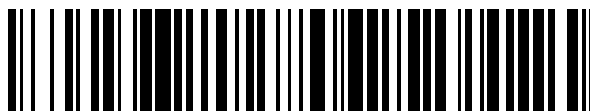


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 611 854**

51 Int. Cl.:

A61K 8/19 (2006.01)
A61K 8/21 (2006.01)
A61K 8/27 (2006.01)
A61K 8/44 (2006.01)
A61K 8/66 (2006.01)
A61K 8/67 (2006.01)
A61K 8/97 (2006.01)
A61Q 11/00 (2006.01)
A61K 8/34 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **22.03.2011** **PCT/GB2011/000399**
87 Fecha y número de publicación internacional: **05.01.2012** **WO12001337**
96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **22.03.2011** **E 11711963 (6)**
97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.10.2016** **EP 2588067**

54 Título: **Composición para la salud dental**

30 Prioridad:

01.07.2010 GB 201011074

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
10.05.2017

73 Titular/es:

TAYLOR, ROBERT PETER (33.3%)
1 Blomfield Road Little Venice
London W9 1AH, GB;
LALVANI, TEJ (33.3%) y
SHELATKAR, ROHIT (33.3%)

72 Inventor/es:

TAYLOR, ROBERT PETER;
LALVANI, TEJ y
SHELATKAR, ROHIT

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 611 854 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

Composición para la salud dental

DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

CAMPO TÉCNICO

- 5 Esta invención se refiere a una composición, combinada con constituyentes estándares de dentífricos y colutorios para uso en la higiene dental y oral, infecciones e inflamaciones.

ANTECEDENTES DE LA TÉCNICA

Pasta dentífrica

- 10 La pasta dentífrica es un dentífrico de pasta o gel que se utiliza con un cepillo de dientes como un accesorio para limpiar y mantener la estética y la salud de los dientes. Esto ayuda en la separación de la placa dental y la comida de los dientes, ayuda a eliminar o enmascarar la halitosis y suministra ingredientes activos tales como fluoruro o xilitol con el fin de evitar enfermedades de los dientes y de las encías (gingivitis). La mayor parte de la limpieza se realiza mediante el uso mecánico del cepillo de dientes.

- 15 El fluoruro en diversas formas es el ingrediente activo más popular en la pasta de dientes. Está incluido en las pastas de dientes con el fin de prevenir las caries. Se produce de forma natural en pequeñas cantidades en las plantas y los animales. El fluoruro de sodio es la forma más común de flúor utilizada en las pastas dentífricas. Algunas marcas de pasta dentífrica utilizan monofluorofosfato de sodio. Otros ingredientes se utilizan con menos frecuencia, incluyendo nanocristales de hidroxiapatita y fosfato de calcio para la remineralización de los dientes, y nitrato de potasio para reducir la sensibilidad. Triclosan, que es un agente antibacteriano, es un ingrediente activo en algunas pastas dentífricas, que se utiliza para prevenir la gingivitis.

- 20 Además de fluoruro, el otro ingrediente fundamental en la mayoría de las pastas dentífricas es un abrasivo. Los abrasivos en pastas dentífricas reducen a la mitad el tiempo necesario para eliminar la placa de los dientes. Abrasivos tales como los agentes de pulido dental utilizados en cirugías dentales, también provocan una pequeña cantidad de erosión del esmalte que se denomina acción de "pulido". Algunas marcas contienen mica blanca en polvo, que actúa como un abrasivo suave y añade un brillo reluciente cosméticamente agradable a la pasta. La eliminación de placa y de cálculos previene caries y la enfermedad periodontal. El pulido de los dientes elimina las manchas de las superficies de los dientes, pero no se ha demostrado que mejore la salud dental más allá de los efectos de la eliminación de la placa y los cálculos.

- 25 Muchos, aunque no todas las pastas dentífricas contienen lauril-sulfato de sodio. Es, en gran parte, un agente espumante aunque también actúa como un potente agente antimicrobiano. Sin embargo, lauril-sulfato de sodio puede provocar una mayor frecuencia de úlceras en la boca en algunas personas, ya que puede secar la capa protectora de los tejidos orales que provocan que los tejidos subyacentes se dañen.

- 30 La pasta dentífrica viene en una diversidad de colores y sabores. Los sabores más habituales son alguna variación en la menta, menta verde, menta piperita y menta regular. Sabores más exóticos incluyen: anís, albaricoque, canela, hinojo, lavanda, nim, jengibre, vainilla, limón, naranja, pino. Existe, sin embargo, pasta dentífrica sin saborizantes, sin embargo, la mayoría son con sabor y endulzadas. Dado que el azúcar fomenta el crecimiento de las bacterias que provocan la caries, se utilizan generalmente en su lugar edulcorantes artificiales tales como sorbitol o sacarina.

Colutorios

- 35 Los colutorios (o enjuagues bucales) son un producto utilizado para mejorar la higiene oral. Los enjuagues bucales antisépticos y anti-placa sostienen que matan a la placa dental que provoca la caries dental, gingivitis y el mal aliento. Los enjuagues bucales anti-caries utilizan fluoruro para proteger contra la caries dental. Sin embargo, el uso del colutorio no elimina la necesidad tanto del cepillado como del uso de hilo dental.

- 40 Los ingredientes activos en las marcas comerciales de colutorios pueden incluir timol, eucaliptol, metilparabeno, peróxido de hidrógeno, bromuro de domifeno, fluoruro, enzimas y calcio. Ingredientes también incluyen agua, edulcorantes tales como el sorbitol, sucralosa, sacarina sódica y xilitol, que actúa como un inhibidor bacteriano. A veces se añade una cantidad significativa de etanol. Colutorios comerciales contienen por lo general un conservante tal como benzoato de sodio y metilparabeno para conservar la frescura una vez que el recipiente ha sido abierto.

Muchas marcas más recientes están libres de alcohol y contienen agentes de eliminación de olores tales como oxidantes para evitar que se desarrolle el futuro mal aliento.

Productos de higiene oral

Las siguientes son las formulaciones de productos de higiene oral y dental de uso común:

- 5 Sensodyne Multiaction con tecnología iso-active® (limpieza general) - Ingredientes activos: nitrato de potasio al 5% (para la anti-hipersensibilidad), fluoruro de sodio al 0,15% p/v ion fluoruro (para la anti-caries); ingredientes inactivos: agua, sorbitol, glicerol, sílice hidratada, PEG-8, metil-cocoil-aurato de sodio, isopentano, sabor, cocamidopropil-betaína, goma xantano, carragenano, sacarina sódica, sucralosa, hidróxido de sodio, FD&C azul nº1.
- 10 Sensodyne Multiaction con tecnología iso-active® (limpieza general y blancura) - Ingredientes activos: nitrato de potasio al 5% (para la anti-hipersensibilidad), fluoruro de sodio al 0,15% p/v ion fluoruro (para la anti-caries); ingredientes inactivos: agua, glicerol, sorbitol, sílice hidratada, trifosfato pentasódico, PEG-8, isopentano, sabor, metil-cocoil-aurato de sodio, cocamidopropil-betaína, goma xantano, carragenano, hidróxido de sodio, sacarina sódica, sucralosa, FD&C azul nº1.
- 15 Sensodyne Pronamel - Ingredientes activos: Nitrato de potasio al 5% p/p, fluoruro de sodio (1450 ppm de fluoruro); Ingredientes inactivos: agua, glicerol, sorbitol, sílice hidratada, PEG-6, cocamidopropil-betaína, goma xantano, carragenano, hidróxido de sodio, sacarina sódica, aroma, dióxido de titanio, limoneno, alcohol de anís.
- 20 Sensodyne TOTAL CARE (blanqueamiento suave) - Ingredientes activos: nitrato de potasio, Fluoruro de sodio (1400 ppm de fluoruro); Ingredientes inactivos: agua, glicerol, sorbitol, sílice hidratada, trifosfato pentasódico, PEG-6, cocamidopropil-betaína, goma xantano, carragenano, hidróxido de sodio, sacarina sódica, aroma, dióxido de titanio, metil-cocoil-aurato de sodio.
- Pearl Drops – blanco reposición - Ingredientes: bicarbonato de sodio (bicarbonato sódico), glicerol, PEG-8, sílice hidratada, copolímero de PEG/PPG-116/66, sulfato de calcio, lauril-sulfato de sodio, aroma, fosfato dipotásico, carbonato de sodio, sacarina sódica, goma de celulosa, fluoruro de sodio, limoneno, CI 77891.
- 25 Pearl Drops - destello de fiesta - Ingredientes: agua, sorbitol, sílice hidratada, glicerol, hexametáfosfato de sodio, lauril-sulfato de sodio, PEG-12, aroma, monofluorofosfato de sodio, goma de celulosa, sacarina sódica, mica, cinamal, alcohol bencílico, CI 42053, CI 77891. Contiene monofluorofosfato de sodio (1000 ppm de F).
- 30 Pearl Drops-sonrisa de Hollywood - Ingredientes: Sorbitol, agua, sílice hidratada, glicerol, óxido de aluminio, dodecibencenosulfonato de sodio, PEG-12, aroma, trifosfato pentasódico, trifosfato pentapotásico, peróxido de zinc, goma de celulosa, fluoruro de sodio, sacarina sódica, polvo de perlas, limoneno, CI 74160, CI 77891. contiene fluoruro de sodio (1300 ppm de F).
- Swiss Dent – blanqueo extensivo inoxidable - RDA 40 - Ingredientes: Nanóxido, peróxido de calcio, papaína, bromelaína, fluoruro, coenzima Q10, vitamina E, bicarbonato sódico.
- Swiss Dent – blanqueo nanoblanqueador suave - RDA 25 - Ingredientes: Nanóxido, peróxido de calcio, papaína, bromelaína, fluoruro, coenzima Q10, vitamina E, bicarbonato sódico.
- 35 Swissdent Frescor puro Control de la Respiración - Contiene fluoruro de sodio. Ingredientes: Nanóxido, peróxido de calcio, papaína, bromelaína, fluoruro, coenzima Q10, vitamina E, bicarbonato sódico.
- Retardex® - Ingredientes activos: marca CloSYS II de dióxido de cloro estabilizado, agua, sílice hidratada, sorbitol, glicerol, goma de celulosa, fosfato trisódico, sacarina sódica, menta piperita, menta spicata, mentol, bicarbonato de sodio, clorito sódico, limoneno, CI 77891/dióxido de titanio.
- 40 Arm and Hammer – cuidado del esmalte (para el blanqueo natural) - Ingredientes: Bicarbonato de Sodio (bicarbonato sódico), glicerol, PEG-8, sílice hidratada, sílice, copolímero de PEG/PPG-116/66, sulfato de calcio, lauril-sulfato de sodio, aroma, fosfato dipotásico, sacarina sódica, goma de celulosa, fluoruro de sodio, limoneno, CI42053, CI 77891.
- 45 Arm and Hammer – Blanqueo avanzado - Ingredientes: Sorbitol, bicarbonato de sodio, agua, sílice hidratada, glicerol, pirofosfato tetrasódico, Aroma, lauroil-sarcosinato de sodio, sacarina sódica, goma de celulosa, lauril-sulfato de sodio, limoneno, CI 77891.

Colgate Sensitive pro-relief - Ingredientes: arginina-8%, sílice hidratada, carbonato de calcio, glicerol, agua, bicarbonato, sabor, goma de celulosa, sacarina sódica, FD&C azul nº 1 (CI 42090).

5 Colgate – protector del esmalte - Ingredientes: agua, sorbitol, glicerol, sílice hidratada, nitrato de potasio, PEG-12, lauril-sulfato de sodio, aroma, goma de celulosa, pirofosfato tetrasódico, fluoruro de sodio, sacarina sódica, goma xantano, eugenol, limoneno, CI 77891.

Colgate-protección anticaries - Ingredientes: fosfato dicálcico dihidrato, agua, glicerol, sorbitol, PEG-12, lauril-sulfato de sodio, aroma, goma de celulosa, monofluorofosfato de sodio, pirofosfato tetrasódico, sacarina sódica, glicerofosfato de calcio, fluoruro de sodio, limoneno.

10 Colgate blanqueo total-plus - Sustancias activas: fluoruro de Sodio 0,32% p/p (1450 ppm de F) Triclosan 0.3% p/p; Otros Ingredientes: Copolímero, sílice tipo dental, glicerol, sorbitol, lauril-sulfato de sodio, aroma 89303/89854, carmelosa sódica, dióxido de titanio, sacarina sódica, carragenano, hidróxido de sodio, mica, agua, CI Azul alimento 2 (E133).

15 Colgate-sensible blanqueo - Ingredientes: fluoruro de sodio (1450 ppm de F-), agua, glicerol, sorbitol, sílice hidratada, nitrato de potasio, PEG-12, pirofosfato tetrasódico, copolímero de PVM/MA, lauril-sulfato de sodio, aroma, goma de celulosa, hidróxido sódico, sacarina sódica, goma xantano, eugenol, limoneno, CI 77891, CI 42051.

Listerine Colutorio para el Cuidado Total: agua, alcohol, sorbitol, aroma, Poloxámero 407, ácido benzoico, eucaliptol, salicilato de metilo, timol, mentol, fluoruro de sodio, cloruro de zinc, sucralosa, sacarina sódica, benzoato de sodio, alcohol bencílico, CI 16035, CI 42090 , contiene fluoruro de sodio (0,022% p/v 100 ppm de F)

20 Aquafresh Colutorio suave y menta: agua, alcohol, aroma, cocamidopropil-betaína, sacarina sódica, cloruro de cetilpiridinio, fluoruro de sodio, PEG-60, aceite de ricino hidrogenado, bicarbonato de sodio, CI 42051, CI 75810, CI 15985.

DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

Esta invención se refiere a una nueva composición, combinada con constituyentes estándares de pastas dentífricas y colutorios, para uso en higiene dental y oral, infecciones e inflamaciones.

25 Los siguientes son los ingredientes activos de la pasta dentífrica y del colutorio:

Extracto de Pelargonium sidoides

Vitamina A

Vitamina C

Vitamina E

30 Niacinamida

Ácido fólico

Zinc

Coenzima Q10

Arginina

35 Carbonato de calcio

Fluoruro

Cloruro de estroncio

Papaína

40 Los ingredientes activos se combinan con constituyentes estándares de pastas dentífricas o colutorios. Estos ingredientes adicionales pueden ser alterados y adaptados a las necesidades, ya sea agregando otros ingredientes, sustituyendo ingredientes o eliminando los ingredientes existentes.

Con el fin de maximizar el efecto de la composición, después del cepillado, pasta adicional que contiene la composición activa se puede aplicar directamente a los dientes y las encías durante 1 a 2 minutos antes de enjuagar.

45 Lo siguiente es un ejemplo de los ingredientes adicionales de la formulación cuando se utilizan en una pasta dentífrica: edulcorante (tal como sorbitol o sacarina sódica), colorante (tal como agua), saborizantes (tales como menta verde o mentol), aroma, agua, abrasivos suaves (tales como mica o bicarbonato de sodio), lauril-sulfato de sodio (agente espumante), goma de celulosa (texturante).

Lo siguiente es un ejemplo de los ingredientes adicionales de la formulación cuando se utiliza en un colutorio: alcohol (soporte para el sabor y como un anti-bacteriano), edulcorante (tal como sorbitol o sacarina sódica), colorante (tal como aqua), saborizante (tal como menta verde o limoneno), aroma, agua, benzoato de sodio (conservante).

- 5 Las siguientes son las razones de la inclusión de los ingredientes activos en la pasta dentífrica y colutorio:

Extracto de *Pelargonium sidoides* - El género *Pelargonium* comprende aproximadamente 280 especies conocidas, de las cuales el 80% se cultiva en el interior de África del Sur. Las especies de plantas se distinguen por el color de las flores, la forma de las hojas y el color del polen. *Pelargonium sidoides* es una pequeña planta de tipo geranio que crece en una roseta de raíces subterráneas gruesas y pardas muy oscuras que crecen hasta 15 cm de longitud. Tallos escasamente ramificados crecen desde la base y muestran flores de color rojo oscuro a negro, y la especie se distingue por hojas cordadas o en forma de corazón. El polen de las especies de plantas es de color amarillo. Por el contrario, *Pelargonium reniforme* tiene flores rojo magenta a negras, hojas en forma de riñón y polen de blanco a verde. Ambas especies de plantas se pueden encontrar a lo largo de la costa marina y las zonas interiores de África del Sur. Debido a la deficiente viabilidad de la semilla, se ha desarrollado un método de propagación clonal para reducir la presión sobre las poblaciones naturales. Especies de plantas indígenas a zonas de África del Sur son ampliamente utilizadas por los curanderos tradicionales de los zulúes, Basuto, Xhosa, y las tribus Mfengi para tratar la disentería, diarrea, molestias hepáticas, heridas, resfriados, fatiga, fiebres, debilidad generalizada e infecciones del tracto respiratorio incluyendo tuberculosis. El uso occidental de las especies de *Pelargonium sidoides* y *Pelargonium reniforme* para el tratamiento de la tuberculosis se remonta al inglés el Mayor Charles Stevens en 1897, cuando fue tratado por un curandero tribal, con un extracto de las raíces de las especies de *Pelargonium*. Originalmente, se identificó como *Pelargonium reniforme* la fuente de la planta del fármaco. Sin embargo, investigaciones botánicas adicionales descubrieron la especie *Pelargonium sidoides* estrechamente relacionada, que ahora se utiliza predominantemente con fines terapéuticos. Los análisis químicos han conducido a la caracterización de aproximadamente 65 metabolitos, incluyendo ácidos fenólico y cinámico, taninos, flavonoides y cumarinas en ambas especies vegetales. Los extractos de *Pelargonium sidoides* se componen de 6 componentes principales que representan el 70% a 80% del peso total: prodelfinidinas sustituidas y no sustituidas, hidratos de carbono monómeros y oligómeros, minerales, péptidos, derivados de purina y benzopirranonas altamente sustituidas. Casi 230 componentes se han detectado en cada uno de los aceites esenciales de las especies vegetales, siendo los sesquiterpenos los más abundantes. La cumarina, 5,6-dimetoxi, 7-hidroxi-cumarina y varios éteres relacionados, glucósidos y sulfatos se han aislado de las dos especies de *Pelargonium*. Muchas de estas cumarinas también se encuentran en las raíces de otras especies de *Pelargonium* de Sudáfrica. *Pelargonium sidoides* contiene flavonoides y compuestos fenólicos similares. El alto contenido en taninos (aproximadamente el 9%) puede justificar el uso de la planta en las molestias gastrointestinales en los casos de diarrea secretora inducida por la toxina bacteriana. El amplio espectro de actividad contra los virus y las bacterias puede ser provocado por las cumarinas y los ácidos fenólicos. El extracto de *Pelargonium sidoides* puede ser útil en trastornos infecciosos orales, ya que tiene actividad antiviral (virus herpes simplex), antibacteriana (*Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pneumoniae*) y antifúngica (*Candida albicans*) contra los organismos causantes de trastornos orales tales como gingivitis, periodontitis, glositis y candidiasis oral.

40 Vitamina A – La vitamina A como palmitato de retinilo y su formación de retinol pueden conducir a un enriquecimiento de vitamina A en células de la mucosa bucal. De esta manera, alteraciones metaplásicas del epitelio de la mucosa bucal pueden prevenirse o invertirse mediante la aplicación de palmitato de retinilo tópico. La vitamina A puede reducir la actividad del sangrado gingival y puede ser eficaz en el tratamiento de la periodontitis leve.

Vitamina C – La vitamina C puede reducir la puntuación total del cálculo supragingival y reducir el número de sitios de sangrado.

45 Vitamina E - La vitamina E tópica puede ser una terapia eficaz en pacientes con mucositis oral inducida por quimioterapia.

Coenzima Q10: La aplicación tópica puede mejorar la periodontitis del adulto.

50 Ácido fólico - El ácido fólico parece tener una influencia en la salud gingival a través de la influencia local. Existe una mejora significativa en la inflamación gingival. Ácido fólico de aplicación tópica puede ser eficaz para facilitar la resolución de las lesiones orales.

Niacinamida – La niacinamida parece tener una influencia en la salud gingival a través de la influencia local. Existe una mejora significativa en la inflamación gingival.

Zinc – El citrato de zinc puede permitir una inhibición significativa de la formación de placa dental, por lo tanto, sugiere un nuevo dentífrico antiplaca y posible multi-beneficio para la higiene oral. El zinc en determinadas formas puede reducir el mal olor bucal.

- 5 Arginina – La arginina puede ayudar a proporcionar un alivio significativamente incrementado de la hipersensibilidad de la dentina.

Carbonato de calcio – El carbonato de calcio puede ayudar a proporcionar un alivio incrementado significativamente de la hipersensibilidad de la dentina.

Fluoruro - El fluoruro ayuda a prevenir las caries, y tiene efectos sobre la formación del esmalte dental y los huesos.

- 10 Cloruro de estroncio - El cloruro de estroncio puede ser un medio eficaz para reducir el malestar y el dolor generado por estímulos térmicos y táctiles en pacientes con hipersensibilidad de la dentina.

Papaína - La papaína es una enzima proteolítica con baja especificidad, adecuada para la limpieza de la placa de proteína salival que tiene un efecto blanqueador sobre las superficies de los dientes.

APLICABILIDAD INDUSTRIAL

- 15 De acuerdo con esta invención, hay una composición, en combinación con componentes estándares de pastas dentífricas y colutorios, para uso en higiene dental y oral, infecciones e inflamaciones. En su realización óptima, la composición consiste, en forma de pasta dentífrica y colutorio, en: extracto de *Pelargonium sidoides*, vitamina A, vitamina C, vitamina E, ácido fólico, niacinamida, zinc, coenzima Q10, arginina, carbonato de calcio, fluoruro, cloruro de estroncio y papaína, combinados con constituyentes estándares de pastas dentífricas y colutorios.

REIVINDICACIONES

1. Una composición contra las infecciones e inflamaciones dentales y orales que está en forma de pasta dentífrica o colutorio, en la que los ingredientes activos son Pelargonium, vitamina A, vitamina C, vitamina E, ácido fólico, niacinamida, zinc, coenzima Q10, arginina, carbonato de calcio, fluoruro, cloruro de estroncio y papaína.
- 5 2. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1, que se combina en pastas dentífricas con lo siguiente: edulcorante, colorante, saborizante, aroma, agua, bicarbonato de sodio, lauril-sulfato de sodio, goma de celulosa, y lo siguiente en colutorios: alcohol, edulcorante, colorante, saborizante, aroma, agua, benzoato de sodio.
3. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, que se combina con otros constituyentes de pastas dentífricas o colutorios.
- 10 4. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, que está sólo en forma de una pasta dentífrica.
5. Una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, que está sólo en forma de un colutorio.