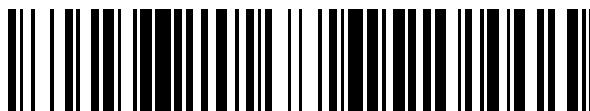


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 670 680**

51 Int. Cl.:

A61Q 11/00 (2006.01)
A61K 8/362 (2006.01)
A61K 8/34 (2006.01)
A61K 8/365 (2006.01)
A61K 8/97 (2007.01)
A61K 8/46 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **09.09.2013 PCT/US2013/058760**

87 Fecha y número de publicación internacional: **13.03.2014 WO14039966**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.09.2013 E 13765580 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **02.05.2018 EP 2892620**

54 Título: **Enjuague en la boca y composiciones de tratamiento de sensibilidad al diente**

30 Prioridad:
10.09.2012 US 201213608814

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la
traducción de la patente:
31.05.2018

73 Titular/es:
JOHNSON & JOHNSON CONSUMER INC.
(100.0%)
199 Grandview Road
Skillman, NJ 08558, US

72 Inventor/es:
SHARMA, DEEPAK y
MIFSUD, ROGER

74 Agente/Representante:
IZQUIERDO BLANCO, María Alicia

ES 2 670 680 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).

Enjuague en la boca y composiciones de tratamiento de sensibilidad al diente**Descripción****5 CAMPO DE LA INVENCION**

[0001] La presente invención se refiere a composiciones para el tratamiento de la sensibilidad dental, que incluyen enjuagues bucales, que comprenden diácido C₂-C₅, sales triácidas o tetraácidas y un agente o agentes enmascaradores del sabor. Los métodos para usar las composiciones también se describen.

10 ANTECEDENTES DE LA INVENCION

[0002] Muchas personas padecen dientes sensibles, y esta afección a menudo se denomina hipersensibilidad dentinaria. Se define como, y se usa en este documento para significar, un dolor transitorio que surge de la dentina expuesta, típicamente en respuesta a estímulos químicos, térmicos, táctiles u osmóticos que no pueden explicarse por ningún otro defecto o patología dental. La erosión de la superficie externa del diente y/o la recesión de las encías a menudo resulta en la exposición de los túbulos dentinarios. Cualquier estímulo (altos niveles de azúcar, calor o frío) que causa un movimiento rápido del fluido biológico en los túbulos dentinarios expuestos produce una distorsión de los nervios intradentales y genera una respuesta al dolor. Los mecanismos de transmisión del dolor a través de la dentina no se conocen por completo, pero tanto los desensibilizadores de los nervios como los agentes de oclusión de los túbulos de la dentina se han usado para tratar la sensibilidad de los dientes. Las pastas dentales especiales, que contienen nitrato de potasio y/o bi-vidrio, fosfato de calcio amorfo, etc., son utilizadas regularmente por los consumidores que sufren de sensibilidad dentinaria. Otro agente que se usa para tratar la sensibilidad dental es el oxalato de potasio. Aunque el oxalato de potasio es eficaz para atenuar la sensibilidad de la dentina, existen varios problemas.

[0003] Las composiciones que contienen sales de diácidos C₂-C₅ tales como oxalato de potasio tienden a tener un mal sabor y son difíciles de saborear. Las notas de sabor como los cítricos, incluida la baya, y las notas herbales como el té verde no logran altos niveles de enmascaramiento del sabor para una mejor aceptación del consumidor. Además, incluso los aromas de menta no alcanzan niveles tan elevados de enmascaramiento de sabor aceptable para el consumidor. Existe, por lo tanto, una necesidad continua de composiciones de tratamiento de sensibilidad dental que contienen diácido C₂-C₅, sales triácidas o tetraácidas, que tienen una aceptabilidad del sabor mejorada.

35 SUMARIO DE LA INVENCION

[0004] Se ha descubierto que el objetivo mencionado anteriormente se puede lograr mediante las composiciones proporcionadas en este documento. En una realización, la presente invención proporciona una composición para tratar dientes sensibles de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende de 0,1% a 3% de al menos un diácido C₂-C₅, triácido o sal tetraácida; una cantidad efectiva de enmascaramiento del sabor de al menos un extracto de sabor de vainilla; de 0,001% a 0,25% de mentol y/o un derivado del mismo y al menos un disolvente oralmente aceptable.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

[0005] Las composiciones de la presente invención pueden comprender, consistir en, o consistir esencialmente en los elementos y limitaciones esenciales de la invención descrita en este documento, así como cualquiera de los ingredientes, componentes o limitaciones adicionales u opcionales descritas en este documento. El término "que comprende" (y sus variaciones gramaticales) como se usa en este documento se usa en el sentido inclusivo de "tener" o "incluir" y no en el sentido exclusivo de "que consiste únicamente en".

[0006] Los términos "un" y "el" tal como se usan en la presente memoria se entiende que abarcan tanto el plural como el singular.

[0007] A menos que se indique lo contrario, todos los documentos citados son, en parte relevante, incorporados aquí como referencia; la cita de cualquier documento no debe interpretarse como una admisión de que es estado de la técnica con respuesta a la presente invención.

[0008] La frase "cantidad efectiva de enmascaramiento del sabor" significa la concentración o cantidad o nivel del extracto de aroma de vainilla de la presente invención que puede alcanzar un extremo estético o de enmascaramiento del sabor particular con respecto al sabor adverso del diácido C₂-C₅, triácido o sal(es) tetraácida(s).

[0009] La frase "aceptable por vía oral" significa que el vehículo es adecuado para la aplicación a las superficies de la cavidad oral o la ingestión por un organismo vivo que incluye, pero no se limita a, mamíferos y humanos sin toxicidad indebida, incompatibilidad, inestabilidad, respuesta alérgica, y similares.

[0010] Por "composición para el cuidado bucal" se entiende un producto, que en el curso ordinario de uso, no se

traga intencionadamente con fines de administración sistémica de agentes terapéuticos particulares, sino que se retiene en la cavidad oral durante un tiempo suficiente para contactar sustancialmente todas las superficies dentales y/o tejidos orales para propósitos de actividad oral. La composición para el cuidado bucal puede estar en diversas formas incluyendo pasta de dientes, dentífrico, gel dental, gel subgingival, enjuague bucal, soluciones, espuma, producto para el cuidado de dentaduras postizas, pulverizador bucal, pastilla o tableta masticable. La composición para el cuidado bucal también se puede incorporar en hilo dental, tiras o películas para aplicación directa o unión a superficies orales o integradas en un dispositivo o aplicador tal como un cepillo de dientes o roll-ons. Tales aplicadores pueden ser para uso simple o múltiple.

[0011] Todos los porcentajes, partes y relaciones se basan en el peso total de la composición de la presente invención, a menos que se especifique lo contrario. Todos los pesos que pertenecen a los ingredientes enumerados se basan en el nivel del ingrediente particular descrito y, por lo tanto, no incluye portadores o subproductos que pueden incluirse en materiales comercialmente disponibles, a menos que se especifique lo contrario.

[0012] La frase "nivel reducido" o "esencialmente libre" de alcohol significa una cantidad de un alcohol monohidroxilado C₂-C₄ hasta 10% v/v, opcionalmente, hasta 5% v/v, opcionalmente, hasta 1,0% v/v, opcionalmente hasta 0,1% v/v en volumen de la composición total. Opcionalmente, las composiciones de la presente invención están libres de alcoholes monohídricos C₂-C₄.

[0013] Las composiciones de la presente invención pueden estar en forma de enjuagues bucales, dentífricos, pastas de dientes, geles, soluciones o tiras tales como tiras de blanqueamiento dental sin peróxido y similares.

El diácido C₂-C₅, triácido o sal tetraácida

[0014] Las composiciones de la presente invención comprenden al menos un diácido, triácido o sal tetraácida C₂-C₅ de acuerdo con la reivindicación 1. Las sales diácidas, triácidas o tetraácidas C₂-C₅ adecuadas incluyen sales de sodio o potasio e incluyen, pero no están limitadas a sales de ácido oxálico, cítrico y propano-1,2,3-tricarboxílico.

[0015] Ejemplos de sales de diácidos adecuadas incluyen, pero no se limitan a, sales de metales alcalinos de ácido oxálico, ácido succínico, ácido metilsuccínico, ácido diglicólico, ácido glutárico (es decir, pentanodioico), ácido 3,5,5-trimetilpentanodioico, ácido hexanodioico, ácido 3,5,5-trimetilhexanodioico, ácido 2,4,4-trimetilhexanodioico, ácido decanodioico, ácido undecanodioico, ácido dodecanodioico, ácido 1,4-ciclohexanodicarboxílico, ácido ciclohexan-1,4-diacético, ácido maleico, ácido citracónico, ácido itacónico, ácido fumárico, ácido oxálico, ácido tereftálico, ácido ftálico y ácido isoftálico, ácido hidroxisuccínico, ácido malónico, ácido adípico, ácido sebácico y ácido tartárico, opcionalmente, ácido oxálico, ácido succínico u opcionalmente ácido oxálico.

[0016] Los ejemplos de sales de triácidos adecuados incluyen, pero sin limitación, sales de metal alcalino de ácido cítrico.

[0017] Ejemplos de sales de tetraácidos adecuadas incluyen, pero no se limitan a, sales de metal alcalino de ácido 1,1,2,2-etanotetracarboxílico; ácido 1,1,2,3-propanetetracarboxílico; ácido 1,1,4,4-butanotetracarboxílico; ácido 1,2,4,5-benzenotetracarboxílico y ácido etilendiaminotetraacético, u opcionalmente ácido 1,1,2,2-etanotetracarboxílico.

[0018] En ciertas realizaciones, el diácido, triácido o tetraácido C₂-C₅ es una sal de sodio o potasio de oxálico, cítrico y propano-1,2,3-tricarboxílico o mezclas de los mismos, opcionalmente, oxalato de potasio, citrato de potasio y mezclas de los mismos.

[0019] En ciertas realizaciones, el diácido, triácido o sal tetraácida C₂-C₅ es oxalato de potasio. Los proveedores de oxalato de potasio incluyen al Dr. Paul Lohmann GmbH KG (Emmerthal, Alemania) y Canton Lab. Pvt. Ltd (Makapura, Vadodara, India). En ciertas realizaciones, el diácido, triácido o sal tetraácida C₂-C₅ está presente en concentraciones de 0,1% a 3%, opcionalmente de 1% a 2%, opcionalmente de 1,2% a 1,6%, u, opcionalmente, aproximadamente 1,4%, en peso de la composición total.

Extracto de sabor a vainilla

[0020] Las composiciones de la presente invención comprenden además al menos un componente de aroma de vainilla, en donde el componente de aroma de vainilla comprende vainillina de etilo. Ejemplos ilustrativos, pero no limitativos, de componentes de aroma de vainilla adecuados incluyen mezclas de vainillina de etilo y un componente de aroma de vainilla seleccionado del grupo que consiste en vainillina, heliotropina, guaetol de propenilo, extractos de vainilla, veratraldehído, 4-cis-heptenal, diacetilo, lactato de butilo, lactato de etilo, acetato de metilo-para-terc-butilfenilo, hexalactona gamma y delta y heptalactona, benzodihidropirona, destilado inicial de mantequilla, tetradecalactona delta y butiraldehído. En ciertas realizaciones, el componente de aroma de vainilla es una mezcla de vainillina de etilo y un componente de aroma de vainilla seleccionado del grupo que consiste en vainillina, heliotropina, 4-cis-heptenal, diacetilo y acetato de fenilo de metilo-para-terc-butilo. En ciertas otras realizaciones, la vainilla es una mezcla de vainillina de etilo y vainillina. Los proveedores de vainillina de etilo o vainillina incluyen Symrise (Goose Creek, SC), Firmenich, IFF, Givaudan, AM Todd, Virginia Dare, etc. Los solventes o diluyentes

adecuados incluyen, pero no se limitan a, propilenglicol, neobee (se suministran triglicéridos de cadena media) por Stepan Lipid Nutrition) y otros comúnmente usados en la industria del sabor y mezclas de los mismos. Puede encontrarse una discusión más detallada de los extractos de sabor de vainilla en la Publicación de Patente de Estados Unidos US 2006/0280852 de Harvey et al.

[0021] En ciertas realizaciones, el componente de aroma de vainilla está presente a una cantidad efectiva de enmascaramiento del sabor. En otras realizaciones, el extracto de sabor de vainilla es presente en concentraciones de 0,001% a 0,12%, opcionalmente de 0,006% a 0,03% u opcionalmente de 0,012% a 0,015%.

Mentol y/o derivado de mentol

[0022] Las composiciones de la presente invención comprenden además mentol ($\text{CH}_3\text{C}_6\text{H}_9(\text{C}_3\text{H}_7)\text{OH}$), también conocido como hexahidrotirol. El mentol, además de cualquier propiedad antiséptica, proporciona una sensación refrescante y de hormigueo. También son útiles aquí los derivados de mentol. Los derivados de mentol adecuados incluyen, pero sin limitación, (+)-neo-mentol; mentona; (+)-isometona; acetato de mentilo; isovalerato de mentilo; (-)-lactato de mentilo; para-ment-1-en-3ol; piperitona; carbonato de etilenglicol (-)-mentol; (-)-mentol 1- y 2-propilenglicol carbonato; (-)-mentona 1,2-glicerol cetil; (+)-mentona 1,2-glicerol cetil; succinato de mono-mentilo y mezclas de los mismos. Mentol y/o derivados de mentol pueden proporcionarse en forma de aceites de menta, que incluyen, pero no se limitan a, uno o más de los siguientes: aceite de menta *mentha piperita*; aceite de menta *mentha arvensis*; aceite de menta *mentha spicata*; aceite de menta *mentha cardiaca*; aceite de menta *mitcham rosa*; aceite de menta de maíz; aceite de menta japonesa; aceite de menta china; y combinaciones de los mismos. Los proveedores del mentol o derivado de mentol incluyen Jindal Drugs Limited (Navi Mumbai, India) y Symrise (Goose Creek, SC).

[0023] En ciertas realizaciones, el mentol o el derivado de mentol está presente a concentraciones de al menos 0,001%, opcionalmente de 0,001% (o más de 0,001%) a 0,25%, opcionalmente de 0,01% a 0,15%, opcionalmente de 0,05% a 0,1 %, o, opcionalmente, aproximadamente 0,07%, en peso de la composición total.

[0024] Además del mentol o derivado de mentol, la composición de la presente invención puede comprender un agente sensado seleccionado del grupo que consiste en un derivado de carboxamida, ciclohexanocarboxamida, succinimida de mentilo de dimetilo, lactato de mentilo (disponible bajo el nombre comercial de Frescolat ML de Symrise GmbH & Co., Holzminden, Alemania), acetal de glicerina de mentona.

[0025] (Disponible bajo el nombre comercial Frescolat MGA de Symrise GmbH & Co., Holzminden, Alemania), mentoxipropanodiol (comercialmente disponible bajo el nombre comercial Coolact 10 y Coolact P (-)-isopulegol de Takasago Int'l Corp., Tokio, Japón); neoisomenthol, neomentol, isomentol, PMD 38 p-mentano-3,8,-diol, (2R)-3-(1-mentoxi)propan-1,2-diol, (2RS)-3-(1-mentoxi)propano-1,2-diol; N-etilo-p-mentano-3-carboxamida (WS-3), p-mentano-3-carboxilato de etilenglicol (WS-4), etilo de 3-(p-mentano-3-carboxamido)acetato (WS-5), N-(4-metoxifenilo)-p-mentano-3-carboxamida (WS-12), N-butilo-p-mentano-3-carboxamida (WS-14), 2-isopropilo-N-2,3-trimetilbutiramida (WS-23), 1-glicerilo p-mentano-3-carboxilato (WS-30) (todos comercialmente disponibles de Millennium Chemicals, Hunt Valley, Md., USA); derivados no mentol tales como derivados de fenol, por ejemplo, timol y eugenol, Icilina (Phoenix Pharmaceuticals, Belmont, CA, EE.UU.), 2(5H)-NIPF (Nestec, Vevey, Suiza), 4-metilo-3-(1-pirrolidinilo)2[5H]-furanona, MPD vanililo acetal (Takasago Int'l Corp., Tokio, Japón) Hotact VBE (Lipo Chemicals, Inc., Paterson, NJ, EE. UU.) o capsaicina (derivado de pimienta de cayena).

[0026] En ciertas realizaciones, el agente sensado puede estar presente, con o sin el mentol y/o derivado de mentol, a concentraciones de 0,001% a 1,0%, opcionalmente de 0,01% a 0,5% u opcionalmente de 0,1% a 0,4 % en peso de la composición total.

Componentes opcionales

[0027] Las composiciones de la presente invención pueden comprender además componentes opcionales (denominados colectivamente portadores o excipientes oralmente aceptables) que se describen en los siguientes párrafos junto con ejemplos no limitantes. Estos materiales de vehículo oralmente aceptables incluyen uno o más excipientes o diluyentes sólidos o líquidos compatibles que son adecuados para administración oral tópica. Por "compatible" se entiende que los componentes de la composición pueden mezclarse sin interacción de una manera que reduzca sustancialmente estabilidad y/o eficacia de la composición. Los vehículos o excipientes adecuados son bien conocidos en la técnica. Su selección dependerá de consideraciones secundarias como sabor, costo y estabilidad de almacenamiento, etc. Aunque a continuación se proporciona una lista general de componentes opcionales, se puede encontrar una discusión más detallada de los componentes opcionales adecuados (incluidos excipientes y vehículos) en la Publicación de Patente de EE. UU. 20110089073 a Baig et al.

Tensioactivo de alquilsulfato

[0028] Las composiciones líquidas orales también contienen al menos un tensioactivo de alquilsulfato. En ciertas realizaciones, los tensioactivos de alquilsulfato adecuados incluyen, pero no se limitan a C_8 a C_{18} sulfatados,

alcoholes de cadena de carbono con número par de C₁₀ a C₁₆ sulfatados opcionalmente neutralizados con una sal básica adecuada tal como carbonato de sodio o hidróxido de sodio y mezclas de los mismos. El tensioactivo de alquilsulfato tiene un número par C₈ a C₁₈, opcionalmente C₁₀ a C₁₆, longitud de cadena. En ciertas realizaciones, el sulfato de alquilo se selecciona del grupo que consiste en sulfato de laurilo sódico, sulfato de hexadecilo y mezclas de los mismos. En ciertas realizaciones, se usan mezclas comercialmente disponibles de alquilsulfatos. Un desglose porcentual típico de alquilsulfatos por longitud de la cadena alquílica en sulfato de laurilo sódico (SLS) comercialmente disponible del siguiente modo:

Longitud de cadena de alquilo	Porcentaje de componente en SLS
C ₁₂	> 60%
C ₁₄	20% - 35%
C ₁₆	< 10%
C ₁₀	< 1%
C ₁₈	< 1%

[0029] Las mezclas adecuadas comercialmente disponibles incluyen Stephanol WA-100 NF USP (Stepan, Northfield, ILO), Texapon K12 G PH (Cognis, Carlstadt, NJ) y mezclas de las mismas.

[0030] En ciertas realizaciones, la cantidad del tensioactivo de alquilsulfato añadido a la composición puede ser de 0,01% a 2,0% p/v, opcionalmente de 0,03% a 0,5% p/v, u opcionalmente de 0,04% a 0,35% p/v de la composición.

[0031] En ciertas realizaciones, la relación del sistema disolvente al tensioactivo de alquilsulfato en la composición debe ser de 360:1 a 10:1, opcionalmente de 100:1 a 20:1.

Tensioactivo adicional

[0032] En ciertas realizaciones, la presente invención contiene un tensioactivo además del tensioactivo de alquilsulfato para ayudar a la solubilización de aceites esenciales si están presentes, con la condición de que dichos tensioactivos adicionales no afecten a la biodisponibilidad de los aceites esenciales. Los ejemplos adecuados incluyen tensioactivos aniónicos adicionales, tensioactivos no iónicos, tensioactivos anfóteros y mezclas de los mismos.

[0033] Los tensioactivos aniónicos útiles en la presente invención incluyen, aunque sin limitación, tensioactivos de tipo sarcosina o sarcosinatos; tauratos tales como taurato de cocoilo de metilo sódico; sulfoacetato de laurilo sódico; isetonato de lauroilo sódico; carboxilato de laureth sódico; dodecibencenosulfonato de sodio y mezclas de los mismos. Muchos tensioactivos aniónicos adecuados se describen en la patente de los EE.UU. N°3.959.458, de Agrícola, et al.

[0034] Los tensioactivos no iónicos que se pueden usar en las composiciones de la presente invención incluyen, pero no se limitan a, compuestos producidos por la condensación de grupos óxido de alquileo (de naturaleza hidrófila) con un compuesto orgánico hidrófobo que puede ser alifático o alquilo-aromático en la naturaleza. Los ejemplos de tensioactivos no iónicos adecuados incluyen, pero sin limitación, alquilpoliglucósidos; aceites de ricino hidrogenados etoxilados disponibles comercialmente, por ejemplo, bajo el nombre comercial CRODURET (Croda Inc., Edison, NJ), y/o; etoxilatos de alcohol graso; condensados de óxido de polietileno de fenoles de alquilo; productos derivados de la condensación de óxido de etileno con el producto de reacción de óxido de propileno y etilendiamina; condensados de óxido de etileno de alcoholes alifáticos; óxidos de aminas terciarias de cadena larga; óxidos de fosfina terciaria de cadena larga; sulfóxidos de dialquilo de cadena larga; y mezclas de los mismos.

[0035] Los tensioactivos anfóteros útiles en la presente invención incluyen, pero no se limitan a, derivados de aminas alifáticas secundarias y terciarias en las que el radical alifático puede ser de cadena lineal o ramificada y en donde uno de los sustituyentes alifáticos contiene desde aproximadamente 8 hasta aproximadamente 18 átomos de carbono y uno contiene un grupo aniónico soluble en agua, por ejemplo, carboxilato, sulfonato, sulfato, fosfato o fosfonato. Los ejemplos de tensioactivos anfóteros adecuados incluyen, pero no están limitados a, alquilimino-dipropionatos, (mono o di) alquilafoglicinatos, (mono o di) alquilafopropionatos, (mono o di) alquilafacetatos, ácidos N-alquilo-aminopropiónicos, carboxilatos de alquilpoliamino, imidazolin fosforiladas, betaínas de alquilo, betaínas de alquilamido, betaínas de alquilamidopropilo, sultainas de alquilo, sultainas de alquilamido y mezclas de los mismos. En ciertas realizaciones, la tensioactiva anfotérica se selecciona del grupo que consiste en alquilamidopropilbetaínas, anfoacetatos tales como lauroanfoacetato de sodio y mezclas de los mismos. También se pueden emplear mezclas de cualquiera de los tensioactivos mencionados anteriormente. Puede encontrarse una discusión más detallada de tensioactivos aniónicos, no iónicos y anfóteros en las Patentes de Estados Unidos N° 7.087.650 de Lennon; 7.084.104 de Martin et al.; 5.190.747 de Sekiguchi et al.; y 4.051.234, Gieske, et al.

[0036] En ciertas realizaciones, el tensioactivo adicional es un taurato. En una realización, el tensioactivo adicional es taurato de cocoilo de metilo sódico.

[0037] Cuando están presentes un tensioactivo de alquilsulfato y aceites esenciales, el tensioactivo adicional puede añadirse a una concentración de aproximadamente 0,01% a 2,0% p/p, opcionalmente de 0,01% a 0,5% p/p, u opcionalmente de 0,01% a 0,2% p/p.

5 Aceites esenciales

[0038] En ciertas realizaciones, las composiciones de la presente invención pueden contener al menos un aceite esencial además de lo que pueden proporcionar los aceites descritos previamente como fuentes para el mentol y/o derivados de mentol.

[0039] El timol, $[(CH_3)_2CHC_6H_3(CH_3)OH]$, también conocido como isopropilo-m-cresol], es solo ligeramente soluble en agua pero es soluble en alcohol, y su presencia es una de las razones por las cuales el alcohol era necesario en enjuagues bucales comerciales bien establecidos y con alto contenido de alcohol. El salicilato de metilo, $[C_6H_4OHCOOCH_3]$, también conocido como aceite de gaulteria], también proporciona saborizante. El eucaliptol ($C_{10}H_{18}O$, también conocido como cineol) es un éter terpénico y proporciona un sabor refrescante y picante.

[0040] En ciertas realizaciones, la cantidad total de aceites esenciales presentes en las composiciones divulgadas puede ser de 0,001% a 0,35% p/v, u opcionalmente 0,16% a 0,28% p/v de la composición.

[0041] En algunas realizaciones, las composiciones de la presente invención contienen timol y adicionalmente eucalyptol, o salicilato de metilo, o mezclas de los mismos. Opcionalmente, la composición contiene los tres de estos aceites esenciales.

[0042] En ciertas realizaciones, el timol se emplea en cantidades de 0,001% a 0,25% p/v, u opcionalmente de 0,04% a 0,08% p/v de la composición. En ciertas realizaciones, el eucaliptol se puede emplear en cantidades de 0,001% a 0,25% p/v, u opcionalmente de 0,01% a 0,11% p/v de la composición, pero, en otras realizaciones, no más de 0,05% u opcionalmente 0,03% p/v de la composición. En ciertas realizaciones, el salicilato de metilo puede emplearse en cantidades de 0,001% a 0,25% p/v, u opcionalmente de 0,04% a 0,08% p/v de la composición.

[0043] En ciertas realizaciones, las composiciones de la invención incluyen un disolvente oralmente aceptable. Los disolventes oralmente aceptables incluyen, pero no se limitan a, agua, alcoholes monovalentes C_2-C_4 , propilenglicol y mezclas de los mismos. Cuando están presentes, los alcoholes monohídricos C_2-C_4 están en un nivel reducido.

[0044] Las composiciones de la presente invención también pueden incluir uno o más ingredientes opcionales que incluyen de forma no exclusiva un agente espesante, humectantes, agentes quelantes, agentes blanqueadores y aditivos tales como aromatizantes, conservantes, agentes de ajuste del pH y similares. El pH de las composiciones de esta invención se mantiene opcionalmente en el intervalo de 5 a 7,5 u opcionalmente de 5,5 a 7.

[0045] Los agentes espesantes disponibles comercialmente, que son capaces de impartir la viscosidad apropiada a las composiciones, son adecuados para uso en esta invención. Los ejemplos de agentes espesantes adecuados no exclusivos incluyen: mono o diésteres de 1) polietilenglicol de fórmula: $HO-(CH_2CH_2O)_zH$, en donde z es un número entero de aproximadamente 3 a aproximadamente 200; y 2) ácidos grasos que contienen de aproximadamente 16 a aproximadamente 22 átomos de carbono; ésteres de ácidos grasos de polioles etoxilados; derivados etoxilados de mono y diésteres de ácidos grasos y glicerina; hidroxialquilcelulosa; celulosa de alquilo; celulosa de alquilo de hidroxialquilo; y mezclas de los mismos. Los espesantes preferidos incluyen éster de polietilenglicol, u opcionalmente diestearato de PEG-150 que está disponible de la Stepan Company de Northfield, Illinois o de Comiel, S.p.A. de Bolonia, Italia, bajo el nombre comercial "PEG 6000 DS".

[0046] Los humectantes disponibles comercialmente son adecuados para usar en la presente invención. El humectante puede estar presente en una cantidad de 0% a 20%, opcionalmente de 0,5% a 15%, u opcionalmente de 0,5% a 10%, basado en el peso total de la composición. Ejemplos de humectantes adecuados incluyen: 1) polioles líquidos solubles en agua seleccionados del grupo que comprende o que consiste en sorbital, glicerina, propilenglicol, hexilenglicol, butilenglicol, dipropilenglicol y mezclas de los mismos; 2) polialquilenglicol de la fórmula: $HO-(R''O)_b-H$, en donde R'' es un grupo alquilo que tiene de 2 a 3 átomos de carbono y b es un número entero de 2 a 10; 3) polietilenglicoléter de metilglucosa de fórmula $CH_3-C_6H_{10}O_5-(OCH_2CH_2)_c-OH$, en donde c es un número entero de 5 a 25; 4) urea; y 5) mezclas de los mismos, en ciertas realizaciones, el humectante es una mezcla de sorbitol y propilenglicol.

[0047] Los ejemplos de agentes quelantes adecuados incluyen aquellos que son capaces de proteger y preservar las composiciones de esta invención. Opcionalmente, el agente quelante es ácido etilendiaminotetraacético ("EDTA"), u opcionalmente es EDTA tetrasódico, disponible comercialmente de Dow Chemical Company de Midland, Michigan con el nombre comercial "Versene 100XL" y está presente en una cantidad, basada en el peso total de la composición, de 0 a 0,5% u opcionalmente de 0,05% a 0,25%.

[0048] Los conservantes adecuados incluyen, benzoato de sodio y poliisorabato, y están presentes en la composición en una cantidad, basada en el peso total de la composición, de 0 a 0,2%, u opcionalmente de 0,05% a

0,10%.

[0049] Las composiciones descritas anteriormente se pueden preparar combinando los componentes deseados en un recipiente adecuado y mezclándolos en condiciones ambientales en cualquier medio de mezcla convencional bien conocido en la técnica, tal como una hélice agitada mecánicamente, paleta y similares.. El orden de mezcla no es crítico.

[0050] La invención ilustrativamente descrita en el presente documento se puede poner en práctica adecuadamente en ausencia de cualquier componente, ingrediente o etapa que no se describa específicamente en el presente documento. Varios ejemplos se exponen a continuación para ilustrar adicionalmente la naturaleza de la invención y la manera de llevarla a cabo. Sin embargo, la invención no debe considerarse como limitada a los detalles de la misma.

[0051] En ciertas realizaciones, las composiciones de la presente invención están libres o esencialmente libres de goma de mascar o base de goma de mascar. La goma de mascar o las bases de goma de mascar tienden a atrapar o inhibir la disponibilidad de agentes de cuidado oral tales como las sales de diácido, triácido o tetraácido C₂-C₅ de la presente invención de modo que no pueden realizar su función prevista. Además, la fusión y la mezcla de la masa de goma altamente viscosa (es decir, de la goma de mascar o de la base de goma de mascar) dificulta el control de la precisión de dosificación y la uniformidad de dichos agentes para el cuidado bucal. "Esencialmente libre" como se usa con respecto a la goma de mascar o base de goma de mascar se define como formulaciones que tienen menos de 5%, opcionalmente, 3%, opcionalmente, 1%, u opcionalmente 0,1, u opcionalmente, 0,01%, en peso (p/v) de la composición total de un compuesto que afecta la biodisponibilidad. En ciertas realizaciones, el compuesto que afecta a la biodisponibilidad puede incluir, pero no se limita a, copolímeros de bloques de óxido de polietileno/óxido de polipropileno tales como poloxámeros; ciclodextrinas; polisorbatos tales como Tweens; y mezclas de los mismos. Los gomas de mascar y la base de goma de mascar se describen con más detalle en la Publicación de Patente US 2006/0280852 de Harvey et al.

EJEMPLOS

[0052] Los siguientes ejemplos son solo ilustrativos y no deben interpretarse como limitativos de la invención de ninguna manera. Los expertos en la técnica apreciarán que son posibles variaciones que están dentro del alcance de las reivindicaciones adjuntas.

Calificación de aceptabilidad del sabor

[0053] Las composiciones de la presente invención que contienen oxalato de potasio se evaluaron respecto a la aceptabilidad del sabor. La evaluación del sabor de las composiciones se realizó por un grupo de prueba de 190 miembros. Se pidió a los miembros que agitaran 10 ml de cada composición de los Ejemplos A a E (**Tabla 1**) en sus bocas durante 60 segundos, expectoran y proporcionarían una calificación de aceptabilidad del sabor en una escala de 1 a 9, usando la siguiente escala de gusto general del sabor: 0-4 = inaceptable; 5 = neutral; y 6-9 = aceptable. Las composiciones de la Tabla 1 se prepararon usando tecnología de mezcla convencional.

	Ejemplo A (Ejemplo comparativo)	Ejemplo B (Ejemplo comparativo)	Ejemplo C (Ejemplo comparativo)	Ejemplo D (Ejemplo comparativo)	Ejemplo E (Ejemplo comparativo)	Ejemplo F (Ejemplo inventivo)
	Conc. (%)	Conc. (%)	Conc. (%)	Conc. (%)	Conc. (%)	Conc. (%)
Ingrediente						
Agua purificada	66,6781	66,6000	60,73000	66,6500	60,7600	60,6500
190 control alcohol etílico	9,6235	9,6235	---	9,6235	---	---
Solución de sorbitol, 70%	19,3311	19,3311	27,3474	19,3311	27,3474	27,3474
Monohidrato de oxalato potásico	1,9247	1,9247	1,2762	1,9247	1,2762	1,2762
Ácido fosfórico NF	1,2992	1,2992	0,2188	1,2992	0,2188	0,2188
Sacarina sódica	0,2900	0,2900	0,0456	0,2900	0,0456	0,0456
Poloxámero 407	0,2406	0,2406	0,2279	0,2406	0,2279	0,2279
Eucaliptol	0,0887	0,0887	---	0,0887	---	---
Salicilato metílico	0,0638	0,0638	---	0,0638	---	---
Timol	0,0615	0,0615	---	0,0615	---	---
Mentol (componente de sabor menta)	0,0385	0,0423	---	0,0423	---	---
Polvo de sucralosa NF	0,0385	0,0385	0,0182	0,0385	0,0182	0,0182
Fluoruro sódico	0,0213	0,0213	---	0,0213	---	---
Color	0,0005	0,0005	---	0,0005	---	---
Ácido benzoico	---	---	0,1367	---	0,1367	0,1367
PEG 400	---	---	7,2926	---	7,2926	7,2926
Glicerina	---	---	2,2789	---	2,2789	2,2789
Cocamidopropil 1 betaina	---	---	0,0912	---	0,0912	0,0912
Sulfato de laurilo sódico NF	---	---	0,0912	---	0,0912	0,0912
Familia de sabro cítrico	---	0,3750	---	---	---	---
Sabor - Herbal (baya)	---	---	0,3250	---	---	---
Sabor - Herbal (té verde)	---	---	---	0,3250	---	---
Sabor - Menta	0,3000	---	---	---	0,3000	0,2850
Vainillina etílica	---	---	---	---	---	0,0400
TOTAL	100,0000	100,0007	100,0797	100,0007	100,0847	99,9997
Escala de apreciación global de sabor (1 a 9) valoración media. (p=0,06)	3,5	3,0	5,2	2,8	5,2	6,2

En base a la escala de apreciación global de sabor, los resultados de la Tabla 1 muestran que solo el Ejemplo F inventivo que contiene el extracto de sabor de vainillina con la sal de oxalato y el mentol proporcionaron una puntuación (puntuación de 6,2) en el rango de 5 a mayor de 6. Notablemente, formulaciones sin el extracto de vainillina, es decir aquellas que contienen sabor a menta más aceites esenciales (puntuación 3,5), sabor cítrico más aceites esenciales (puntuación 3,0), té verde a base de hierbas más aceites esenciales (puntuación 2,8) o sabor a menta solo (puntuación 5,2) dieron como resultado puntuaciones bajas de 5 o menos.

[0054] Las realizaciones adicionales de la presente invención se ejemplifican en los Ejemplos 1 y 2 de la Tabla 2 y se pueden preparar usando tecnología de mezcla convencional. Cada uno de los Ejemplos 1 y 2 proporciona puntajes (puntaje de 5,9 y puntaje de 5,7, respectivamente) en el rango alto de 5.

Tabla 2

	Ejemplo 1	Ejemplo 2
Ingrediente	Concentración (%)	Concentración (%)
Agua purificada	82,7343	82,8255
190 control alcohol etílico		
Solución de sorbitol, 70%	9,6098	9,6098
Monohidrato de oxalato potásico	1,3454	1,3454
Ácido fosfórico NF	0,3350	0,3350
Sacarina sódica	0,0480	0,0200
Poloxámero 407	0,2402	0,2402
Polvo de sucralosa NF	0,0192	0,0400
Sulfato de laurilo sódico NF	0,0500	0,0500
Benzoato sódico	0,1441	0,1441
Sodio, taurato de cocoilo metílico	0,0600	0,0600
Propilenglicol	5,0000	5,0000
Vainillina etílica	0,400	0,0400
Mentol	0,0701	0,0701
Timol	0,0640	0,0640
Salicilato metílico	0,0660	0,0660
Eucaloptol	0,0923	0,0300
Sabor	0,0910	0,0660
TOTAL	100,0000	100,0000
Escala de apreciación global de sabor (1 a 9) valoración media. (p=0,06)	5,9	5,7

Reivindicaciones

1. Una composición para tratar dientes sensibles que comprende:

- i. de 0,1% a 3% de al menos una sal de potasio de un diácido, triácido o tetraácido C₂-C₅;
- ii. al menos un extracto de sabor de vainilla, en el que el extracto de sabor de vainilla comprende vainillina de etilo;
- iii. de 0,001% a 0,25% de mentol o un derivado del mismo; y
- iv. al menos un disolvente oralmente aceptable;

en donde la cantidad total de diácido, triácido o sales tetraácidas C₂-C₅ es de 0,1% a 3%; y en donde la composición es un enjuague bucal y comprende hasta 1% v/v de la composición total de alcoholes monohídricos C₂-C₄.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende además de 0,01% a 2% de un tensioactivo de alquilsulfato.

3. Las composiciones según la reivindicación 2, en las que el tensioactivo de alquilsulfato es un tensioactivo de alquilsulfato que tiene una longitud de la cadena C₈ a C₁₈ de numeración par.

4. Las composiciones de acuerdo con la reivindicación 3, en las que el tensioactivo de alquilsulfato se selecciona del grupo que consiste en laurilsulfato de sodio, hexadecilsulfato y mezclas de los mismos.

5. La composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 2-4 que comprende adicionalmente de 0,01% a 2% de un tensioactivo adicional.

6. La composición de acuerdo con la reivindicación 5, en la que el tensioactivo adicional es un taurato.

7. La composición de acuerdo con la reivindicación 6, en la que el tensioactivo adicional es taurato de cocoilo metílico.

8. La composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en la que el extracto de aroma de vainilla es una mezcla de vainillina de etilo y un extracto de sabor seleccionado del grupo que consiste en vainillina, heliotropina, guatehol de propenilo, extractos de vainilla, veratraldehído, 4-cis-heptenal, diacetilo, lactato de butilo, lactato de etilo, acetato de metilo-para-terc-butilfenilo, hexalactona y heptalactona gamma y delta, benzodihidropirona, destilado inicial de mantequilla, tetradecalactona delta y butiraldehído.

9. La composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en la que la composición contiene de 0,001% a 0,12% del extracto de aroma de vainilla.

10. La composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1-9, en la que la composición contiene de 0,01% a 0,15% del mentol o un derivado del mismo.

11. La composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1-10, en la que el mentol o derivado del mismo es mentol.

12. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en la que la composición está libre de alcoholes monovalentes C₂-C₄.

13. La composición de una cualquiera de las reivindicaciones 1-12, para uso en el tratamiento de dientes sensibles, comprendiendo dicho tratamiento la etapa de aplicar la composición a al menos un diente sensible.