

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 683 128**

51 Int. Cl.:

A61K 8/19 (2006.01)

A61K 8/25 (2006.01)

A61Q 11/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **05.06.2014 PCT/JP2014/064934**

87 Fecha y número de publicación internacional: **11.12.2014 WO14196592**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.06.2014 E 14808461 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.05.2018 EP 3006013**

54 Título: **Composición oral que contiene partículas de diamante**

30 Prioridad:

07.06.2013 JP 2013120779

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

25.09.2018

73 Titular/es:

**SUNSTAR SUISSE SA (100.0%)
Route de Pallatex 15
1163 Etoy, CH**

72 Inventor/es:

FUJISAWA, KOUICHI

74 Agente/Representante:

CURELL AGUILÁ, Mireia

ES 2 683 128 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 oral que contiene partículas de diamante.

5 Campo técnico

La presente invención se refiere a una composición oral que comprende partículas de diamante, y más específicamente a una composición para la cavidad bucal que comprende partículas de diamante específicas y partículas de sílice abrasiva específicas. La presente solicitud reivindica prioridad de la solicitud de patente japonesa nº 2013-120779, presentada el 7 de junio de 2013.

Técnica anterior

La decoloración del diente es consecuencia de la deposición sobre el diente de sustancias cromógenas denominadas "manchas". Esto provoca un grave problema desde el punto de vista estético. Como medio para eliminar manchas, es importante el cepillado de los dientes. Por ejemplo, se mantiene en la boca una composición oral tal como una composición dentífrica que comprende un abrasivo dental con un utensilio tal como un cepillo dental, y se cepillan los dientes a fin de eliminar manchas de la superficie de los dientes. Se considera que un abrasivo dental con un poder abrasivo más elevado tiene un efecto de eliminación de manchas más elevado y, por lo tanto, parece preferible para lograr este fin. Esto es debido a que un abrasivo dental más duro produce una abrasión sobre la superficie de los dientes con una fuerza física superior y, por lo tanto, se considera que proporciona un efecto de eliminación de manchas más elevado.

No obstante, cuando se utiliza una composición oral que contiene un abrasivo dental que tiene un poder abrasivo elevado, existe el riesgo de que pueda provocarse sobre el diente más abrasión de la necesaria. Por ejemplo, la alúmina, que es un ejemplo típico de abrasivo dental duro, tiene un poder de eliminación de manchas excelente, pero también daña el diente por abrasión. Aunque se han desarrollado diversas estrategias para prevenir el daño a los dientes, el problema aún no se ha resuelto. Actualmente las composiciones orales raramente contienen alúmina.

El documento US2010254915 divulga un dentífrico blanqueador o una composición de pulido dental que comprende partículas de diamante de 0,05 a 5,0 micrómetros. El intervalo de tamaño más preferido es de 0,1 a 0,5 micrómetros. Todos los ejemplos utilizan polvo de diamante con un tamaño de 0,5 micrómetros. Los ejemplos comprenden todos, también, un abrasivo de sílice.

El documento WO2010060653 divulga un producto de cuidado bucal que comprende partículas de diamante que presentan tamaños dentro de un primer intervalo de tamaño de 0,3 a 2,5 micrómetros. Estas bloquean los túbulos y también eliminan manchas y pulen los dientes.

La RDA (abrasión de dentina relativa) y la REA (abrasión de esmalte relativa) se utilizan ampliamente como índices del poder abrasivo de abrasivos dentales. Como se ha definido, la RDA es un índice del grado de abrasión de la dentina del diente, mientras que la REA es un índice del grado de abrasión del esmalte del diente. La superficie del diente es esmalte. No obstante, cuando las encías se contraen debido a periodontitis o trastornos similares, la dentina puede quedar al descubierto. En consecuencia, deberían medirse tanto la RDA como la REA.

Para eliminar manchas o similares de la superficie dental, los abrasivos dentales tienen preferentemente por lo menos algún grado de RDA. No obstante, los abrasivos dentales con una RDA demasiado elevada pueden causar mucha abrasión sobre la superficie del diente, por lo que no se recomiendan. Las normas internacionales ISO de 1995 sobre "propiedades físicas y seguridad de abrasivos dentales" establecen que la RDA no debería ser superior a 250. La dentina, habitualmente, no está al descubierto en la superficie. Incluso si la dentina está al descubierto, debe minimizarse el daño a la misma. En consecuencia, la REA, que es un índice del desgaste del esmalte normalmente dispuesto al descubierto sobre la superficie dental, no excede preferentemente un valor específico (normalmente 40).

Como se ha descrito anteriormente, existe la necesidad de una composición oral que tenga un poder de eliminación de manchas elevado y un poder abrasivo apropiado.

Listado de referenciasLiteratura de patente

60 PTL 1: panfleto WO 10/060653

Sumario de la invención

Problema técnico

- 5 Un objetivo de la presente invención es proporcionar una composición oral que tenga una gran capacidad para eliminar manchas de la superficie de los dientes y un poder abrasivo adecuado.

Solución al problema

- 10 En el contexto de la presente invención se ha descubierto que una composición oral que comprende partículas de diamante específicas y partículas de sílice abrasiva específicas tiene un poder de eliminación de manchas marcadamente elevado, así como una capacidad de abrasión tal que su poder abrasivo sobre la dentina no excede el valor óptimo (aproximadamente 150) y su poder abrasivo sobre el esmalte no es ni demasiado pequeño ni demasiado grande. Se completó la presente invención con las mejoras adicionales basadas en este hallazgo.

- 15 Específicamente, la presente invención comprende, por ejemplo, los objetos descritos en los puntos siguientes.

- 20 Punto 1. Composición oral que comprende partículas de diamante y partículas de sílice abrasiva, en la que las partículas de diamante tienen un tamaño cuya mediana (d50) es de 2,0 a 3,5 μm y las partículas de sílice abrasiva presentan una RDA no inferior a 50 y no superior a 200.

- 25 Punto 2. Composición oral según el punto 1, en la que las partículas de diamante son de tal forma que la diferencia entre el valor del percentil 10 (d10) en distribución de tamaño de partícula acumulativa y el d50 no supera 2 μm , y la diferencia entre el valor del percentil 99 (d99) en la distribución de tamaño de partícula acumulativa y el d50 no supera 3 μm .

Punto 3. Composición oral según el punto 1 o 2, en la que las partículas de sílice abrasiva tienen un tamaño cuya mediana (d50) es de 2,5 a 10 μm .

- 30 Punto 4. Composición oral según uno cualquiera de los puntos 1 a 3, en la que las partículas de diamante están presentes en una cantidad del 0,1 al 0,3% en masa.

- 35 Punto 5. Composición oral según uno cualquiera de los puntos 1 a 4, en la que las partículas de sílice abrasiva están presentes en una cantidad del 1 al 10% en masa.

Punto 6. Composición oral según uno cualquiera de los puntos 1 a 5, que además comprende un tensioactivo de sulfosuccinato.

Efectos ventajosos de la invención

- 40 La composición oral de la presente invención tiene un poder de eliminación de manchas excelente y un poder abrasivo excelente. (Es decir, el poder abrasivo sobre la dentina no excede el valor óptimo (preferentemente no excede aproximadamente 150) y el poder abrasivo sobre el esmalte no es ni demasiado pequeño ni demasiado grande). Por lo tanto, la composición oral de la presente invención puede utilizarse preferentemente para el cuidado dental.

Descripción de formas de realización

- 50 La presente invención se describe a continuación con mayor detalle.

La composición oral de la presente invención comprende partículas de diamante específicas y partículas de sílice abrasiva específicas.

- 55 Las partículas de diamante específicas tienen un tamaño cuya mediana (diámetro de partícula correspondiente al 50% en la distribución de tamaño de partícula acumulativa (es decir, el 50% de diámetro acumulativo): d50) es de 2 a 3,5 μm , preferentemente de 2,5 a 3,5 μm y de forma más preferida de 2,5 a 3 μm . Las partículas de diamante tienen preferentemente una distribución de tamaño de partícula aguda. Específicamente, las partículas de diamante son preferentemente de tal forma que la diferencia entre el valor del percentil 10 (10% de diámetro acumulativo: d10) en la distribución de tamaño de partícula acumulativa y d50 no supera 2 μm , y la diferencia entre el valor del percentil 99 (99% de diámetro acumulativo: d99) en la distribución de tamaño de partícula acumulativa y d50 no supera 3 μm . La diferencia entre d10 y d50 es de forma más preferida no superior a 1,5 μm , y de forma incluso más preferida no superior a 1 μm . La diferencia entre d99 y d50 es de forma más preferida no superior a 2,5 μm , y de forma incluso más preferida no superior a 2 μm .

- 65 El tamaño de partícula (diámetro acumulativo) de las partículas de diamante mencionado en la presente memoria es un valor determinado sobre la base del principio de Coulter (el procedimiento de la zona de detección eléctrica)

utilizando agua como dispersante (es decir, un valor obtenido utilizando un contador Coulter). Este valor puede medirse, por ejemplo, utilizando un contador Multisizer 3 Coulter (producido por Beckman Coulter, Inc.).

5 El tamaño de partícula (diámetro acumulativo) de las partículas de sílice mencionado en la presente memoria es un valor obtenido utilizando difracción/dispersión láser. Este valor puede medirse, por ejemplo, utilizando un aparato Malvern Mastersizer sobre la base del principio de difracción de Fraunhofer utilizando un láser de He/Ne de baja potencia.

10 No existe mucha diferencia en su efecto independientemente de si el diamante es natural o sintético. Se prefieren los diamantes sintéticos, que están disponibles a un precio relativamente bajo. Dichas partículas de diamante pueden obtenerse adquiriendo productos comercialmente disponibles de Micro-diamond Co., Ltd., BM Group Co., Ltd., etc.

15 Los presentes inventores han encontrado que una composición oral que contiene partículas de diamante tiene unas propiedades específicas tales que la composición presenta algún grado de potencia limpiadora (PCR), aunque insuficiente, y provoca una buena abrasión sobre la parte dura (esmalte) de la superficie dental, mientras que no provoca mucha abrasión sobre la parte blanda (dentina) de la superficie dental. En consecuencia, cuando las partículas de diamante se incorporan a una composición oral, la REA de la composición resultante puede ser demasiado elevada. Para asegurar unas propiedades de limpieza suficientes, debería utilizarse también sílice con un valor de RDA no inferior a un valor específico (50 o superior). No obstante, si se incorpora sílice en una cantidad suficiente para asegurar propiedades de limpieza desde el punto de vista de eliminación de manchas, la RDA del dentífrico se torna demasiado elevada, y el uso diario de dicho dentífrico puede dañar los dientes. Los presentes inventores han encontrado que el uso combinado de sílice abrasiva con diamante que presenta un diámetro de partícula específico y una distribución del tamaño de partícula específico puede proporcionar una REA, una RDA y una PCR apropiadas.

20 La REA del dentífrico (partículas de diamante y partículas de sílice abrasiva) mencionada en la presente memoria es un valor determinado según el procedimiento descrito en la norma ISO 11609: 2010, anexo B. La REA puede obtenerse, por ejemplo, solicitando a Therametric Technologies, Inc., Indiana 46060, Estados Unidos, que realice la medición.

25 En general, el abrasivo dental presenta preferentemente una REA de 40 o inferior.

35 Las partículas de sílice abrasiva tienen un valor de RDA de por lo menos 50 y no superior a 200, preferentemente de por lo menos 75 y no superior a 170 y de forma más preferida de por lo menos 100 y no superior a 160 y de la forma más preferida de por lo menos 120 y no superior a 150. El procedimiento de producción de partículas de sílice abrasiva no está particularmente limitado. Dichas partículas de sílice pueden ser, por ejemplo, partículas de sílice precipitada, partículas de sílice fundida y partículas similares.

40 La RDA de las partículas mencionada en la presente memoria es un valor determinado mediante el procedimiento descrito en la norma ISO 11609: 2010, anexo B. La RDA puede obtenerse, por ejemplo, solicitando a Therametric Technologies, Inc., Indiana 46060, Estados Unidos, que realice la medición.

45 Las partículas de sílice abrasiva tienen preferentemente un tamaño cuya mediana (50% de diámetro acumulativo; d₅₀) es de 2,5 a 10 µm y de forma más preferida de 2,5 a 9 µm. No se recomienda un tamaño cuya mediana sea demasiado elevada debido a que el valor de PCR no aumenta y el valor de RDA se incrementa.

50 Como dichas partículas de sílice abrasiva pueden adquirirse y utilizarse, por ejemplo, productos comerciales disponibles de PQ Silicas, Ltd., Huber Corporation, Evonik Degussa y Rhodia, Inc.

55 La composición oral de la presente invención comprende preferentemente las partículas de diamante específicas en una cantidad del 0,1 al 0,3% en masa, y de forma más preferida del 0,15 al 0,25% en masa. Dichos niveles del contenido de partículas de diamante pueden proporcionar de forma más preferida el efecto de la presente invención y también, preferentemente, inhibir que la REA se vuelva demasiado elevada.

60 La composición oral de la presente invención comprende preferentemente las partículas de sílice abrasiva específicas en una cantidad de por lo menos el 1% en masa y no superior al 10% en masa, y de forma más preferida del 1 al 8% en masa, y de forma incluso más preferida del 2 al 7% en masa. Dichos niveles del contenido de sílice abrasiva pueden proporcionar preferentemente el efecto de la presente invención.

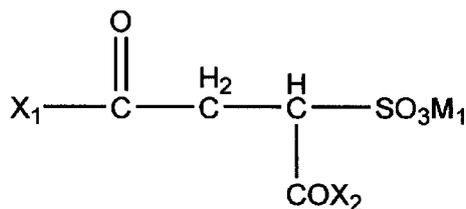
65 En particular, una composición oral que presenta el contenido de partículas de diamante anterior y el contenido de partículas de sílice abrasiva anterior puede proporcionar de forma particularmente preferida el efecto de la presente invención.

Preferentemente, la composición oral de la presente invención comprende además, preferentemente, un tensioactivo de sulfosuccinato. El tensioactivo de sulfosuccinato es un componente que se incorpora habitualmente como agente

espumante a composiciones para la cavidad bucal. Una composición oral de la presente invención que contiene un tensioactivo de sulfosuccinato, además de partículas de diamante y de partículas de sílice abrasiva, puede producir, de forma más preferida, sinérgicamente el efecto de la presente invención.

5 Aunque el tensioactivo de sulfosuccinato que puede utilizarse en la presente invención no está particularmente limitado, se prefieren los tensioactivos de sulfosuccinato de alquilo. Por ejemplo, pueden utilizarse preferentemente monoésteres de ácido sulfosuccínico. Por ejemplo, pueden utilizarse los monoésteres de ácido sulfosuccínico divulgados en el documento JP2003-81796A. Específicamente, pueden utilizarse preferentemente monoésteres de ácido sulfosuccínico representados por la fórmula (1).

10



15

(en la que o bien X_1 o bien 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 $\text{M}_2\text{O}-$; M_1 y M_2 son iguales o diferentes y cada uno representa hidrógeno, metal alcalino, metal alcalinotérreo, amonio o alcanolamina; R_1 es un grupo alquilo o alqueno que tiene de 8 a 22 átomos de carbono; AO es un grupo oxialquilenilo que tiene 2 o 3 átomos de carbono y el número de moles de adición promedio n de AO es de 0 a 20; y B es $-\text{NH}-$ o un residuo de monoalcanolamina que tiene 2 o 3 átomos de carbono).

20 En el monoéster de ácido sulfosuccínico representado por la fórmula (1), R_1 es un grupo alquilo o alqueno lineal o ramificado, natural o sintético, que tiene de 8 a 22 átomos de carbono, tal como Laurilo, cocoilo, miristilo, estearilo, alquilo $\text{C}_{12}-\text{C}_{14}$ sintético, isononilo, isododecilo, octenilo y dodecenilo. Cuanto más larga sea la cadena de carbonos de R_1 , más reducidos serán el amargor y el estímulo, mientras que cuanto más corta sea la cadena de carbonos de R_1 , mayor será el efecto de inhibición de formación de manchas. Así, R_1 tiene preferentemente de aproximadamente 10 a 16 átomos de carbono, y de forma más preferida de aproximadamente 12 a 14 átomos de carbono. En particular, lo que más se prefiere es alquilo $\text{C}_{12}-\text{C}_{14}$ sintético o una combinación de Laurilo y miristilo.

25

M_1 y M_2 pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa hidrógeno, un metal alcalino, un metal alcalinotérreo, amonio o alcanolamina. Los ejemplos de metales alcalinos incluyen sodio, potasio y metales similares. Los ejemplos de metales alcalinotérreos incluyen magnesio y metales similares. Los ejemplos de alcanolaminas incluyen monoetanolamina, dietanolamina, trietanolamina y compuestos similares. Entre los mismos, M_1 y M_2 son preferentemente sodio y magnesio, siendo de forma particularmente preferida sodio.

30

35 El grupo AO es un grupo oxialquilenilo que tiene aproximadamente 2 o 3 átomos de carbono, y es preferentemente un grupo oxietileno. El número de moles de adición promedio n de AO es preferentemente de aproximadamente 0 a 20. Cuando el número de moles de adición promedio n disminuye, el efecto de inhibición de formación de manchas aumenta y el amargor también disminuye. Por lo tanto, n es preferentemente de aproximadamente 0 a 7, y de la forma más preferida de aproximadamente 0 a 2. Un número de moles de adición promedio de AO de 0 significa que el monoéster de sulfosuccinato no contiene grupos oxialquilenilo.

35

40 Los ejemplos de monoésteres de ácido sulfosuccínico representados por la fórmula (1) son polioxietilén (7 moles)-lauril-sulfosuccinato de disodio, polioxietilén (2 moles)-lauril-sulfosuccinato de disodio, polioxietilén (1 mol)-lauril-sulfosuccinato de disodio, lauril-sulfosuccinato de disodio, polioxietileno (7 moles)-miristil-sulfosuccinato de disodio, polioxietilén (2 moles)-alquil (C_{12-14})-sulfosuccinato de disodio, polioxietilén (1 mol)-alquil (C_{12-14})-sulfosuccinato de disodio, polioxietilén (2 moles)-lauril-sulfosuccinato de magnesio, polioxietilén (2 moles)-alquil (C_{12-14})-sulfosuccinato de magnesio, polioxietilén (7 moles)-miristil-sulfosuccinato de dietrietanolamina y similares.

45

El monoéster de ácido sulfosuccínico más adecuado es una sal de sodio de fórmula (1) en la que R_1 es un grupo alquilo que tiene de aproximadamente 12 a 14 átomos de carbono, el grupo AO es oxietileno, y el número de moles de adición promedio n de AO es de aproximadamente 0 a 2. Ejemplos específicos son polioxietilén (2 moles)-alquil (C_{12-14})-sulfosuccinato de disodio, polioxietilén (1 mol)-alquil (C_{12-14})-sulfosuccinato de disodio, alquil (C_{12-14})-sulfosuccinato de disodio y compuestos similares.

50

Pueden utilizarse tensioactivos de sulfosuccinato individualmente o en combinaciones de dos o más.

55 La composición oral de la presente invención comprende preferentemente un tensioactivo de sulfosuccinato en una cantidad de, por ejemplo, aproximadamente el 0,1 al 10% en masa, de forma más preferida de aproximadamente el

0,2 al 5% en masa y de forma incluso más preferida de aproximadamente el 0,5 al 2% en masa.

La composición oral de la presente invención puede producirse utilizando un procedimiento conocido La composición oral de la presente invención puede utilizarse para dientes y dentaduras postizas, y puede formularse en dentífricos de diversas formas mediante procedimientos habituales, tales como dentífricos en pasta, dentífricos en polvo, dentífricos en crema, dentífricos en gel, dentífricos líquidos, pastas y similares. En particular, se prefieren dentífricos en pasta, dentífricos en polvo, dentífricos en crema o dentífricos en gel.

La composición oral de la presente invención puede producirse, por ejemplo, mezclando partículas de diamante y partículas de sílice (y otros componentes, si es necesario) con un material de base que sea farmacéuticamente aceptable o higiénicamente aceptable en la cavidad bucal. Los ejemplos de dicho material de base incluyen agua, glicerina, etilenglicol, dietilenglicol, polietilenglicol, propilenglicol, polipropilenglicol, sorbitol, xilitol, lactitol, manitol, etanol y compuestos similares.

La composición oral de la presente invención puede contener otros componentes (componentes opcionales) que se incorporan habitualmente en composiciones orales

Los ejemplos de tensioactivos que pueden incorporarse incluyen, además de tensioactivos de sulfosuccinato de alquilo, tensioactivos no iónicos, tensioactivos aniónicos y tensioactivos anfóteros. Ejemplos específicos de tensioactivos no iónicos incluyen ésteres de ácidos grasos, alcanolamidas de ácidos grasos, ésteres de sorbitán de ácidos grasos, monoglicéridos de ácidos grasos, ésteres de poliglicerol de ácidos grasos, polioxietilén-alquil-fenil-éteres, alquil-glicósidos, sebacato de dietilo, aceites de ricino hidrogenados con polioxietileno, ésteres de polioxietilén-sorbitán de ácidos grasos y similares. Los ejemplos de tensioactivos aniónicos incluyen alquilsulfatos (tales como laurilsulfato de sodio), polioxietilén-alquiletersulfatos, polioxietilén-alquiletersulfosuccinatos, sales ácidas de N-acilamino, sales de N-aciltaurina, alquiletercarboxilatos, alquifosfatos, polioxietilén-alquileterfosfatos, sulfatos de monoglicéridos de ácidos grasos, alquilsulfoacetatos y similares. Los ejemplos de tensioactivos anfóteros incluyen alquildimetilaminoacetatobetaínas, alquilamidopropildimetil-aminoacetatobetaínas, N-acil-N-carboximetil-N-hidroxi-etilendiaminas, N-alquilaminoetilglicinas y similares. Estos tensioactivos se pueden utilizar individualmente o en combinaciones de dos o más. Dichos tensioactivos se incorporan normalmente en una cantidad del 0,1 al 10% en masa, con respecto a la masa total de la composición.

Los ejemplos de espesantes que pueden incorporarse incluyen derivados de celulosa tales como carragenano, carboximetilcelulosa o sales de la misma, hidroxipropilcelulosa, hidroxipropilmetilcelulosa, hidroxietilcelulosa, y celulosa cristalina-carmelosa sódica; gomas tales como goma xantana, goma tragacanto, goma caraya, goma arábica y goma gellan; aglutinantes sintéticos tales como poli(alcohol vinílico), poli(acrilato sódico), polímero carboxivinílico y polivinilpirrolidona; aglutinantes inorgánicos tales como espesantes de sílice (por ejemplo, sílice que tiene una RDA de 10 o inferior), sílice sililada, gel de sílice de aluminio y veegum; alginato de sodio, pectina, polisacáridos de soja, condroitinsulfato de sodio, hialuronato de sodio y similares. Estos espesantes se pueden utilizar individualmente o en combinaciones de dos o más. Dichos espesantes se incorporan normalmente en una cantidad del 0,01 al 20% en masa.

Los ejemplos de agentes saborizantes que pueden incorporarse incluyen mentol, ácido carboxílico, anetol, eugenol, salicilato de metilo, limoneno, ocimeno, alcohol n-decílico, citronelal, α -terpineol, acetato de metilo, acetato de citronelilo, metileugenol, cineol, linalool, etil-linalool, timol, aceite de hierbabuena, aceite de menta piperita, aceite de limón, aceite de naranja, aceite de salvia, aceite de romero, aceite de canela, aceite de Perilla frutescens, aceite de gaulteria, aceite de clavo, aceite de eucalipto, aceite de pimienta, d-canfor, d-borneol, aceite de hinojo, aceite de canela, cinamaldehído, aceite de menta, vainillina y similares. Estos agentes saborizantes se pueden utilizar individualmente o en combinaciones de dos o más. Dichos agentes saborizantes se incorporan normalmente en una cantidad del 0,01 al 1% en masa, con respecto a la masa total de la composición.

Los ejemplos de agentes edulcorantes que pueden incorporarse incluyen sacarina sódica, acesulfamo potásico, estevióside, extracto de estevia, sucralosa, neohesperidil-dihidrocalcona, glicirricina, perilartina, taumatina, éster metílico de aspartil-fenilalanilo, aldehído p-metoxicinámico y similares. Estos agentes edulcorantes se pueden utilizar individualmente o en combinaciones de dos o más. Dichos agentes edulcorantes se incorporan normalmente en una cantidad del 0,01 al 1% en masa, con respecto a la masa total de la composición.

Los ejemplos de agentes humectantes que pueden incorporarse incluyen sorbitol, etilenglicol, propilenglicol, glicerol, 1,3-butilenglicol, polipropilenglicol, xilitol, maltitol, lactitol, palatinita, polietilenglicol y similares. Estos agentes humectantes se pueden utilizar individualmente o en combinaciones de dos o más.

Los ejemplos de conservantes que pueden incorporarse incluyen parabenos tales como metilparabeno, etilparabeno, propilparabeno y butilparabeno; benzoato de sodio, fenoxietanol, clorhidrato de alquildiaminoetilglicina y similares. Estos conservantes se pueden añadir individualmente o en combinaciones de dos o más.

Los ejemplos de colorantes que pueden incorporarse incluyen colorantes legales, tales como Azul N° 1, Amarillo N° 4, Rojo N° 202 y Verde N° 3; pigmentos basados en minerales, tales como azul ultramarino, azul ultramarino oscuro

y azul de Prusia; óxido de titanio y similares. Estos colorantes se pueden utilizar individualmente o en combinaciones de dos o más.

5 Los ejemplos de ajustadores del pH que pueden utilizarse incluyen ácido cítrico, ácido fosfórico, ácido málico, ácido pirofosfórico, ácido láctico, ácido tartárico, ácido glicerofosfórico, ácido acético, ácido nítrico, sales químicamente aceptables de los mismos, hidróxido de sodio y similares. Estos ajustadores del pH pueden utilizarse individualmente o en una combinación de dos o más para que la composición tenga un pH de 4 a 8, y de forma más preferida de 5 a 7. Dichos ajustadores del pH pueden utilizarse, por ejemplo, en una cantidad del 0,01 al 2% en peso.

10 La composición oral de la presente invención puede contener, como ingrediente medicinal, desinfectantes catiónicos tales como cloruro de cetilpiridinio, cloruro de benzalconio, cloruro de bencetonio, clorhidrato de clorhexidina y gluconato de clorhexidina; vitamina E tal como acetato de dl- α -tocoferol, succinato de tocoferol y nicotinato de tocoferol; desinfectantes anfóteros tales como dodecildiaminoetilglicina; desinfectantes no iónicos tales como triclosán e isopropilmetilfenol; enzimas tales como dextranasa, amilasa, proteasa, mutanasa, lisozima, y enzimas
15 líticas; fluoruros tales como monofluorofosfato de sodio, fluoruro de sodio y fluoruro estannoso; ácido tranexámico, ácido epsilon-aminocaproico, aluminio-clorohidroxialantoína, dihidrocolesterol, ácido glicirretínico, glicerofosfato, clorofila, cloruro de sodio, péptido cal, glicirricinato de dipotasio, alantoína, hinoquitol, nitrato de potasio y similares. Estos componentes se pueden añadir individualmente o en combinaciones de dos o más.

20 No existe una limitación específica sobre el recipiente para conservar la composición oral de la presente invención. Por ejemplo, puede utilizarse un recipiente fabricado de vidrio, metal, plástico, un material laminado o materiales similares. La forma del recipiente tampoco está particularmente limitada. Por ejemplo, puede utilizarse un recipiente tal como una botella, una copa, una bolsa o un tubo.

25 Ejemplos

La presente invención se describe a continuación con mayor detalle haciendo referencia a los ejemplos, pero no está limitada a los mismos.

30 Preparación de la composición oral

Las composiciones orales (pastas) de los ejemplos 1 a 9 y los ejemplos comparativos 1 a 3 se prepararon según las formulaciones que se muestran en la tabla 1 siguiente. Específicamente, después de mezclar los materiales de
35 partida diferentes de las partículas de diamante, las partículas de sílice abrasivas y los agentes espumantes (sulfosuccinato de sodio y laurilsulfato de sodio), se añadieron las partículas de diamante y las partículas de sílice abrasiva y la mezcla resultante se agitó y se homogeneizó. Por último, se añadieron los agentes espumantes y la mezcla resultante se agitó y se homogeneizó. (Este proceso también actuó como un tratamiento desespumante). Las partículas de diamante utilizadas se adquirieron de Microdiamant AG, CH-8574 Lingwil, Suiza. Todas las cantidades de los componentes se presentan en la tabla 1 en % en masa.

40 Se utilizaron como partículas de sílice abrasiva cinco tipos de partículas de sílice precipitada abrasiva disponibles comercialmente (sílice A a sílice E), y sílice fundida abrasiva (sílice F). La mediana de tamaño (d50) y la RDA de cada una de las partículas de sílice abrasiva son las siguientes.

45 (Partículas de sílice A) d50: 2 μ m, RDA: 120
(Partículas de sílice B) d50: 3 μ m, RDA: 160
(Partículas de sílice C) d50: 4 μ m, RDA: 200
(Partículas de sílice D) d50: 8 μ m, RDA: 150
(Partículas de sílice E) d50: 14 μ m, RDA: 100
50 (Partículas de sílice F) d50: 14 μ m, RDA: 130

Se utilizaron tres tipos de partículas de diamante (partículas de diamante A a C). Las partículas de diamante A tenían una d50 de 2,8 μ m, una d10 de 1,8 μ m y una d99 de 4,5 μ m. Las partículas de diamante B tenían una d50 de
55 2 μ m, una d10 de 1 μ m o superior y una d99 de 3,5 μ m o inferior. Las partículas de diamante C tenían una d50 de 3 μ m, una d10 de 1,8 μ m o superior y una d99 de 4,5 μ m o inferior.

Entre los componentes utilizados, la sílice espesante pertenece a la sílice precipitada, pero tiene una RDA de 10 o inferior, y no tiene el poder abrasivo requerido para composiciones para la cavidad bucal. La sílice espesante se utiliza como espesante, no como sílice abrasiva. La sílice espesante utilizada tiene un tamaño de partícula promedio
60 de 13 μ m.

El tamaño de partícula de las partículas de sílice abrasiva mencionadas anteriormente se determina utilizando un aparato Malvern Mastersizer sobre la base del principio de difracción de Fraunhofer utilizando un láser de He/Ne de baja potencia. El tamaño de partícula de las partículas de diamante se determina utilizando un aparato Coulter Counter Multisizer 3 (producido por Beckman Coulter, Inc.). La RDA anterior se determina según el procedimiento descrito en la norma ISO 11609: 2010, anexo B.

Evaluación de la composición oral

5 El poder de eliminación de manchas (PCR; proporción de limpieza de la película) de cada una de las composiciones orales obtenidas se determinó según el procedimiento de Stooky (J Dent Research, 61: 1236-1239, 1982). La RDA se evaluó según el procedimiento descrito en la norma ISO 11609: 2010, anexo B. La tabla 1 muestra los resultados.

10 Utilizando partículas de diamante que tienen una mediana del tamaño diferente (mediana del tamaño: 5 μm o 10 μm), se prepararon composiciones orales que tenían la misma formulación que en el ejemplos comparativo 1 y se denominaron "ejemplo comparativo 1a" (utilizando partículas de diamante con un tamaño cuya mediana es de 5 μm) y "ejemplo comparativo 1b" (utilizando partículas de diamante con un tamaño cuya mediana es de 10 μm). La REA de las composiciones orales en estos ejemplos comparativos se midió según el procedimiento descrito en la norma ISO 11609: 2010, anexo B, excepto que se utilizó esmalte en lugar de dentina, el número de pasadas de cepillo alternas se modificó de 1.500 a 10.000 y la dosis de radicación se modificó para que fuera 10. Los resultados muestran que la composición oral obtenida en el ejemplo comparativo 1a tenía una REA de aproximadamente 45, y la composición oral obtenida en el ejemplo comparativo 1b tenía una REA de aproximadamente 100. Los valores de REA de las composiciones obtenidas en el ejemplo 5 y los ejemplos comparativos 1 a 5 también se midieron de la misma forma. La composición oral del ejemplo 5 tenía un valor de RDA de 22,5, y las composiciones orales de los ejemplos comparativos 1, 2, 3, 4 y 5 tenían valores de REA de 21,4, 16,2, 28,0, 5,4 y 3,7, respectivamente.

20 Los resultados de los ejemplos comparativos 1 a 3 de la presente solicitud muestran lo siguiente. Aunque la RDA se correlaciona a menudo, generalmente, positivamente con la PCR, la comparación entre las composiciones de los ejemplos comparativos 1 a 3, que tenían valores de RDA similares en el intervalo de aproximadamente 15 a 20, así como valores de d10 similares y valores de d99 similares, muestra que las partículas de diamante que tenían una d50 de 2,8 μm a 3 μm tienen un valor de PCR superior a las partículas de diamante que tienen una d50 de 2 μm . Por otra parte, el valor de REA tiende a aumentar al aumentar el valor de d50. Estos resultados sugieren que las partículas de diamante que se van a utilizar tienen preferentemente un valor de d50 de aproximadamente 2 a 3,5 μm y de forma más preferida de 2,5 a 3 μm .

30 Los resultados anteriores confirman que la composición oral según la presente invención tiene un poder de eliminación de manchas marcadamente elevado, así como una capacidad de abrasión tal que su abrasión sobre la dentina no es demasiado elevada y su poder abrasivo sobre el esmalte no es ni demasiado pequeño ni demasiado grande.

Tabla 1

| Formulación N° | Ejemplos | | | | | | | | | | Ejemplos comparativos | | | | |
|-------------------------------------|----------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|-----------------------|---------|---------|---------|---------|
| | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 6 | 7 | 8 | 9 | | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 |
| Solución de sorbitol (70%) | 50 | 50 | 50 | 50 | 50 | 50 | 50 | 50 | 50 | | 50 | 50 | 50 | 50 | 50 |
| Sacarina sódica | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 |
| Glicerina | 17 | 17 | 17 | 17 | 17 | 17 | 17 | 17 | 17 | | 17 | 17 | 17 | 17 | 17 |
| Goma xantana | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 |
| Carboximetilcelulosa de sodio | 0,5 | 0,5 | 0,6 | 0,5 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,5 | 0,5 | | 0,5 | 0,5 | 0,5 | 0,5 | 0,5 |
| Sílice espesante | 12 | 12 | 12 | 12 | 12 | 12 | 12 | 12 | 12 | | 12 | 12 | 12 | 12 | 12 |
| Óxido de titanio | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 | 0,6 |
| Metil-parabeno | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 |
| Propilenglicol | 3 | 3 | 3 | 3 | 3 | 3 | 3 | 3 | 3 | | 3 | 3 | 3 | 3 | 3 |
| Laurilsulfato de sodio | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 | | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 | 1,2 |
| POE-alquilsulfosuccinato de disodio | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 | | 1 | 1 | 1 | 1 | 1 |
| Partícula de diamante A | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 | | 0,2 | | | | |
| Partícula de diamante B | | | | | | | | | | | | 0,2 | | | |
| Partícula de diamante C | | | | | | | | | | | | | 0,2 | | |
| Partículas de sílice A | 5 | 6 | | | | | | | | | | | | | |
| Partículas de sílice B | | | 4 | 5 | | | | | | | | | | | |
| Partículas de sílice C | | | | | 3 | 4 | 5 | | | | | | | | |
| Partículas de sílice D | | | | | | | | 4 | 5 | | | | | | |
| Partículas de sílice E | | | | | | | | | | | | | | | 7,2 |
| Partículas de sílice F | | | | | | | | | | | | | | 2 | |
| Agua de intercambio iónico | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance | Balance |
| Total | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |
| RDA | 112 | 119 | 123 | 145 | 127 | 145 | 176 | 104 | 116 | 116 | 15 | 13 | 17 | 55 | 46 |
| PCR | 111 | 118 | 118 | 120 | 111 | 116 | 118 | 118 | 113 | 113 | 61 | 55 | 72 | 80 | 68 |

REIVINDICACIONES

- 5 1. Composición oral que comprende unas partículas de diamante y partículas de sílice abrasiva, presentando las partículas de diamante un tamaño cuya mediana (d50) es de 2,0 a 3,5 μm y presentando las partículas de sílice abrasiva una RDA de por lo menos 50 y no superior a 200.
- 10 2. Composición oral según la reivindicación 1, en la que las partículas de diamante son tales que la diferencia entre el valor del percentil 10º (d10) en distribución de tamaño de partícula acumulativa y el d50 no es superior a 2 μm , y la diferencia entre el valor del percentil 99º (d99) en la distribución de tamaño de partícula acumulativa y el d50 no es superior a 3 μm .
- 15 3. Composición oral según la reivindicación 1 o 2, en la que las partículas de sílice abrasiva presentan un tamaño cuya mediana (d50) es de 2,5 a 10 μm .
- 20 4. Composición oral según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en la que las partículas de diamante están presentes en una cantidad de 0,1 a 0,3% en masa.
5. Composición oral según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en la que las partículas de sílice abrasiva están presentes en una cantidad de 1 a 10% en masa.
6. Composición oral según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, que comprende además un tensioactivo de sulfosuccinato.