

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 705 619**

51 Int. Cl.:

A61K 8/22 (2006.01)

A61K 8/24 (2006.01)

A61K 8/42 (2006.01)

A61Q 11/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.09.2008 PCT/GB2008/050836**

87 Fecha y número de publicación internacional: **26.03.2009 WO09037505**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.09.2008 E 08806652 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.10.2018 EP 2187862**

54 Título: **Preparaciones para blanqueamiento dental**

30 Prioridad:

20.09.2007 GB 0718346

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

26.03.2019

73 Titular/es:

**SMT RESEARCH LIMITED (100.0%)
35 Crescent Business Park Enterprise Crescent
Lisburn
Co. Antrim. BT28 2GN, GB**

72 Inventor/es:

**TODD, CHRISTOPHER y
TRIMBLE, SYLVIA**

74 Agente/Representante:

SALVÀ FERRER, Joan

ES 2 705 619 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

Preparaciones para blanqueamiento dental

5 La presente invención se refiere a preparaciones para blanqueamiento dental, y a ciertos aductos químicos útiles en la formulación de estas.

Es bien conocido en la técnica que el peróxido de hidrógeno, el peróxido de carbamida (peróxido de urea) y otros peróxidos pueden utilizarse como agentes blanqueadores en la formulación de geles blanqueadores dentales. La técnica previa también divulga que el carboxipolimetileno (Carbopol), poloxámero (Pluronic), y goma celulósica, así como otros espesantes, pueden utilizarse como el agente gelificante en la preparación de geles de peróxido.

10 Se ha prestado mucha atención en la técnica de controlar el pH de tales composiciones en uso para optimizar el rendimiento del blanqueamiento.

De esta manera, US2006251591 divulga composiciones dentales y métodos para blanqueamiento dental referentes a compuestos que contienen peróxido de hidrógeno que se mantienen a un rango de pH sustancialmente constante de 6,0-10,0 durante el procedimiento de blanqueamiento dental en presencia de un agente quelante del calcio.

15 Una dificultad que enfrenta el formulador de gel blanqueador dental, como se reconoce en US2006251591, es que el peróxido de hidrógeno, en solución acuosa, es estable bajo condiciones ácidas, pero es un agente blanqueador altamente activo bajo condiciones alcalinas.

Las ideas presentes consideran que el peróxido de hidrógeno se disocia como una reacción reversible, de esta forma:

20
$$\text{H}_2\text{O}_2 = \text{H}^+ + \text{OOH}^-$$

25 y que el ion perhidroxilo (OOH^-) es el responsable del efecto blanqueador. Dado que la reacción es reversible, se desplazará hacia la derecha si hay algún álcali presente para absorber los iones H^+ , es decir, si el valor del pH es relativamente alto. En condiciones ácidas habrá abundancia de iones de hidrógeno, por lo que el equilibrio se desplazará hacia la izquierda y favorecerá la estabilidad del peróxido de hidrógeno menos reactivo.

Sería deseable producir una forma mejorada de solución estable de peróxido a un pH relativamente alto que pueda utilizarse como base para un gel blanqueador dental.

De acuerdo con un aspecto de la presente invención, se proporciona un aducto adecuado para uso para la formulación de una composición blanqueadora dental, según la reivindicación 9.

30 La invención también se refiere a las preparaciones de blanqueamiento dental que comprenden el aducto, de acuerdo con la reivindicación 1, siempre que tales preparaciones estén formuladas con respecto a la identidad de cualquier ingrediente adicional, y/o las proporciones relativas de esos ingredientes entre sí y/o con respecto al aducto para asegurar que las preparaciones de blanqueamiento dental de la invención también exhiban un pH en solución acuosa que se eleva por lo menos en 1,0 al diluir la solución en 10 partes.

35 Los inventores han encontrado que mediante una cuidadosa selección de los materiales de partida para el aducto, preferiblemente con respecto a su relación % p/p entre sí; mediante una cuidadosa selección de cualquier material adicional, preferiblemente con respecto a su relación % p/p con respecto a cualquier otro material adicional y/o con respecto al aducto; y/o mediante una cuidadosa selección del orden o la forma en que están formulados los ingredientes, es posible proporcionar de forma fiable una preparación blanqueadora dental que presente excelentes propiedades blanqueadoras y que tenga un pH en solución acuosa que aumente con la dilución (y, por tanto, in situ, en la boca, cuando se utiliza), por lo tanto, se teoriza, liberando iones de peróxido activo adicionales en los dientes cuando se utiliza y proporcionando así un rendimiento superior con respecto a ciertas formulaciones de técnicas anteriores, que no presentan un aumento de pH o un aumento de pH significativamente inferior.

45 Es una característica sorprendente del aducto o de la combinación de aductos, o de las preparaciones de blanqueamiento dental fabricados a partir de estos, que el valor del pH de una solución acuosa del aducto o de la combinación de aductos o de la preparación parezca aumentar con la dilución en una medida significativa. Hemos encontrado que el pH de un aducto de acuerdo con la invención (el aducto descrito abajo en el Ejemplo 1) en una solución acuosa de 50% p/p es aproximadamente 7,5, y que aumenta a aproximadamente 9,0 en dilución con agua a 5% p/p.

50 Preferentemente, el pH de la solución antedicha al 50% p/p es superior a 7,0.

Preferentemente, el pH de la solución antedicha al 5% p/p es superior a 8,0.

Hemos encontrado que ciertas formulaciones de la técnica previa pueden exhibir un modesto aumento del pH en la dilución, una característica que, según se cree, puede atribuirse a la presencia de Carbopol en dichas formulaciones.

Aunque un aumento modesto del pH en la dilución puede tener algún efecto beneficioso en la liberación de iones de peróxido cuando se utiliza la formulación (es decir, cuando se aplica en los dientes), creemos que un aumento más sustancial del pH en la dilución es necesario o, al menos, deseable para conseguir un rendimiento superior de los preparados de acuerdo con la invención. El comportamiento químico del aducto en las preparaciones de la invención está creído para ser en gran parte, o al menos significativamente, responsable del aumento de pH en la dilución exhibida por las composiciones y aductos de la invención.

5

Preferentemente, el aumento del pH (de la preparación de blanqueamiento dental y/o de la solución de aducto inicial) es de al menos 1,0 y, Preferentemente, de al menos 2,0 cuando se diluye 10 veces. Dicho aumento del pH puede observarse en las composiciones de la invención incluso cuando se formulan en ausencia de Carbopol.

10 El peróxido y los materiales de partida de urea pueden suministrarse juntos como peróxido de urea. Alternativamente, otros peróxidos, preferiblemente peróxido de hidrógeno, y urea pueden suministrarse como materiales de partida separados. Además, los aductos de la invención pueden incluir aductos de tres componentes en el que una combinación química de cada uno de los materiales de partida está presente; pero también aductos de dos componentes que comprenden una combinación química de dos de los materiales de partida a condición de que el aducto de dos componentes se proporcione en contacto o asociación con el tercer material de partida, pero, de manera importante, como o como parte de una formulación acuosa con un pH que aumenta en dilución.

15

El polifosfato de metal alcalino preferido es un tripolifosfato de metal alcalino, en particular el tripolifosfato de sodio.

Nuestro trabajo experimental mostró que el aducto de la invención, teniendo la propiedad del aumento del pH en solución acuosa cuando se diluye, está formulado con ciertas proporciones de materiales de partida.

20 La proporción de polifosfato de metal alcalino: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de polifosfato alcalino anhidro: proporción de solución de peróxido de hidrógeno (concentración de 35% p/p) en peso de desde aproximadamente 0,05:1 a aproximadamente 0,5:1.

La proporción de polifosfato de metal alcalino: urea en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de polifosfato de metal alcalino anhidro: urea en peso de aproximadamente 0,1:1 a aproximadamente 2,0:1.

25 La proporción de urea: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de urea: solución de peróxido de hidrógeno (concentración del 35 % p/p) en peso de aproximadamente 0,2:1 a aproximadamente 1,0:1.

También se proporciona, de acuerdo con la invención, un método para preparar un aducto adecuado para uso para la formulación de una composición blanqueadora dental, según la reivindicación 10. La solución puede combinarse con otros ingredientes deseables (si los hubiera) para proporcionar una formulación de blanqueamiento dental.

30 También se divulga en la presente un aducto preparado de acuerdo con el método mencionado anteriormente, y una formulación blanqueadora dental preparada de acuerdo con el método.

También se divulga en la presente el uso del aducto como se menciona anteriormente en la preparación de una formulación blanqueadora dental.

35 También se divulga en la presente una preparación blanqueadora dental que comprende el aducto mencionado anteriormente o una solución del mismo.

La preparación blanqueadora dental de acuerdo con lo que figura anteriormente puede incluir, además del aducto, uno o más materiales funcionales, excipientes, portadores, espesantes, blanqueadores, estabilizantes y similares. La preparación puede formularse en forma de gel, solución, polvo, dispersión, emulsión o similar, preferiblemente en forma de gel.

40 La invención se ilustra adicionalmente en los siguientes ejemplos. Todos los porcentajes son en peso y se expresan en términos del peso total de la composición.

Ejemplo 1

Un aducto de peróxido/urea/polifosfato, que es adecuado para su uso en la formulación de un gel blanqueador dental:

Ingrediente	% p/p
Peróxido de hidrógeno (sol. al 35%)	55,0
Tripolifosfato de sodio (anhidro)	18,0
Urea	27,0

45 Hemos encontrado que existen varias maneras adecuadas de formular el aducto, pero uno de estos métodos comienza con la adición del tripolifosfato de sodio al peróxido de hidrógeno, seguido de la urea. Después de la adición de la urea,

la mezcla se agita hasta que la urea se disuelve. La solución se utiliza para hacer un gel blanqueador dental.

Ejemplo 2

Se formuló un gel blanqueador a partir de la solución de aducto que se obtuvo en el ejemplo 1 a partir de los ingredientes que se indican a continuación:

Ingrediente	% p/p
Aducto	36,0
Glicerina	36,0
Polivinilpirrolidona	25,0
Agua desionizada al	100,00

5

Los ingredientes simplemente se combinaron para producir un gel blanqueador dental de acuerdo con la invención.

Ejemplo 3

Se formuló un gel blanqueador a partir de la solución de aducto obtenida en el ejemplo 1 a partir de los ingredientes que se indican a continuación:

Ingrediente	% p/p
Efectuar la aducción	35,0
Glicerina	17,0
Carbopol (ácido poliacrílico)	7,0
Polietileno glicol	6,0
Agua desionizada al	100,00
Hidróxido de sodio (ajustador de pH)	q.s.

10

Los ingredientes simplemente se combinaron para producir un gel blanqueador dental de acuerdo con la invención.

Ejemplo 4

Se formuló un gel blanqueador dental directamente a partir de los ingredientes que se indican a continuación.

Ingrediente	% p/p
Urea	1,60
Tripolifosfato de sodio	2,00
Peróxido de hidrógeno al 35%	7,00
Soda cáustica	7,50
Carbopol 974 PNF	8,00
Glicerina	36,45
Menores (fragancia, fluoruro de sodio, etc.)	0,90
Agua desionizada a	100,00

15

El método de mezcla para este ejemplo es: Etapa 1: el Carbopol, la glicerina y la fragancia se mezclan. Etapa 2: el agua, la urea, el fluoruro de sodio y otros ingredientes menores se mezclan hasta que se disuelven. Etapa 3: las etapas 1 y 2 se mezclan hasta que sean homogéneas. Etapa 4: la soda cáustica se añade a la etapa 3 para neutralizar el Carbopol. Etapa 5: el peróxido de hidrógeno y el STPP se mezclan y se añaden a la etapa 4 y se mezclan hasta obtener una mezcla homogénea. El pH se ajusta entonces a c. 6,5.

20

REIVINDICACIONES

1. Una preparación de blanqueamiento dental que comprende un aducto formulado a partir de materiales de partida que incluyen peróxido, urea y un polifosfato de metal alcalino,
- 5 en donde la proporción de polifosfato de metal alcalino: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de polifosfato alcalino anhidro: proporción de solución de peróxido de hidrógeno, concentración de 35% p/p, en peso de desde aproximadamente 0,05:1 a aproximadamente 0,5:1,
- en donde la proporción de polifosfato de metal alcalino: urea en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de polifosfato de metal alcalino anhidro: urea en peso de aproximadamente 0,1:1 a aproximadamente 2,0:1.
- 10 y
- en donde la proporción de urea: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de urea: solución de peróxido de hidrógeno, concentración de 35% p/p, en peso de aproximadamente 0,2:1 a aproximadamente 1,0:1,
- 15 el aducto suministrado en la preparación en solución acuosa y la preparación y/o el aducto con un pH en solución acuosa que aumente al menos 1,0 en una dilución de 10 veces de la solución, en la que los materiales de partida de peróxido de urea y peróxido de urea se suministran juntos como peróxido de urea o bien como materiales de partida separados en los que el peróxido es peróxido de hidrógeno.
2. Una preparación de blanqueamiento dental de acuerdo con la reivindicación 1, en la que el aumento del pH es de al menos 0,5 cuando se diluye 5 veces.
3. Una preparación de blanqueamiento dental de acuerdo con la reivindicación 2, en la que el aumento del pH es de al menos 0,25 cuando se diluye dos veces.
- 20 4. Una preparación de blanqueamiento dental de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en la que el pH de la solución al 50% p/p es superior a 7,0.
5. Una preparación de blanqueamiento dental de acuerdo con la reivindicación 4, en la que el pH de la solución diluida al 5% p/p es superior a 8,0.
- 25 6. Una preparación de blanqueamiento dental de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en la que el polifosfato de metal alcalino es un tripolifosfato de metal alcalino.
7. Una preparación de blanqueamiento dental de acuerdo con la reivindicación 6, en la que el tripolifosfato de metal alcalino es tripolifosfato de sodio.
- 30 8. Una preparación de blanqueamiento dental de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, que comprende uno o más materiales funcionales, excipientes, portadores, espesantes, agentes blanqueadores y/o estabilizantes.
9. Un aducto adecuado para el uso en la formulación de una composición blanqueadora dental, el aducto se formula desde materiales de partida que comprenden peróxido, urea y un polifosfato de metal alcalino,
- 35 en donde la proporción de polifosfato de metal alcalino: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de polifosfato alcalino anhidro: proporción de solución de peróxido de hidrógeno, concentración de 35% p/p, en peso de desde aproximadamente 0,05:1 a aproximadamente 0,5:1,
- en donde la proporción de polifosfato de metal alcalino: urea en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de polifosfato de metal alcalino anhidro: urea en peso de aproximadamente 0,1:1 a aproximadamente 2,0:1;
- 40 y
- en donde la proporción de urea: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de urea: solución de peróxido de hidrógeno, concentración de 35% p/p, en peso de aproximadamente 0,2:1 a aproximadamente 1,0:1; y
- 45 el aducto con un pH en solución acuosa que aumente al menos 1,0 en una dilución de 10 veces de la solución, en la que los materiales de partida de peróxido de urea y peróxido de urea se suministran juntos como peróxido de urea o bien como materiales de partida separados en los que el peróxido es peróxido de hidrógeno.
10. El método para preparar un aducto formulado a partir de materiales de partida que comprenden peróxido, urea y un polifosfato de metal alcalino,
- 50 en donde la proporción de polifosfato de metal alcalino: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de polifosfato alcalino anhidro: proporción de solución de peróxido de hidrógeno, concentración de 35% p/p, en peso de desde aproximadamente 0,05:1 a aproximadamente 0,5:1,
- en donde la proporción de polifosfato de metal alcalino: urea en una solución acuosa del aducto corresponde a una

ES 2 705 619 T3

proporción de polifosfato de metal alcalino anhidro: urea en peso de aproximadamente 0,1:1 a aproximadamente 2,0:1; y

5 en donde la proporción de urea: peróxido en una solución acuosa del aducto corresponde a una proporción de urea: solución de peróxido de hidrógeno, concentración de 35% p/p, en peso de aproximadamente 0,2:1 a aproximadamente 1,0:1; y

en donde el aducto tiene un pH en solución acuosa que aumente al menos en 1,0 en una dilución de 10 veces la solución, el método consistente en suministrar los materiales de partida y mezclar los materiales de partida en una solución acuosa en condiciones de temperatura y/o presión y/o agitación eficaces para proporcionar una solución de los materiales de partida, y

10 en donde los materiales de partida de peróxido y de urea están proporcionados tanto juntos como peróxido de urea o como materiales de partida separados en donde el peróxido es peróxido de hidrógeno.