

379946

P.- 44.826

U.S. Ser. N° 809.035

SECCION TECNICA
COMUNICACION I.P.C.
CLASE A61
SUBCLASE K

30 DIC



Memoria descriptiva

379946

para solicitar PATENTE DE INVENCION por 20 años

a nombre de COLGATE-PALMOLIVE COMPANY

entidad / ~~de nacionalidad~~ norteamericana

con domicilio en 300 Park Avenue, Nueva York, N.Y., Estados Unidos de América

por: "UN METODO DE PREPARAR UNA COMPOSICION SAPORIFERAN
(Clase Internacional A61k)

POOR
QUALITY



30011

Esta invención se refiere a una composición -
para dar sabor la cual simula el sabor poco usual del
cloroformo.

5 Debido a su sabor poco usual el cloroformo -
ha sido usado en diversas composiciones en las cuales -
se desea las características de su gusto picante. Entre
las composiciones en las cuales se ha usado el cloro-
formo como sabor las preparaciones orales son particu-
larmente dignas de atención.

10 El efecto del sabor a cloroformo disminuye -
rápidamente después del contacto inicial con la cavidad
oral.

15 Esta invención proporciona una composición -
para dar sabor la cual simula inmediatamente el sabor
poco usual del cloroformo y continúa proporcionando -
este sabor durante el período total de contacto de la -
composición para dar sabor con la cavidad oral.

20 De acuerdo con ciertos de sus aspectos esta
invención se refiere a una composición para dar sabor
que comprende cloruro de metileno y un perfluorohidro-
carburo saturado no tóxico.

25 Se ha encontrado inesperadamente que cuando
el cloruro de metileno se mezcla con un perfluorohi-
drocarburo saturado no tóxico del tipo comúnmente usado
en los propulsores y almacenado bajo presión a tempe-
raturas bajas, por ejemplo alrededor de 5°C. a 15°C.,
el efecto etéreo deseable y poco usual del cloroformo
es substancialmente simulado. Además, el sabor se desa-
rolla rápidamente y se mantiene satisfactorio durante
30 el tiempo en que la composición para dar sabor está en



contacto con la cavidad oral.

5 Los fluorohidrocarburos no tóxicos típicos -
que pueden ser empleados son aquellos materiales ací-
clicos (de 2 a 6 átomos de carbono) y cíclicos (de 3
a 6 átomos de carbono) que contienen de 2 a 6 átomos -
de carbono. Estos incluyen hexafluoroetano, octofluoro-
propano, decafluorobutano, dodecafluoropentano, y te-
trafluorohexano, hexafluorociclopropano, octafluoroci-
clobutano, decafluorociclopentano y dodecafluorociclo-
10 hexano. El fluorocarburo preferido es octafluorociclo-
butano.

15 Generalmente, los componentes del sabor pro-
porcionan su gusto deseable cuando la composición con-
tiene alrededor de 0,5 a 3,0 partes, preferiblemente -
alrededor 1 parte en peso, por cada 100 partes de clo-
ruro de metileno presente.

20 De acuerdo con ciertos aspectos de esta in-
vención los componentes de sabor son incorporados a un
material portador para proporcionar un contacto con la
cavidad oral. Preferiblemente la incorporación es lle-
vada a cabo a alrededor de la temperatura a la cual -
los componentes del sabor son almacenados, por ejemplo
alrededor de 4,5°C. Típicamente, basado en la composi-
ción total, la composición para dar sabor contiene al-
25 rededor del 1,5 al 40% en peso de cloruro de metileno
y alrededor de 0,5 a 3,0 partes en peso, preferiblemen-
te alrededor de 1 parte, de perfluorohidrocarburo por
cada 100 partes por peso de cloruro de metileno pre--
sente.

30 El material portador puede ser cualquier ma-



30 000

5 terial al cual, se desea proporcionar cuando es puesto en contacto con la cavidad oral, un sabor pircante deseable y duradero tal como el que ha sido creado por - cloroformo durante períodos de tiempo más cortos. Típicamente, tal portador es un dentífrico. El sabor generalmente comprende alrededor del 0,5 al 2,5% en peso, - preferiblemente alrededor del 0,5 al 1,5% de la composición total.

10 Las composiciones para dar sabor tienen normalmente un pH entre alrededor de 5 y 9 y preferiblemente alrededor de 6 a 7. Si se desea el pH puede ser - mantenido con un sistema tampón.

15 Cuando el material portador es un dentífrico hay presente en el mismo un agente abrillantador substancialmente insoluble en agua del tipo comúnmente empleado en las cremas dentales, tabletas masticables y polvos. Hay un número relativamente grande de estos materiales conocidos en la técnica. Materiales representativos incluyen, por ejemplo, fosfato dicálcico, fosfato tricálcico, metafosfato sódico insoluble, hidróxido de aluminio, carbonato de magnesio, carbonato de calcio, pirofosfato de calcio, sulfato de calcio, polimetacrilato de metilo bentonita, etc., incluyendo mezclas apropiadas de los mismos. Se prefiere usar las sales de fosfato insolubles en agua como los agentes --
20
25
30
abrillantadores y más particularmente metafosfato sódico insolubles y/o fosfato de calcio, tal como el dihidrato de fosfato dicálcico. El agente abrillantador puede ser el único material portador, particularmente cuando el dentífrico es un polvo dental. Típicamente están



presentes en el portador otros ingredientes y la cantidad de agente abrillantador es de hasta el 95% en peso del portador. En el caso de una crema dental o tableta masticable el agente abrillantador es generalmente de alrededor del 20 al 75% en peso del portador y en un polvo dental es generalmente de alrededor del 70 al 95% en peso del portador.

En la preparación de un polvo dental es usualmente suficiente mezclar mecánicamente los ingredientes del portador con cloruro metileno al cual se le ha agregado el fluorhidrocarburo.

En las formulaciones de cremas dentales, los líquidos y los sólidos deben estar proporcionados necesariamente para formar una masa cremosa de una consistencia deseada la cual susceptible de ser extruída desde un envase a presión o comprimible, por ejemplo un tubo de aluminio o de plomo. En general los líquidos en la crema dental comprenderán primordialmente agua, glicerina, soluciones acuosas de sorbita, propilenglicol polietilenglicol 400, etc., incluyendo mezclas apropiadas de los mismos. Es usualmente ventajoso usar una mezcla de tanto agua como un humectante o aglutinante tal como glicerina o sorbita. El contenido total de líquido será generalmente de alrededor del 20 al 75% en peso del portador. Se prefiere usar también un agente gelatinizante en las cremas dentales tal como las gomas naturales y sintéticas y materiales parecidos a la goma, por ejemplo, Musgo Irlandés, goma de tragacanto, carboximetilcelulosa sódica, polivinilpirrolidona, almidón y similares, usualmente en una



300.0.571

cantidad de hasta alrededor del 10% en peso, y preferiblemente alrededor del 0,2 al 5% del portador.

5 Los componentes del sabor de la invención son mezclados en tales fórmulas de cremas dentales. En las tabletas dentales masticables los sólidos y los líquidos son similarmente proporcionados a las cantidades en las cremas dentales y el sabor es mezclado con los sólidos y los líquidos; una matriz cérica tal como polietilenoglicol que tiene un peso molecular de alrededor de 6000 está también presente, generalmente en una cantidad de alrededor del 4 al 20% por peso, con el fin de facilitar la formación de una tableta de un tamaño y forma deseada.

15 En otras preparaciones orales, tal como enjuagues bucales y similares, el portador es un vehículo acuoso el cual puede comprender alrededor del 20 al 99% en peso de la preparación. Típicamente el vehículo también incluye alrededor del 5 al 30% en peso de un alcohol no tóxico tal como etanol.

20 Un agente orgánico tensioactivo puede ser usado en el portador de la presente invención para facilitar la obtención de una dispersión completa y a fondo de las composiciones presentes a través de toda la cavidad oral, y hacer más aceptables cosméticamente las composiciones de la presente invención. El material orgánico tensioactivo puede ser de naturaleza aniónica, no iónica, anfófica o catiónica, y se prefiere emplear en calidad de agente tensioactivo un material detergente que imparte a la composición propiedades detergentes y espumantes. Tales detergentes apropiados son sales solu-

25

30



bles en agua de los monosulfatos de ácidos grasos superiores, tales como la sal sódica del monoglicerido monosulfatado de los ácidos grasos de aceite de coco - hidrogenado, alcohol sulfatos superiores, tales como dodecilo benceno sulfato sódico, alcohol sulfacetatos superiores, éster de ácido graso superior de 1,2 dihidroxi propansulfonatos, y las acilamidas alifáticas superiores substancialmente saturadas, de los compuestos de ácidos aminocarboxílicos alifáticos inferiores, tales como las que tienen de 12 a 16 carbonos en el ácido graso, radicales alcohol o acilo, y similares. Ejemplos de las últimas amidas mencionadas son las de N-lauroilsarcosina, y las sales de sodio, potasio y etanolamina de N-lauroil-, N-miristoil- ó N-palmitoil-, de sarcosinato las cuales deben estar substancialmente libres de jabón o de otro material similar de ácido graso superior el cual tiende a reducir substancialmente el efecto de estos compuestos. El uso de estos compuestos de sarcosinato en las composiciones dentífricas de la presente invención es particularmente ventajoso ya que estos materiales presentan un efecto prolongado y notable en la inhibición de ácido en la cavidad oral debido a carbohidratos, además de ejercer alguna reducción en la solubilidad del esmalte dental en soluciones ácidas.

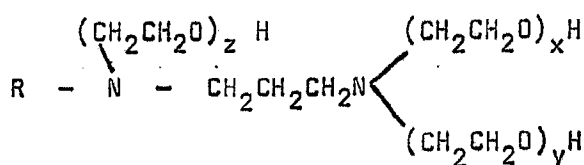
Otros materiales tensioactivos apropiados - incluyen agentes no iónicos tales como los condensados de monoestearato de sorbitán con aproximadamente 60 moles de óxido de etileno, condensados de propilenglicol ("Pluronic") y compuestos germicidas y anti-



bacterianos catiónicos tensioactivos tales como cloruro de di-isobutil-fenoxietoxietil-amonio aminas terciarias que tienen un grupo alcoholo graso (de desde 12 a 18 -- átomos de carbono) y dos grupos (poli)oxietileno unidos al nitrógeno (conteniendo típicamente un total de desde alrededor de 2 a 50 grupos etenoxi por molécula) y sales de los mismos con ácidos, y compuestos de la estructura:

5

10



15

en donde R es un grupo alcoholo graso que contiene desde alrededor de 12 a 18 átomos de carbono, y x, y, y z suman en total 3 ó más alto, así como sales de los mismos con ácidos minerales u orgánicos.

20

Se prefiere usar el agente tensioactivo en una cantidad de alrededor de 0,05 al 5% en peso del -- portador.

25

Otros diversos materiales también pueden ser incorporados en el portador. Ejemplos de los mismos son agentes colorantes o blanqueadores, preservativos, silicones, compuestos de clorofila, materiales amoniados tales como urea, fosfato diamónico y mezclas de los -- mismos, y otros constituyentes. Estos coadyuvantes son incorporados en las composiciones de la presente invención en cantidades que no afecten sustancialmente de --

30



modo adverso las propiedades y características seleccionadas apropiadamente y usadas en cantidades apropiadas que dependen del tipo particular de preparación implicado.

5

También sería deseable incluir agentes antibacterianos en el portador, típicamente en una cantidad de alrededor del 0,01 al 5%, preferiblemente alrededor del 0,05 al 1,0% en peso del portador, agentes típicos antibacterianos incluyen:

10

N¹-(4-clorobencil-N⁵-(2,4-diclorobencil)biguanida;

p-clorofenil-biguanida;

4-clorobenzidril-biguanida;

4-clorobenzidrilguanilurea;

15

N-3-lauroxipropil-N⁵-p-clorobenzilbiguanida;

1,6-di-p-clorofenilbiguanidohexano;

dicloruro de 1-(laurildimetilamonio)-8-(p-clorobencildimetilamonio)octano

5,6-dicloro-2-guanidinobenzimidazol;

20

N¹-p-clorofenil-N⁵-laurilbiguanida;

5-amino-1,3-bis(2-etilhexil)-5-metilhexahidropirimidina;

y sus sales por adición de ácidos no tóxicas.

25

Además del sabor de la presente invención, pueden ser incluidos materiales adicionales saporíferos o edulcorantes del tipo comúnmente empleado en los dentífricos en el portador. Tales materiales, si los hay, ayudan a modificar los gustos particulares del sabor en la forma deseada. Ejemplos de tales materiales adicionales incluyen los aceites saporíferos, por

30

19.12.70

-10



ejemplo, aceites de menta piperita, menta romana, de
pirola, sasafrás, clavo, salvia, eucaliptus, mejorana,
canela, limón y naranja, así como metil-salicilato. Agen-
tes apropiados edulcorantes incluyen sacarosa, lactosa,
5 maltosa, sorbita, ciclamato de sodio y sacarina. Apro-
piadamente, el agente saporífero y edulcorante pueden
comprender conjuntamente alrededor del 0,01 al 2,0% en
peso del portador.

El portador puede contener apropiadamente un
10 compuesto que contiene flúor que tiene cierto efecto
beneficioso en el cuidado e higiene de la cavidad oral,
por ejemplo, disminución de la solubilidad del esmalte
en ácidos y protección de los dientes contra las ca-
ries. Ejemplos de los mismos incluyen fluoruro de so-
15 dio, fluoruro estannoso, fluoruro de potasio, fluoruro
potásico-estannoso ($\text{SnF}_2 \cdot \text{KF}$), hexafluoroestannato de
sodio, cloro fluoruro estannoso, fluoro zirconato de so-
dio, y monofluorofosfato de sodio. Estos materiales,
que disocian o liberan iones que contienen flúor en
20 agua, pueden estar presentes apropiadamente en el por-
tador en una cantidad efectiva pero no tóxica, usual-
mente dentro del margen de alrededor de 0,01 al 1% en
peso del contenido del flúor soluble en agua del mis-
mo.

25 Los siguientes ejemplos específicos ilustran
aún más la naturaleza de la presente invención pero
se deberá entender que la invención no está limitada a
los mismos. Las cantidades y proporciones en los ejem-
plos son en peso a no ser que se indique lo contrario.

30

80475

30412



EJEMPLO 1

5 Se almacenan bajo presión a 4,5°C. 3,2 partes de una composición a presión (alrededor de 0,77 - kgs. por cm²) conteniendo 99% de cloruro de metileno y 1% de perfluorociclobutano.

10 El cloruro de metileno y el perfluorociclobutano son luego mezclados a 4,5°C. con los siguientes portadores de cremas dentales:

	<u>Componentes</u>	<u>Partes</u>		
		<u>A</u>	<u>B</u>	<u>C</u>
	Glicerina	25,7	28,5	25,1
	Carboximetilcelulosa	0,75	-	-
15	Musgo Irlandés	-	1,3	1,3
	Pirofosfato tetrasódico	0,25	-	0,25
	Benzoato sódico	0,5	0,15	0,5
	Sacarina	-	-	0,2
	Agua	14,6	17,4	13,9
20	Laurilsulfato sódico	1,0	1,5	1,0
	Fluoruro estannoso	-	0,4	-
	Monofluorofosfato de sodio	-	-	0,76
	Fosfato dicálcico	46,7	15,0	46,7
	Carbonato de calcio	5,0	-	5,0
25	Metafosfato sódico <u>in</u> soluble	-	30,6	-
	Color	-	0,4	-

30 Cuando los dientes son cepillados con estas composiciones, se desarrolla inmediatamente un sabor - picante que simula el sabor del cloroformo y se mantie-



ne en la cavidad oral durante todo el tiempo de cepi-
llado y durante un corto período de tiempo después.

En el ejemplo dado arriba el hexafluoroetano,
hexafluorociclopropano, tetradecafluorohexano y dode-
cafluorociclohexano, pueden reemplazar al octafluoroci-
clobutano.

EJEMPLO 2

3,2 partes de la composición a presión del
Ejemplo 1 son mezcladas con el siguiente portador pa-
ra un enjuague bucal:

<u>Componentes</u>	<u>Partes</u>
Alcohol etílico (95%)	14,8
Condensado de monoestearato polioxie- tilensorbitán conteniendo alrededor de 80 moles de óxido de etileno	2,5
Glicerina (99,3%)	10,0
Agua	71,6
Color	0,6
Acido cítrico	0,03

Durante el lavado de la boca se desarrolla -
inmediatamente un sabor picante que simula el sabor -
del cloroformo y permanece en la cavidad oral a través
del tiempo de contacto y durante un corto período --
después.

EJEMPLO 3

3,2 partes de la composición a presión del



Ejemplo 1 son mezcladas con el siguiente portador para una tableta dental masticable:

	<u>Componentes</u>	<u>Partes</u>
5	Fosfato dicálcico	76,1
	Laurilsulfato sódico	0,5
	Sal sódica de sulfato de monoglicerido de Aceite de Coco hidrogenado	1,2
	Cloruro de di-isobutil-fenoxietil-dimetilbencil-amonio	0,1
10	Poli(etilenglicol 6000	10,0
	Almidón	2,5
	Carboximetilcelulosa	1,25
	Dióxido de silicio	1,25
	Poli(alcohol vínlico)	2,9
15	Talco	2,0

20 Durante el mascado de esta tableta y cepillado de los dientes, se desarrolla inmediatamente un sabor picante que simula el sabor del cloroformo y permanece en la cavidad oral a través del tiempo de contacto y durante un corto período de tiempo después.

25

- REIVINDICACIONES -

30

Los puntos de invención, propia y nueva, que

19.12.70

379946



se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España por VEINTE años, son los siguientes:

5 1.- Un método de preparar una composición sa porífera, que comprende mezclar cloruro de metileno con un perfluorohidrocarburo saturado no tóxico y alma cenar la mezcla a presión, realizándose dicha mezcla y dicho almacenamiento a aproximadamente 4,5°C.

10 2.- El método según la reivindicación 1, en el cual dicho perfluorohidrocarburo saturado está presente en una cantidad entre 0,5 y 3,0 partes en peso por cada 100 partes de cloruro de metileno presente.

15 3.- El método según la reivindicación 2, en el cual dicho perfluorohidrocarburo saturado está pre sente en una cantidad de 1 parte en peso por cada 100 partes de cloruro de metileno presente.

20 4.- El método de la reivindicación 2, en el cual dicha mezcla a presión recibe la adición de un portador para el cloruro de metileno y para el perfluorohidrocarburo saturado.

5.- El método de la reivindicación 4, en el cual dicho portador incluye un agente abrillantador substancialmente insoluble en agua.

25 6.- El método de las reivindicaciones 1 a 5, en el cual dicho perfluorohidrocarburo saturado contiene de 2 a 5 átomos de carburo.

30 7.- El método de la reivindicación 5, en el cual dicho perfluorohidrocarburo saturado es un perfluorociclohidrocarburo que contiene de 3 a 6 átomos de car bono.

29-11-72

379946



8.- El método de la reivindicación 7, en el cual dicho perfluorciclohidrocarburo es octafluorociclobutano.

5 9.- El método de las reivindicaciones 5 a 7, en el cual dicho portador incluye un compuesto que contiene flúor.

10 10.- El método de la reivindicación 9, en el cual dicho compuesto que contiene flúor está seleccionado del grupo consistente en fluoruro estannoso y monofluorofosfato sódico.

15 11.- El método de las reivindicaciones 4 a 10, en el cual dicha composición comprende del 1,5 al 4% en peso del cloruro de metileno y 0,5 a 3,0 partes en peso de perfluorhidrocarburo por cada 100 partes de cloruro de metileno presente.

20 12.- Un método de preparar una composición saporífera, que comprende mezclar 1,5-4,0% en peso de cloruro de metileno con 1 parte de perfluorociclobutano por cada 100 partes de cloruro de metileno presentes a aproximadamente 4,5°C, almacenar a aproximadamente 4,5°C la mezcla a presión y combinar dicha mezcla puesta a presión con un portador para crema dental que incluye un agente abrillantador dental sustancialmente insoluble en agua.

25 13.- El método de la reivindicación 12, en el cual dicho portador para crema dental incluye un compuesto que contiene flúor.

30 14.- El método de la reivindicación 13, en el cual dicho compuesto que contiene flúor es fluoruro estannoso.

15.- El método de la reivindicación 14, en el

29-11-72

379946

-1 DIO



cual dicho compuesto que contiene flúor es monofluorofosfato de sodio.

16.- El método de la reivindicación 4, en el cual dicho portador es un vehículo acuoso.

5 17.- El método de la reivindicación 16, en el cual dicho vehículo acuoso contiene del 5 al 30% en peso de un alcohol no tóxico.

18.- Un método de preparar una composición sa porífera.

10 Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de dieciseis hojas escritas a máquina por una sola de sus caras.

15

Madrid,

-1 DIC. 1972

P.A.

Alberto de Eizaburu
For-Feudry

29-11-72

LFG/4

- 16 -

379946