N-alquil diaminoetilglicinas, alquil betaínas, betaínas ácido graso amidopropílicas (por ejemplo, la cadena alquílica de la mitad ácido graso: de C<sub>8</sub> a C<sub>16</sub>), alquil sulfo betaínas, alquil betaína imidazonio betaínas, etc; surfactantes catiónicos tales como cloruros alquiltrimetilamónicos, bromuros alquiltrimetilamónicos, cloruros alquildimetilamónicos, etc. Entre éstos, se prefieren el aceite de ricino polioxietilén hidrogenado y el glicósido alquílico.

La cantidad de los surfactantes distintos a los aniónicos y de los surfactantes sulfosuccinato representados por la fórmula general (1) es habitualmente de 0,001 a 5% y preferentemente, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 2%, basados en el peso total de la composición.

Los ejemplos de aglomerantes incluyen derivados de la celulosa tales como la carboximetilcelulosa sódica, etc; alginatos metálicos alcalinos, tales como alginato sódico; gomas tales como propilenglicolalginato, goma xantan, goma tragacanto, goma karaya, goma arábica, carragenina, etc; aglomerantes sintéticos tales como alcohol polivinílico, poliacrilato sódico, polímeros carboxivinílicos, polivinilpirrolidona, etc. Dichos aglomerantes pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad de aglomerante es habitualmente de 0,3 a 5% aproximadamente, basada en el peso total de la composición.

Los ejemplos de saborizantes incluyen mentol, carvona, anetol, vainilla, benzilsuccinato, eugenol, metilsalicilato, limoneno, ocimeno, alcohol n-decílico, citronelol,  $\alpha$ -terpineol, acetato de metilo, acetato de citronelilo, metil eugenol, cineol, linalool, etil linalool, timol, etc. Pueden utilizarse solos, y pueden utilizarse como extractos vegetales, tales como aceites esenciales que contienen el sabor anteriormente mencionado (por ejemplo, extractos vegetales tal como se muestran a continuación). Los ejemplos de sabores incluyen extractos vegetales como aceite de tomillo,

- aceite de nuez moscada, aceite de menta verde, aceite de menta piperita, aceite de anís, aceite de anís estrellado, aceite de hinojo, aceite de limón, aceite de naranja, aceite de salvia, aceite de romero, aceite de canela, aceite de pimienta, aceite de diatomeas, aceite de Perilla, aceite de gualteria, aceite de clavo, aceite de eucalipto, aceite de albahaca, aceite de árbol del té, aceite de davana, aceite de vainilla, aceite de arándano, etc. Los sabores pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad de sabor puede determinarse apropiadamente según el tipo de sabor que se utilice, etc., y es habitualmente de aproximadamente 0,05 a aproximadamente 10%, y preferentemente, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5%, basándose en el peso total de la composición.
- La composición de la presente invención contiene preferentemente por lo menos, entre estos sabores, uno de vainilla, uno de anetol y uno de bencilsuccinato. El olor peculiar de los surfactantes de sulfosuccinato se enmascara mezclando los sabores anteriormente descritos con la composición de la presente invención, siendo, de este modo, preferible. La cantidad, por lo menos, de un sabor de vainilla, de anetol y de bencilsuccinato, es habitualmente de aproximadamente 0,0001 a aproximadamente 1%, preferentemente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 0,5%, más preferentemente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 0,2%, basado en el peso total de la composición.
- Los ejemplos de edulcorantes incluyen sacarina, sacarina sódica, esteviósido, acesulfamo K, glicirrizina, perilartina, taumatina, éster metil aspartilfenilalanina, xilitol, paratinosa, palatinit, eritritol, maltitol, etc. Los edulcorantes pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad de edulcorante puede determinarse apropiadamente según el sabor a dulce que se desee, y es habitualmente de 0,01 a 5% basado en el peso total de la composición.
- La composición de la presente invención contiene preferentemente sacarina sódica y esteviósido entre los edulcorantes anteriormente descritos. En particular, la proporción ponderal de la sacarina sódica con respecto al esteviósido es del orden de 1:1 a 8:1 aproximadamente (preferentemente, del orden de aproximadamente 1:1 a aproximadamente 4:1), y el total de la sacarina sódica y el esteviósido es de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 1% (preferentemente de aproximadamente 0,02 a aproximadamente 0,5%), basado en el peso total de la composición. El esteviósido puede utilizarse solo o como un extracto vegetal que contiene esteviósido (por ejemplo, extracto de estevia).
- La combinación de la sacarina sódica y el esteviósido es excelente para suprimir el amargor peculiar de los surfactantes sulfosuccinato, siendo, por tanto, preferible. El amargor peculiar de los surfactantes sulfosuccinato puede reducirse suficientemente cuando la proporción ponderal de la sacarina sódica y del esteviósido es del orden del intervalo anteriormente mencionado, siendo así preferible. El amargor se suprime suficientemente cuando la cantidad total de sacarina sódica y esteviósido es de 0,01% en peso o más, mientras que la edulcoración no es demasiado intensa y el sabor es excelente cuando su cantidad total es, en peso, de 1% o inferior, siendo así, la cantidad total, preferible.
- Los ejemplos de humectantes incluyen una solución de sorbitol, glicerina, etilenglicol, propilenglicol, 1,3-butilenglicol, polietilenglicol, polipropilenglicol, lactitol, etc. Los humectantes pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad de humectante es habitualmente de aproximadamente 5 a aproximadamente 70% aproximadamente, basada en el peso total de la composición.
- Los ejemplos de agentes para ajustar el pH incluyen ácidos fosfóricos y sus sales (fosfatos de sodio, hidrogenofosfatos sódicos, etc), ácido cítrico y sus sales (sodio, etc), ácido fosfórico y sus sales, ácido málico y sus sales, ácido glucónico y sus sales, ácido maleico y sus sales, ácido aspártico y sus sales, ácido succínico y sus sales, ácido glucurónico y sus sales, ácido fumárico y sus sales, ácido glutámico y sus sales, ácido adípico y sus sales, ácido clorhídrico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, silicato sódico, etc. Los agentes que ajustan el pH pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad del agente que ajusta el pH no está limitada, hasta el punto de que se alcanza el pH deseado, pero se encuentra habitualmente entre aproximadamente 0,01 y aproximadamente 5%, y preferentemente entre 0,1 y 3% basado en el peso total de la composición. El pH de la composición de la presente invención no está limitado, hasta el punto de que pueden obtenerse los efectos de la presente invención, pero se encuentra habitualmente entre aproximadamente 4 y aproximadamente 10, y preferentemente, entre aproximadamente 5,5 y aproximadamente 9.
- Los ejemplos de antisépticos incluyen sales del ácido benzoico, tales como el benzoato sódico; parabenos, tales como el metilparabeno, butilparabeno, etc. Los antisépticos pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad de antiséptico es habitualmente de 0,01 a 3%, basada en el peso total de la composición.
- Los ejemplos de colorantes incluyen tinturas autorizadas, tales como azul nº 1, amarillo nº 4, rojo nº 202, verde nº 3, etc.; agentes colorantes que se basan en minerales, tales como azul ultramarino, azul ultramarino fortalecedor, azul de Prusia, etc.; óxido de titanio, etc. Los colorantes pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad de colorante es habitualmente de aproximadamente 0,0001 a 1% aproximadamente, basada en el peso total de la composición.
- Los ejemplos de principios activos incluyen bactericidas catiónicos tales como sales amónicas cuaternarias (por ejemplo, cloruro de cetilpiridinio, cloruro de bencetonio, cloruro de diestearildimetilamonio, cloruro de

estearildimetilbencilamonio, cloruro de esteariltrimetilamonio, cloruro de lauriltrimetilamonio, cloruro de laurilpiridinio, etc.), bactericidas biguanídicos (por ejemplo, clorhidrato de clorhexidina, acetato de clorhexidina, gluconato de clorhexidrina, clorhidrato de alexidina, acetato de alexidina, gluconato de alexidina, etc.) etc.; bactericidas aniónicos, tales como sarcosinato N-lauroil sódico, etc.; bactericidas no iónicos, tales como triclosán, isopropilmetilfenol, etc.; enzimas tales como dextranasa, amilasa, papaína, proteasa, mutanasa, lisozimas, enzimas líticas, etc.; compuestos de cinc, tales como óxido de cinc, cloruro de cinc, etc.; fluoruros tales como monofluorofosfatos metálicos alcalinos (por ejemplo, monofluorofosfato sódico, monofluorofosfato potásico, etc.), fluoruro sódico, fluoruro estannoso, etc.), ácido tranexámico, ácido ε-aminocaproico, alantoína clorhidroxilo aluminica, dihidrocolesterol, derivados de la vitamina E tales como acetato de tocoferol, etc., sales gliciricínicas, ácido glicirético, glicerofosfato, clorofila, nitrato potásico, cloruro sódico, calopéptido, compuestos solubles de ácido fosfórico inorgánico, etc. Los ejemplos de compuestos solubles de ácido fosfórico inorgánico incluyen los compuestos representados por las fórmulas generales siguientes (2) y (3):

Fórmula general (2):



[en la que M representa Na o K, y m es un número entero de 2 o superior]

Fórmula general (3):



[en la que M representa Na o K, y 1 es un número entero de 3 o superior]

En las fórmulas generales anteriores, m es habitualmente un número entero de 2 o superior, y preferentemente un número entero de 2 a 6, y 1 es habitualmente un número entero de 3 o superior, y preferentemente, un número entero de 3 a 6.

Los ejemplos de compuestos representados por la fórmula general (2) incluyen pirofosfato sódico, pirofosfato potásico, tripolifosfato sódico, etc.

Los ejemplos de compuestos representados por la fórmula general (3) incluyen tetrametafosfato sódico, hexametafosfato sódico, etc.

Los principios activos pueden utilizarse solos o en combinaciones de dos o más. La cantidad de principios activos no está limitada hasta el punto de que el efecto deseado puede alcanzarse, pudiéndose determinar apropiadamente la cantidad según el tipo del principio activo que se haya utilizado, etc.

La cantidad de los principios activos es habitualmente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 30%, basada en el peso total de la composición, y preferentemente, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20% en peso.

### Mejor modo de poner en práctica la invención

La presente invención se explica con mayor detalle haciendo referencia a los ejemplos y los ejemplos comparativos. En los ejemplos y ejemplos comparativos siguientes, los porcentajes se expresan en su totalidad en peso, si no se especifica lo contrario.

Los ejemplos y ejemplos comparativos siguientes utilizan la sílice precipitada abrasiva tal como se muestra a continuación:

Sílice A precipitada abrasiva;  $d_{50} = 3,5 \mu\text{m}$ ,  $d_{90} = 9,5 \mu\text{m}$ , valor RDA = 180;  
 Sílice B precipitada abrasiva;  $d_{50} = 10 \mu\text{m}$ ,  $d_{90} = 30 \mu\text{m}$ , valor RDA = 90; y  
 Sílice C precipitada abrasiva;  $d_{50} = 4,0 \mu\text{m}$ ,  $d_{90} = 10 \mu\text{m}$ , valor RDA = 130.

Las sílices precipitadas abrasivas A y C pertenecen a la "primera sílice", mientras que la sílice precipitada abrasiva B pertenece a la "segunda sílice".

### Ejemplos I-1 a I-3, Ejemplo de Referencia I-4 y Ejemplos Comparativos I-1 a I-4

Se prepararon pastas dentales mezclando los componentes presentados a continuación, según un procedimiento conocido, utilizándose para evaluar los efectos de inhibición de la formación de las manchas y de la supresión de su depósito.

Formulación

Componentes	Proporciones
Sílice de engrosamiento	5,0
Sílice precipitada abrasiva	Representada en la tabla 1
Solución de sorbitol (70%)	35,0
Surfactante de sulfosuccinato	Representada en la tabla 1
Sacarina sódica	0,2
Estevióside	0,1
Triclosán	0,1
Carboximetilcelulosa sódica	1,0
Sabor	0,9
Agua	equilibrio
<b>Total</b>	<b>100,0</b>

Procedimiento de evaluación

5

(Efecto inhibitor de la formación de las manchas)

Utilizando como modelo dental un disco de hidroxiapatito de un diámetro de 1 cm, se sumergió sucesivamente en saliva humana (10 minutos), en una solución acuosa a 0,2% de gluconato de clorhexidina (2 minutos), en un sobrenadante, para su ensayo, de la lechada de las pastas dentales, diluida 4 veces (2 minutos), en una solución acuosa a 0,3% de citrato férrico amónico (III) (2 minutos), y en un extracto de té (10 minutos), repitiéndose 10 veces el ciclo de inmersión. Entonces, se midió la diferencia de color de los discos respectivos antes y después del experimento, (haciendo referencia a esta diferencia como dE). La diferencia de color cuando se utilizó el agua destilada en vez de la pasta dental (a la que se denominó dE0), se utilizó como valor control, y el grado de inhibición de la formación de las manchas, se calculó mediante la fórmula siguiente:

15

$$\text{Grado de inhibición de la formación de las manchas (\%)} = (dE0 - dE) \times 100 / dE0$$

20

El medidor CR-241 de la diferencia de color (fabricado por Minolta) se utilizó para la medida de las diferencias de color.

Cuando el grado de inhibición de la formación de las manchas es grande, pueden obtenerse efectos intensos. El grado de inhibición de la formación de las manchas se clasifica de la siguiente manera: el intervalo desde 0% (inclusive) a 50% (exclusive), se define como "c", el intervalo desde 50% (inclusive) a 70% (exclusive) se define como "b", y el intervalo desde 70% (inclusive) a 100% (inclusive) se define como "a".

25

(Efecto supresor del depósito de las manchas)

A partir de un diente incisivo central mandibular bovino, se obtuvo una pieza bucal de esmalte, de 4 mm<sup>2</sup>, para llevar a cabo un ensayo, embutiéndose a continuación en una resina transparente de poliéster. A continuación, la superficie de la pieza de prueba del esmalte se alisó con una lija y se sometió a un lustre limpiador de un espejo plano, utilizando óxido de aluminio. La superficie de la pieza de prueba del esmalte se sumergió en 0,2 mol/l de ácido clorhídrico durante 60 segundos, y a continuación, durante 30 segundos, en una solución acuosa saturada de carbonato sódico y sumergiéndose otra vez, a continuación, en una solución acuosa a 1% de ácido fítico durante 60 segundos. Se lavó con agua intercambiadora de iones y se utilizó como muestra. La muestra se fijó a un dispositivo de rozamiento que seguía las normas BSI, que mostraba instalado un cepillo dental comercial (de pelo de nailon). Se provocó que el dispositivo de rozamiento se moviera 1000 veces hacia adelante y hacia atrás bajo presión de 150 g en la lechada diluida 4 veces de las pastas dentales que iban a ensayarse, lavándose la muestra con agua intercambiadora de iones. Separadamente, aproximadamente 5 g de hojas de té se dispusieron en 1000 ml de agua intercambiadora de iones, infundiéndose la mezcla durante 10 minutos para obtener una solución. Entonces, se preparó un medio de cultivo de las manchas en la solución obtenida, disolviendo aproximadamente 3,4 g de té instantáneo, aproximadamente 2,5 g de mucina de estómago de cerdo, y aproximadamente 1,0 g de hexahidrato de cloruro de hierro (III). La muestra se disolvió en el medio de cultivo preparado de las manchas, a temperatura ambiente, y entonces se secó al aire, lo que se repitió cada 30 segundos durante 1 hora. A continuación, la muestra se lavó con agua intercambiadora de iones, secándose entonces con aire durante 1 hora, por lo menos. Entonces, se evaluó visualmente el grado de decoloración de esta muestra, basándose en los criterios siguientes:

35

40

45

a: sustancialmente, sin decoloración

b: decoloración ligera

50

c: decoloración moderada

d: decoloración considerable

Tabla 1

Componentes	Ejemplo I				Ejemplo comparativo I			
	1	2	3	4	1	2	3	4
Polioxietilén disodio (2 moles) alquil (12 a 14) sulfosuccinato	1	1	0,5			1		
Lauril disodio sulfosuccinato			0,5	0,5	0,5			
Sílice A abrasiva precipitada	2	3	2	8			1	
Sílice B abrasiva precipitada	15	17	20			10	10	
(Resultados de evaluación)								
Inhibición de la formación de las manchas	a	a	a	b	b	a	c	C
Inhibición del depósito de las manchas	a	a	a	a	d	c	b	D

Tal como se aprecia en la tabla 1, las pastas dentales que contienen el surfactante sulfosuccinato y la sílice precipitada abrasiva, con una  $d_{50}$  de 5  $\mu\text{m}$  o inferior,  $d_{90}$  de 15  $\mu\text{m}$  o inferior, y el valor RDA de 120 o más (la sílice A abrasiva precipitada) mostraban intensos efectos inhibidores de la formación de las manchas y de supresión de los depósitos de las mismas. Las pastas dentales que contienen además sílice B precipitada abrasiva, mejoran en el efecto inhibidor de la formación de las manchas, cuando se comparan con las pastas dentales que contienen sólo la sílice A precipitada abrasiva.

### Ejemplo I-5

Las pastas dentales se prepararon mediante las fórmulas siguientes, según un procedimiento conocido.

Componentes	Proporciones (%)
Sílice A precipitada abrasiva	2,0
Sílice B precipitada abrasiva	18,0
Solución de sorbitol (70%)	30,0
Glicerina	10,0
Oxido de titanio	0,5
Polietilenglicol 400	3,0
Carboximetilcelulosa sódica	1,0
Sulfato lauril sódico	1,0
Aceite de ricino hidrogenado polioxietilénico (60)	1,0
Polioxietilén disodio (2-moles) alquil (12 a 14) sulfosuccinato	1,0
Fluoruro sódico	0,2
Isopropil metilfenol	0,05
Sabor	1,0
Sacarina sódica	0,2
Extracto de estevia	0,1
Agua	equilibrio
<b>Total</b>	<b>100,0</b>

### Ejemplo I-6 (Ejemplo de Referencia)

Las pastas dentales se prepararon mediante las fórmulas siguientes, según un procedimiento conocido.

Componentes	Proporciones (%)
Dihidrato de fosfato cálcico secundario	15,0
Sílice C precipitada abrasiva	8,0
Sílice de engrosamiento	5,0
Carboximetilcelulosa sódica	1,0
Sulfato lauril sódico	1,2
Sulfosuccinato lauril disódico	2,0
Sabor	0,9
Bencilsuccinato	0,01
Sacarina sódica	0,2
Extracto de estevia	0,04
Agua	equilibrio
<b>Total</b>	<b>100,0</b>

Las pastas dentales preparadas en los ejemplos I-5 y I-6 presentaban excelentes efectos inhibidores de la formación de las manchas, y efectos supresores del depósito de éstas.

La presente invención puede proporcionar una composición oral que posee ambos efectos, el inhibidor de formación de las manchas y el supresor del depósito de éstas, previniendo, de este modo, efectivamente, la decoloración

dental.

**Ejemplos II-1 a II-4**

- 5 Las pastas dentales se prepararon mezclando los componentes presentados a continuación según un procedimiento conocido, y se utilizaron para evaluar el amargor y el olor del surfactante.

Componentes	Proporciones (%)
Sílice A precipitada abrasiva	3,0
Sílice B precipitada abrasiva	15,0
Sílice de engrosamiento	5,0
Solución de sorbitol (70%)	35,0
Surfactante sulfosuccinato	proporcionada en la tabla 2
Sacarina sódica	proporcionada en la tabla 2
Esteviósido	proporcionada en la tabla 2
Triclosán	0,1
Carboximetilcelulosa sódica	1,0
Vainilla	proporcionada en la tabla 2
Anetol	proporcionada en la tabla 2
Bencilsuccinato	proporcionada en la tabla 2
Sabor	0,9
Agua	equilibrio
<b>Total</b>	<b>100,0</b>

Procedimiento de evaluación

- 10 (Evaluación del amargor)

El amargor se evaluó en una escala de 1 a 5, cuando se cepillaron los dientes mediante las pastas dentales ensayadas:

- 15 1: Sin amargor  
 2: Sustancialmente sin amargor  
 3: Amargor ligero  
 4: Amargor mediano  
 5: Amargor considerable

- 20 La intensidad del amargor se clasificó mediante la totalidad de las clasificaciones dadas por 5 jurados, de la forma siguiente: 5 a 10, como "a", 11 a 15, como "b", 16 o más, como "c". Una clasificación alta muestra que el amargor es intenso.

- 25 (Evaluación del olor del surfactante)

La evaluación del olor del surfactante se evaluó en una escala de 1 a 5, cuando se lavaron los dientes con las pastas dentales que se habían ensayado:

- 30 1: El surfactante no huele  
 2: El surfactante, susstancialmente, no huele.  
 3: Ligero olor del surfactante.  
 4: Olor moderado del surfactante.  
 5: Olor considerable del surfactante.

- 35 La intensidad del olor del surfactante se clasificó mediante la totalidad de las clasificaciones dadas por 5 jurados, de la forma siguiente: 5 a 10, como "a", 11 a 15, como "b", 16 o más, como "c". Una clasificación alta muestra que el olor del surfactante es intenso.

- 40 Estos resultados de la evaluación se muestran en la tabla 2.

Tabla 2

Componentes	Ejemplo II			
	1	2	3	4
Polioxietilén disodio (2 moles) alquil (12 a 14) sulfosuccinato	1	1	0,5	
Sulfosuccinato lauril disódico			0,5	0,5
Sacarina sódica	0,15	0,2	0,15	0,3

Tabla 2 (continuación)

Componentes	Ejemplo II			
	1	2	3	4
Esteviósido	0,15	0,08	0,05	0,04
Anetol	0,01	0,01		0,01
Vainilla		0,01		0,01
Bencilsuccinato		0,01	0,01	
Resultados de la evaluación)				
Amargor	a	a	a	a
Olor del surfactante	a	a	a	a

5 Tal como se muestra en la tabla 2, las pastas dentales se prepararon conteniendo de 0,01% inclusive a 1% exclusive de sacarina sódica y extracto de estevia en una proporción ponderal de sacarina sódica: extracto de estevia de 1:1 a 8:1, que contenía además uno o más compuestos saborizantes, seleccionados a partir de vainilla, anetol, y bencilsuccinato. Dichas pastas dentales mostraban un escaso amargor y un escaso olor del surfactante. La totalidad de las pastas dentales representadas en la tabla 2 estaban provistas de efectos inhibidores de la formación de manchas y efectos supresores del depósito de éstas.

10

**Ejemplos II-5 (Ejemplo de Referencia)**

Las pastas dentales se prepararon mediante las fórmulas siguientes, según un procedimiento conocido.

Componentes	Proporciones (%)
Carbonato cálcico	30,0
Sílice A precipitada abrasiva	3,0
Solución de sorbitol (70%)	30,0
Carboximetilcelulosa sódica	1,0
Sulfato lauril sódico	1,2
Sulfosuccinato lauril disódico	2,0
N-lauroil sarcosina sódica	0,1
Sabor	0,9
Aceite de vainilla (que contiene vanilina)	0,01
Anetol	0,05
Bencilsuccinato	0,01
Sacarina sódica	0,2
Extracto de estevia (contenido de 70% de esteviósido)	0,04
Agua	equilibrio
Total	100,0

15

**Ejemplo II-6**

Las pastas dentales se prepararon mediante las fórmulas siguientes, según un procedimiento conocido.

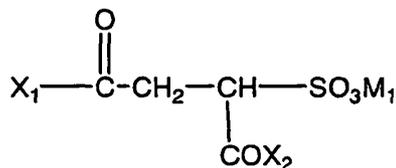
Componentes	Proporciones (%)
Sílice B precipitada abrasiva	10,0
Sílice C precipitada abrasiva	4,0
Sílice de engrosamiento	6,0
Solución de sorbitol (70%)	30,0
Glicerina	10,0
Oxido de titanio	0,5
Polietilenglicol 400	3,0
Carboximetilcelulosa sódica	1,0
Polioxietilén disodio (2-moles) alquil (12 a 14) sulfosuccinato	0,2
Sulfato lauril sódico	1,0
Aceite de ricino hidrogenado polioxietilénico (60)	1,0
Sacarina sódica	0,2
Extracto de estevia (contenido de 50% de esteviósido)	0,1
Fluoruro sódico	0,2
Isopropil metilfenol	0,05
Sabor	0,9
Vainilla	0,02
Aceite de anís estrella (que contiene 50% anetol)	0,03
Agua	equilibrio
Total	100,0

Las composiciones orales preparadas en los ejemplos II-5 y II-6 mostraron los efectos de la inhibición de la formación de las manchas y de su depósito, y reduciendo también el amargor y el olor del surfactante.

- 5 La presente invención puede proporcionar una composición oral que inhiba de modo efectivo la formación de las manchas y de su depósito, y los dientes pueden así conservarse estéticamente favorables, y puede proporcionar además una composición oral que está libre de tanto del amargor como del olor del surfactante, resultando de utilización agradable.

## REIVINDICACIONES

- 5 1. Composición oral que comprende de 0,5 a 10% en peso de una sílice precipitada abrasiva, que presenta un percentil 50 ( $d_{50}$ ) del diámetro de partícula de 5  $\mu\text{m}$  o inferior, un percentil 90 ( $d_{90}$ ) del diámetro de partícula de 15  $\mu\text{m}$  o inferior, y un valor de abrasión de la dentina radioactiva de 120 o más, de 3 a 25% en peso de una sílice precipitada abrasiva que presenta un valor de abrasión de la dentina radioactiva de 40 a 110, y de 0,01 a 5% en peso de por lo menos uno de los surfactantes de sulfosuccinato representados por la fórmula general (1):



10 en la que  $\text{X}_1$  o  $\text{X}_2$  es  $\text{R}_1\text{O}-(\text{AO})_n^-$  o  $\text{R}_1\text{CO}-\text{B}-(\text{AO})_n^-$  y el otro es  $\text{M}_2\text{O}^-$ ;  $\text{M}_1$  y  $\text{M}_2$  son los mismos o distintos, y representan cada uno hidrógeno, metales alcalinos, metales alcalinotérreos, amonio o alcanolamina;  $\text{R}_1$  es alquilo o alqueniilo con 8 a 22 carbonos;  $\text{AO}$  es oxialquileo con 2 ó 3 carbonos y el número promedio de moles de la polimerización de adición de  $\text{AO}$ , "n", es 0 a 20; y  $\text{B}$  es  $-\text{NH}-$  o un residuo de monoalcanolamina con 2 ó 3 carbonos.

15 2. Composición oral según la reivindicación 1, en la que el número promedio de moles de la polimerización de adición de  $\text{AO}$ , "n", del surfactante de sulfosuccinato representado por la fórmula general (1) es de 0 a 7.

20 3. Composición oral según la reivindicación 1, en la que un número de carbonos de un grupo alquilo o de un grupo alqueniilo del surfactante de sulfosuccinato representado por la fórmula general (1) es de 10 a 14.

4. Composición oral según la reivindicación 1, en la que  $\text{M}_1$  y  $\text{M}_2$  del surfactante de sulfosuccinato representado por la fórmula general (1) son sodio.

25 5. Composición oral según la reivindicación 1, en la que un valor de abrasión de la dentina radioactiva de la sílice precipitada abrasiva es de 130 a 200.

6. Composición oral según la reivindicación 1, en la que la cantidad de la sílice precipitada abrasiva es de 1 a 5% en peso.

30 7. Composición oral según la reivindicación 1, en la que la sacarina sódica y el esteviósido están contenidos además en la proporción ponderal de sacarina sódica a esteviósido de 1:1 a 8:1, y su cantidad total es de 0,01 a 1% en peso.

35 8. Composición oral según la reivindicación 1, que comprende además por lo menos un elemento seleccionado de entre el grupo constituido por vainilla, anetol y bencilsuccinato.