



QF

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL
División de Nuevas Creaciones



PCT

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

ENTIDAD ADMINISTRATIVA DE LA REPUBLICA NACIONAL

08-75/98

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO SISTEMA ABRASIVO PARA COMPOSICIONES DE CUIDADO ORAL

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL A61K 8/25 ; 8/24

71. SOLICITANTE COLGATE - PALMOLIVE COMPANY

DOMICILIO NEW YORK, NY, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

74. APODERADO JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

22. SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

SS-

PETITORIO

AS: 107. 531



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075198- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 17:08:28 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 107

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

1

SOLICITUD DE:



Patente de Invención.



Patente de Modelo de Utilidad.



Capítulo I.



Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: **COLGATE – PALMOLIVE COMPANY**

Dirección: 300 Park Avenue, New York, New York
10022, Estados Unidos de América
Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos de América
Lugar de Constitución: Estados Unidos de América
Teléfono: Fax:
E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

Dirección: Cra. 7 No. 71-21 Torre B – Piso 4,
Bogotá, Colombia.

Teléfono: 744-2200 Fax: 742-2200
E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 80.410.337 TP 57492

4

**INVENTOR (ES)
(72)**

Nombre: Michael PRENCIPE, Sayed IBRAHIM.

Dirección: 39 Spruce Street, Princeton Junction, NJ 08550, US; 152 Kingsberry Drive,
Somerset, NJ 08873, US (Respectivamente).

Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos de América (Respectivamente).

5 PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/US2006/062511
Publicación Internacional No WO 2007/094891 A2

Fecha 21-12-2006
Fecha 23-08-2007

6 Título (54):

SISTEMA ABRASIVO PARA COMPOSICIONES DE CUIDADO ORAL

7 Clasificación Internacional (51):

A61K 8/24 ; 8/25

8 Prioridad

SI ☒

NO ☐

(33) País de Origen

US

(32) Fecha

21-12-2005

(31) Número de Solicitud

60/752,340

9 Comprobante de pago No.

08 – 44, 571

Fecha

18-07-2008

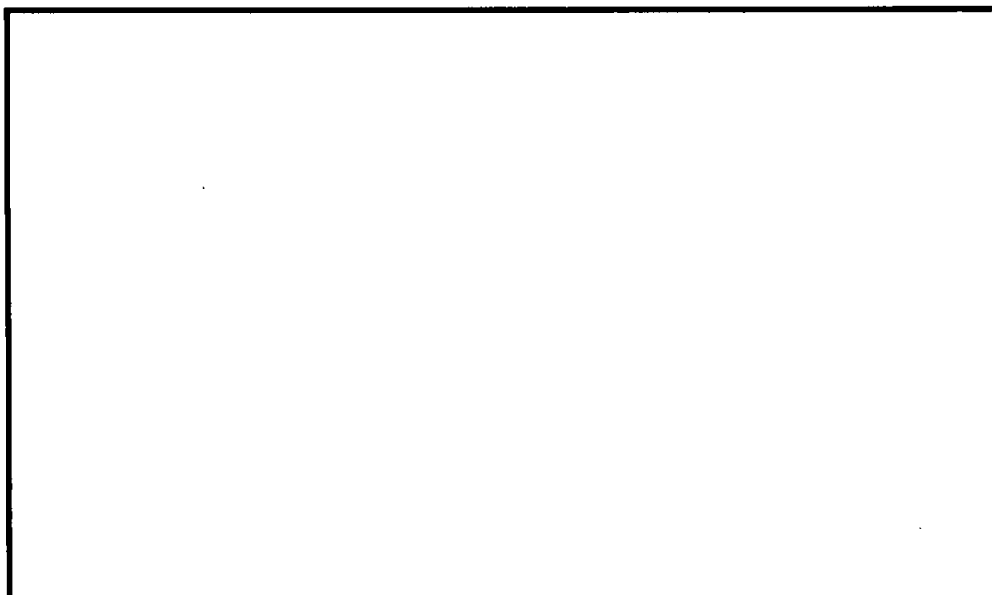
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

10.

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud. \$ 501.000
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso. **Fotocopia autenticada**
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☐ Arte final 12x12.
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: Tarjeta de Propietarios
Documentos PCT

11 FIGURA CARACTERÍSTICA:



12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

FIRMA:

[Firma manuscrita]
C.C. 80.410.337 de Usaquén. TP- 57492 del C.S.J.

Instrucciones para la presentación de los anexos, ver reverso de esta página.

AB 107531.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 44,571
FECHA : JUNIO 5 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075198- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 17:08:28 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 107

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BRIGARD & CASTRO LTDA	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	3255976	04/06/2008	53,900,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	501,000.00
	TOTAL :	\$ 501,000.00

: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

107531

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
23 August 2007 (23.08.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/094891 A2

(51) International Patent Classification:

A61Q 11/00 (2006.01) A61K 8/24 (2006.01)
A61K 8/25 (2006.01)

(21) International Application Number:

PCT/US2006/062511

(22) International Filing Date:

21 December 2006 (21.12.2006)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

60/752,340 21 December 2005 (21.12.2005) US

(71) Applicant (for all designated States except US): COL-
GATE-PALMOLIVE COMPANY [US/US]; 300 Park
Avenue, New York, NY 10022 (US).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): PRENCIPE,
Michael [US/US]; 39 Spruce Street, Princeton Junction,
NJ 08550 (US). IBRAHIM, Sayed [US/US]; 152 Kings-
berry Drive, Somerset, NJ 08873 (US).

(74) Agent: LIN, Rachel, J.; Colgate-palmolive Company,
Patent Department, 909 River Road, Piscataway, NJ 08855
(US).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every

kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS,
JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY,
MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS,
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every

kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— without international search report and to be republished
upon receipt of that report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: ABRASIVE SYSTEM FOR ORAL CARE COMPOSITIONS

(57) Abstract: Oral compositions comprising a first and a second abrasive are provided. The first abrasive preferably has an Ein-
lehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions, and the second abrasive preferably has an Einlehner hardness
of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions. A ratio of the first abrasive to the second abrasive ranges from about 1:1.6 to
about 1.6:1, and the first and second abrasives are preferably present in the oral composition at an amount of about 13% to about 21
% by weight, respectively. The pellicle cleaning ratio of the oral composition is greater than 100 and the radioactive dentin abrasive-
ness is preferably less than 200, and in certain embodiments, preferably less than about 175. Methods of using the oral compositions
are also provided.

WO 2007/094891 A2

TITLE OF THE INVENTION

Abrasive System for Oral Care Compositions

CROSS REFERENCE TO RELATED APPLICATION

[0001] The present application claims benefit of United States Provisional Application No. 60/752,340 filed December 21, 2005, which is hereby incorporated by reference in its entirety.

BACKGROUND OF THE INVENTION

[0002] Abrasives in oral compositions debride and physically scrub the external surface of the teeth. This scrubbing action removes organic biofilm (*i.e.*, the pellicle) on the tooth surface that is formed primarily of salivary proteins, bacteria, and bacterial byproducts. It can be stained and discolored by foods, such as coffee, tea and berries, as well as, by tobacco smoke, cationic compounds, and chromogenic bacteria. Such physical removal of the stained pellicle is a simple and effective means of removing the undesirable surface staining and discoloration which occurs daily. Further, such physical removal of the pellicle also removes plaque bacteria on the pellicle surface, thereby minimizing the potential for gingivitis, periodontitis, and caries formation. However, oral compositions such as dentifrices should not have such high abrasiveness that potential damage to the enamel or tissue may result. As such, it is desirable to develop oral compositions that optimize the cleaning and/or polishing efficacy of the oral composition, while minimizing the harmful abrasiveness to avoid potential damage oral surfaces.

BRIEF SUMMARY OF THE INVENTION

[0003] In various embodiments, the present invention is directed to an oral composition comprising:

a first abrasive having an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions; and

a second abrasive having an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions;

wherein the ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1, and wherein oral composition has a pellicle cleaning ratio (PCR) of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion (RDA) of less than about 200.

[0004] In various embodiments, the present invention is directed to an oral composition comprising:

a first abrasive comprising silica, having an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions and an oil of absorption of less than about 90 cm³/100g; and

a second abrasive comprising silica, having an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions and an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g;

wherein the first abrasive is present in an amount of about 13% to about 21% by weight and the second abrasive is present in an amount of about 13% to about 21% by weight of the composition.

[0005] In various embodiments, the present invention is directed to an oral composition comprising:

a first abrasive comprising silica and having an oil of absorption of less than about 90 cm³/100g and an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions; and

a second abrasive comprising silica and having an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g and an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions;

wherein a ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1, and a total amount of the first and second abrasives present in the oral composition is greater than about 25% by weight of the composition; and wherein the oral composition has a pellicle cleaning ratio of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion of less than about 200.

[0006] In various embodiments, the present invention provides methods of increasing delivery of an active ingredient in an oral composition to an oral surface

comprising:

introducing an oral composition into an oral cavity, wherein the oral composition comprises the active ingredient, a first abrasive and a second abrasive, wherein the first and second abrasives each comprise silica and each are present in an amount of about 13% to about 21% by weight, wherein the oral composition has a pellicle cleaning ratio of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion of less than about 200. The composition is contacted with the oral surface. The delivery of the active ingredient in the oral composition is greater than a comparative composition having an abrasive comprising silica and a pellicle cleaning ratio of less than about 100; and

contacting the composition with the oral surface, wherein the delivery of the active ingredient is greater than a comparative composition having an abrasive comprising silica and a pellicle cleaning ratio of less than about 100.

[0007] In various embodiments, the present invention is directed to an oral care composition comprising:

a first abrasive having an Einlehner hardness of greater than about 10 mg loss per 100,000 revolutions; and

a second abrasive having an Einlehner hardness of less than about 10 mg loss per 100,000 revolutions;

wherein the ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1, and wherein oral composition has a pellicle cleaning ratio (PCR) of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion (RDA) of less than about 200.

DETAILED DESCRIPTION OF THE INVENTION

[0008] As used herein, all measurement levels described herein are by weight of the total composition, unless otherwise indicated. Additionally, all references cited herein are hereby incorporated by reference in their entireties. However, in the event of a conflict between any definitions in the present disclosure and those in a cited reference, the present disclosure controls.

[0009] In various embodiments, an oral composition is provided that has a first abrasive and a second abrasive. Abrasive selection for the present oral compositions may account for the abrasive type, fineness (particle size), particle size distribution and amount of abrasive, to ensure that tooth enamel is not excessively abraded during normal use of the composition, but is sufficiently cleaned and/or polished. In the context of oral care, the efficacy of the abrasive can be expressed based on a cleaning or an abrasion basis for a dentifrice, namely the pellicle cleaning ratio (PCR) or the radioactive dentin abrasion (RDA) respectively. Methods of performing PCR and RDA are described in *e.g.*, United States Patent Nos. 5,939,051 and 6,290,933.

[0010] In commonly accepted conventional practice, RDA values for an oral composition are generally kept below 250 to avoid harming enamel/dentin with repeated usage. However, in order to achieve a higher PCR, typically the amount and hardness of abrasives must be increased, which is conventionally known to increase the RDA. For example, it has been observed that when the RDA value of a dentifrice composition exceeds certain values, such as, *e.g.*, above about 100 to about 115, the dentifrice does not necessarily exhibit a corresponding increase in the cleaning performance of the dentifrice. It has been challenging to formulate oral compositions that have a PCR of greater than about 80 or 90 but still have an RDA that is below 250, more preferably below 200.

[0011] However, in certain embodiments of the present invention, an oral composition has been achieved that has a PCR of greater than 100, while having an RDA of less than 200. In certain embodiments, the RDA is less than or equal to about 175, while still having a PCR that exceeds about 100. In certain embodiments, the RDA is less than 165. In this regard, the oral compositions of the present invention provide a superior cleaning and/or polishing efficacy, while achieving a desirably low RDA that minimizes potential damage to enamel or dentin.

[0012] The present compositions may provide cleaning and/or polishing of a tooth surface. Cleaning and/or polishing abrasives can be classified by various physical parameters. As appreciated by one of skill in the art, a single abrasive species typically

3

performs at least some cleaning and polishing simultaneously. However, particles are generally categorized in the art by the predominant effect they have on a target oral surface.

[0013] As used herein, the term "cleaning" generally refers to the removal of contaminants, dirt, impurities, and/or extraneous matter on a target surface. For example, in the context of oral surfaces, where the surface is tooth enamel, the cleaning may remove at least some of a film or stain, such as plaque biofilm, pellicle or tartar. As used herein, "polishing" generally refers to a finishing or refining process that makes a surface smoother and/or glossier. Polishing and cleaning can also provide brightening of the surface where stain removal occurs, for example, whitening of a tooth surface.

[0014] Typically, "polishing abrasives" are considered to be relatively small particles having high hardness, where abrasives with relatively large particle sizes and low hardness are considered to be "cleaning abrasives." Further, the behavior the abrasive exhibits as it interacts with the surface indicates how well it will polish (or "lap") the surface, as a desirable polishing agent usually degrades into progressively smaller fragments as contact with the surface proceeds. The lapping behavior relates to the ease with which an abrasive breaks down to a successively finer particle sizes and is generally believed to be based on the abrasive particle's crystalline shape, lines of cleavage, and friability, for example.

[0015] Thus, an abrasive is generally categorized on a gradient extending from softer cleaning abrasives to harder polishing abrasives. In certain embodiments, a method of cleaning and/or polishing a target oral surface comprises contacting the surface with an oral composition that comprises a first abrasive and a second abrasive. The first abrasive of the composition may be a distinct species from the second abrasive, meaning that each abrasive may have a different effect on the target surface; for example, categorized in a different category on the abrasiveness gradient. Any number of abrasives can be selected in this manner. Thus, the first abrasive may be a relatively low cleaning abrasive and the second abrasive may be a relatively high cleaning abrasive. The first abrasive may be a cleaning abrasive and the second abrasive may be

a polishing abrasive. It should be noted that the oral compositions optionally comprise a plurality of different abrasive species, and are not solely limited to the first and second abrasives.

[0016] Other parameters are also useful for categorizing abrasiveness of particles, including for example, hardness. Hardness can be expressed by a number of different tests known to those of skill in the art, including the Einlehner, Knoop, Vickers, and Rockwell hardness tests, as well as the Mohs scale of hardness. One particularly useful method of evaluating abrasive particles is the Einlehner hardness value. Einlehner hardness value is obtained using an Einlehner At-1000 Abrader to measure the softness of the abrasive particle in the following manner: a Fourdrinier brass wire screen is weighed and exposed to the action of a suspension of the abrasive (for example, a 10% aqueous suspension of the abrasive) for a given number of revolutions. The hardness value is expressed as milligrams weight lost of the Fourdrinier wire screen per 100,000 revolutions. Thus, in certain embodiments, the oral composition comprises a first abrasive having an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions and a second abrasive having an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions. In certain embodiments, the first abrasive has an Einlehner hardness of greater than about 10 mg loss per 100,000 revolutions and a second abrasive having an Einlehner hardness of less than about 10 mg loss per 100,000 revolutions.

[0017] When the first particle has an Einlehner hardness of greater than 5 mg loss per 100,000 revolutions, it may have more of a polishing function when it is contacted with an oral surface. When the second particle has an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions, it may have more of a cleaning function, as it is a softer particle. In certain embodiments, the second particle has a hardness of greater than about 10 mg loss per 100,000 revolutions, and in other embodiments, greater than about 15 mg loss per 100,000 revolutions.

[0018] In certain embodiments, the first abrasive is a cleaning abrasive having a hardness of less than or equal to that of the oral surface to be treated, and the second

2

abrasive is a polishing abrasive having a hardness of greater than or equal to that of the oral surface to be treated.

[0019] The structure of an abrasive particle may also reflect abrasiveness; a relatively low structure tends to have higher abrasiveness and a relatively high structure abrasive tends to have lower abrasiveness. Particle structure may be indicated by absorption of linseed oil or dibutyl phthalate (DBP) per 100 grams. Oil absorption values can be measured using the ASTM Rub-Out Method D281.

[0020] In certain embodiments, the first abrasive has an oil absorption structure of less than about $90 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$, and the second abrasive has an oil absorption structure of greater than about $90 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$. In various embodiments, a particle of the first abrasive has an absorption structure of less than about $80 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$, less than about $70 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$, or less than about $60 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$. In various embodiments, a particle of the second abrasive has an oil absorption of greater than about $100 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$, or greater than about $110 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$.

[0021] Particle size can be indicative of an abrasive's cleaning and/or polishing efficacy. In certain embodiments, the first abrasive has a first particle size, and the second abrasive has a second particle size. In certain embodiments, the first particle size is less than the second particle size. Mean particle size can be measured using a Malvern Particle Size Analyzer, Model Mastersizer S, Malvern Instruments, Inc. (Southborough, Massachusetts, USA). A helium-neon gas laser beam is projected through a transparent cell that contains the abrasive suspended in an aqueous solution. Light rays that strike the particles are scattered through angles that are inversely proportional to the particle size. The photodetector array measures the quantity of light at several predetermined angles. Electrical signals proportional to the measured light flux values are then processed by a microcomputer system, against a scatter pattern predicted from theoretical particles as defined by the refractive indices of the sample and aqueous dispersant to determine the particle size distribution of the subject abrasive.

[0022] In various embodiments, the first abrasive has a mean particle size of less than about 11 μm , or less than about 10 μm . For example, examples of suitable abrasives have mean particle sizes of about 7 μm to 11 μm . Some abrasives have particle sizes of less than about 5 μm . In various embodiments, the second abrasive has a mean particle size of greater than about 8 μm , or greater than about 10 μm . In some embodiments, the second abrasive can have a mean particle size of about 8 μm to about 14 μm .

[0023] In certain embodiments, the composition is safe for oral use with humans or other animals, and any orally or cosmetically acceptable abrasive fulfilling the requirements set forth above can be selected for an oral composition. Suitable abrasives include without limitation: silica, silicate, silicon, alumina (including calcined aluminum oxide), aluminosilicates, such as bentonite, zeolite, kaolin, and mica, siliceous or diatomaceous earth, pumice, calcium carbonate, cuttlebone, insoluble phosphates, composite resins, such as melamine resin, phenolic resin, and urea-formaldehyde resin, polycarbonate, silicon carbide, boron carbide, microcrystalline wax, microcrystalline cellulose, including combinations of colloidal microcrystalline cellulose and carboxymethylcellulose, commercially available under the trade name AVICEL® from FMC Biopolymer (Philadelphia, Pennsylvania, USA) and combinations and derivatives thereof.

[0024] As used herein, "mica" refers to any of a group of hydrous aluminum silicate minerals with plate morphology and perfect basal (micaceous) cleavage. Mica can be, for example, sheet mica, scrap mica or flake mica, as exemplified by muscovite, biotite or phlogopite type micas. Among insoluble phosphates useful as abrasives are orthophosphates, polymetaphosphates and pyrophosphates. Illustrative examples are dicalcium orthophosphate dihydrate, dicalcium phosphate dihydrate, calcium hydrogen phosphate, calcium pyrophosphate, β -calcium pyrophosphate, tricalcium phosphate, calcium metaphosphate, potassium metaphosphate, and sodium metaphosphate.

[0025] Synthetic silicas include both silica gels and precipitated silicas that are prepared by the neutralization of aqueous silicate solutions with a strong mineral acid. In the preparation of silica gel, a silica hydrogel is formed which is then typically washed to low salt content. The washed hydrogel may be milled to the desired size, or otherwise dried, ultimately to the point where its structure no longer changes as a result of shrinkage. When preparing such synthetic silicas, the objective is to obtain abrasives that provide maximal cleaning (*i.e.*, removal of stained pellicle) with minimal damage to the tooth enamel and other oral tissue.

[0026] Abrasives comprising silica are particularly useful in certain embodiments of the present invention. There has been significant difficulty in the past in using a silica based abrasive at high concentrations within an oral composition, due to chemical and physical instability in the oral composition when provided at high concentrations, mouth-feel issues, and excessive abrasiveness reflected by high RDA values. However, silica is a particularly attractive option as an abrasive, as it efficaciously cleans and/or polishes oral surfaces. Further, it is relatively inert and compatible with other ingredients in the oral composition and is relatively inexpensive. Thus, in certain embodiments of the present invention, both the first and second abrasive each comprises silica. In some embodiments, the first abrasive is selected to be a harder and smaller abrasive, *e.g.*, a higher cleaning and/or polishing abrasive, and the second abrasive is a typical cleaning abrasive. In certain embodiments, the oral compositions may comprise a particularly efficacious combination of silica abrasive particle species.

[0027] Useful abrasive materials for preparing oral compositions include high cleaning, low structure silica abrasives, such as those marketed under the trade designation SYLODENT® XWA or SYLODENT® 783 by Davison Chemical Division of W. R. Grace & Co. (Baltimore, Maryland, USA). SYLODENT® XWA 650 is a silica hydrogel composed of particles of colloidal silica.

[0028] Exemplary silica hydrogels comprise colloidal particles of silica having, in various embodiments, an average particle size of about 3 μm to about 12 μm , or about 5 μm to about 10 μm , with a pH of about 4 to about 10, or about 6 to about 9 when

measured as a 5% by weight slurry. The particles of the XWA 650 contain about 10 % to about 35% by weight water, have a mean particle size of about 5 μm to about 12 μm , an Einlehner hardness of greater than or equal to about 5 to about 20 mg loss per 100,000 revolutions, an oil absorption of less than about 90 $\text{cm}^3/100\text{ g}$, for example from between about 40 $\text{cm}^3/100\text{ g}$ to about 90 $\text{cm}^3/100\text{ g}$. The abrasives have a Brunauer, Emmett and Teller (BET) surface area of about 100 to about 700 m^2/g . XWA 650 has a brightness of 96.8 technidyne. Such abrasives are discussed in United States Patent No. 6,290,933 to Durga et al.

[0029] Another useful high cleaning silica abrasive is marketed as SYLODENT® XWA 300 and is a silica hydrogel containing about 10% to about 25% water by weight, where the mean particle size is about 2 μm to about 4 μm . The particles have BET surface area in the range of 150 to 400 m^2/g of silica. The XWA 300 abrasive has an oil absorption of less than 90 $\text{cm}^3/100\text{ g}$ silica; and a pH, in a 5% w/w suspension in boiled (CO_2 free) demineralized water, equal to or greater than 8.5. Such abrasives are discussed in, *e.g.*, United States Patent No. 5,939,051 to Santalucia et al.

[0030] In other embodiments, a high cleaning silica for the present invention comprises a silica product, where the particles are about 5 % to about 35% by weight water, having a mean particle size of about 7 μm to about 11 μm , an Einlehner hardness of about 12 to about 19 and an oil absorption value of about 50 $\text{cm}^3/100\text{ g}$ to about 65 $\text{cm}^3/100\text{ g}$. A BET surface area is about 100 to about 700 m^2/g of silica. The brightness is generally reported to be greater than about 95 technidyne. Such a silica product is commercially available as ZEODENT® 105 from J.M. Huber (Havre de Grace, Maryland, USA).

[0031] Other useful abrasives include typical cleaning silica abrasives, such as precipitated silicas having a mean particle size of up to about 20 μm , typically at about 8 to about 14 μm , with an oil absorption structure of greater than about 90 to about 110 $\text{cm}^3/100\text{ g}$; for example, ZEODENT®115, marketed by J. M. Huber, that has a pH at 5% of the particles of about 6.5-7.5 and an Einlehner hardness of about 2 to 4 mg loss per 100,000 revolutions. The brightness of such a silica particle is greater than about 95. In

certain embodiments, such cleaning abrasives comprise the second abrasive of the oral composition.

[0032] In certain embodiments, the oral composition is in the form of a dentifrice that is a clear or transparent gel. There, an abrasive of colloidal silica, such as those sold under the trademark SYLOID® as SYLOID® 72 and SYLOID® 74 or under the trademark SANTOCEL® 100 alkali metal alumina-silicate complexes may be particularly useful, since these abrasives have refractive indices close to the refractive indices of gelling agent-liquid (including water and/or humectant) systems commonly used in dentifrices.

[0033] In various embodiments, a first and a second abrasive are combined in an oral composition to provide unexpectedly superior cleaning capability, unanticipated mildness (relatively low abrasivity), and aesthetically acceptable oral care compositions. In various embodiments the ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1. For example, in certain embodiments, a ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1. In certain embodiments, the respective amounts of the first abrasive and the second abrasive present in an oral composition are about 13 to about 21% by weight of the oral composition. In some embodiments, the amount of the first abrasive is about 15% to about 19%, and the amount of the second abrasive is about 15% to about 19% by weight of the oral composition. In certain embodiments, the first abrasive is present at about 17% by weight and the second abrasive is present at about 17% by weight of the oral composition. In various embodiments, the total amount of abrasive, including the first and second abrasive, is greater than about 25%, greater than about 30%, or greater than about 35% by weight of the oral composition.

[0034] In some embodiments, an oral composition comprises a first abrasive having an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions and a second abrasive having an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions. Further, the oral composition has a PCR of greater than about 100 and an RDA of less than about 200. In certain embodiments, the RDA is less than about 175.

[0035] In certain embodiments, the first abrasive has an oil of absorption of less than

about 90 cm³/100g, and the second abrasive has an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g. In certain embodiments, the total amount of the abrasives is greater than about 30%. In various embodiments, the first abrasive and the second abrasive are present in amounts of about 13% to about 21%, about 15% to about 19%, or at about 17% each by weight of the total composition. In various embodiments, the first and second abrasives optionally comprise silica.

[0036] In certain embodiments, an oral composition comprises a first abrasive comprising silica, having an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions, and an oil of absorption of less than about 90 cm³/100g; and a second abrasive comprising silica having an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions, and an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g.

[0037] The oral composition further comprises a second abrasive comprising silica and having an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g and an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions.

[0038] In other embodiments, methods of increasing the delivery of an active ingredient in an oral composition to an oral surface are provided. In various embodiments, the method comprises introducing an oral composition into an oral cavity containing the oral surface, wherein the oral composition comprises the active ingredient, a first abrasive and a second abrasive. In certain embodiments the first and second abrasives each comprise silica and each are present in an amount of about 13% to about 21% by weight. The oral composition has a PCR of greater than about 100 and an RDA of less than about 200. The oral composition is contacted with the oral surface. It has been unexpectedly discovered that the delivery of the active ingredient is greater for this oral composition, when compared with a comparative composition that has an abrasive comprising silica but has a PCR of less than about 100, as will be discussed in more detail below.

[0039] In particular embodiments, the active ingredient comprises a non-ionic antibacterial ingredient, such as a halogenated diphenyl ether like triclosan, which will be discussed in more detail below. In some embodiments, the first abrasive has an oil of

absorption of less than about 90 cm³/100g and an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions, and the second abrasive has an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g and an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions. Further, the oral composition may comprise an efficacy enhancing copolymer, such as for example, a copolymer of polyvinyl methyl ether and maleic anhydride, such as the commercially available GANTREZ® products sold by ISP Corporation of Wayne, N.J., and/or an anti-caries active agent, which will be discussed in more detail below.

[0040] The oral compositions may further comprise an orally acceptable carrier. Conventional ingredients that can be used to form the carriers for oral care compositions are known to the skilled artisan. The specific composition of the carrier depends on the intended use of the composition. The carrier can be a liquid, semi-solid, or solid phase. Oral compositions can be in the form of a dentifrice (including toothpastes, toothpowders, and prophylaxis pastes), confectionaries (including gums, beads and chews), film, paint-on gels, or any other form known to one of skill in the art where abrasives are employed. Selection of specific carrier components is dependent on the desired product form.

[0041] In certain embodiments, the oral composition is in the form of a dentifrice, and the exemplary carrier is substantially semi-solid or solid. The carrier can be aqueous, *i.e.*, comprising about 5% to about 95% water. In other embodiments, the carrier is substantially non-aqueous. The carrier optionally comprises, for example, oral care active ingredients, surface active agents, such as surfactants, emulsifiers, and foam modulators, viscosity modifiers and thickeners, humectants, diluents, fillers, additional pH modifying agents, colorants, preservatives, solvents, and combinations thereof. It is understood that while general attributes of each of the above categories of materials may differ; there may be some common attributes and any given material may serve multiple purposes within two or more of such categories of materials. As recognized by one of skill in the art, the oral compositions optionally include other materials in addition to those components previously described, including for example, emollients,

19

moisturizers, mouth feel agents and the like. Examples of suitable carriers for oral compositions are discussed in United States Patent Nos. 6,669,929 to Boyd et al., 6,379,654 to Gebreselassie et al., and 4,894,220 to Nabi et al.

[0042] The oral care active ingredients include for example, anti-bacterial active agents, anti-tartar agents, anti-caries agents, anti-inflammatory agents, anti-sensitivity agents, enzymes, nutrients, and the like. Actives useful herein are optionally present in the compositions of the present invention in safe and effective amounts that are sufficient to have the desired therapeutic or prophylactic effect in the human or lower animal subject to whom the active is administered, without undue adverse side effects (such as toxicity, irritation, or allergic response), commensurate with a reasonable risk/benefit ratio when used in the manner of this invention. The specific safe and effective amount of the active will vary with such factors as the particular condition being treated, the physical condition of the subject, the nature of concurrent therapy (if any), the specific active used, the specific dosage form, the carrier employed, and the desired dosage regimen. Active ingredients useful for treating such conditions include those discussed in United States Patent Publication 2003/0206874 to Doyle et al. Actives among those useful herein are also discussed in United States Patent 6,290,933 to Durga et al. and United States Patent 6,685,921 to Lawlor.

[0043] Any suitable fluoride ion source can be present in the oral composition, such as those discussed in United States Patent No. 5,080,887 to Gaffar et al. Sources of fluoride ions, acid phosphatases, and pyrophosphatase enzyme inhibitors, are well known in the art as anti-caries agents. A fluoride ion source may be slightly soluble in water or may be fully water-soluble. It is characterized by its ability to release fluoride ions in water and by freedom from undesired reaction with other compounds of the oral preparation. Examples of such sources are inorganic metal and/or ammonium fluoride salts and compounds, such as, for example: sodium fluoride, potassium fluoride, ammonium fluoride, calcium fluoride; a copper fluoride, such as cuprous fluoride; zinc fluoride, barium fluoride; sodium silicafluoride, ammonium fluorosilicate, sodium fluorozirconate; and sodium monofluorophosphate, aluminum

mono- and di-fluorophosphate, and fluorinated sodium calcium pyrophosphate. The fluoride source can also be an amine fluoride, such as olaflur (N'-octadecyltrimethylenediamine-N,N,N'-tris(2-ethanol)-dihydrofluoride).

[0044] The amount of fluoride-providing source is dependent to some extent upon the type of source, its solubility, and the type of oral preparation, but it will be present in a non-toxic amount, generally about 0.001% to about 3.0% in the preparation. In a dentifrice preparation, *e.g.*, dental gel, toothpaste (including cream), toothpowder, or dental tablet, an amount of such source which releases up to about 5,000 ppm of F⁻ ion by weight of the preparation is considered satisfactory. Any suitable minimum amount of such source may be used, but in various embodiments is an amount sufficient to release about 300 to 2,000 ppm, about 500 to about 1,800 ppm or about 800 to about 1,500 ppm of fluoride ion.

[0045] The oral composition optionally comprises an anti-calculus composition, such as, for example, one or more of the anti-calculus compositions discussed in United States Patent No. 5,292,526 to Gaffar, et al. In various embodiments, the anti-calculus composition includes one or more polyphosphates. The anti-calculus composition can include at least one wholly or partially neutralized alkali metal or ammonium triphosphate or hexametaphosphate salt present in the oral composition at an effective anti-calculus amount. The anti-calculus active can also include at least one water soluble, linear, molecularly dehydrated polyphosphate salt effective in an anticalculus amount. The anti-calculus active can also include a mixture of potassium and sodium salts, at least one of which is present in an effective anti-calculus amount as a polyphosphate anti-calculus agent. The anti-calculus active agent can also contain an effective anticalculus amount of linear molecularly dehydrated polyphosphate salt anti-calculus agent present in a mixture of sodium and potassium salts. The ratio of potassium to sodium in the composition can be up to less than 3:1. The polyphosphate can be present in the oral composition in various amounts, such as an amount wherein the weight ratio of polyphosphate ion to anti-bacterial agent ranges from in excess of 0.72:1 to less than 4:1, or wherein the weight ratio of the anti-bacterial enhancing agent

to the polyphosphate ion ranges from about 1:6 to about 2.7:1, or wherein the weight ratio of the anti-bacterial enhancing agent to the polyphosphate ranges from about 1:6 to about 2.7:1. Other useful anticalculus agents include polycarboxylate polymers and polyvinyl methyl ether/maleic anhydride (PVM/MA) copolymers, such as GANTREZ®.

[0046] Another active agent useful in dentifrice compositions of the present invention are antibacterial agents, which may be present in amounts of about 0.001 to about 3.0% by weight of the oral composition. A non-limiting list of useful additional oral care compounds includes non-ionic antibacterial agents, including phenolic and bisphenolic compounds, such as, halogenated diphenyl ethers, including triclosan (2,4,4'-trichloro-2'-hydroxy-diphenylether, triclocarban (3,4,4-trichlorocarbanilide), as well as 2-phenoxyethanol, benzoate esters, and carbanilides. A halogenated diphenyl ether, such as triclosan, can be present in an amount of about 0.3% by weight of the oral composition, for example.

[0047] Suitable surface active agents are those that are reasonably stable throughout a wide pH range. These compounds are well known in the art, and include non-soap anionic (e.g., sodium lauryl sulfate (SLS), N-myristoyl, and N-palmitoyl sarcosine), nonionic (e.g., Polysorbate 20 (polyoxyethylene 20 sorbitan monolaurate, TWEEN® 20) and Polysorbate 80 (polyoxyethylene 20 sorbitan mono-oleate, TWEEN® 80), Poloxamer 407, available under the trade name PLURONIC® F127 from BASF Corporation), cationic, zwitterionic (e.g., cocamidopropyl betaine and lauramido propyl betaine), and amphoteric organic synthetic detergents. Examples of suitable surface active agents for use in oral compositions are discussed in, for example, United States Patent Nos. 4,894,220 to Nabi et al., 6,555,094 to Glandorf et al., and 6,706,256 to Lawlor, *inter alia*. In various embodiments, one or more surface active agents are present in the oral composition of the present invention in the range of about 0.001% to about 5%, or about 0.5% to about 2.5%.

[0048] Optional thickeners for use in oral compositions include natural and synthetic gums and colloids, such as carrageenan (Irish moss), xanthan gum, sodium

2

carboxymethyl cellulose, starch, polyvinylpyrrolidone, hydroxyethylpropyl cellulose; hydroxybutyl methyl cellulose, hydroxypropylmethyl cellulose, and hydroxyethyl cellulose. Inorganic thickeners include amorphous silica compounds which function as thickening agents and include colloidal silicas compounds available under trademarks such as Cab-o-sil fumed silica manufactured by Cabot Corporation and distributed by Lenape Chemical (Bound Brook, N.J, USA); ZEODENT® 165 from J.M. Huber Chemicals, and Sylox 15, also known as SYLODENT® 15, available from Davison Chemical Division of W.R. Grace Corp. In various embodiments, the thickening agent is present in the dentifrice composition in amounts of about 0.1 to about 10% by weight, or about 0.5 to about 4% by weight.

[0049] The orally-acceptable dentifrice carrier vehicle used to prepare the dentifrice composition optionally comprises a humectant. The humectant can be glycerin, sorbitol, and xylitol, propylene glycol of molecular weight in the range of about 200 to about 1,000; or other humectants and mixtures thereof. The humectant concentration typically totals about 5 to about 70% by weight of the oral composition. Water is typically present in an amount of at least about 10% by weight, and generally about 25 to 70% by weight of the oral composition.

[0050] Synthetic anionic linear polycarboxylates are efficacy enhancing agents for optional use in oral compositions having certain active ingredients, including antibacterial, anti-tartar or other active agents within the oral composition. Such anionic polycarboxylates are generally employed in the form of their free acids, or partially or fully neutralized water soluble alkali metal (e.g., potassium and preferably sodium) or ammonium salts. The terms "synthetic" and "linear" exclude known thickening or gelling agents comprising carboxymethylcellulose and other derivatives of cellulose and natural gums, nor carbopols having reduced solubility due to cross-linkages.

[0051] Preferred copolymers are 1:4 to 4:1 copolymers of maleic anhydride or acid with another polymerizable ethylenically unsaturated monomer, preferably methyl vinyl ether (methoxyethylene) having a molecular weight (M.W.) of about 30,000 to

about 1,000,000. One useful copolymer is methylvinylether/maleic anhydride. Examples of these copolymers are available from ISP Corporation under the trade name GANTREZ®, *e.g.*, AN 139 (M.W. 1,100,000), AN 119 (M.W. 200,000); S-97 Pharmaceutical Grade (M.W. 1,500,000), AN 169 (M.W. 2,000,000), and AN 179 (M.W. 2,400,000); wherein the preferred copolymer is S-97 Pharmaceutical Grade (M.W. 1,500,000). When present, the anionic polycarboxylate is employed in amounts effective to achieve the desired enhancement of the efficacy of any antibacterial, antitartar or other active agent within the dentifrice composition. In various embodiments, a synthetic anionic polycarboxylate is included in the oral composition is present at about 0.001 to about 5%, or about about 0.1 to about 2.0% of the oral composition.

[0052] The oral composition of the present invention can be made by any of the methods known in the art for combining ingredients to make oral care compositions. Examples of methods that can be used are set forth in, *e.g.*, United States Patent No. 6,403,059 to Martin et al.; Clinical Pharmacology for Dental Professionals (Mosby-Year Book, Inc., 3rd ed. 1989); Mosby's Dental Hygiene: Concepts, Cases and Competencies, (Daniel, S. and Harfst, S. eds., Elsevier Science Health Science Div. 2002); and Ernest W. Flick, Cosmetic and Toiletry Formulations, 2nd ed.

[0053] The present invention provides for methods and processes of using the oral compositions of the present invention to clean and/or polish oral surfaces. Further, the oral compositions optionally treat and inhibit oral conditions, such as oral inflammatory conditions, dental plaque, and dental calculus. The oral compositions can be applied to the subject in any suitable manner known in the art; for example, by introducing the oral composition to the subject's oral cavity using a suitable applicator or delivery device, such as a brush, dental strip, film, syringe, tape, pill, or any other applicator or delivery device known in the art. The compositions can be used in prophylactic methods and processes to promote and maintain oral health, appearance, maintain systemic health and the like. The oral compositions can be repeatedly applied to the subject over a number of days according to a particular treatment schedule to treat and/or inhibit stain, plaque, calculus or tartar formation. Instructions setting forth the

treatment schedule can be provided in commercial packaging with the product, as commercially prepared and stored.

[0054] The present invention is further illustrated through the following non-limiting example(s).

EXAMPLE I

[0055] A dentifrice composition according to the present invention, having the ingredients listed as Dentifrice 1 in Table I is prepared by the following method: Sodium saccharin, sodium benzoate, sodium monofluorophosphate, and any other salts are dispersed in water and mixed in a conventional mixer under agitation. The humectants *e.g.*, glycerin and sorbitol, are added to the water mixture under agitation. Then organic thickeners, such as sodium carboxymethyl cellulose, carrageen and any polymers, such as GANTREZ® are added.

[0056] The resultant mixture is agitated until a homogeneous gel phase is formed. The mixture is then transferred to a high-speed vacuum mixer; where the abrasives are added. The mixture is then mixed at high speed for from 5 to 30 minutes, under vacuum of about 20 to 50 mm Hg, preferably about 30 mmHg. The flavor oil is weighed out and triclosan is then added to the flavor oil. The flavor oil and flavonoid mixture is added to the mixture. Surfactants, such as sodium lauryl sulfate (SLS) are charged into the mixer. The resultant product is a homogeneous, semi-solid, extrudable paste or gel product. The resulting dentifrice can be applied with a brush or other applicator to the oral surfaces.

[0057] Dentifrices A and B are comparative examples and are prepared in the same manner as described above for Dentifrice 1.

3

Table I

INGREDIENTS	DENTIFRICE 1 (weight %)	Comparative DENTIFRICE A (weight %)	Comparative DENTIFRICE B (weight %)
Glycerin	8-15	15-25	15-25
Sorbitol (70% in water)	15-25	15-25	15-25
Sodium Carboxymethyl	0.1-5	0.1-5	0.1-5
GANTREZ® S-97	1-3	1-3	1-3
Carrageenan	0.1-1	0.1-1	0.1-1
Sodium Saccharin	0.1-1	0.1-1	0.1-1
Sodium Benzoate	0.1-3	0.1-3	0.1-3
Sodium Monofluorophosphate	0.01-1	0.01-1	0.01-1
Triclosan	0.01-3	0.01-3	0.01-3
Sodium Lauryl Sulfate	0.5-3	0.5-3	0.5-3
Flavor Oil	0.1-5	0.1-5	0.1-5
SYLODENT® XWA 650	15-18	19-21	7-14
ZEODENT® 115	15-20	---	8-14
Water	Q.S.	Q.S.	Q.S.

EXAMPLE II

[0058] PCR and RDA data is shown in Table II for Dentifrice 1 prepared in accordance with the present invention, as compared to Dentifrices A and B.

[0059] The RDA is determined according to the method recommended by the American Dental Association as set forth by Hefferren, Journal of Dental Research, Volume 55, Issue 4, July-August 1976, pp. 563-573, and described in the United States Patent Nos. 4,340,583, 4,420,312, and 4,421,527 all to Wason.

[0060] PCR, as described above, is an *in vitro* method used to measure the efficacy of removing tea and coffee tooth stains relative to a standard. The PCR values referred to herein are obtained by a modification of the method described in "In Vitro Removal of Stain with Dentifrice", G. K. Stookey, et al J. Dental Research, 61, 123-9 (1982). The modification of the PCR method used herein is described in United States Patent Nos. 5,658,553 and 5,651,958 both to Rice. In this modification, a clear pellicle material is applied to a bovine tooth first, which is then stained with a combination of the pellicle

material and tea, coffee and FeCl_3 whereas in the original method described by Stookey et al. both pellicle and stain are applied simultaneously.

Table II

Example	PCR	% Increase of PCR	RDA	% Increase of
Dentifrice 1	108	27	163	18
Dentifrice A	98	15	180	30
Dentifrice B	85	---	138	---

[0061] Dentifrice B is a typical oral composition formulation having a combination of high cleaning silica (XWA 650) and regular cleaning silica (ZEODENT® 115) at 10% by weight, respectively. Dentifrice B is the control having a PCR of about 85 and an RDA of 138. As can be observed, in Dentifrice A the high cleaning silica (XWA 650) is doubled to 20% while removing the regular cleaning silica (ZEODENT® 115). For Dentifrice A, the RDA increases to 180, but the PCR only increases to about 98. In comparison, Dentifrice 1 has 17% of both the high cleaning silica (XWA 650) and the regular cleaning silica (ZEODENT® 115), but the RDA is only 163, while the PCR exceeds 100 (about 108). Thus, the combination of abrasives in Dentifrice 1 provides an unexpectedly low RDA (with only an 18% increase over Dentifrice B) while achieving a 27% increase in PCR over Dentifrice B. Comparatively, Dentifrice A has an RDA increase of over 30% and a PCR increase of only 15%, when compared to Dentifrice B.

[0062] It is discovered, therefore, that desirably high PCR values for a dentifrice composition can be achieved, while the RDA values are significantly less than would be expected.

EXAMPLE III

[0063] An *in vitro* polishing analysis is conducted with Dentifrice 1, Dentifrice B, a dentifrice prepared in accordance with Table III below and designated Dentifrice C, and a commercially available whitening dentifrice designated Dentifrice D. Dentifrice C is prepared in the same manner as described above for Dentifrice 1 in Example I, and contains 20% by weight of regular cleaning silica, ZEODENT® 115. Dentifrice D is commercially available as CREST® Dual Action Whitening Toothpaste from Procter

27

and Gamble of Cincinnati, OH, and is believed to contain the ingredients sodium fluoride at 0.243 %, glycerin, hydrated silica, water, sorbitol, sodium hexametaphosphate (for tartar control/stain prevention), propylene glycol, flavor, PEG-12, cocamidopropyl betaine, SLS, CARBOMER® 956, sodium saccharin, Poloxamer 407, polyethylene oxide, xanthan gum, sodium hydroxide, cellulose gum, sodium hydroxide, titanium dioxide, and Blue 1 and Yellow 5 colorings.

Table III

INGREDIENTS	DENTIFRICE C (weight %)
Glycerin	15-30
Sorbitol (70% in water)	15-30
Sodium Carboxymethyl	0.5-5
GANTREZ® S-97	1-5
Carrageenan	0.1-2
Sodium Saccharin	0.1-2
Sodium Benzoate	0.1-2
Sodium Monofluorophosphate	0.05-1
Triclosan	0.1-2
Sodium Lauryl Sulfate	1-4
Flavor Oil	0.05-5
ZEODENT® 115	15-25
Water	Q.S.

[0064] Table IV shows the *in vitro* mean polishing analysis of these dentifrices. The maximum reflectance of the dulled tooth surface is determined by means of a reflectometer especially adapted to detect the changes in the degree of polish of the enamel surface. The reflectometer is constructed so that the enamel is exposed to a beam of polarized light, the amount of light reflected from the enamel surface was determined by a photoelectric cell which in turn activated a galvanometer. The smoother the enamel surface, the smaller the amount of diffused and absorbed light and, hence, the higher the galvanometer reading.

[0065] After the maximum reflectance of the dulled tooth is determined, the tooth is brushed with the dentifrice to be tested. The enamel surface is then rinsed with water

to remove any residual particles of the cleaning and polishing agent, and the reflectance of the enamel surface is again measured with the tooth located in exactly the same position as that used to obtain the "dull" reading. The absolute change in the amount of reflectance between the dull and polished enamel surfaces is taken as a measure of the degree of polishing imparted by the treatment. The total brushing period is about 30,000 strokes. The results in Table IV are expressed in terms of the mean increment in the luster of the enamel specimens.

[0066] Dentifrice C is a conventional dentifrice having 20% of a regular cleaning silica abrasive, and is selected as the Control for calculating the percentage increase in mean polish increment. It is observed that Dentifrice 1 demonstrates the highest increase in mean polishing increment.

TABLE IV

Example	Mean Polish Increment	% Increase in Mean Polish Increment
Dentifrice 1	3.93	11
Dentifrice B	3.79	7
Dentifrice C	3.54	---
Dentifrice D	3.59	1

EXAMPLE IV

[0067] The average uptake of triclosan on a hydroxyapatite disk is set forth in Table V. Dentifrices 1, B, and C are compared for triclosan uptake levels. The uptake of an active ingredient triclosan is assessed using disks of hydroxyapatite (HAP) available from Clarkson Chromatography Products, Inc., which are saliva coated (SCHAP), as an *in vitro* model for human teeth. This *in vitro* model has been found to be correlated to *in vivo* delivery of and retention of antibacterial agents on oral surfaces.

[0068] To determine the delivery and retention of triclosan to a SCHAP disk from a dentifrice containing triclosan and an anionic copolymer of the present invention, namely AMPS terpolymer, and VCAP copolymer, SCHAP disks were treated with dentifrice slurry compositions identified in Table I above. The amounts of dentifrice

slurry used to contact the disks simulated in vivo surface to volume ratios found in the mouth, to simulate, in part, brushing condition. After incubation for 30 minutes at 37°C, the SCHAP disks were removed from the dentifrice slurry and washed three times with water. The uptake absorption of triclosan, on SCHAP disks, from Dentifrices 1, B, and C are set forth in Table V, below.

TABLE V

Example	Average Triclosan Uptake for a HAP disk
Dentifrice 1	80 ± 2.6
Dentifrice B	65 ± 3.2
Dentifrice C	65 ± 3.2

[0069] The results in Table V show that delivery and retention of triclosan to SCHAP disks from Dentifrice 1 is substantially greater than for either of comparative examples of Dentifrices B and C. Thus, these compositions provide methods of increasing delivery of an active ingredient in an oral composition to an oral surface.

EXAMPLE V

[0070] Various samples (A-E) were prepared and tested in accordance with the present invention. Sample A represents non high-cleaning silica. Samples B-E represent various high cleaning silica compositions. All were tested with an Einlehner Abrasian Analysis. The samples were dispersed at 10% W/V (100g diluted to a volume of 1000 mL) and run in duplicate on an Einlehner AT 1000. Results are shown in Table 6 Below:

2

TABLE VI

Sample	Program/# of Revolutions	Milligrams Loss		Correcetd (mg loss at 174,000 revs)
		Run 1	Run 2	
A	5/174,000	5.9	4	5.0
B	5/174,000	15.5	16.9	16.2
C	5/174,000	18.9	20.8	19.8
D	5/174,000	21.1	19.5	22.1
E	5/174,000	22.2	22.0	

3/

CLAIMS

We claim:

1. An oral composition comprising:
a first abrasive having an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions; and
a second abrasive having an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions;
wherein the ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1, and wherein the oral composition has a pellicle cleaning ratio of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion of less than about 200.
2. The composition according to claim 1, wherein the radioactive dentin abrasion is less than about 175.
3. The composition according to claim 1, wherein the first abrasive has an oil of absorption of less than about 90 cm³/100g and the second abrasive has an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g.
4. The composition according to claim 1, wherein the first abrasive has a mean particle size of less than about 11 μm and the second abrasive has a mean particle size of greater than about 8 μm.
5. The composition according to claim 1, wherein the ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.
6. The composition according to claim 5, wherein the first abrasive is present in an amount of about 17 % by weight and the second abrasive is present in an amount of about 17% by weight in the oral composition.

52

7. The composition according to claim 1, wherein a total amount of the first and second abrasives in the oral composition is greater than about 30% by weight of the composition.

8. The composition according to claim 1, wherein the first abrasive is present in an amount of about 13 % to about 21% by weight and the second abrasive is present in an amount of about 13% to about 21% by weight of the oral composition.

9. The composition according to claim 1, wherein the first abrasive is present in an amount of about 15% to about 19% by weight and the second abrasive is present in an amount of about 15% to about 19% by weight of the oral composition.

10. The composition according to claim 1, wherein the first abrasive and the second abrasive each comprise silica.

11. An oral composition comprising:

a first abrasive comprising silica, having an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions and an oil of absorption of less than about 90 cm³/100g; and

a second abrasive comprising silica, having an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions and an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g;

wherein the first abrasive is present in an amount of about 13% to about 21% by weight and the second abrasive is present in an amount of about 13% to about 21% by weight of the composition.



12. The composition according to claim 11, wherein the first abrasive is present in an amount of about 15% to about 19% by weight and the second abrasive is present in an amount of about 15% to about 19% by weight of the oral composition.

13. The composition according to claim 12, wherein the first abrasive is present in an amount of about 17 % by weight and the second abrasive is present in an amount of about 17% by weight of the oral composition.

14. The composition according to claim 11, wherein the oral composition has a pellicle cleaning ratio of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion of less than about 200.

15. The composition according to claim 14, wherein the radioactive dentin abrasion is less than about 175.

16. The composition according to claim 11, wherein a total amount of the first and second abrasives in the oral composition is greater than about 30%.

17. The composition according to claim 11, wherein the first abrasive has a mean particle size of less than about 11 μm , and the second abrasive has a mean particle size of greater than about 8 μm .

18. An oral composition comprising:
a first abrasive comprising silica and having an oil of absorption of less than about 90 $\text{cm}^3/100\text{g}$ and an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions; and

a second abrasive comprising silica and having an oil of absorption of greater than about 90 $\text{cm}^3/100\text{g}$ and an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions;

wherein a ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1, and a total amount of the first and second abrasives present in the oral composition is greater than about 25% by weight of the composition; and wherein the oral composition has a pellicle cleaning ratio of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion of less than about 200.

19. The composition according to claim 18, wherein the ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.

20. The composition according to claim 18, wherein the first abrasive is present in an amount of about 17 % by weight and the second abrasive is present in an amount of about 17% by weight in the oral composition.

21. A method of increasing delivery of an active ingredient in an oral composition to an oral surface comprising:

introducing an oral composition into an oral cavity, wherein the oral composition comprises the active ingredient, a first abrasive and a second abrasive, wherein the first and second abrasives each comprise silica and each are present in an amount of about 13% to about 21 % by weight, wherein the oral composition has a pellicle cleaning ratio of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion of less than about 200; and

contacting the composition with the oral surface, wherein the delivery of the active ingredient is greater than a comparative composition having an abrasive comprising silica and a pellicle cleaning ratio of less than about 100.

22. The method according to claim 21, wherein a ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1.

23. The method according to claim 21, wherein the active ingredient

comprises a halogenated diphenyl ether.

24. The method according to claim 21, wherein a ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1.

25. The method according to claim 21, wherein the first abrasive has an oil of absorption of less than about 90 cm³/100g and an Einlehner hardness of greater than about 5 mg loss per 100,000 revolutions, and the second abrasive has an oil of absorption of greater than about 90 cm³/100g and an Einlehner hardness of less than about 5 mg loss per 100,000 revolutions.

26. An oral composition comprising:

a first abrasive having an Einlehner hardness of greater than about 10 mg loss per 100,000 revolutions; and

a second abrasive having an Einlehner hardness of less than about 10 mg loss per 100,000 revolutions;

wherein the ratio of the first abrasive to the second abrasive is about 1:1.6 to about 1.6:1, and wherein the oral composition has a pellicle cleaning ratio of greater than about 100 and a radioactive dentin abrasion of less than about 200.

27. The oral composition of claim 18, wherein the composition further comprises a polycarboxylate polymer or polyvinyl methyl ether/maleic anhydride (PVM/MA) copolymer.

(19) Organización Mundial de Propiedad
Intelectual
Oficina Internacional



(43) Fecha de Publicación Internacional
23 de Agosto de 2007 (23.08.2007)

PCT

(10) Número de Publicación Internacional
WO 2007/094891 A2

- (51) Clasificación Internacional de Patentes:
A61Q 11/00 (2006.01) A61K 8/24 (2006.01)
A61K 8/25 (2006.01)
- (21) Numero de Solicitud Internacional:
PCT/US2006/062511
- (22) Fecha de Presentación Internacional:
21 de Diciembre de 2007 (21.12.2006)
- (25) Lenguaje de entrega: Inglés
- (26) Lenguaje de Publicación: Inglés
- (30) Datos de la Prioridad:
60/752,340 21 de Diciembre de 2006 (21.12.2006) EU
- (71) Solicitante (para todos los Estados designados menos los Estados Unidos): COLGATE-PALMOLIVE COMPANY [EU/EU]; 300 Park Avenue, New York, New York 10022 (EU).
- (72) Inventores; e
- (75) Inventores/Solicitantes (solo para los Estados Unidos): PRENCIPE, Michael [EU/EU]; 39 Spruce Street, Princeton Junction, NJ 08550 (EU). IBRAHIM, Sayed [EU/EU]; 152 Kingsberry Drive, Somerset, NJ 08873 (EU).
- (74) Agente: LIN, Rachel, J.; Colgate-Palmolive Company, Patent Department, 909 River Road, Piscataway, NJ 08854 (EU).

(81) Estados Designados (a menos que se indique lo contrario, para todo tipo de protección nacional disponible): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Estados Designados (a menos que se indique lo contrario, para todo tipo de protección regional disponible): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), Europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publicado:

— sin el informe de búsqueda internacional y a ser publicado nuevamente al recibir dicho informe

Para códigos de dos letras y otras abreviaciones, referirse a las "Notas de guía sobre Códigos y Abreviaturas" que aparecen al comienzo de cada edición de la Gaceta del PCT.

(54) Título: SISTEMA ABRASIVO PARA COMPOSICIONES DE CUIDADO ORAL

(57) Resumen: Se proveen composiciones orales que comprenden un primer y un segundo abrasivo. El primer abrasivo tiene preferentemente una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5mg de pérdida por 100,000 revoluciones, y el segundo abrasivo tiene preferentemente una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5mg de pérdida por 100,000 revoluciones. Una proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo varía de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1, y el primer y el segundo abrasivo, con preferencia, están presentes en la composición oral en una cantidad aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso, respectivamente. La proporción de eliminación de película de la composición oral es superior a 100 y la abrasividad de la dentina radiactiva es preferentemente inferior a 200, y en ciertas modalidades, con preferencia inferior a 175. También se proveen métodos de uso de las composiciones orales.

SISTEMA ABRASIVO PARA COMPOSICIONES DE CUIDADO ORAL

REFERENCIAS A SOLICITUDES RELACIONADAS

La presente solicitud reivindica el beneficio de la
5 solicitud de patente provisional de los Estados Unidos N°
60/752,340, presentada el 21 de diciembre de 2005, que se
incorpora a la presente por referencia en su totalidad.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

10 Los abrasivos en las composiciones orales limpian el
tejido contaminado (debridan) y frotan físicamente la
superficie externa de los dientes. Esta acción de frotamiento
remueve la biopelícula orgánica (es decir, la película) sobre
la superficie de los dientes y que está formada
15 principalmente por proteínas de la saliva, bacterias y
subproductos bacterianos. Puede estar manchada y decolorada
por los alimentos, tales como el café, el té y los frutos
rojos, así como por el humo del tabaco, los compuestos
catiónicos y las bacterias cromogénicas. Dicha remoción
20 física de la película manchada es un medio simple y efectivo
para eliminar las manchas y la decoloración de la superficie,
que resultan indeseables y que se producen diariamente. Más
aún, dicha eliminación física de la película también remueve
la placa bacteriana sobre la superficie de la película, con
25 lo cual se minimiza el potencial de gingivitis, periodontitis



y formación de caries. Sin embargo, las composiciones orales, tales como los dentífricos, no debieran tener una abrasividad tan alta que pueda resultar en daño potencial al esmalte o los tejidos. Por lo tanto, resulta deseable desarrollar composiciones orales que optimicen la eficacia de la limpieza y/o el pulido de la composición oral, mientras que al mismo tiempo minimicen la abrasividad nociva para evitar potenciales daños a las superficies orales.

10

BREVE DESCRIPCION DE LA INVENCION

En diversas modalidades, la presente invención se refiere a una composición oral que comprende:

un primer abrasivo que tiene una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones; y

un segundo abrasivo que tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones;

en donde la proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1, y en donde la composición oral tiene una proporción de eliminación de película (PCR) superior a aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva (RDA) inferior a aproximadamente 200.

En diversas modalidades, la presente invención se

refiere a una composición oral que comprende:

un primer abrasivo que comprende sílice, que tiene una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones y un aceite de absorción inferior a aproximadamente 90 cm³/100 g; y

un segundo abrasivo que comprende sílice, que tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones y un aceite de absorción superior a aproximadamente 90 cm³/100 g;

en donde el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso y el segundo abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso de la composición.

En diversas modalidades, la presente invención se refiere a una composición oral que comprende:

un primer abrasivo que comprende sílice y que tiene un aceite de absorción inferior a aproximadamente 90 cm³/100 g y una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones; y

un segundo abrasivo que comprende sílice y que tiene un aceite de absorción superior a aproximadamente 90 cm³/100 g y una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones;

en donde una proporción del primer abrasivo al segundo

86

abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1, y una cantidad total del primer y del segundo abrasivos presentes en la composición oral es superior a aproximadamente el 25% en peso de la composición; y en donde
5 la composición oral tiene una proporción de eliminación de película superior a aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva inferior a aproximadamente 200.

En diversas modalidades, la presente invención proporciona métodos para aumentar el suministro de un
10 ingrediente activo en una composición oral a una superficie oral, que comprende:

introducir una composición oral en una cavidad oral, en donde la composición oral comprende el ingrediente activo, un primer abrasivo y un segundo abrasivo, en donde el primer y
15 el segundo abrasivo comprenden cada uno sílice y cada uno está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso, en donde la composición oral tiene una proporción de eliminación de película superior a aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva
20 inferior a aproximadamente 200. La composición se pone en contacto con la superficie oral. El suministro del ingrediente activo en la composición oral es mayor que en una composición comparativa que tiene un abrasivo que comprende sílice y una proporción de eliminación de película inferior a
25 aproximadamente 100; y

poner en contacto la composición con la superficie oral, en donde el suministro del ingrediente activo es mayor que en una composición comparativa que tiene un abrasivo que comprende sílice y una proporción de eliminación de película inferior a aproximadamente 100.

En diversas modalidades, la presente invención se dirige a una composición para el cuidado oral que comprende:

un primer abrasivo que tiene una dureza Einlehner superior a alrededor de 10 mg de pérdida por 100,000 revoluciones; y

un segundo abrasivo que tiene una dureza Einlehner inferior a alrededor de 10 mg de pérdida por 100,000 revoluciones

en donde la proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1, y en donde la composición oral tiene una proporción de eliminación de película (PCR) superior a aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva (RDA) inferior a aproximadamente 200.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

Según se usan en la presente, todos los niveles de medidas descritos aquí son en peso de la composición total, a menos que se indique lo contrario. Además, todas las referencias aquí citadas se incorporan a la presente por

42

referencia en sus totalidades. Sin embargo, en caso de contradicción entre cualquiera de las definiciones de la presente descripción y aquellas de una referencia citada, prevalecerán las de la presente descripción.

5 En diversas modalidades, se proporciona una composición oral que tiene un primer abrasivo y un segundo abrasivo. La selección del abrasivo para las presentes composiciones orales puede incluir el tipo de abrasivo, la finura (tamaño de partícula), la distribución del tamaño de partícula y la
10 cantidad de abrasivo, a fin de asegurar que el esmalte dental no resulte excesivamente desgastado durante el uso normal de la composición, pero sí lo suficientemente limpio y/o pulido. En el contexto del cuidado oral, la eficacia del abrasivo se puede expresar sobre la base del nivel de limpieza o abrasión
15 del dentífrico, a saber, la proporción de eliminación de película (PCR) o la abrasión de la dentina radiactiva (RDA), respectivamente. Los métodos para realizar PCR y RDA se describen, por ejemplo, en las patentes de los Estados Unidos N° 5,939,051 y 6,290,933.

20 En la práctica convencional comúnmente aceptada, los valores de RDA para una composición oral por lo general se mantienen por debajo de 250 para evitar dañar el esmalte o la dentina con el uso reiterado. Sin embargo, a fin de lograr una mayor PCR, normalmente se debe aumentar la cantidad y la
25 dureza de los abrasivos, lo que se sabe convencionalmente que

aumenta la RDA. Por ejemplo, se ha observado que cuando el valor de RDA de una composición dentífrica excede determinados valores, tales como, por ejemplo, por encima de aproximadamente 100 a aproximadamente 115, el dentífrico no necesariamente exhibe un correspondiente incremento en su capacidad de limpieza. Ha resultado un desafío formular composiciones orales que tengan una PCR superior a aproximadamente 80 ó 90 pero conserven una RDA por debajo de 250, con mayor preferencia por debajo de 200.

10 Sin embargo, en ciertas modalidades de la presente invención, se ha obtenido una composición oral con una PCR de más de 100, que al mismo tiempo tiene una RDA de menos de 200. En ciertas modalidades, la RDA es menor o igual a aproximadamente 175, mientras que conserva una PCR que excede aproximadamente 100. En ciertas modalidades, la RDA es de menos de 165. Con respecto a esto, las composiciones orales de la presente invención proporcionan una eficacia superior en cuanto a la limpieza y/o el pulido, mientras que al mismo tiempo logran una RDA convenientemente baja que minimiza el potencial daño causado al esmalte o la dentina.

25 Las presentes composiciones pueden lograr la limpieza y/o el pulido de la superficie dental. Los abrasivos para limpieza y/o pulido se pueden clasificar según diversos parámetros físicos. Como podrá apreciar el especialista en el arte, una sola especie de abrasivo normalmente realiza al

menos cierta parte de la limpieza y el pulido de manera simultánea. Sin embargo, en la técnica, las partículas generalmente se categorizan según el efecto predominante que tienen sobre una superficie oral objetivo.

5 Según se usa en la presente, el término "limpieza" generalmente se refiere a la eliminación de contaminantes, suciedad, impurezas y/o materia extraña sobre una superficie objetivo. Por ejemplo, en el contexto de las superficies orales, en las cuales la superficie es el esmalte dental, la
10 limpieza puede eliminar al menos parte de una película o mancha, tal como biopelícula de placa, película o sarro. Según se usa en la presente, el término "pulido" generalmente se refiere un proceso de acabado o refinado que hace que la superficie quede más lisa y/o brillante. El pulido y la
15 limpieza también pueden proporcionarle brillo a la superficie donde se produce la eliminación de las manchas, por ejemplo, el blanqueamiento de la superficie dental.

[0001] Generalmente, se consideran "abrasivos para pulido" aquellos que contienen partículas relativamente pequeñas de
20 gran dureza, mientras que los abrasivos con tamaños de partículas relativamente grandes y poca dureza se consideran "abrasivos para limpieza". Más aún, el comportamiento exhibido por el abrasivo cuando interactúa con la superficie indica cuán bien pulirá (o "alisará") la superficie, ya que
25 un agente de pulido deseable generalmente se degrada en

fragmentos cada vez más pequeños a medida que avanza el contacto con la superficie. El comportamiento de alisado se relaciona con la facilidad con la cual un abrasivo se divide en tamaños de partículas cada vez más pequeños y generalmente se cree que está basado en la forma cristalina de las partículas del abrasivo, las líneas de escisión y la friabilidad, por ejemplo.

Por lo tanto, un abrasivo generalmente se categoriza sobre un gradiente que se extiende desde los abrasivos para limpieza más blandos hasta los abrasivos para pulido más duros. En ciertas modalidades, un método para la limpieza y/o el pulido de una superficie oral objetivo comprende poner en contacto la superficie con una composición oral que comprende un primer abrasivo y un segundo abrasivo. El primer abrasivo de la composición puede ser una especie distinta del segundo abrasivo, lo que significa que cada abrasivo puede tener un efecto diferente sobre la superficie objetivo, por ejemplo, puede estar en una categoría diferente en el gradiente de abrasividad. De esta manera se puede seleccionar una cantidad cualquiera de abrasivos. Por consiguiente, el primer abrasivo puede ser un abrasivo para limpieza relativamente bajo y el segundo abrasivo puede ser un abrasivo para limpieza relativamente alto. El primer abrasivo puede ser un abrasivo para limpieza y el segundo abrasivo puede ser un abrasivo para pulido. Cabe destacar que las composiciones orales



opcionalmente comprenden una pluralidad de especies de abrasivos diferentes y no se limitan únicamente al primer y al segundo abrasivo.

Entre los demás parámetros que también resultan útiles para categorizar la abrasividad de las partículas se incluye, por ejemplo, la dureza. La dureza se puede expresar mediante varios ensayos diferentes conocidos para los especialistas en el arte, que incluyen los ensayos de dureza de Einlehner, Knoop, Vickers y Rockwell, así como la escala de dureza de Mohs. Un método particularmente útil para evaluar las partículas del abrasivo es el valor de dureza de Einlehner. El valor de dureza de Einlehner se obtiene usando un instrumento de abrasión Einlehner At-1000 para medir la blandura de la partícula de abrasivo de la siguiente manera: se pesa un tamiz de alambre de bronce Fourdrinier y se la expone a la acción de una suspensión del abrasivo (por ejemplo, una suspensión acuosa al 10% del abrasivo) durante una cantidad determinada de revoluciones. El valor de dureza se expresa como miligramos de peso perdidos del tamiz de alambre Fourdrinier por cada 100,000 revoluciones. Así, en ciertas modalidades, la composición oral comprende un primer abrasivo que tiene una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones y un segundo abrasivo que tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones. En

ciertas modalidades, el primer abrasivo tiene una dureza Einlehner superior a aproximadamente 10 mg de pérdida por 100,000 revoluciones y un segundo abrasivo que tiene una dureza Einlehner inferior a aproximadamente 10 mg de pérdida por 100,000 revoluciones.

Cuando la primera partícula tiene una dureza de Einlehner superior a 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, puede ejercer una función principalmente de pulido cuando se pone en contacto con una superficie oral.

Cuando la segunda partícula tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, puede ejercer una función principalmente de limpieza, ya que es una partícula más blanda. En ciertas modalidades, la segunda partícula tiene una dureza superior a aproximadamente 10 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, y en otras modalidades, superior a aproximadamente 15 mg de pérdida por 100,000 revoluciones.

En ciertas modalidades, el primer abrasivo es un abrasivo para limpieza que tiene una dureza menor o igual a la de la superficie oral que será tratada, y el segundo abrasivo es un abrasivo para pulido que tiene una dureza mayor o igual a la de la superficie oral que será tratada.

La estructura de una partícula de abrasivo también puede reflejar abrasividad; una estructura relativamente baja tiende a presentar una mayor abrasividad y un abrasivo de

estructura relativamente alta tiende a presentar una menor abrasividad. La estructura de las partículas puede estar indicada por la absorción de aceite de linaza o ftalato de dibutilo (DBP) cada 100 gramos. Los valores de absorción de aceite se pueden medir usando el método de frotamiento ASTM D281.

En ciertas modalidades, el primer abrasivo tiene una estructura de absorción de aceite inferior a aproximadamente 90 cm³/100 g, y el segundo abrasivo tiene una estructura de absorción de aceite superior a aproximadamente 90 cm³/100 g. En diversas modalidades, una partícula del primer abrasivo tiene una estructura de absorción inferior a aproximadamente 80 cm³/100 g, inferior a aproximadamente 70 cm³/100 g, o inferior a aproximadamente 60 cm³/100 g. En diversas modalidades, una partícula del segundo abrasivo tiene una absorción de aceite superior a aproximadamente 100 cm³/100 g, o superior a aproximadamente 110 cm³/100 g.

El tamaño de partícula puede ser un indicador de la eficacia de limpieza y/o pulido de un abrasivo. En ciertas modalidades, el primer abrasivo tiene un primer tamaño de partícula, y el segundo abrasivo tiene un segundo tamaño de partícula. En ciertas modalidades, el primer tamaño de partícula es inferior al segundo tamaño de partícula. El tamaño promedio de partícula se puede medir mediante un analizador de tamaño de partícula Malvern, Modelo Mastersizer

8/9

S, Malvern Instruments, Inc. (Southborough, Massachusetts, Estados Unidos). Se proyecta un haz láser de gas neón-helio a través de una celda transparente que contiene el abrasivo suspendido en una solución acuosa. Los rayos de luz que
5 inciden en las partículas se dispersan en ángulos que son inversamente proporcionales al tamaño de partícula. El arreglo del fotodetector mide la cantidad de luz en varios ángulos predeterminados. Luego se procesan las señales eléctricas proporcionales a los valores de flujo de luz
10 medida mediante un sistema de microcomputación, respecto de un patrón de dispersión previsto a partir de partículas teóricas, según se define por los índices de refracción de la muestra y el dispersante acuoso para determinar la distribución del tamaño de partícula del sujeto abrasivo.

15 En diversas modalidades, el primer abrasivo tiene un tamaño de partícula promedio inferior a aproximadamente 11 μm , o inferior a aproximadamente 10 μm . Por ejemplo, los ejemplos de abrasivos adecuados tienen un tamaño promedio de partículas de aproximadamente 7 μm a 11 μm . Algunos abrasivos
20 tienen tamaños de partícula inferiores a aproximadamente 5 μm . En diversas modalidades, el segundo abrasivo tiene un tamaño de partícula promedio superior a aproximadamente 8 μm , o mayor que aproximadamente 10 μm . En algunas modalidades, el segundo abrasivo puede tener un tamaño promedio de partícula
25 de aproximadamente 8 μm a aproximadamente 14 μm .

130

En ciertas modalidades, la composición es segura para el uso oral en humanos u otros animales, y cualquier abrasivo adecuado desde el punto de vista cosmético y oral que cumple con los requisitos antes establecidos se puede seleccionar para una composición oral. Los abrasivos adecuados incluyen, sin limitación: sílice, silicato, silicona, alúmina (incluso óxido de aluminio calcinado), aluminosilicatos, tales como bentonita, zeolita, caolín, y mica, tierra silícea o de diatomeas, piedra pómez, carbonato de calcio, hueso cuticular, fosfatos insolubles, resinas de composito, tales como resina de melamina, resina fenólica, y resina de urea-formaldehído, policarbonato, carburo de silicio, carburo de boro, cera microcristalina, celulosa microcristalina, incluso combinaciones de celulosa microcristalina coloidal y carboximetilcelulosa, disponible en el comercio con el nombre comercial AVICEL® de FMC Biopolymer (Filadelfia, Pennsylvania, Estados Unidos) y sus combinaciones y derivados.

Tal como se usa en la presente, "mica" se refiere a cualquiera de un grupo de minerales de silicato de aluminio hidratado con morfología de placa y perfecta escisión basal (micácea). La mica puede ser, por ejemplo, mica en capas, mica en trozos o mica en copos, como se ejemplifica por micas de tipo muscovita, biotita o flogopita. Entre los fosfatos insolubles de utilidad como abrasivos incluyen ortofosfatos,

J7

polimetafosfatos y pirofosfatos. Los ejemplos de ilustración incluyen ortofosfato dicálcico dihidratado, fosfato dicálcico dihidratado, fosfato de hidrógeno cálcico, pirofosfato de calcio, β -pirofosfato de calcio, fosfato tricálcico, 5 metafosfato de calcio, metafosfato de potasio, y metafosfato de sodio.

Las sílices sintéticas incluyen geles de sílice y sílices precipitados que se preparan por neutralización de soluciones de silicato acuoso con un ácido mineral fuerte. En 10 la preparación de gel de sílice, se forma un hidrogel de sílice que luego generalmente se lava para reducir el contenido de sales. El hidrogel lavado se puede moler al tamaño deseado, o de otro modo se seca, por último hasta el punto en que la estructura ya no cambia como consecuencia de 15 reducción de tamaño. Cuando se preparan dichos sílices sintéticos, el objetivo consiste en obtener abrasivos que proveen máxima limpieza (es decir, eliminación de película manchada) con mínimo daño del esmalte dentario y otros tejidos orales.

20 Los abrasivos que comprenden sílice son particularmente útiles en ciertas modalidades de la presente invención. Ha habido significativa dificultad en el pasado en el uso de un abrasivo basado en sílice con altas concentraciones dentro de una composición oral, debido a inestabilidad química y física 25 en la composición oral cuando se provee en altas

concentraciones, cuestiones de sensación en la boca, y
excesiva calidad de abrasivo reflejada por los altos valores
de RDA. Sin embargo, la sílice es una opción particularmente
atractiva como abrasivo, y limpia y/o pule con eficacia las
5 superficies orales. Además, es relativamente inerte y
compatible con otros ingredientes en la composición oral y es
relativamente barato. En consecuencia, en ciertas modalidades
de la presente invención, el primero y el segundo abrasivo
comprenden sílice cada uno. En algunas modalidades, el primer
10 abrasivo se selecciona de un abrasivo más pequeño y más duro,
por ejemplo, un mejor abrasivo de limpieza y/o pulido, y el
segundo abrasivo es un típico abrasivo de limpieza. In
ciertas modalidades, las composiciones orales pueden
comprender una combinación particularmente eficaz de especies
15 de partículas de abrasivo.

Los materiales abrasivos útiles para preparar
composiciones orales incluyen abrasivos de sílice de alta
limpieza, y baja estructura, tales como los comercializados
con el nombre comercial SYLODENT® XWA o SYLODENT® 783 de
20 Davison Chemical Division de W. R. Grace & Co. (Baltimore,
Maryland, Estados Unidos). SYLODENT® XWA 650 es un hidrogel
de sílice compuesto por partículas de sílice coloidal.

Los ejemplos de hidrogeles de sílice comprenden
partículas de sílice coloidal con un tamaño promedio de
25 partícula, en diversas modalidades, de aproximadamente 3 μm a

J3

aproximadamente 12 μm , o aproximadamente 5 μm a aproximadamente 10 μm , con un pH de aproximadamente 4 a aproximadamente 10, o aproximadamente 6 a aproximadamente 9 medido como 5% en peso de lechada. Las partículas de XWA 650
5 contienen aproximadamente 10% a aproximadamente 35% en peso de agua, tienen un tamaño promedio de partícula de aproximadamente 5 μm a aproximadamente 12 μm , una dureza de Einlehner mayor o igual a aproximadamente 5 a aproximadamente 20 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, una absorción de
10 aceite inferior a aproximadamente 90 $\text{cm}^3/100 \text{ g}$, por ejemplo de entre aproximadamente 40 $\text{cm}^3/100 \text{ g}$ a aproximadamente 90 $\text{cm}^3/100 \text{ g}$. Los abrasivos tienen un área superficial de Brunauer, Emmett y Teller (BET) de aproximadamente 100 a aproximadamente 700 m^2/g . XWA 650 tiene un brillo de 96.8 de
15 tecnidina. Dichos abrasivos se analizan en la patente de los Estados Unidos N.º 6.290.933 de Durga et al.

Otro abrasivo de alta limpieza útil se comercializa como SYLODENT® XWA 300 y es un hidrogel de sílice que contiene aproximadamente 10% a aproximadamente 25% de agua en peso, en
20 donde el tamaño promedio de partícula es aproximadamente 2 μm a aproximadamente 4 μm . Las partículas tienen superficie BET en el rango de 150 a 400 m^2/g de sílice. El abrasivo XWA 300 tiene una absorción de aceite inferior a 90 $\text{cm}^3/100 \text{ g}$ de sílice; y un pH, en una suspensión 5% p/p en agua hervida
25 (sin CO_2) desmineralizada, igual o mayor que 8,5. Dichos



abrasivos se analizan, por ejemplo, en la patente de los Estados Unidos N.º 5.939.051 de Santalucia et al.

[0002] En otras modalidades, un sílice de alta limpieza para la presente invención comprende un producto de sílice, en donde las partículas son aproximadamente 5% a aproximadamente 35% en peso de agua, con un tamaño promedio de partícula de aproximadamente 7 μm a aproximadamente 11 μm , una dureza de Einlehner de aproximadamente 12 a aproximadamente 19 y un valor de absorción de aceite de aproximadamente 50 $\text{cm}^3/100\text{ g}$ a aproximadamente 65 $\text{cm}^3/100\text{ g}$. Una superficie BET es de aproximadamente 100 a aproximadamente 700 m^2/g de sílice. Generalmente se informa un brillo superior a aproximadamente 95 tecnidina. Dicho producto de sílice está comercialmente disponible como ZEODENT® 105 de J. M. Huber (Havre de Grace, Maryland, Estados Unidos).

Otros abrasivos útiles incluyen típicos abrasivos de limpieza de sílice, tales como sílices precipitados con un tamaño promedio de partículas de hasta aproximadamente 20 μm , generalmente a aproximadamente 8 a aproximadamente 14 μm , con una estructura de absorción de aceite superior a aproximadamente 90 a aproximadamente 110 $\text{cm}^3/100\text{ g}$; por ejemplo, ZEODENT®115, comercializado por J. M. Huber, con un pH al 5% de las partículas de aproximadamente 6.5-7.5 y una dureza de Einlehner de aproximadamente 2 a 4 mg de pérdida

por 100,000 revoluciones. El brillo de dicha partícula de sílice es superior a aproximadamente el 95. En ciertas modalidades, dichos abrasivos de limpieza comprenden el segundo abrasivo de la composición oral.

5 En ciertas modalidades, la composición oral está en la forma de un dentífrico que es un gel límpido o transparente. Allí, un abrasivo de sílice coloidal, tal como los vendidos con la marca comercial SYLOID® como SYLOID® 72 y SYLOID® 74 o con la marca comercial SANTOCEL® 100 como complejos de
10 silicato de alúmina de metal alcalino pueden ser particularmente útiles, dado que estos abrasivos tiene índices de refracción cercanos a los índices de refracción de sistemas agente gelante-líquido (incluso agua y/o humectante) de uso común en dentífricos.

15 En diversas modalidades, un primer y un segundo abrasivo se combinan en una composición oral para proveer capacidad de limpieza inesperadamente superior, suavidad no prevista (abrasividad relativamente baja), y composiciones de cuidado oral estéticamente aceptables. En diversas modalidades la
20 proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1. Por ejemplo, en ciertas modalidades, una proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1. En ciertas modalidades, la cantidad respectiva del primer abrasivo y el
25 segundo abrasivo presente en una composición oral son

aproximadamente 13 a aproximadamente el 21% en peso de la composición oral. En algunas modalidades, la cantidad del primer abrasivo es aproximadamente 15% a aproximadamente 19%, y la cantidad del segundo abrasivo es aproximadamente 15% a aproximadamente 19% en peso de la composición oral. En ciertas modalidades, el primer abrasivo está presente a aproximadamente 17% en peso y el segundo abrasivo está presente a aproximadamente 17% en peso de la composición oral. En diversas modalidades, la cantidad total del abrasivo, incluso del primero y el segundo abrasivo, es superior a aproximadamente el 25%, superior a aproximadamente 30%, o superior a aproximadamente 35% en peso de la composición oral.

En algunas modalidades, una composición oral comprende un primer abrasivo que tiene una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones y un segundo abrasivo que tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones. Además, la composición oral tiene un PCR superior a aproximadamente 100 y un RDA inferior a aproximadamente 200. En ciertas modalidades, el RDA es inferior a aproximadamente 175.

En ciertas modalidades, el primer abrasivo tiene una absorción de aceite inferior a aproximadamente 90 cm³/100 g, y el segundo abrasivo tiene una absorción de aceite superior

57

a aproximadamente 90 cm³/100 g. En ciertas modalidades, la cantidad total de los abrasivos es superior a aproximadamente el 30%. En diversas modalidades, el primer abrasivo y el segundo abrasivo están presentes en cantidades de

5 aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21%, aproximadamente 15% a aproximadamente 19%, o de aproximadamente 17% cada uno en peso de la composición total. En diversas modalidades, el primer y el segundo abrasivo comprenden opcionalmente sílice.

10 En ciertas modalidades, una composición oral comprende un primer abrasivo que comprende sílice, que tiene una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, y una absorción de aceite inferior a

15 aproximadamente 90 cm³/100 g; y un segundo abrasivo que comprende sílice que tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, y una absorción de aceite superior a aproximadamente 90 cm³/100 g.

La composición oral también comprende un segundo

20 abrasivo que comprende sílice y que tiene una absorción de aceite superior a aproximadamente 90 cm³/100 g y una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones.

En otras modalidades, se proveen los métodos para

25 aumentar la provisión de un ingrediente activo en una

13

composición oral sobre una superficie oral. En diversas modalidades, el método comprende introducir una composición oral en una cavidad oral que contiene la superficie oral, en donde la composición oral comprende el ingrediente activo; un
5 primer abrasivo y un segundo abrasivo. En ciertas modalidades el primer y el segundo abrasivo comprenden cada uno sílice y cada uno está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso. La composición oral tiene un PCR superior a aproximadamente 100 y un RDA inferior
10 a aproximadamente 200. La composición oral se pone en contacto con la superficie oral. Inesperadamente se ha descubierto que el suministro del ingrediente activo es mayor para esta composición oral, cuando se compara con una composición comparativa que tiene un abrasivo que comprende
15 sílice pero tiene un PCR inferior a aproximadamente 100, tal como se analizará con mayor detalle más adelante.

En particulares modalidades, el ingrediente activo comprende un ingrediente antibacteriano no iónico, por ejemplo un difeniléter halogenado como triclosano, que se
20 analizará con mayor detalle más adelante. En algunas modalidades, el primer abrasivo tiene una absorción de aceite inferior a aproximadamente $90 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$ y una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, y el segundo abrasivo tiene una
25 absorción de aceite superior a aproximadamente $90 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$ y

JG

una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones. Además, la composición oral puede comprender un copolímero de aumento de eficacia, tal como por ejemplo, un copolímero de metiléter de polivinilo y anhídrido maleico, tal como los productos comercialmente disponibles GANTREZ® vendidos por ISP Corporation de Wayne, N. J., y/o un agente activo anticaries, que se analizarán con mayor detalle a continuación.

Las composiciones orales también pueden comprender un portador oralmente aceptable. Los ingredientes convencionales que se pueden usar para formar los portadores de composiciones de cuidado oral son conocidos por el experto en el arte. La composición específica del portador depende del uso pretendido de la composición. El portador puede ser una fase líquida, semisólida, o sólida. Las composiciones orales pueden estar en la forma de un dentífrico (incluso pastas dentífricas, polvos dentales, y pastas preventivas), confituras (incluso gomas, perlas y masticables), película, geles para pintar, o cualquier otra forma conocida por los expertos en el arte cuando se emplean abrasivos. La selección de componentes portadores específicos depende de la forma del producto de interés.

En ciertas modalidades, la composición oral está en forma de un dentífrico y el portador de ejemplo es sustancialmente semisólido o sólido. El portador puede ser

60

acuoso, es decir, puede comprender de aproximadamente el 5% a aproximadamente el 95% de agua. En otras modalidades, el portador es sustancialmente no acuoso. El portador comprende opcionalmente, por ejemplo, ingredientes activos para el

5 cuidado oral, agentes tensoactivos tales como tensoactivos, emulsionantes y moduladores de la espuma, modificadores de la viscosidad y espesantes, humectantes, diluyentes, rellenos, agentes modificadores del pH adicionales, colorantes, conservantes, solventes, y combinaciones de ellos. Se

10 entiende que, mientras que los atributos generales de cada una de las categorías anteriores de los materiales pueden diferir, hay algunos atributos comunes y cualquier material dado puede servir para múltiples propósitos dentro de dos o más de estas categorías de materiales. Tal como reconocerá un

15 especialista en el arte, las composiciones orales opcionalmente incluyen otros materiales además de aquellos componentes previamente descritos, incluyendo por ejemplo, emolientes, humidificantes, agentes de sensación oral y similares. Los ejemplos de portadores apropiados para

20 composiciones orales se comentan en las patentes de los Estados Unidos Nros. 6,669,929 de Boyd et al., 6,379,654 de Gebreselassie et al., y 4,894,220 de Nabi et al.

Los ingredientes activos de cuidado oral incluyen, por ejemplo, agentes activos antibacterianos, agentes antisarro,

25 agentes anticaries, agentes antiinflamatorios, agentes

6/

antisensibilizantes, enzimas, nutrientes, y similares. Activos útiles aquí están presentes opcionalmente en las composiciones de la presente invención en cantidades seguras y efectivas que son suficientes para que tengan el efecto terapéutico o preventivo deseado en el ser humano o un sujeto animal inferior al que se administra el agente activo, sin efectos colaterales adversos indebidos (tales como toxicidad, irritación o respuesta alérgica), en proporción con una relación riesgo/beneficio razonable cuando se usa en la manera según la invención. La cantidad segura y efectiva específica del agente activo variará con factores como la condición en tratamiento, la condición física del sujeto, la naturaleza de la terapia concurrente (de haber alguna), el agente activo específico usado, la forma de dosificación específica, el portador empleado y el régimen posológico deseado. Los ingredientes activos de utilidad para tratar tales condiciones incluyen aquellos comentados en la publicación de patente de los Estados Unidos 2003/0206874 de Doyle et al. Los ingredientes activos entre aquellos de utilidad en la presente también se comentan en la patente de los Estados Unidos 6,290,933 de Durga et al. y la patente de los Estados Unidos 6,685,921 de Lawlor.

Cualquier fuente de ion fluoruro apropiada puede estar presente en la composición oral, tales como las comentadas en la patente de los Estados Unidos N.º 5,080,887 de Gaffar et

al. Las fuentes de iones fluoruro, fosfatasas ácidas e inhibidores de la enzima pirofosfatasa son bien conocidos en el arte como agentes anticaries. Una fuente de ion fluoruro puede ser ligeramente soluble en agua o puede ser totalmente soluble en agua. Se caracteriza por su capacidad de liberar iones fluoruro en agua y por la libertad de la reacción indeseada con otros compuestos en la preparación oral. Los ejemplos de tales fuentes son sales y compuestos de metal inorgánico y/o fluoruro de amonio tales como, por ejemplo: fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de amonio, fluoruro de calcio; un fluoruro de cobre, tal como fluoruro cuproso; fluoruro de zinc, fluoruro de bario; silicafluoruro de sodio, fluorosilicato de amonio, fluorozirconato de sodio; y monofluorofosfato de sodio, mono- y di-fluorofosfato de aluminio y pirofosfato de sodio y calcio fluorado. La fuente de fluoruro también puede ser un fluoruro de amina como olaflur (N'-octadeciltrimetilendiamin-N,N,N'-tris(2-ethanol)-dihidrofluoruro).

La cantidad de fuente que provee fluoruro depende en cierta manera del tipo de fuente, su solubilidad y del tipo o preparación oral, pero estará presente en una cantidad no tóxica, en general de aproximadamente 0.001% a aproximadamente el 3.0% en la preparación. En una preparación de dentífrico, por ejemplo, gel dental, pasta dental (incluyendo crema), polvo dental o comprimido dental, se

considera satisfactoria una cantidad de esa fuente que libera hasta aproximadamente 5,000 ppm de ion F^- en peso de la preparación. Se puede usar cualquier cantidad mínima apropiada de esa fuente, pero en diversas modalidades es

5 suficiente una cantidad para liberar aproximadamente 300 a 2,000 ppm, aproximadamente 500 a aproximadamente 1,800 ppm o aproximadamente 800 a aproximadamente 1,500 ppm de ion fluoruro.

La composición oral opcionalmente comprende una

10 composición anti-sarro tales como, por ejemplo, una o varias de las composiciones anti-sarro mencionadas en la patente de los Estados Unidos N.º 5,292,526 de Gaffar, et al. En determinadas modalidades, la composición anti-sarro incluye uno o varios polifosfatos. La composición anti-sarro puede

15 incluir al menos una sal de tripolifosfato o hexametafosfato de metal alcalino o amonio total o parcialmente neutralizada presente en la composición oral en una cantidad anti-sarro efectiva. El agente activo anti-sarro también puede incluir al menos una sal de polifosfato molecularmente deshidratado

20 soluble, lineal, efectiva en una cantidad anti-sarro. El agente activo anti-sarro también puede incluir una mezcla de sales de potasio y de sodio, al menos una que está presente en una cantidad anti-sarro efectiva como un agente anti-sarro de polifosfato. El agente activo anti-sarro también puede

25 contener una cantidad anti-sarro efectiva de un agente anti-

sarro de sal de polifosfato molecularmente anti-sarro efectiva presente en una mezcla de sales de sodio y de potasio. La relación de potasio a sodio en la composición puede ser de hasta menos de 3:1. El polifosfato puede estar
5 presente en la composición oral en varias cantidades, como una cantidad en donde la relación en peso de ion polifosfato a agente antibacteriano varía de un exceso de 0.72:1 a menos de 4:1, o en donde la relación en peso de agente mejorador antibacteriano a ion polifosfato varía de aproximadamente 1:6
10 a aproximadamente 2.7:1, o en donde la relación en peso del agente mejorador antibacteriano a polifosfato varía de aproximadamente 1:6 a aproximadamente 2.7:1. Otros agentes anti-sarros de utilidad incluyen polímeros de policarboxilato y copolímeros de éter polivinilmetílico/anhídrido maleico
15 (PVM/MA), tal como GANTREZ®.

Otro agente activo de utilidad en composiciones de dentífrico de la presente invención son agentes antibacterianos que están presentes en cantidades de aproximadamente el 0.001 a aproximadamente el 3.0% en peso de
20 la composición oral. Una lista no limitativa de compuestos adicionales de cuidado oral incluyen agentes antibacterianos no iónicos, incluyendo compuestos fenólicos y bisfenólicos, tales como difeniléteres halogenados, incluyendo triclosano (2,4,4'-tricloro-2'-hidroxi-difeniléter, triclocarbano
25 (3,4,4-triclorocarbanilida), así como 2-fenoxietanol, ésteres

6

de benzoato y carbanilidas. Puede estar presente un difeniléter halogenado, como triclosano, en una cantidad de aproximadamente el 0.3% en peso de la composición oral, por ejemplo.

5 Los agentes tensoactivos apropiados son aquellos que son razonablemente estables en un amplio rango de pH. Estos compuestos son conocidos en el arte, e incluyen detergentes no jabonosos aniónicos (por ejemplo, laurilsulfato sódico (SLS), N-miristoílo y N-palmitoilsarcosina), no iónicos (por
10 ejemplo, Polysorbate 20 (monolaurato de polioxietilen 20 sorbitano, TWEEN® 20) y Polysorbate 80 (monooleato de polioxietilen 20 sorbitano, TWEEN® 80), Poloxamer 407, disponible con la marca comercial de PLURONIC® F127 de BASF, Florham Park, New Jersey, Estados Unidos), catiónicos,
15 zwitteriónicos (por ejemplo, cocamidopropilbetaína y lauramidopropilbetaína) y sintéticos orgánicos anfotéricos. Los ejemplos de agentes activos apropiados para usar en composiciones orales se comentan en, por ejemplo, las patentes de los Estados Unidos Nros. 4,894,220 de Nabi et
20 al., 6,555,094 de Glandorf et al., y 6,706,256 de Lawlor, *inter alia*. En determinadas modalidades, están presentes uno o varios agentes tensoactivos en la composición oral de la presente invención en el rango de aproximadamente el 0.001% a aproximadamente el 5%, o de aproximadamente el 0.5% a
25 aproximadamente el 2.5%.

66

Los espesantes opcionales para usar en composiciones orales incluyen gomas naturales y sintéticas y coloides, tales como carragenano (musgo irlandés), goma xantán, carboximetilcelulosa sódica, almidón, polivinilpirrolidona, hidroxietilpropilcelulosa, hidroxibutilmetilcelulosa, hidroxipropilmetilcelulosa e hidroxietilcelulosa. Los espesantes inorgánicos incluyen compuestos de sílice amorfa que funcionan como agentes espesantes e incluyen compuestos de sílice coloidal disponibles bajo las marcas comerciales como sílice fumante Cab-o-sil fabricada por Cabot Corporation y distribuida por Lenape Chemical (Bound Brook, N. J, Estados Unidos); ZEODENT® 165 de J. M. Huber Chemicals, y Sylox 15, también conocido como SYLODENT® 15, disponible de Davison Chemical Division de W. R. Grace Corp. En determinadas modalidades, el agente espesante está presente en la composición de dentífrico en cantidades de aproximadamente el 0.1 a aproximadamente el 10% en peso, o de aproximadamente el 0.5 a aproximadamente el 4% en peso.

El vehículo portador oralmente aceptable usado para preparar la composición de dentífrico opcionalmente comprende un humectante. El humectante puede ser glicerina, sorbitol y xilitol, propilenglicol de un peso molecular en el rango de aproximadamente 200 a aproximadamente 1.000; u otros humectantes y mezclas de ellos. La concentración del humectante totaliza típicamente aprox. el 5 a aprox. el 70%

67

en peso de la composición oral. El agua está típicamente presente en una cantidad de al menos aproximadamente el 10% en peso, y en general de aproximadamente el 25 al 70% en peso de la composición oral.

- 5 Los policarboxilatos lineales aniónicos sintéticos son eficaces agentes intensificadores para uso opcional en composiciones orales que presentan determinados ingredientes activos, incluyendo agentes activos antibacterianos, 10 antisarro u otros agentes activos en la composición oral. Tales policarboxilatos aniónicos se emplean generalmente en forma de sus ácidos libres o sales de metales alcalinos solubles en agua total o parcialmente neutralizadas (p. ej., de potasio y de preferencia de sodio) o sales de amonio. Los 15 conceptos "sintéticos" y "lineales" no incluyen conocidos agentes espesantes o gelificantes que comprenden carboximetilcelulosa y otros derivados de celulosa y gomas naturales, ni tampoco carbopoles con una reducida solubilidad debida a enlaces cruzados.

- Los copolímeros de preferencia son copolímeros 1:4 a 4:1 20 de anhídrido maleico o ácido maleico con otro monómero insaturado que puede polimerizarse con etileno, de preferencia metilviniléter (metoxileno) que presenta un peso molecular (P.M.) de aproximadamente 30,000 a aproximadamente 1,000,000. Un copolímero útil es metilviniléter/anhídrido 25 maleico. Se pueden obtener ejemplos de estos copolímeros de

62

ISP Corporation bajo el nombre comercial de GANTREZ®, p. ej., AN 139 (P.M. 1,100,000), AN 119 (P.M. 200,000); S-97 Pharmaceutical Grade (P.M. 1,500,000), AN 169 (P.M. 2,000,000), y AN 179 (P.M. 2,400,000); en donde el copolímero
5 preferido es S-97 Pharmaceutical Grade (P.M. 1,500,000). Cuando existe, el policarboxilato aniónico se utiliza en cantidades efectivas para lograr el deseado aumento de la eficacia de cualquier agente activo antibacteriano, antisarro u otro agente activo incluido en la composición del
10 dentífrico. En diferentes realización, se incluye un policarboxilato aniónico sintético en la composición oral en alrededor de 0.001 a aproximadamente 5%, o alrededor de 0.1 a aproximadamente 2.0% de la composición oral.

La composición oral de la presente invención puede
15 prepararse mediante cualquiera de los métodos conocidos en el arte para combinar ingredientes para producir composiciones de cuidado oral. Los ejemplos de estos métodos que pueden usarse se indican en p. ej., Patente Estadounidense N° 6,403,059 de Martin et al.; Clinical Pharmacology for Dental
20 Professionals (Mosby-Year Book, Inc., 3rd ed. 1989); Mosby's Dental Hygiene: Concepts, Cases y Competencies, (Daniel, S. y Harfst, S. eds., Elsevier Science Health Science Div. 2002); y Ernest W. Flick, Cosmetic y Toiletry Formulations, 2nd ed.

La presente invención brinda métodos y procesos para
25 usar las composiciones orales de la presente invención para

69

limpiar y/o lustrar superficies orales. Además, las composiciones orales de modo opcional tratan e inhiben condiciones orales, tales como estados inflamatorios, placa dental y sarro dental. Las composiciones orales pueden

5 aplicar al individuo en cualquier modo conocido en el arte; por ejemplo, al introducir la composición oral en la cavidad oral del individuo usando un aplicador o dispositivo de suministro adecuado, tal como un cepillo, una faja dental, una lámina, jeringa, una cinta, píldora o cualquier otro

10 aplicador o dispositivo de suministro conocido en el arte. Las composiciones pueden usarse en métodos y procesos profilácticos a fin de ayudar y mantener la salud oral, la apariencia, mantener la salud sistémica, y similares. Las composiciones orales pueden aplicarse en forma repetida al

15 individuo durante una cantidad de días según un esquema de tratamiento particular para tratar y/o inhibir la formación de manchas, placa, cálculo o sarro. Las instrucciones indicadas en el esquema de tratamiento pueden suministrarse en el envase comercial junto con el producto, del modo

20 ofrecido y conservado comercialmente.

La presente invención es ilustrada además a través del/de los siguiente/s ejemplo/s no limitantes.

EJEMPLO I

25 Una composición dentífrica conforme la presente

invención, que presenta los ingredientes indicados para el DENTÍFRICO 1 en TABLA I se prepara según el siguiente método: sacarina sódica, benzoato de sodio, monofluorofosfato de sodio y otras sales cualesquiera se dispersan en agua y se
5 mezclan en un agitador convencional bajo agitación. Se agregan los humectantes, p. ej., glicerina y sorbitol, a la mezcla de agua bajo agitación. Se agregan los espesantes orgánicos, tales como carboximetilcelulosa sódica, carragenano y algunos polímeros, tal como GANTREZ®.

10 La mezcla resultante se agita hasta que se forma una fase homogénea de gel. La mezcla luego se transfiere a un mezclador al vacío de alta velocidad; en el cual se agregan los abrasivos. La mezcla luego se agita a elevada velocidad durante 5 a 30 minutos, bajo un vacío de aproximadamente 20 a
15 50 mm Hg, de preferencia alrededor de 30 mmHg. Se realiza el pesaje del aceite saborizante y se agrega luego triclosano al aceite saborizante. Se agregan a la mezcla el aceite saborizante y el flavonoide. Se cargan los tensoactivos, tales como lauril sulfato de sodio (SLS) en el mezclador. El
20 producto resultante es una pasta o producto en gel homogéneo, semi-sólido, extrusionable. El dentífrico resultante puede aplicarse mediante un cepillo u otro aplicador sobre las superficies orales.

Los dentífricos A y B son ejemplos comparativos y se
25 preparan del mismo modo que se describió anteriormente para

71

el DENTÍFRICO 1.

Tabla I

5		INGREDIENTES	DENTÍFRICO 1 (% en peso)	DENTÍFRICO Comparativo A (% en peso)	DENTÍFRICO Comparativo B (% en peso)
		glicerina	8-15	15-25	15-25
		Sorbitol (70% en agua)	15-25	15-25	15-25
		Carboximetilcelulosa sódica	0.1-5	0.1-5	0.1-5
		GANTREZ® S-97	1-3	1-3	1-3
		Carragenano	0.1-1	0.1-1	0.1-1
10		Sacarina sódica	0.1-1	0.1-1	0.1-1
		Benzoato de sodio	0.1-3	0.1-3	0.1-3
		Monofluorofosfato de sodio	0,01-1	0,01-1	0,01-1
		Triclosano	0,01-3	0,01-3	0,01-3
		Laurilsulfato de sodio	0.5-3	0.5-3	0.5-3
		Aceite saborizante	0.1-5	0.1-5	0.1-5
15		SYLODENT® XWA 650	15-18	19-21	7-14
		ZEODENT® 115	15-20	---	8-14
		Agua	cant.necesaria	cant.necesaria	cant.necesaria

EJEMPLO II

Se muestran los datos del PCR y RDA en la TABLA II para
20 el dentífrico 1 preparado según la presente invención, en
comparación con los dentífricos A y B.

Se determina el RDA según el método recomendado por la
American Dental Association como es indicado por Hefferren,
Journal of Dental Research, Volume 55, Issue 4, julio-agosto
25 1976, págs. 563-573, y se describe en las Patentes

h

Estadounidenses N° 4,340,583, 4,420,312 y 4,421,527 todas de Wason.

El PCR, como se describió antes, es un método in vitro usado para medir la eficacia de eliminar manchas de té o de 5 café en los dientes respecto a un estándar. Los valores PCR aquí referidos se obtuvieron a partir de una modificación del método que se describe en "In Vitro Removal of Stain with Dentifrice", G. K. Stookey, et al J. Dental Research, 61, 123-9 (1982). La modificación del método PCR aquí usado se 10 describe en las Patentes Estadounidenses N° 5,658,553 y 5,651,958 ambos de Rice. En esta modificación se aplica un material de película transparente en primer lugar a un diente bovino, que luego es teñido con una combinación del material de película y té, café y FeCl₃, donde en el método original 15 que describió Stookey et al., se aplican ambos, la película y la mancha en forma simultánea.

Tabla II

EJEMPLO	PCR	% de incremento de PCR	RDA	% de incremento de RDA
DENTÍFRICO 1	108	27	163	18
DENTÍFRICO A	98	15	180	30
DENTÍFRICO B	85	---	138	---



El dentífrico B es una típica formulación de composición oral que presenta una combinación de sílice de elevado poder de limpieza (XWA 650) y de sílice de un poder de limpieza regular (ZEODENT® 115) en un 10% en peso, respectivamente. El dentífrico B es el control con un PCR de aproximadamente 85 y una RDA de 138. Como puede observarse, en el dentífrico A, el sílice de elevado poder de limpieza (XWA 650) se aumenta en un 20% mientras que se elimina el sílice de regular poder de limpieza (ZEODENT® 115). Para el dentífrico A, la RDA aumenta a 180, pero la PCR sólo se incrementa a aproximadamente 98. En comparación, el dentífrico 1 presenta un 17% de ambos, el sílice de alto poder de limpieza (XWA 650) y el sílice de regular poder de limpieza (ZEODENT® 115), pero la RDA sólo es de 163, mientras que la PCR es superior a 100 (alrededor de 108). Así, la combinación de abrasivos en el dentífrico 1 brinda una RDA inesperadamente baja (con un incremento de sólo 18% respecto del dentífrico B) mientras que se logra un aumento del 27% en la PCR respecto del dentífrico B. En comparación, el dentífrico A presenta un aumento de la RDA de más del 30 % y un aumento de la PCR de sólo 15%, en comparación con el dentífrico B.

Se ha descubierto, por lo tanto, que pueden lograrse los valores PCR elevados deseados para una composición dentífrica, mientras que los valores RDA son

74

significativamente menores que los esperados.

EJEMPLO III

Se realiza un análisis de pulido in vitro con el
5 dentífrico 1, dentífrico B, un dentífrico preparado según la
TABLA III a continuación y el dentífrico C indicado, y un
dentífrico de blanqueado que puede obtenerse en el mercado,
designado dentífrico D. El dentífrico C se prepara del mismo
modo que se describió anteriormente para el dentífrico 1 en
10 el EJEMPLO I, y contiene un 20% en peso del sílice de poder
de limpieza regular, ZEODENT® 115. El dentífrico D puede
obtenerse en el mercado como CREST® dentífrico blanqueado de
acción dual de Procter y Gamble de Cincinnati, OH, y se cree
que contienen los ingredientes fluoruro de sodio en un
15 0,243%, glicerina, sílice hidratado, agua, sorbitol,
hexametafosfato de sodio (para control de sarro/ prevención
de manchas), propilenglicol, saborizante, PEG-12,
cocamidopropilbetaína, SLS, CARBOMER® 956, sacarina sódica,
Poloxamer 407, óxido de polietileno, goma de xantano,
20 hidróxido de sodio, goma celulosa, hidróxido de sodio,
dióxido de titanio y colorantes Azul 1 y Amarillo 5.

Tabla III

INGREDIENTES	DENTÍFRICO C (% en peso)
glicerina	15-30
Sorbitol (70% en agua)	15-30
Carboximetilcelulosa sódica	0.5-5
GANTREZ® S-97	1-5
Carragenano	0.1-2
Sacarina sódica	0.1-2
Benzoato de sodio	0.1-2
Monofluorofosfato de sodio	0,05-1
Triclosano	0.1-2
Laurilsulfato de sodio	1-4
Aceite saborizante	0,05-5
ZEODENT® 115	15-25
Agua	cant. suf.

En la Tabla IV se muestra el análisis de pulido del medio in vitro de estos dentífricos. Se determina el máximo brillo de la superficie dental opaca mediante un reflectómetro especialmente adaptado para detectar los cambios en el grado de pulido de la superficie del esmalte. El reflectómetro se construyó de modo tal, que se expone el esmalte a un rayo de luz polarizada, y se determina la cantidad de luz reflejada de la superficie del esmalte mediante una célula fotoeléctrica, que a su vez activa un galvanómetro. Cuanto más lisa es la superficie del esmalte, menor es la difusión y la absorción de la luz, y por lo tanto, tanto mayor es el valor leído por el galvanómetro.

Después de determinar el máximo reflejo de la superficie opaca de la pieza dental, el diente es cepillado con el dentífrico a ser evaluado. Luego la superficie esmaltada es enjuagada con agua para remover las partículas residuales del agente de limpieza y pulido, y se mide nuevamente la reflectancia de la superficie esmaltada, colocando el diente en exactamente la misma posición que la usada para realizar la lectura "opaca". El cambio absoluto en la cantidad de reflectancia entre la superficie esmaltada opaca y la pulida, se considera como una medida del grado de pulido obtenido durante el tratamiento. El período de cepillado total es de alrededor de 30,000 movimientos. Los resultados en la TABLA IV se expresan en términos del aumento medio en el brillo de los tipos de esmalte.

El dentífrico C es un dentífrico convencional que presenta un 20% de un sílice abrasivo de poder de limpieza regular y se selecciona como el control para calcular el porcentaje de aumento en el incremento medio de brillo. Puede observarse que el dentífrico 1 evidencia el mayor aumento en incremento medio de lustrado.

TABLA IV

EJEMPLO	Incremento medio de brillo	% de aumento medio en el incremento medio de brillo
dentífrico 1	3,93	11
dentífrico B	3,79	7
dentífrico C	3,54	---
dentífrico D	3,59	1

EJEMPLO IV

La absorción promedio de triclosano en un disco de
10 hidroxipatita se indica en TABLA V. Se comparan los
dentífricos 1, B, y C respecto de los niveles de absorción de
triclosano. La absorción del ingrediente activo triclosano se
asegura usando discos de hidroxiapatita (HAP) que pueden
15 obtenerse de Clarkson Chromatography Products, Inc., que
están recubiertos con saliva (SCHAP), como un modelo in vitro
para dientes humanos. Se encontró que este modelo in vitro es
correlativo al suministro y la retención in vivo de agentes
antibacterianos sobre superficies orales.

A fin de determinar el suministro y la retención de
20 triclosano a un disco SCHAP a partir de un dentífrico que
contiene triclosano y un copolímero aniónico de la presente
invención, es decir el terpolímero AMPS y el copolímero VCAP,
los discos SCHAP son tratados con composiciones de solución
de dentífrico identificadas en la TABLA I anterior. Las
25 cantidades de solución de dentífrico usadas para contactar

h

los discos simulan proporciones in vivo de superficie a volumen que se encontraron en la boca, para estimular en parte la condición de cepillado. Luego de la incubación durante 30 minutos a 37°C, se retiraron los discos SCHAP de la solución de dentífrico y se lavaron tres veces con agua. El aumento de absorción de triclosano sobre los discos SCHAP de los dentífricos 1, B, y C se indican en la TABLA V, a continuación.

10 Tabla V

Ejemplo	Absorción promedio de triclosano en un disco HAP
dentífrico 1	80 ± 2,6
dentífrico B	65 ± 3,2
dentífrico C	65 ± 3,2

15

Los resultados en la TABLA V muestran que el suministro y la retención de triclosano en discos SCHAP del dentífrico 1 son sustancialmente más elevados que de cualquier de los ejemplos comparativos de los dentífricos B y C. Así, estas composiciones brindan métodos de un mayor suministro de un ingrediente activo en una composición oral a una superficie oral.

EJEMPLO V

25 Diversas muestras (A-E) se prepararon y probaron de

Fy

acuerdo con la presente invención. La muestra A representa sílice que no es de alta limpieza. Las muestras B-E representan diversas composiciones de sílice de alta limpieza. Todas se probaron con un Análisis Abrasivo Einlehner. Las muestras se dispersaron a 10% p/v (100g diluidos a un volumen de 1000 ml) y se corrieron por duplicado en un Einlehner AT 1000. Se muestran los resultados en la Tabla 6 a continuación:

10 TABLA VI

15

Muestra	Programa/# de revoluciones	Pérdida de miligramos		Corregido (pérdida de mg a 174,000 revs)
		Corrida 1	Corrida 2	
A	5/174,000	5.9	4	5.0
B	5/174,000	15.5	16.9	16.2
C	5/174,000	18.9	20.8	19.8
D	5/174,000	21.1	19.5	22.1
E	5/174,000	22.2	22.0	

JW

REIVINDICACIONES

1. Una composición oral que comprende:

un primer abrasivo que tiene una dureza de Einlehner
5 superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000
revoluciones; y

un segundo abrasivo que tiene una dureza de Einlehner
inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000
revoluciones;

10 en donde la proporción del primer abrasivo al segundo
abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1,
y en donde la composición oral tiene una proporción de
eliminación de película superior a aproximadamente 100 y una
abrasión de la dentina radiactiva inferior a aproximadamente
15 200.

2. La composición de conformidad con la reivindicación
1, caracterizada porque la abrasión de la dentina radiactiva
es inferior a aproximadamente 175.

3. La composición de conformidad con la reivindicación
20 1, caracterizada porque el primer abrasivo tiene un aceite de
absorción inferior a aproximadamente 90 cm³/100 g y el
segundo abrasivo tiene un aceite de absorción superior a
aproximadamente 90 cm³/100 g.

4. La composición de conformidad con la reivindicación
25 1, caracterizada porque el primer abrasivo tiene un tamaño de

21

partícula medio inferior a aproximadamente 11 μm y el segundo abrasivo tiene un tamaño de partícula medio superior a aproximadamente 8 μm .

5 5. La composición de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque la proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.

10 6. La composición de conformidad con la reivindicación 5, caracterizada porque el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 17% en peso y el segundo abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 17% en peso en la composición oral.

15 7. La composición de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque una cantidad total del primer y del segundo abrasivo en la composición oral es superior a aproximadamente el 30% en peso de la composición.

20 8. La composición de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso y el segundo abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso de la composición oral.

25 9. La composición de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 15% a aproximadamente el 19% en peso y el segundo abrasivo está presente en una

82

cantidad de aproximadamente el 15% a aproximadamente el 19% en peso de la composición oral.

10. La composición de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque el primer abrasivo y el segundo
5 abrasivo comprenden cada uno sílice.

11. Una composición oral caracterizada porque comprende:

un primer abrasivo que comprende sílice, que tiene una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de
10 pérdida por 100,000 revoluciones y un aceite de absorción inferior a aproximadamente 90 cm³/100 g; y

un segundo abrasivo que comprende sílice, que tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de
15 pérdida por 100,000 revoluciones y un aceite de absorción superior a aproximadamente 90 cm³/100 g;

en donde el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso y el segundo abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso de
20 la composición.

12. La composición de conformidad con la reivindicación 11, caracterizada porque el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 15% a aproximadamente el 19% en peso y el segundo abrasivo está presente en una
25 cantidad de aproximadamente el 15% a aproximadamente el 19%

85

en peso de la composición oral.

13. La composición de conformidad con la reivindicación 12, caracterizada porque el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 17% en peso y el segundo abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 17% en peso de la composición oral.

14. La composición de conformidad con la reivindicación 11, caracterizada porque la composición oral tiene una proporción de eliminación de película superior a aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva inferior a aproximadamente 200.

15. La composición de conformidad con la reivindicación 14, caracterizada porque la abrasión de la dentina radiactiva es inferior a aproximadamente 175.

16. La composición de conformidad con la reivindicación 11, caracterizada porque una cantidad total del primer y del segundo abrasivo en la composición oral es superior a aproximadamente el 30%.

17. La composición de conformidad con la reivindicación 11, caracterizada porque el primer abrasivo tiene un tamaño de partícula medio inferior a aproximadamente 11 μm , y el segundo abrasivo tiene un tamaño de partícula medio superior a aproximadamente 8 μm .

18. Una composición oral caracterizada porque comprende:

un primer abrasivo que comprende sílice y que tiene un aceite de absorción inferior a aproximadamente $90 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$ y una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones; y

5 un segundo abrasivo que comprende sílice y que tiene un aceite de absorción superior a aproximadamente $90 \text{ cm}^3/100 \text{ g}$ y una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones;

10 en donde una proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1, y una cantidad total del primer y del segundo abrasivo presente en la composición oral es superior a aproximadamente el 25% en peso de la composición; y en donde la composición oral tiene una proporción de eliminación de película superior
15 a aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva inferior a aproximadamente 200.

19. La composición de conformidad con la reivindicación 18, caracterizada porque la proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.

20 20. La composición de conformidad con la reivindicación 18, caracterizada porque el primer abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 17% en peso y el segundo abrasivo está presente en una cantidad de aproximadamente el 17% en peso en la composición oral.

25 21. Un método para aumentar el suministro de un

8, -

ingrediente activo en una composición oral a una superficie oral, caracterizado porque comprende:

introducir una composición oral en una cavidad oral, en donde la composición oral comprende el ingrediente activo, un
5 primer abrasivo y un segundo abrasivo, en donde el primer y el segundo abrasivo comprenden cada uno sílice y cada uno está presente en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso, en donde la composición oral tiene una proporción de eliminación de película superior a
10 aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva inferior a aproximadamente 200; y

poner en contacto la composición con la superficie oral, en donde el suministro del ingrediente activo es mayor que una composición comparativa que tiene un abrasivo que
15 comprende sílice y una proporción de eliminación de película inferior a aproximadamente 100.

22. El método de conformidad con la reivindicación 21, caracterizado porque una proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a
20 aproximadamente 1.6:1.

23. El método de conformidad con la reivindicación 21, caracterizado porque el ingrediente activo comprende un difeniléter halogenado.

24. El método de conformidad con la reivindicación 21,
25 caracterizado porque una proporción del primer abrasivo al

segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1.

25. El método de conformidad con la reivindicación 21, caracterizado porque el primer abrasivo tiene un aceite de absorción inferior a aproximadamente 90 cm³/100 g y una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, y el segundo abrasivo tiene un aceite de absorción superior a aproximadamente 90 cm³/100 g y una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones.

26. Una composición oral caracterizada porque comprende:

un primer abrasivo que tiene una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 10 mg de pérdida por 100,000 revoluciones; y

un segundo abrasivo que tiene una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 10 mg de pérdida por 100,000 revoluciones;

en donde la proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo es de aproximadamente 1:1,6 a aproximadamente 1,6:1, y en donde la composición oral tiene una proporción de eliminación de película superior a aproximadamente 100 y una abrasión de la dentina radiactiva inferior a aproximadamente 200.

27. La composición oral de conformidad con la

S

reivindicación 21, caracterizada porque la composición además comprende un polímero de policarboxilato o copolímero de éter polivinilmetílico/anhídrido maleico (PVM/MA).

RESUMEN DE LA INVENCIÓN

Se proveen composiciones orales que comprenden un primer y un segundo abrasivo. El primer abrasivo tiene preferentemente una dureza de Einlehner superior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones, y el segundo abrasivo tiene preferentemente una dureza de Einlehner inferior a aproximadamente 5 mg de pérdida por 100,000 revoluciones. Una proporción del primer abrasivo al segundo abrasivo varía de aproximadamente 1:1.6 a aproximadamente 1.6:1, y el primer y el segundo abrasivo, con preferencia, están presentes en la composición oral en una cantidad de aproximadamente el 13% a aproximadamente el 21% en peso, respectivamente. La proporción de eliminación de película de la composición oral es superior a 100 y la abrasividad de la dentina radiactiva es preferentemente inferior a 200, y en ciertas modalidades, con preferencia inferior a aproximadamente 175. También se proveen métodos de uso de las composiciones orales.

PCT

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

Applicant's or agent's file reference 8059-00-W0	FOR FURTHER ACTION see Form PCT/ISA/220 as well as, where applicable, item 5 below.	
International application No. PCT/US2006/062511	International filing date (day/month/year) 21/12/2006	(Earliest) Priority Date (day/month/year) 21/12/2005
Applicant COLGATE-PALMOLIVE COMPANY		

This international search report has been prepared by this International Searching Authority and is transmitted to the applicant according to Article 18. A copy is being transmitted to the International Bureau.

This international search report consists of a total of 6 sheets.

☒ It is also accompanied by a copy of each prior art document cited in this report.

1. Basis of the report

a. With regard to the language, the international search was carried out on the basis of:

- ☒ the international application in the language in which it was filed
☐ a translation of the international application into _____, which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1(b))

b. ☐ With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, see Box No. I.

2. ☒ Certain claims were found unsearchable (See Box No. II)

3. ☐ Unity of invention is lacking (see Box No. III)

4. With regard to the title,

- ☒ the text is approved as submitted by the applicant
☐ the text has been established by this Authority to read as follows:

5. With regard to the abstract,

- ☒ the text is approved as submitted by the applicant
☐ the text has been established, according to Rule 38.2(b), by this Authority as it appears in Box No. IV. The applicant may, within one month from the date of mailing of this international search report, submit comments to this Authority

6. With regard to the drawings,

- a. the figure of the drawings to be published with the abstract is Figure No. _____
☐ as suggested by the applicant
☐ as selected by this Authority, because the applicant failed to suggest a figure
☐ as selected by this Authority, because this figure better characterizes the invention
- b. ☐ none of the figures is to be published with the abstract

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/US2006/062511

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. A61K8/25 A61Q11/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 6 379 654 B1 (GEBRESELASSIE-PETROS [US] ET AL) 30 April 2002 (2002-04-30) column 2, line 9 - line 60 column 4, line 61 - line 67 column 5, line 31 - line 35 table 1 claim 8	1-27
X	US 5 939 051 A (SANTALUCIA JOHN [US] ET AL) 17 August 1999 (1999-08-17) cited in the application column 2, line 66 - column 4, line 34 column 5, line 12 - line 17 column 6, line 43 - line 47 tables I,II claim 9	1-27



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *8* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

11 September 2007

Date of mailing of the international search report

21/09/2007

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

PALONIEMI LEGLAND, R

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 01/85115 A (COLGATE PALMOLIVE CO [US]) 15 November 2001 (2001-11-15) page 10, line 1 - line 2 tables I,III claims 1-9 -----	1-27
X	WO 96/34594 A (PROCTER & GAMBLE [US]) 7 November 1996 (1996-11-07) page 9, line 20 - line 22 claim 1 -----	1-22, 24-27
A	WO 2004/043419 A (HUBER CORP J M [US]) 27 May 2004 (2004-05-27) claims 1-5 -----	1-27

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2006/062511

Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 2 of first sheet)

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: —
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Although claims 21-25 are directed to a method of treatment of the human/animal body, the search has been carried out and based on the alleged effects of the compound/composition.
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2006/062511

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 6379654	B1	30-04-2002	AT 356605 T 15-04-2007
			AU 3135602 A 06-05-2002
			BG 107830 A 30-07-2004
			BR 0114930 A 06-01-2004
			CA 2431714 A1 02-05-2002
			CN 1482894 A 17-03-2004
			CZ 20031440 A3 17-09-2003
			DK 1333799 T3 02-07-2007
			EP 1333799 A2 13-08-2003
			HU 0303573 A2 29-03-2004
			MX PA03003645 A 07-08-2003
			NZ 525575 A 24-12-2004
			PL 361991 A1 18-10-2004
			RU 2275219 C2 27-04-2006
			SK 6332003 A3 07-10-2003
			WO 0234213 A2 02-05-2002
			ZA 200303469 A 06-05-2004
US 5939051	A	17-08-1999	AT 224181 T 15-10-2002
			AU 744931 B2 07-03-2002
			AU 2784699 A 15-09-1999
			BR 9908294 A 31-10-2000
			CA 2322329 A1 02-09-1999
			DE 69902998 D1 24-10-2002
			DE 69902998 T2 05-06-2003
			DK 1056437 T3 20-01-2003
			EP 1056437 A1 06-12-2000
			ES 2184418 T3 01-04-2003
			PL 342598 A1 18-06-2001
			PT 1056437 T 28-02-2003
			WO 9943291 A1 02-09-1999
			ZA 9901544 A 25-08-2000
WO 0185115	A	15-11-2001	AR 030217 A1 13-08-2003
			AT 270874 T 15-07-2004
			AU 5960601 A 20-11-2001
			BR 0110591 A 01-04-2003
			CA 2407693 A1 15-11-2001
			CN 1440270 A 03-09-2003
			DE 60104305 D1 19-08-2004
			DE 60104305 T2 25-08-2005
			EP 1282391 A2 12-02-2003
			ES 2225538 T3 16-03-2005
			HK 1054186 A1 18-03-2005
			JP 2003532663 T 05-11-2003
			MX PA02010713 A 10-03-2003
			NZ 522325 A 25-06-2004
			PL 358545 A1 09-08-2004
			PT 1282391 T 30-11-2004
			RU 2242965 C2 27-12-2004
			TR 200402646 T4 22-11-2004
			TW 230074 B 01-04-2005
			US 6290933 B1 18-09-2001
			ZA 200208801 A 09-02-2004
WO 9634594	A	07-11-1996	AT 198143 T 15-01-2001
			AU 5488096 A 21-11-1996
			CA 2220061 A1 07-11-1996

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2006/062511

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9634594	A	CN 1183037 A	27-05-1998
		CZ 9703450 A3	18-03-1998
		DE 69611294 D1	25-01-2001
		DE 69611294 T2	12-07-2001
		EP 0824340 A1	25-02-1998
		ES 2152521 T3	01-02-2001
		GR 3035122 T3	30-03-2001
		HU 9801942 A2	28-01-1999
		JP 11504920 T	11-05-1999
		PT 824340 T	30-04-2001
		US 5589160 A	31-12-1996
WO 2004043419	A 27-05-2004	AT 355819 T	15-03-2007
		AU 2003263078 A1	03-06-2004
		BR 0316257 A	04-10-2005
		CA 2505800 A1	27-05-2004
		CN 1713881 A	28-12-2005
		DK 1567120 T3	09-07-2007
		EP 1567120 A1	31-08-2005
		KR 20050067235 A	30-06-2005
		MX PA05005207 A	08-09-2005
		TR 200502348 T1	21-11-2006

92

From the
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

To:

PCT

see form PCT/ISA/220

WRITTEN OPINION OF THE INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY (PCT Rule 43bis.1)

Date of mailing
(day/month/year) see form PCT/ISA/210 (second sheet)

Applicant's or agent's file reference
see form PCT/ISA/220

FOR FURTHER ACTION
See paragraph 2 below

International application No.
PCT/US2006/062511

International filing date (day/month/year)
21.12.2006

Priority date (day/month/year)
21.12.2005

International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC
INV. A61K8/25 A61Q11/00

Applicant
COLGATE-PALMOLIVE COMPANY

1. This opinion contains indications relating to the following items:

- ☒ Box No. I Basis of the opinion
- ☐ Box No. II Priority
- ☒ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
- ☒ Box No. V Reasoned statement under Rule 43bis.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- ☐ Box No. VI Certain documents cited
- ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
- ☒ Box No. VIII Certain observations on the international application

2. FURTHER ACTION

If a demand for international preliminary examination is made, this opinion will usually be considered to be a written opinion of the International Preliminary Examining Authority ("IPEA") except that this does not apply where the applicant chooses an Authority other than this one to be the IPEA and the chosen IPEA has notified the International Bureau under Rule 66.1bis(b) that written opinions of this International Searching Authority will not be so considered.

If this opinion is, as provided above, considered to be a written opinion of the IPEA, the applicant is invited to submit to the IPEA a written reply together, where appropriate, with amendments, before the expiration of 3 months from the date of mailing of Form PCT/ISA/220 or before the expiration of 22 months from the priority date, whichever expires later.

For further options, see Form PCT/ISA/220.

3. For further details, see notes to Form PCT/ISA/220.

Name and mailing address of the ISA:



European Patent Office
D-80298 Munich
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Date of completion of
this opinion

see form
PCT/ISA/210

Authorized Officer

PALONIEMI LEGLAND, R
Telephone No. +49 89 2399-7315



9

WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

International application No.
PCT/US2006/062511

Box No. I Basis of the opinion

1. With regard to the **language**, this opinion has been established on the basis of:
 - ☒ the international application in the language in which it was filed
 - ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1 (b)).
2. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application and necessary to the claimed invention, this opinion has been established on the basis of:
 - a. type of material:
 - ☐ a sequence listing
 - ☐ table(s) related to the sequence listing
 - b. format of material:
 - ☐ on paper
 - ☐ in electronic form
 - c. time of filing/furnishing:
 - ☐ contained in the international application as filed.
 - ☐ filed together with the international application in electronic form.
 - ☐ furnished subsequently to this Authority for the purposes of search.
3. ☐ In addition, in the case that more than one version or copy of a sequence listing and/or table relating thereto has been filed or furnished, the required statements that the information in the subsequent or additional copies is identical to that in the application as filed or does not go beyond the application as filed, as appropriate, were furnished.
4. Additional comments:

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/US2006/062511

Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of

☐ the entire international application

☒ claims Nos. 21-25

because:

☒ the said international application, or the said claims Nos. 21-25 relate to the following subject matter which does not require an international search (*specify*):

see separate sheet

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ no international search report has been established for the whole application or for said claims Nos.

☐ a meaningful opinion could not be formed without the sequence listing; the applicant did not, within the prescribed time limit:

☐ furnish a sequence listing on paper complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ furnish a sequence listing in electronic form complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ pay the required late furnishing fee for the furnishing of a sequence listing in response to an invitation under Rules 13ter.1(a) or (b).

☐ a meaningful opinion could not be formed without the tables related to the sequence listings; the applicant did not, within the prescribed time limit, furnish such tables in electronic form complying with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions, and such tables were not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in electronic form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions.

☐ See Supplemental Box for further details

97
WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

International application No.
PCT/US2006/062511

Box No. V Reasoned statement under Rule 43*bis*.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	
	No: Claims	<u>1-27</u>
Inventive step (IS)	Yes: Claims	
	No: Claims	<u>1-27</u>
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	<u>1-20,26-27</u>
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

Box No. VIII Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

see separate sheet

Re Item III.

Rule 39.1(iv) PCT - Method for treatment of the human or animal body by therapy

Claims 21-25 relate to subject-matter considered by this Authority to be covered by the provisions of Rule 67.1(iv) PCT. Consequently, no opinion will be formulated with respect to the industrial applicability of the subject-matter of these claims (Article 34(4)(a)(I) PCT).

Re Item V.

For the assessment of the present claims 21-25 on the question whether they are industrially applicable, no unified criteria exist in the PCT Contracting States. The patentability can also be dependent upon the formulation of the claims. The EPO, for example, does not recognize as industrially applicable the subject-matter of claims to the use of a compound in medical treatment, but may allow, however, claims to a known compound for first use in medical treatment and the use of such a compound for the manufacture of a medicament for a new medical treatment.

1 Reference is made to the following documents:

D1 : US 6 379 654 B1 (GEBRESELASSIE PETROS [US] ET AL) 30 April 2002
(2002-04-30)

D2 : US 5 939 051 A (SANTALUCIA JOHN [US] ET AL) 17 August 1999 (1999-08-17) cited in the application

D3 : WO 01/85115 A (COLGATE PALMOLIVE CO [US]) 15 November 2001 (2001-11-15)

D4 : WO 96/34594 A (PROCTER & GAMBLE [US]) 7 November 1996 (1996-11-07)

D5 : WO 2004/043419 A (HUBER CORP J M [US]) 27 May 2004 (2004-05-27)

2 NOVELTY (Art. 33(1) PCT)

The present application does not meet the criteria of Article 33(1) PCT, because the subject-matter of claim 1 is not new in the sense of Article 33(2) PCT.

Since the oral compositions of the present application comprise same abrasive components Zeodent 115 and Sylodent 650XWA (see p.20, table I) as disclosed in the cited prior art, it is assumed that the claimed parameters are implicitly the same. Moreover, since the claimed amounts of the abrasives in the present application are "about" something, the amounts of abrasives in the cited prior art are falling under said claims.

Document D1 discloses oral compositions comprising the abrasives Zeodent 115 and Sylodent 650XWA (table 1). The total quantity of the abrasives is at a level of 5 to 40 % by weight (col.2, l.56-58). Moreover, the compositions of D1 may comprise Triclosan and Gantrez S-97 (col.4, l.61-67; col.5, l.31-35). Thus, D1 is novelty destroying for claims 1-27.

Document D2 discloses dental compositions comprising the silica abrasives (5-30 % by weight) of the present application (col.5, l.12-17; col.6, l.43-47; table I). Triclosan and Gantrez S-97 are also disclosed. Thus, D2 is novelty destroying for claims 1-27.

Document D3 discloses dentifrice compositions comprising the silica abrasives (5-30 % by weight) Zeodent 115 and Sylodent XWA 650 as well as Triclosan and Gantrez S-97 (p.10, l.1-2; table I, III; claims 1-9).

Document D4 discloses dentifrice compositions comprising silica abrasives having a particle size of 5-11 microns and an oil absorption of 95-135 ml/100 gm and 70 to below 95 ml/100 gm. Gantrez S-97 is also disclosed (p.9, l.20-22). Thus, D4 is novelty destroying for claims 1-22 and 24-27.

Re Item VIII.

The application does not meet the requirements of Article 6 PCT, because claims 1-20 and 26-27 are not clear.

Present claims 1-20 and 25-27 relate to a product defined (inter alia) by reference to the following unusual parameter: **Einlehner hardness**. In the present application said parameter has a unity of "mg loss per 100000 revolutions". In document D4 "an Einlehner hardness of from 0,8 to 2,5 for abrasive to brass screen and from 5 to below 8 for abrasive to polyester screen" has been disclosed. Moreover, in D5 a parameter "**Brass Einlehner abrasion value** of less than about 5 mg loss/100000 rev." has been disclosed. It seems that there are different "Einlehner" parameters.

The use of this unusual parameter in the present context is considered to lead to a lack of clarity because the claims do not clearly identify the products encompassed by them as the parameters cannot be clearly and reliably determined by indications in the description or by objective procedures which are usual in the art. This makes it impossible to compare the claims to the prior art.

In addition, claims 1-20 and 25-27 attempt to define the subject-matter in terms of the result to be achieved (PCR and RDA values of the oral composition), which merely amounts to a statement of the underlying problem, without providing the technical features necessary for achieving this result.

The relative term "about" used in claims 1-9, 11-22 and 24-26 has no well-recognised meaning and leaves the reader in doubt as to the meaning of the technical features to which it refers, thereby rendering the definition of the subject-matter of said claims unclear, Article 6 PCT.

107

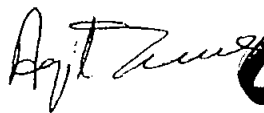
Apostille

(Convention de La Haye du 5 Octobre 1961)

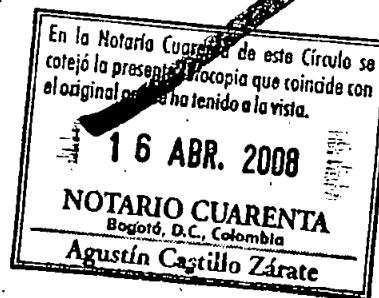
1. Country: **United States of America**
This public document
2. has been signed by **Norman Goodman**
3. acting in the capacity of **County Clerk**
4. bears the seal/stamp of the county of **New York**

Certified

5. At New York, New York
6. the 30th day of October 2001
7. by Special Deputy Secretary of State, State of New York
8. No. NYC-9786540B
9. Seal/Stamp
10. Signature



Aqil M. Qureshi
Special Deputy Secretary of State



Brigard & Castro

SANTA FE DE BOGOTA - COLOMBIA

PODER

POWER OF ATTORNEY

Yo (nosotros)

domiciliado(s) en

Nombrotamos) a: RAMIRO CASTRO DUQUE y/o JUAN PABLO CADENA SARMIENTO y/o BEATRIZ JARAMILLO S.

de Santafé de Bogotá, Colombia, apoderados verdaderos y legales con poder especial, amplio y suficiente, para recabar de las oficinas y autoridades colombianas administrativas, judiciales y de policía, en cualquier instancia o recurso, la obtención de patentes de invención, registros de marcas, diseños industriales, modelos de utilidad, depósitos de nombres comerciales y enseñanzas, registros de derechos de autor y contratos sobre los mismos, obtención de certificados de obtentor de variedades vegetales, así como sus prórrogas, renovaciones, anotaciones de traspaso, cambios de nombre y/o domicilio; elaborar, tramitar y registrar contratos de licencia y licencias de cualesquiera clases; intervenir como demandante o como demandado en cualquier instancia y recurso ante cualquier juez, corporación, funcionario público o autoridad en acciones judiciales, administrativas y de policía tales como: oposiciones al registro de marcas; acciones de caducidad, cancelación y nulidad; acciones reivindicatorias, acciones derivadas de la obtención o explotación de licencias; acciones de competencia desleal; demandas penales; acciones de indemnización de perjuicios, reclamos y observaciones a solicitudes de patentes, diseños industriales, modelos de utilidad, en el ejercicio de medidas cautelares y en otras acciones o medidas similares.

A este efecto, lo(s) facultamos para elevar solicitudes, formular descripciones, enmiendas, protestas, declaraciones, oposiciones, cancelaciones, nulidades, apelaciones y reclamos; pagar impuestos, cuotas y gravámenes prescritos por la ley; renunciar o desistir a derechos concedidos o en curso de concesión; recibir toda clase de documentos y valores, dando el descargo respectivo, y, en general, para dar ante dichas autoridades todos los pasos necesarios al efecto indicado y tomar todas las medidas que creyeran conducentes al resguardo de mis (nuestros intereses), con todas las demás facultades legales necesarias.

Este poder comprende la facultad de ratificar o confirmar en mi (nuestro) nombre lo actuado así como la facultad de desistir, transigir, comprometer, y la de sustituirlo en todo o en parte y revocar sustituciones. Asimismo nombro(amos) a: RAMIRO CASTRO DUQUE y/o JUAN PABLO CADENA SARMIENTO y/o BEATRIZ JARAMILLO S. domiciliado(s) en la Carrera 7 No. 16-56 Piso 9, mis (nuestros) apoderados en Colombia, con facultades para recibir notificaciones y designar apoderados judiciales o extrajudiciales.

Otorgado y firmado en

hoy de

Firma

Nombre

I (We)

COLGATE-PALMOLIVE COMPANY, a Delaware corporation, of 300 Park Avenue, New York, New York 10022, U. S. A.

Herby appoint RAMIRO CASTRO DUQUE and/or JUAN PABLO CADENA SARMIENTO and/or BEATRIZ JARAMILLO S.

of Santafé de Bogotá, Colombia, my (our) true and lawful attorneys with special, ample and sufficient power to obtain from the Colombian administrative, judicial and police offices and authorities, in any instance, privileges of patents of invention, registration of trademarks, industrial designs and utility models; registration of commercial names and emblems, registration of copyright and contracts related thereto, certificates of obtainers of vegetable varieties, as well as extensions, renewals and recordal of assignments and changes of name and domicile related to the above; to prepare, prosecute and register licenses of any kind; to act as plaintiff or defendant in any instance or recourse, and before any judge, corporation, public official or authority in judicial, administrative and police actions, such as: oppositions to the registration of trademarks; caducity, cancellation and nullity actions; claim actions derived from the obtaining or exploitation of licenses, action of unfair competition; penal demands, actions of indemnities for damages; claims or observations on patent applications, models, industrial designs and utility models; in the exercise of preventive measures; and in other actions or similar proceedings.

To that effect they are hereby empowered to file applications, formulate descriptions, amendments, protests, declarations, oppositions, cancellations, nullities, appeals and claims; to pay taxes, quotas and assessments prescribed by law, renounce or waive the rights granted or in the process of granting; to receive all kind of documents and valuables, giving the respective release of receipt, and, in general, to take before said authorities the necessary steps to such effect, and any measures that they may deem pertinent to the safeguard of my (our) interest(s) with all the other necessary legal powers.

This power includes the faculty to ratify or confirm desist, settle and compromise on my (our) behalf, and to substitute this power in whole or in part and to revoke substitutions. At the same time I (We) hereby appoint RAMIRO CASTRO DUQUE and/or JUAN PABLO CADENA SARMIENTO and/or BEATRIZ JARAMILLO S. domiciled in Carrera 7 No. 16-56, Piso 9, my (our) attorney(s) in fact, with powers to receive notifications and to designate judicial and extrajudicial attorneys.

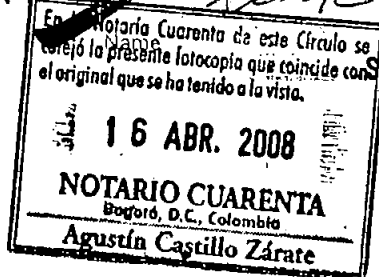
Granted and signed in New York, N.Y.

VICE PRESIDENT &
ASSOCIATE GENERAL COUNSEL
TRADEMARK

this OCT 29 2001 day of 200...

Signature

SCOTT E THOMPSON



CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

Hoy de de
personalmente compareció ante mí

a quien conozco, y de quien me consta que firmó el anterior documento, debidamente juramentado declaró y dijo que él es

de

Sociedad legalmente constituida para un período de duración que aún no ha terminado; que el declarante está autorizado por dicha compañía para conferir este poder; que el sello estampado por él al pie de tal poder, en nombre y representación de la expresada compañía, es el sello oficial de ella; y que el objeto para el cual se confiere este instrumento está comprendido dentro del de la sociedad.

El suscrito Notario hace constar que tuvo a la vista las pruebas de la existencia de la sociedad.

Estado de
con fecha

y que quien confiere el presente poder es su representante.

Notario Público (sello)

CERTIFICADO NOTARIAL
PERSONA NATURAL

Hoy de de , compareció(eron)
ante mí

a quien (es) conozco y me consta que es(son) la(s) persona(s) firmante(s) del documento que precede y quien(es) declara(n) que otorgan el mismo para los fines y propósitos que en él se expresan.

Notario Público (sello)

LEGALIZACION POR APOSTILLA ES REQUERIDA.

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

On this OCT 29 2001 day of of
personally appeared before me

SCOTT E THOMPSON

to me known, and known to me to be the person who signed the foregoing instrument who being by me duly sworn did depose and say that he (she) is the

VICE PRESIDENT &

ASSOCIATE GENERAL COUNSEL

TRADEMARK

COLGATE-PALMOLIVE COMPANY

Which is legally constituted for a term not yet expired, that deponent is authorized by said Company to confer this Power of Attorney: that the seal affixed hereunto by the deponent in the name and on behalf of said Corporation is the corporate seal thereof; and that the purpose for which this instrument is granted is included within the corporate purpose of company.

The undersigned Notary Public attests that he has seen the documents that prove the existence of the company.

State of Delaware
under date of May 13, 1997

and that he (she) who grants the present power of attorney is its Representative.

Notary Public (Seal)

ROSIE S. DIZON

Notary Public, State of New York

No. 31-4941117

Qualified in New York County

Commission Expires Aug. 15, 2002

On this OCT 29 2001 day of of
personally appeared before me

SCOTT E THOMPSON

who (are) known to me and who I attest, executed the foregoing document and he (they) declared he (they) executed the document for the uses and purposes therein expressed.

Notary Public (Seal)

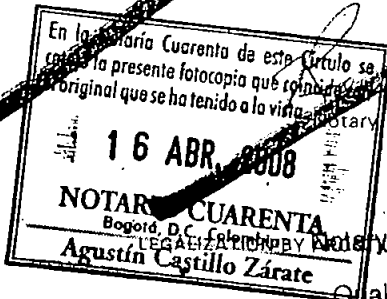
ROSIE S. DIZON

Notary Public, State of New York

No. 31-4941117

Qualified in New York County

Commission Expires Aug. 15, 2002



64

State of New York
County of New York

CLERK
NEW YORK
COUNTY

252373

Form 1

I, NORMAN GOODMAN, County Clerk and Clerk of the Supreme Court of the State of New York, in and for the County of New York, a Court of Record, having by law a seal, DO HEREBY CERTIFY pursuant to the Executive Law of the State of New York, that

Rosie S. Dizon

whose name is subscribed to the annexed affidavit, deposition, certificate of acknowledgment or proof, was at the time of taking the same a NOTARY PUBLIC in and for the State of New York duly commissioned, sworn and qualified to act as such; that pursuant to law, a commission or a certificate of his official character, with his autograph signature has been filed in my office; that at the time of taking such proof, acknowledgment or oath, he was duly authorized to take the same; that I am well acquainted with the handwriting of such NOTARY PUBLIC or have compared the signature on the annexed instrument with his autograph signature deposited in my office, and I believe that such signature is genuine.

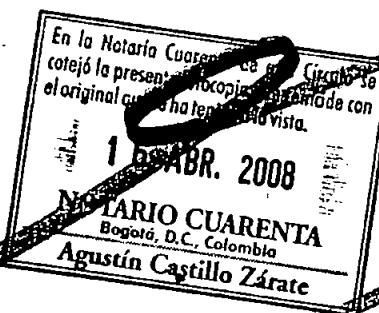
IN WITNESS WHEREOF, I have hereunto set my hand affixed my official seal this

OCT. 30 2001

FEE PAID \$3.00

Norman Goodman

County Clerk and Clerk of the Supreme Court, New York County



105

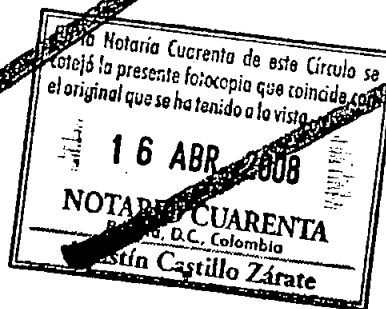
APOSTILLE

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: ESTADOS UNIDOS DE AMERICA
Este documento público
2. ha sido firmado por **Norman Goodman**
3. actuando en capacidad de **Oficial del Condado**
4. lleva el sello/timbre del condado de **New York**

CERTIFICADO

5. en New York, New York
6. el 30 de Octubre de 2001
7. por Secretario de Estado Encargado Especial, Estado de New York
8. No. NYC-9786540B
9. Sello/Timbre
10. Firma
(Firma)
Aquil M. Qureshi
Secretario de Estado Encargado Especial



106

Estado de New York	)	252373
	) ss.	
Condado de New York	)	

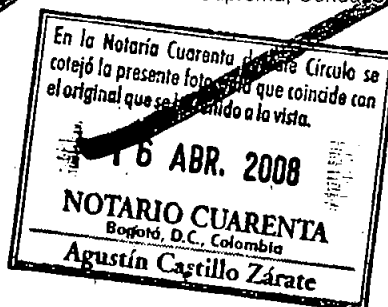
CERTIFICO POR MEDIO DE LA PRESENTE de acuerdo con la Ley Ejecutiva del Estado de New York, que

cuyo nombre está suscrito al acta notarial, deposición, certificado de reconocimiento o prueba, era al momento de tomar el mismo NOTARIO PÚBLICO en y para el Estado de New York debidamente comisionado, juramentado y calificado para actuar como tal; que de acuerdo con la ley, una comisión o un certificado de este carácter oficial, con su firma autógrafa ha sido presentada en mi oficina; que al momento de tomar tal prueba, reconocimiento o juramento, estaba debidamente autorizado para tomar el mismo; que estoy bien familiarizado con la escritura de tal NOTARIO PÚBLICO o he comparado la firma en el instrumento anexo con la firma autógrafa depositada en mi oficina, y creo que tal firma es genuina.

30 de Octubre de 2001

(Firma)

Oficial del Condado ~~de~~ Oficial de la Corte Suprema, Condado de New York





GAVIRI A

ORGANIZACION ELECTORAL
REGISTRADURÍA NACIONAL DEL ESTADO CIVIL

REGISTRO CIVIL DE DEFUNCIÓN

Indicativo
Serial 5562241

Datos de la oficina de registro									
Clase de oficina:	Registraduría	Notaría	☒	Consulado	Corregimiento	Insp. de Policía	Código	9795	
País - Departamento - Municipio - Corregimiento o/o Inspección de Policía									
COLOMBIA CUNDINAMARCA BOGOTA D.C. NOTARIA 32.									

Datos del Inscrito									
Apellidos y nombres completos									
CASTRO DUQUE RAMIRO									
Documento de identificación (Clase y número)					Sexo (en Letras)				
C.C.No. 170322 DE BOGOTA					MASCULINO				

Datos de la defunción													
Lugar de la Defunción: País - Departamento - Municipio - Corregimiento o/o Inspección de Policía													
COLOMBIA CUNDINAMARCA BOGOTA D.C.													
Fecha de la defunción				Hora		Número de certificado de defunción							
Año	2	0	0	4	Mes	1	0	Día	3	0	04:10 PM	A- 2094375.	
Presunción de muerte													
Juzgado que profiere la sentencia					Fecha de la sentencia								
-					-								
Documento presentado					Nombre y cargo del funcionario								
Autorización judicial ☐ Certificado Médico ☒					ANDRES DIAZ CAMPOS.- R.M. No. 79982662								

Datos del denunciante									
Apellidos y nombres completos									
EDGAR DAVID REGINO H.									
Documentos de identificación (Clase y número)					Firma				
C.C.No. 15.030.154 DE LORICA/ CORDOBA									

Primer testigo									
Apellidos y nombres completos									
-									
Documentos de identificación (Clase y número)					Firma				
-					-				

Segundo testigo									
Apellidos y nombres completos									
-									
Documentos de identificación (Clase y número)					Firma				
-					-				

Fecha de inscripción										
Año	2	0	0	4	Mes	1	1	Día	0	2
Nombre y firma del funcionario que autoriza										

PADRES: ALFON SO CASTRO ESPACIO PARA NOTAS									
MERCEDES DUQUE.									

ORIGINAL PARA LA OFICINA DE REGISTRO



NOTARIA 32

DEL CIRCULO DE SANTA FE DE BOGOTA, D.C

Germán Eleázar Moreno L
Notario

COMO SECRETARIO DELEGADO DE LA NOTARIA TREINTA Y DOS (32) DEL
CIRCULO DE BOGOTA

CERTIFICO QUE

La presente acta es fiel copia del original tomada del registro
civil de defunciones serial indicativo número 5562241
que expido en la ciudad de Bogotá D.C., hoy 05 NOV 2004

NEILSON ELIZABETH O
SECRETARIO DELEGADO

NEILSON ELIZABETH O
SECRETARIO DELEGADO
DIRECCION DE REGISTRO CIVIL

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No 08-075198 00000-0000

Fecha 2008 07 21 17 08 28 Dep 2020 NUECREACION
Tra 11 PATENTEIYII Eve 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 107



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

PATENTE DE INVENCION [X]

MODELO DE UTILIDAD []

- Indicación de que se solicita la concesión de una patente [X]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [X]
- Descripción de la invención [X]
- Dibujos de ser estos pertinentes [X]
- Comprobante de pago de las tasas establecidas [X]

COMPLETA [X]

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- Representación gráfica del esquema trazado []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

STC
Firma Responsable

Fecha Jul 21-08

Carrera 13 No 27-00 Piso 6, 7 y 10
Contactador: 3 82 08 40
Fax 350 52 20
E mail, info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D C, Colombia

109

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CADENA SARMIENTO JUAN PABLO
Apoderado(a) y/o Representante de
COLGATE - PALMOLIVE COMPANY

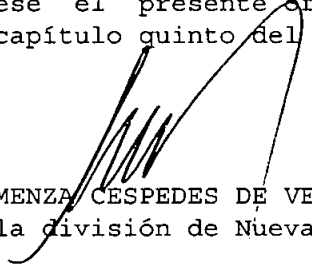
REFERENCIA	Radicación No.	8 75198
	Solicitud internacional	PCT/US2006/062511
	Fecha inicio fase nacional	21/07/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	10145

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, deben legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 08 AGO. 2008
adpall