

385264

PATENTE DE INVENCION

O.Z. 15.

S:	
ACIC:	AGI
SUB:	K



Memoria Descriptiva

sobre:

PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE PREPARADOS PARA LA
HIGIENE BUCAL Y DE LOS DIENTES.-

Solicitante: BLENDAX-WERKE R.SCHNEIDER & CO., entidad alemana,
residente en 65 Mainz, Rheinallee 88, República
Federal Alemana.

La invención se refiere a un procedimiento de obtención de preparados para la higiene bucal y de los dientes que no solo tiene propiedades profilácticas de las caries y, en caso dado, remineralizadoras, sino que también ejercen sobre las encías y las mucosas buca-

5.

385269



les una influencia reforzadora de los tejidos y activadora sobre los vasos, así como fomentadora del riego sanguíneo y que, por lo tanto, contrarresta el sangrado de las encías.

- El empleo de numerosos compuestos de fluor en los
5. agentes para el cuidado de los dientes sirve para la profilaxis de las caries y ha aportado a este respecto éxitos considerables. Asimismo es conocido que los fosfatos inorgánicos y también los orgánicos actúan como remineralizadores sobre el esmalte de los dientes. Resultados óptimos, con relación
10. a la profilaxis de las caries, se logran aquí, según una proporción del solicitante, mediante la combinación de compuestos de fluor con mezclas de fosfatos inorgánicos y orgánicos. También la eficacia inhibidora de las caries por las vitaminas del complejo K, especialmente la vitamina K₃ ha sido descrita por H. Schreiber, Medizinische Klinik 48/21 747-8
15. (1953). La vitamina K influye en el metabolismo donde le inhibe la dehidrogenasa de D-gliceraldehído-3-fosfato y de esta manera interrumpe la disociación de los hidratos de carbono.

- El ácido pantoténico y sus derivados, especialmente
20. el pantenol, actúan por resorción en forma antiflogísticamente reguladora sobre las mucosas y así como en la rutina y sus derivados que, después de la resorción en el tejido, cierran los capilares contra la salida de la sangre, actúan contra el sangrado de las encías y ejercen una influencia reforzadora
25. de los tejidos sobre las encías y las mucosas bucales.

- Se ha descubierto que se puede obtener un preparado de aplicación práctica general para la higiene de los dientes y de la boca que, además de propiedades profilácticas de las caries y en caso dado remineralizantes, ejerce asimismo un
30. efecto excelente contra el sangrado de las encías, así como

385269



también una influencia reforzadora de los tejidos y de actividad sobre los vasos, así como fomentadora del riego sanguíneo, si a un preparado de estos se le agregan combinaciones de compuestos de fluor así como, en caso dado, vitaminas del complejo K y ácido pantoténico y sus derivados, especialmente pantenol y/o rutina y sus derivados, así como, en caso dado, fosfatos inorgánicos y/u orgánicos, preferentemente solubles en agua.

Dentro del margen de la invención se pueden emplear prácticamente todos los compuestos de fluor utilizados hasta ahora en los agentes para la higiene de los dientes, por ejemplo, los fluoruros alcalinos, tales como el fluoruro amónico, el fluoruro sódico, el fluoruro potásico, el fluoruro de litio, el fluoruro de estaño, el fluoruro de zinc, el fluoruro de circonio, el fluoruro de litio, el fluoruro de cobre, el fluoruro de níquel, el fluoruro de paladio, los compuestos de fluoruro unidos en forma compleja tales como los monofluorfosfatos alcalinos, los hexafluorfosfatos alcalinos, los fluorcirconatos alcalinos, el fluorcirconato de estaño los fluorsilicatos, los fluorboratos, los fluorestannitos, los fluorgermanatos, especialmente el fluorgermanato de estaño, los compuestos orgánicos de fluor tales como los aminohidrofluoruros, los alcanolaminofluoruros, los fluoruros de amonio cuaternario y los productos de adición acuosolubles de aminoácidos con ácido fluorhídrico o fluoruros. También se pueden emplear mezclas de estos y de otros compuestos del fluor. Especialmente eficaces son los monofluorfosfatos alcalinos tales como el monofluorfosfato de litio, de amonio, de sodio y de potasio, preferentemente en una cantidad de un 0,05 a 5,0 % en peso de la composición



total.

Vitaminas del complejo K, que en caso dado están contenidas en los preparados de la presente invención para la higiene bucal y de los dientes, son la 2-metil-3-fitil-1,4-naftoquinona (Vit.K₁), la 3-difarnesil-2-metil-1,4-naftoquinona (Vit.K₂), la 2-metil-1,4-naftoquinona (Vit. K₃), el 2-metilnaftalen-1,4-diol (Vit.K₄) y sus ésteres, el hidrocloreto de 4-amino-2-metil-1-nafteno (Vit. K₅), la 2-metil-1,4-naftilendiamina (Vit. K₆), el 4-amino-3-metil-1-nafteno (Vit. K₇) y sus derivados. Con preferencia se emplea la vitamina K₃, cuyo efecto anticaries ya es conocido según se ha indicado más arriba, especialmente en forma de su bisulfito sódico, en cantidades de un 0,01 a un 5,0 % en peso aproximadamente de la composición total.

El ácido pantoténico y sus derivados, especialmente el pantenol, están contenidos en los agentes para la higiene bucal y de los dientes convenientemente en una cantidad de un 0,05 a un 5,0 % en peso de la composición total. La proporción en rutina y sus derivados, especialmente de la sal sódica de rutina-sulfato se encuentra preferentemente en aproximadamente un 0,01 a un 5,0 % en peso de la composición total.

En caso dado, los agentes para la higiene dental y bucal de la presente invención pueden contener preferentemente fosfatos acuosolubles, orgánicos y/o inorgánicos en cantidades de un 0,01 a un 10,0 % en peso. Tales fosfatos son, por ejemplo, los distintos ortofosfatos alcalinos y amónicos, los metafosfatos alcalinos acuosolubles, los polifosfatos alcalinos acuosolubles, los fosfatos de alcoholes polivalentes, así como los fosfatos de azúcar y sus sales alcalinas y alcalino-térreas.

Los preparados para la higiene bucal y de los

385269



dientes se pueden presentar en una forma de aplicación arbitraria, por ejemplo, como pastas, soluciones, ungüentos, emulsiones, polvos, tabletas, grageas o goma de mascar. El pH depende de la clase y de la cantidad de las sustancias activas empleadas.

5. Los preparados según la presente invención para la higiene de los dientes y de la boca contienen las demás sustancias básicas y auxiliares usuales en tales preparados. A las pastas y polvos dentales se les agregan agentes de pulimento en la forma usual. Tales agentes de pulimento son, por ejemplo, los metafosfatos alcalinos insolubles en agua, el carbonato cálcico, los fosfatos de calcio tales como el fosfato dicálcico, o bien su dihidrato, el fosfato tricálcico y el pirofosfato cálcico, los fosfatos de magnesio, el carbonato de magnesio, el óxido de aluminio o bien su trihidrato, el caolín, el dióxido de silicio, los distintos silicatos, tales como el silicato de magnesio y el silicato de aluminio, los circonatos, tales como el circonato de aluminio y, especialmente, los materiales sintéticos pulverulentos, por ejemplo, el poliestireno, el metacrilato polimetílico, las poliamidas, los policarbonatos, los poliésteres, las resinas de urea-formaldehído, las resinas de melamina-formaldehído y las resinas de fenol-formaldehído, así como las mezclas de las sustancias mencionadas entre sí y con otros agentes de pulimento conocidos.
- 10.
- 15.
- 20.
- 25.

- Las pastas para los dientes contienen generalmente agentes adhesivos y espesadores. Como tales sean mencionados, por ejemplo, el ácido poliacrílico y sus sales alcalinas, la polivinilpirrolidina, la carboximetilcelulosa y sus sales, la pectina así como el ácido algínico y sus deri-
- 30.

385269



vados.

Agentes humectadores son, además de la glicerina y la sorbita, especialmente otros polialcoholes, por ejemplo, el propanodiol y/o butanodiol.

5. Los agentes para la higiene de los dientes y de la boca contienen convenientemente agentes de conservación, especialmente p-hidroxibenzoato y hexaclorofeno, así como sustancias tensioactivas, por ejemplo, sulfonatos alquilarílicos, sulfonatos olefínicos, sulfatos monoglicéridos de ácido graso, sulfoacetatos alquílicos superiores, ésteres superiores de ácido graso de dihidroxialcanosulfonatos, tales como 1,2-dihidroxiopropanosulfonato, condensados albuminosos de ácido graso, ácidos N-acilaminocalcanocarboxílicos, especialmente el N-lauroilsarcósido, y sus sales alcalinas; los compuestos
10. tensioactivos no iónicos, tales como los productos de condensación de óxido alquilénico, especialmente de óxido etilénico, los ésteres de ácidos grasos y azúcares, aminóxidos; los tensioactivos catiónicos; las sustancias anfóteras tales como betainas, sulfobetainas, sulfatobetainas y ácidos N-
15. alquilaminocarboxílicos de cadena larga, así como mezclas compatibles de las sustancias tensioactivas mencionadas.

- Finalmente puede contener el preparado para la higiene bucal y dental de la presente invención los sazonantes y aromatizantes usuales, tales como sacarina, ciclamato sódico, mentol, aceite de menta, hierba luisa o eucalipto, alcoholes inferiores, en caso dado colorantes y/o
25. blanqueadores ópticos, formadores de complejos así como también ulteriores sustancias activas, por ejemplo astringentes y en caso dado también enzimas, tales como proteasas, amilasas y/o dextranasas.
- 30.



385269

La preparación de los agentes para la higiene de los dientes y de la boca se efectua en la forma usual mezclando los productos de partida e introduciendo los mismos en un material de carga.

5. Ejemplo 1: Pasta de dientes

	Momofluorofosfato de sodio	0,75 % en peso
	Vitamina K ₃ (como bisulfito sódico)	0,25 "
	Pantenol	0,20 "
	Rutina (como sal sódica del sulfato)	0,10 "
10.	Hexaclorofeno	0,30 "
	p-hidroxibenzoato de etilo	0,20 "
	Glicerina, al 86 %	25,00 "
	Dihidrato de fosfato dicálcico	40,00 "
	Sazonantes y aromatizantes	1,20 "
15.	Sal sódica de N-lauroilsarcosido	1,00 "
	Carboximetilcelulosa	1,50 "
	Agua	29,50

Ejemplo 2: Pasta de dientes

	Monofluorofosfato de sodio	1,00 % en peso
20.	Vitamina K ₃ (como bisulfito sódico)	0,20 % en peso
	Pantenol	0,20 "
	Rutina (como sal sódica del sulfato)	0,20 "
	Dihidrogenofosfato sódico	2,00 "
	p-hidroxibenzoato de metilo	0,30 "
25.	Sazonantes y aromatizantes	1,10 "
	Dióxido de silicio (Aerosil ^R)	1,00 "
	Sulfato de alcohol graso, sal sódica	1,50 "
	Sorbita. al 70 %	20,00 "
	Glicerina, al 86 %	10,00 "
30.	Dihidrato de fosfato dicálcico	35,00 "

385269



Polvo de poliamida	5,00 % en peso
Carboximetilcelulosa	1,50 "
Agua	21,00 "

Ejemplo 3 Crema dental gelatinosa

5.	Fluoruro de calcio	0,50 % en peso
	Pantenol	0,20 "
	Rutina (como sal. sódica del sulfato)	0,15 "
	Carbopol (R) 940	1,50 "
	NaOH, al 5 %	8,00 "
10.	Gel de sílice ⁹	1,00 "
	Laurilsulfato sódico	3,00 "
	Sazonantes y aromatizantes	1,50 "
	Hexaclorofeno	0,15 "
	p-hidroxibenzoato de metilo	0,10 "
15.	Etanol	1,50 "
	Sorbita, al 70 %	10,00 "
	Agua	72,40 "

Ejemplo 4 Agua bucal

	Monofluorfosfato de sodio	1,30 % en peso
20.	Rutina (como sal sódica del sulfato)	0,20 "
	Glicerofosfato disódico	2,50 "
	Dihidrogenofosfato potásico	1,20 "
	Hidrogenofosfato disódico	1,30 "
	Sazonantes y aromatizantes	1,30 "
25.	Cloruro cetilpiridínico	0,20 "
	Glicerina, al 86 %	8,00 "
	Etanol, al 90 %	40,00 "
	Agua	44,00 "

Ejemplo 5 Tabletas para la limpieza de los dientes

30.	Monofluorfosfato sódico	1,50 % en peso
-----	-------------------------	----------------



	Vitamina K ₃ (-bisulfito sódico)	0,20	% en peso
	Pantenol	0,20	"
	Sazonantes y aromatizantes	1,10	"
	Sulfato de alcohol graso, sal sódica	1,50	"
5.	Alginato sódico	1,50	"
	Polietilenglicol (p.m. 600 aprox.)	1,50	"
	Carboximetilcelulosa	1,00	"
	Pirofosfato cálcico	5,50	"
	Metafosfato sódico insoluble	8,00	"
10.	Dihidrato de fosfato dicálcico	78,00	"

Ejemplo 6 Pasta para los dientes

	Hexafluorofosfato sódico (NaPF ₆)	0,80	% en peso
	Rutina (-sal sódica del sulfato)	0,30	"
15.	Syloid ^(R) 63 (dióxido de silicio con un tamaño de partícula de 10 micras y una superficie de 830 m ² /g)	15,00	"
	Syloid ^(R) 244 (dióxido de silicio con un tamaño de partícula de 3 micras y una superficie de 300 m ² /g)	5,00	"
20.	Hidroxipropilcelulosa	1,20	"
	Sorbita, al 70 %	28,00	"
	Glicerina (al 86 %)	10,00	"
	Sazonantes y aromatizantes	1,50	"
	N-lauroilsarcósido, sal sódica	1,90	"
25.	Solución de colorante verde	0,30	"
	p-hidroxibenzoato de metilo	0,10	"
	p-hidroxibenzoato de propilo	0,10	"
	Alantoina	0,80	"
	Agua	35,00	"

30. Ejemplo 7 Pasta para los dientes

38 5269



	Hidroxifluoruro de etanolamina	1,00 % en peso
	Pantenol	0,45 "
	Biopraxe ^(R) SP 10 (Proteasa de Bacillus subtilis)	0,55 "
5.	Hexaclorofeno	0,10 "
	Bromoclorofeno	0,10 "
	p-hidroxibenzoato de etilo	0,10 "
	N-lauroilsarcósido, sal sódica	0,90 "
	Oxido laurildimetílico	0,80 "
10.	Carboximetilcelulosa	1,50 "
	Sorbita, al 70 %	15,00 "
	Glicerina, al 86 %	10,00 "
	Sazonantes y aromatizantes	1,50 "
	Metafosfato sódico insoluble	7,00 "
15.	Metacrilato polimetílico Tamaño de partícula en promedio aproximadamente 1,5 micras)	18,00 "
	Pirofosfato cálcico (principalmente presente en la fase β)	15,00 "
20.	Agua	28,00 "

Ejemplo 8 Goma de mascar

En una masa de goma de mascar de la composición usual se incorporan adicionalmente

	0,85 partes en peso de monofluorfosfato sódico
25.	0,25 " " " " vitamina K ₃ (bisulfito sódico)
	0,25 " " " " pantenol
	0,30 " " " " rutina (sal sódica del sulfato)
	2,10 " " " " dihidrogenofosfato sódico
	1,00 " " " " hidrogenofosfato dipotásico y
30.	2,50 " " " " 1,6-difosfato de fructosa



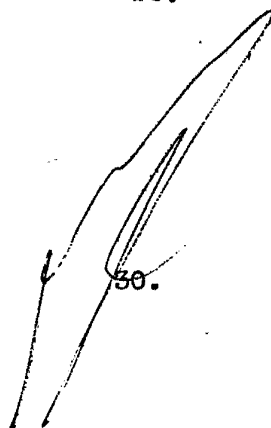
por 100 partes en peso de la composición total, se mezcla íntimamente, la masa se lamina y se corta en tiras. Se obtiene una goma de mascar que no solo tiene propiedades profilácticas de las caries, sino que también ejerce una influencia fomentadora del riego sanguíneo, reforzadora de los tejidos de las encías y de las mucosas de la boca, y que contrarresta el sangrado de las encías.

N O T A

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que el invento corresponde a una solicitud de Patente presentada en Alemania con fecha y número siguientes: 7 de noviembre de 1969, nº P 19 56 016.8; acogiéndose por lo tanto a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor. Siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España sobre: Procedimiento de obtención de preparados para la higiene bucal y de los dientes; caracterizándose por lo siguiente:

1.- Procedimiento de obtención de preparados para la higiene bucal y de los dientes, caracterizado porque comprende mezclar compuestos de fluor y, en caso dado, vitaminas del complejo K, con rutina, o bien sus derivados, y/o con ácido pantoténico, o bien sus derivados, así como, en caso dado, con fosfatos, preferentemente acuosolubles.

2.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque como vitamina del complejo K se mezcla



38 5 269



vitamina K₃.

3.- Procedimiento según la reivindicación 1 y/o 2, caracterizado porque se mezcla pantenol.

5. 4.- Procedimiento según una de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque como compuesto de fluor se mezcla un monofluorofosfato alcalino.

10. 5.- Procedimiento según una de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque se mezcla, en forma de una pasta para los dientes, 0,05 a un 5,0 % en peso de un monofluorofosfato alcalino, un 0,01 a un 5,0 % en peso de vitamina K₃, en forma del bisulfito sódico, un 0,01 a un 5,0 % en peso de rutina, un 0,05 a un 5,0 % en peso de pantenol y, en caso dado, un 0,05 a un 10,0 % en peso de uno o varios fosfatos solubles en agua.

15. 6.- Procedimiento de obtención de preparados para la higiene bucal y de los dientes; tal y como queda descrito sustancialmente en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 12 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

6 NOV. 1970

BLENDAX-WERKE R. SCHNEIDER & CO.

GOMEZ ACEBO Y MODEY

Firmado: F. Hernández Rula

