

PETITORIO

AS: 108.739

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-116918-00000-0000

Fecha 2008-10-31 18:41:13 Dep. 2020 NUECREACION
Ley 11 PATENTE Ley 378 FASE NACIONAL
Art. 41 PRESENTACION Folios 93

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 AméricaNacionalidad 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: Thomas J. BOYD.

Dirección: 228 High Street, Metuchen, NJ 08840, Estados Unidos de América.

Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos de América

8 PCT (88)

Solicitud Internacional No. PCT/US2007/067495

Fecha 26-04-2007

Publicación Internacional No. WO 2007/130841 A2

Fecha 15-11-2007

6 Título (54): COMPOSICIONES ORALES QUE COMPRENDEN POLÍMEROS DE SILOXANO

7 Clasificación Internacional (51): A 61 Q 11 / 00

8 Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

US

(32) Fecha

01-05-2006

(31) Número de Solicitud

60/796,384

9 Comprobante de pago No. 08 - 72, 382

Fecha 31-10-2008

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

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

Applicant's or agent's file reference 6964-00-WO	FOR FURTHER ACTION see Form PCT/ISA/220 as well as, where applicable, item 5 below.	
International application No. PCT/US2007/057495	International filing date (day/month/year) 26/04/2007	(Earliest) Priority Date (day/month/year) 01/05/2006
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 12.2(a) and 23.1(b))

b. ☐ This international search report has been established taking into account the rectification of an obvious mistake authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 43.6bis(a)).

c. ☐ With regard to any nucleotide and/or amino acid sequences disclosed in the international application, see Box No. 1.

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

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

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 35.2(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.

Pat./US2007/067495

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Inv. A61Q11/00 A61K8/896 A61K8/894 A61K8/898

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

B. FIELDS SEARCHED

Maximum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A61Q 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, EMBASE, FSTA, BIOSIS

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 2003/072719 A1 (NELSON DENNIS GEORGE ANTHONY [US] ET AL) 17 April 2003 (2003-04-17) ✓ page 1, paragraphs 2,12,14 page 2, paragraphs 18,21 page 2, paragraph 29 - page 3 page 4, paragraph 46 - page 5 claims 1-3 examples E,F; table 1	1-14, 17-25, 27,28
X	JP 09 187397 A (KAO CORP) 17 June 1997 (1997-06-17) ✓ abstract ----- -/-	1-14, 17-25, 27,28

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family member.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"B" earlier document has published on or after the international filing date

"C" 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)

"D" document relating to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"E" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"F" 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

"G" 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

"H" 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

"I" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search:

31 October 2007

Date of mailing of the international search report

Name and mailing address of the ISA:

European Patent Office, P.O. Box 1, Patentstr. 1
NL - 2280 NY Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2000, Telex: 531 EPO NL
Fax: (+31-70) 340-2015

Authorized officer

Schlie, Stefanie

81

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2007/067495

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Referred to case No.
X	US 5 588 496 A (FOST DENNIS L [US] ET AL) 18 November 1997 (1997-11-18) column 16, line 37 - line 64 claims 1-14 ✓	1-28
X	US 6 004 538 A (HUGHES IAIN ALLAN [GB] ET AL) 21 December 1999 (1999-12-21) column 1, line 7 - line 14 column 3, line 25 - line 57 claim 1 ✓	20-22
X	US 6 193 958 B1 (EDWARDS MARK IEUAN [GB] ET AL) 27 February 2001 (2001-02-27) column 4, line 17 - line 31 claims 1-13 column 3, line 22 - line 30 ✓	20-22
X	EP 0 371 551 A (UNILEVER NV [NL]; UNILEVER PLC [GB]) 6 June 1990 (1990-06-06) page 3, line 35 - line 47 claim 1 ✓	20-22
P,X	EP 1 733 717 A (OREAL [FR]) 20 December 2006 (2006-12-20) ✓ page 8, paragraph 62 - page 10, paragraph 68 page 11, paragraph 71 example 1 -----	1-14, 17-25, 27,28

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Indicate on patent family members

International application No.

PLA/US2007/067495

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 2003072719	A1	17-04-2003	NONE
JP 9157397	A	17-06-1997	NONE
US 5688496	A	18-11-1997	NONE
US 6004538	A	21-12-1999	NONE
US 6193958	B1	27-02-2001	NONE
EP 0371551	A	06-06-1990	CA 2003970 A1 28-05-1990 DE 68910088 D1 25-11-1993 DE 68910388 T2 03-03-1994 ES 2059709 T3 16-11-1994 JP 1979606 C 17-10-1995 JP 2200618 A 08-08-1990 JP 7000542 B 11-01-1995 US 5078988 A 07-01-1992
EP 1733717	A	20-12-2006	BR PI0602547 A 21-02-2007

83

PATENT COOPERATION TREATY

From the
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

CORRECTED VERSION

CT

To:

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/220FOR FURTHER ACTION
See paragraph 2 belowInternational application No.
PCT/US2007/067495International filing date (day/month/year)
26.04.2007Priority date (day/month/year)
01.05.2006International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC
INV. A61Q11/00 A61K8/88 A61K8/894 A61K8/888Applicant
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(b)(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 65.1bis(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-80335 Munich
Tel: +49 89 2339-0 Fax: 023856 epma d
Fax: +49 89 2339-4465

Date of completion of
this opinionsee form
PCT/ISA/210

Authorized Officer

Schüle, Stefanie

Telephone No. +49 89 2339-4865



54

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No
PCT/US2007/067495

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(e) and 23.1 (b)).

2. ☐ This opinion has been established taking into account the rectification of an obvious mistake authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 43bis.1(a))

3. 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.

4. ☐ 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.

5. Additional comments:

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/US2007/067495

Re Item V

Reasoned statement with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. DOCUMENTS

Reference is made to the following documents:

D1: US 2003/072719
D2: JP 09 157397
D3: US-A-5 688 488
D4: US-A-6 004 538
D5: US-B1-6 193 958
D6: EP-A-0 371 551

2. CLARITY (Art. 6 PCT)

- 2.1 Although claims 1, 8, and 20 have been drafted as separate independent claims, they appear to relate effectively to the same subject-matter and to differ from each other only with regard to the definition of the subject-matter for which protection is sought. The aforementioned claims therefore lack conciseness and as such do not meet the requirements of Article 6 PCT.
- 2.2 Claims 8 and 20 actually refer to the same subject-matter as claim 1, yet they define the subject-matter in terms of the result to be achieved, "...anti-attachment agent that substantially inhibits bacteria from forming a biofilm on a tooth surface", which merely amounts to a statement of the underlying problem, without providing the technical features necessary for achieving this result. The effect cannot be seen as technical feature and the scope of claims 8 and 20 corresponds to that of claim 1..

3. NOVELTY (Art. 33(2) PCT)

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/US2007/067495

- 3.1 The present application does not meet the criteria of Article 33(1) PCT, because the subject-matter of claims 1-28 is not new in the sense of Article 33(2) PCT.
- 3.2 D1 discloses an oral composition for removing and loosening plaque and/or stains from a dental surface comprising Pecosil PS-100 (Dimethicone Copolyolphosphate), Poloxamer, tetrapotassium pyrophosphate, tetrasodium pyrophosphate, sodium lauryl sulfate, water and alcohol (D1: see Table 1, example F). The composition equals the example shown in the description in Table 1. D1 also discloses the use of other polysiloxane polymers comprising amines or alkylene oxides as hydrophilic moiety (D1: p.4, paragraph 45). Consequently, D1 is considered novelty-destroying towards the subject-matter of claims 1-14, 17-25, 27 and 28.
- 3.3 D2 discloses composition comprising a siloxane polymer having a phosphorous-containing moiety. The compositions are used for cosmetic and medical application and are considered suitable for the oral use, as the application on teeth rather belongs to a kind of "external use" (D2: see Abstract). Consequently, D2 is considered novelty-destroying towards the subject-matter of claims 1-14, 17-25, 27, and 28.
- 3.4 D3 discloses compositions comprising a siloxane polymer having a phosphorous-containing moiety, in particular a phospholipid moiety. The compositions are used for personal care and home care applications (see D3: c.1, 1.45-46) and they are non-irritating to the eyes and skin (D3: c.16, 1.47-59). Therefore these surfactants are considered "suitable for" oral care composition, especially since an use as dentrifice implies that the composition is not swallowed in large amounts, but rather applied externally. Consequently, and in view of the clarity objections made under 2.2, D3 is considered novelty-destroying towards the subject-matter of claims 1-28.
- 3.5 D4 discloses an oral composition, such as a toothpaste, a liquid dentrifice and a mouthwash, comprising a siloxane polymer with an alkylene oxide moiety (D4: claim 1). Consequently, D4 is considered novelty-destroying towards the subject-matter of claims 20-22.
- 3.6 D5 discloses an oral composition, such as a toothpaste, a liquid dentrifice and a mouthwash, comprising a siloxane polymer with an alkylene oxide moiety and an

88

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/US2007/067495

aminoalkylsilicone (D5: claim 1). Consequently, D5 is considered novelty-destroying towards the subject-matter of claims 20-22.

- 3.7 D6 discloses a dentrifice comprising an aminoalkylsilicone (D6: claim 1) which forms a hydrophobic barrier on the surface of teeth, preventing staining of teeth and caries. Consequently, D5 is considered novelty-destroying towards the subject-matter of claims 20 and 21.

4. INVENTIVE STEP (Art. 33(3) PCT)

The subject-matter of claims 1-28 is not novel and therefore does not involve an inventive step.

5. INDUSTRIAL APPLICABILITY (Art. 33(4) PCT)

The subject-matter of claims 1-28 is industrial applicable according to Art. 33(4) PCT.

Re Item VI

Certain documents cited

Certain published documents

Application No Patent No	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
EP 1733717	20.12.2006	08.08.2006	16.08.2005

Apostille

(Convention de La Haye du 6 Octobre 1961)

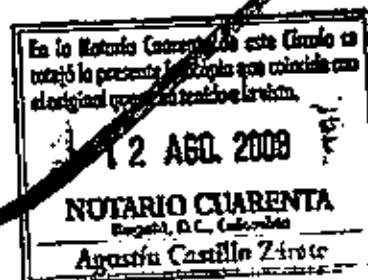
1. Country: **United States of America**
This public document
2. has been signed by **Norman Goodman**
3. acting in the capacity of **County Clerk**
4. bears the seal/stamp of the county of **New York**

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

Aqil M. Qureshi
Special Deputy Secretary of State



90

Brigard & Castro

SANTA FE DE BOGOTÁ - COLOMBIA

PODER

POWER OF ATTORNEY

Yo (nosotros)

domiciliado(s) en

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

de Santa Fe 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 emblemas, 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 cualquier clase; 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 patentes de invención, diseños industriales, modelos de utilidad, en el ejercicio de medidas cautelares y otras acciones o medidas similares.

A este efecto, los(as) facultados(as) para formular solicitudes, formular desistimientos, enmiendas, protestas, declaraciones, oposiciones, cancelaciones, nulidades, apelaciones y recursos; pagar impuestos, cuotas y gravámenes prescritos por la ley; renunciar o waiver los derechos concedidos o en trámite; recibir toda clase de documentación y/o valores, dando el descargo respectivo, y, en general, para ante dichas autoridades todos los pasos y trámites 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 sustituir en todo o en parte y revocar sustituciones. Al mismo tiempo nosotros(as) 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, m/a (nuestros) apoderados en Colombia, con facultades para recibir notificaciones y designar moderadores judiciales o extrajudiciales.

Orogado y firmado en

lugar de

Firma

Nombre

VICE PRESIDENT &
ASSOCIATE GENERAL COUNSEL
TRADEMARK

I (We)

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

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

of Santa Fe 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 obtainment of vegetables varieties, as well as extensions, renewals and records 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, trademark, models, industrial designs and utility models; 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, protestations, declarations, oppositions, cancellations, nullities, appeals and claims; to pay taxes, quotas and emblems prescribed by law, renounce or waive the rights granted or in the process of granting; to receive documents and valuables, giving the respective release of receipt, and, in general, to take before any authorities the necessary steps to such effect, and any measures that they may deem pertinent to the safeguard of my (our) interests and all the other necessary legal powers.

This power includes the faculty to ratify or confirm demand, 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) attorneys-in fact, with powers to receive notifications and to designate judicial and extra-judicial attorneys.

Granted and signed in New York, N.Y.

THIS OCT 29 2001 day of 2001

Signature *Scott E Thompson*

Name SCOTT E THOMPSON

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

Hay de no
personalmente compareció ante mí

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

de

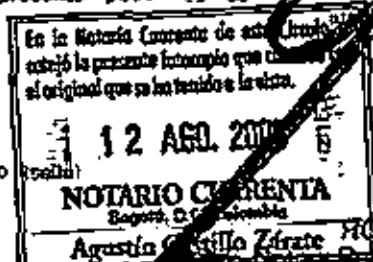
Sociedad legalmente constituida para un periodo de
duración que aún no ha terminado; que el declarante
está autorizado por dicha compañía para conferir este
poder; que el sello estampado por él al pie de tal poder,
en nombre y representación de la expresada compañía,
es el sello oficial de ella; y que 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



CERTIFICADO NOTARIAL
PERSONA NATURAL

COUNTY

Hay de de , comparecieron
ante mí

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

Notario Público (seal)

LEGALIZACION POR APOSTILLA ES REQUERIDA.

On the 17th day of
personally appeared before me

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

SCOTT E THOMPSON
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
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 the 28th day of
personally appeared before me

SCOTT E THOMPSON

who (is/are) known to me and who I attest executed
the foregoing document and he (they) declared he
(they) grant(s) 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

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

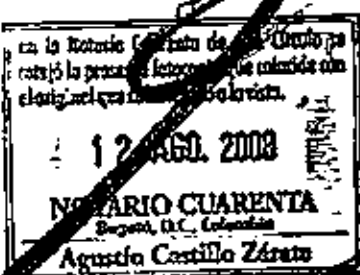
whose name is subscribed to the annexed affidavit, deposition, certificate of acknowledgment or proof, was at the time of taking the same a NOTARY PUBLIC in and for the State of New York duly commissioned, sworn and qualified to act as such; that pursuant to law, a commission or a certificate of his 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 \$1.00

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



93

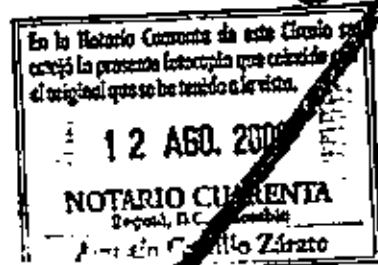
APOSTILLE

(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



Firma

(Firma)

Aquil M. Qureshi
Secretario de Estado Encargado Especial

91

TRADUCCIÓN SIMPLE AL ESPAÑOL del Certificado Notarial y el la apostilla que vienen
junto con el poder dado por Colgate-Palmolive Company, a Delaware Corporation,
domiciliada en 300 Park Avenue, New York, New York, Estados Unidos de América a
Ramiro Castro Duque y/o Juan Pablo Cadena Sarmiento y/o Beatriz Jaramillo S.
domiciliados en la Carrera 7 # 18-56 P. 8, Bogotá.

Certificado Notarial

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

252373

Yo, NORMAN GOODMAN, Oficial del Condado y Oficial de la Corte
Suprema del Estado de New York, en y para el Condado de New York, un Tribunal
de Registros, que tiene un sello por ley.

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

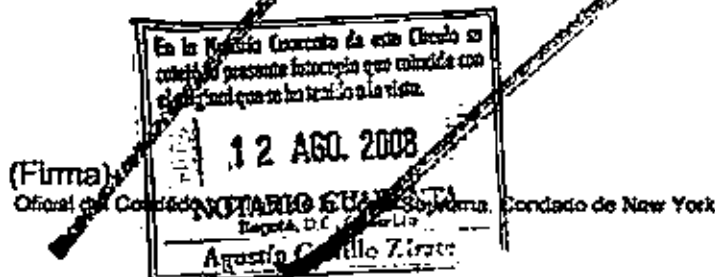
Rosie S. Dizon

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.

COMO TESTIGO DE LO MISMO, he fijado al presente mi firma y mi sello
oficial este

30 de Octubre de 2001

TARIFA PAGADA \$3.00





GAYIRI A

05

ORGANIZACIÓN ELECTORAL
REGISTRADURÍA NACIONAL DEL ESTADO CIVIL

REGISTRO CIVIL DE DEFUNCIÓN

Indicativo Serial 5562241

Ciclo de datos		Registrador	Notario	Corregidor	Insp. de Policía	Código	9790
COLOMBIA CUNDINAMARCA BOGOTÁ D.C. NOTARIA 32							

Datos del difunto		Apellido y nombres completos	
CASTRO DUQUE RAMIRO			
Documento de Identificación (Carné y número)		Sexo (en Letras)	
D.O. No. 170322 DE BOGOTÁ		MASCULINO	

Lugar de la defunción		Fecha de la defunción		Hora		Número de certificado de defunción	
COLOMBIA CUNDINAMARCA BOGOTÁ D.C.		Año 2004 Mes 10 Día 30		04:10 PM		A- 2094375	
Causa de la defunción		Firma del declarante		Firma del registrador		Firma del notario	
Accidental (sí/no)		Causa médica		Nombre y cargo del declarante		R.M. No.	
		X		ANDRES DIAZ CAMPOS		79982662	

Datos del denunciante		Apellido y nombres completos	
EDGAR DAVID REGINO H.			
Documento de Identificación (Carné y número)		Firma	
C.C. No. 15.030.154 DE LORICA CORDOBA		[Firma]	

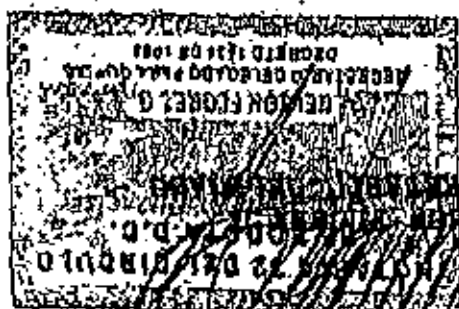
Primer testigo		Apellido y nombres completos	
Documento de Identificación (Carné y número)		Firma	

Segundo testigo		Apellido y nombres completos	
Documento de Identificación (Carné y número)		Firma	

Fecha de inscripción		Notario y firma del funcionario que autoriza	
Año 2004 Mes 10 Día 02		BLANCA LÓPEZ ALLEGRÍA RESTREPO	
PARENTES ALFONSO CASTRO		ESPACIO PARA NOTAS	
MERCEDES DUQUE			

ORIGINAL PARA LA OFICINA DE REGISTRO

74



La presente nota es fiel copia del original tomado del registro
distal de notificaciones social indigena numero 5362241
que expide en la ciudad de Bogota D.C. hoy 17 NOV 2004

CONFIRMADO - 0000

CONFIRMADO - 0000
CONFIRMADO - 0000

Gerardo Roldan Moreno L.
Notario

OTARIA 32
MUNICIPIO DE SANTA FE DE BOGOTA, D.C.



No. 08-116918-00000-0000

Fecha 2008-10-31 18:41:13 Dep 2020 NUESTRACION
 Tr 11 PATENTEYII Evs 378 FASENACIONAL
 Act 411 PRESENTACION Folios 93



Industria y Comercio
 SUPERINTENDENCIA

94
 96

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

POT

PATENTE DE INVENCION

MODELO DE UTILIDAD []

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

COMPLETA []

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 []

Molly B...
 Firma Responsable

Fecha 31 Oct 2008

Carrera 13 No. 27-20 Piso 6, 7 y 10
 Correo: 382 0040
 Fax: 350 5240
 E-mail: info@aic.gov.co
 www.aic.gov.co
 Bogotá, D.C., Colombia

95
97

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

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

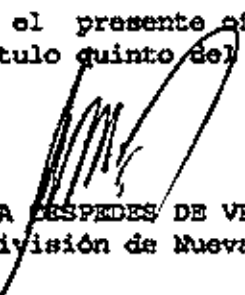
REFERENCIA	Radicación No.	8 116918
	Solicitud internacional	PCT/US2007/067495
	Fecha inicio fase nacional	01/12/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	15604

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 91 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, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.13 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

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 Única No.10 de 2001.


ALIX CARMONA ESPEDOS DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 05 DIC. 2009.
adpall

171

[0005] La siguiente descripción es de naturaleza meramente ejemplar y no está destinada a limitar la presente divulgación, la aplicación o los usos.

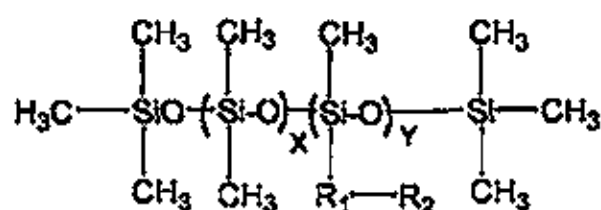
[0006] En varias realizaciones, las composiciones para el cuidado oral están provistas de un ingrediente activo que comprende un polímero de siloxano que proporciona varios beneficios para el cuidado oral, tales como efectos antiplaca y control del sarro, entre otros. Un "polímero de siloxano" se refiere a un polímero que tiene un esqueleto básico de silicio y oxígeno con grupos constituyentes laterales que pueden ser iguales o diferentes, generalmente descritos por la unidad estructural de repetición $(-\text{O}-\text{SiRR}'-)_n$, en donde R y R' pueden ser grupos constituyentes laterales iguales o diferentes, y n puede ser cualquier valor superior a 2 que designa la repetición de la unidad estructural de repetición en el esqueleto del polímero. Los polímeros de siloxano son también conocidos en el arte como polímeros de "silicona". Los polímeros de siloxano pueden incluir poliheterosiloxanos, en donde los grupos laterales y/o las unidades estructurales de repetición pueden ser entidades diferentes (que tienen diferentes grupos constituyentes laterales), tales como, por ejemplo, el copolímero de siloxano descrito por la fórmula de unidad estructural de repetición nominal, $(-\text{O}-\text{SiRR}'-)_n(-\text{O}-\text{Si}-\text{R}''\text{R}''')_m$, en donde R y R' son grupos laterales distintos a R'' y R''' y m es un entero. Adicionalmente R y R' pueden ser diferentes uno del otro; similarmente lo mismo puede ser cierto para R'' y R'''. Tales polímeros de siloxano pueden terminar en cualquier variedad de grupos terminales, tales como, por ejemplo, siloxano terminado en trimetil sililo

$((CH_3)_2Si)$ o siloxano terminado en etil vinilo. A menudo, el polímero de siloxano está enlazado transversalmente, por ejemplo, en una reacción de hidrosililación en la cual unos grupos etilénicamente insaturados reaccionan con grupos hidruro.

[0007] Los polímeros de poliorganosiloxano convencionales son hidrófobos. Sin embargo, de acuerdo con varios aspectos de la divulgación, el ingrediente activo comprende un polímero de siloxano que tiene por lo menos una región hidrófila. En varias realizaciones, la región hidrófila comprende una o más porciones hidrófilas, tales como óxidos de alquileo, aminas o grupos que contienen fósforo. En ciertas realizaciones, la región hidrófila incluye una porción que comprende fósforo. Unos ejemplos de porciones que contienen fósforo incluyen, a modo de ejemplo, fosfatos, fosfonatos, fosfolípidos y similares, como se describirá con más detalle más adelante.

[0008] En ciertas realizaciones, el polímero de siloxano comprende grupos alquilo colgantes. El polímero de siloxano comprende adicionalmente una porción que contiene fósforo, por ejemplo un fosfato. A este respecto, un polímero de siloxano adecuado para ser usado como un ingrediente activo para el cuidado oral comprende un fosfato y uno o más grupos alquilo, y es mencionado de manera amplia como un polímero de alquil fosfato siloxano. En ciertas realizaciones, los grupos alquilo son seleccionados para ser grupos metilo y el polímero de siloxano comprende un polidimetilsiloxano que tiene un grupo fosfato.

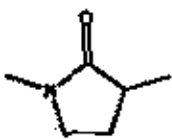
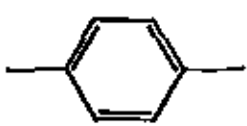
[0009] En ciertas realizaciones, el polímero de siloxano comprende un compuesto de acuerdo con la fórmula general nominal (I):



(I)

en donde R_1 es seleccionado del grupo consistente en: alquilo, arilo, amida, éster, pirrolidona, vinilo, acrilato, siloxano, uretano, carbonato, alcohol vinílico, óxido de alquileno y combinaciones de los mismos; y R_2 comprende una porción seleccionada del grupo consistente en: fosfato, fosfonato, fosfolípidos, un grupo que contiene fosfato y combinaciones de los mismos. En ciertas realizaciones, los grupos alquilo y/o arilo de R_1 varían desde $C_1 - C_{30}$, y en algunas realizaciones tiene grupos alquilo/arilo inferiores, por ejemplo que tienen $C_2 - C_{10}$, opcionalmente $C_2 - C_6$. En ciertas realizaciones, los óxidos de alquileno pueden variar desde $C_2 - C_4$, incluyendo así óxido de etileno, óxido de propileno y óxido de butileno, de los cuales se pueden proporcionar múltiples grupos. "x" varía de 0 a 100 y "y" de 1 a 100.

[0010] En ciertas realizaciones, R_1 comprende $-(CH_2)_v-(Q)_z$, en donde Q es por lo menos un grupo seleccionado de: un óxido de alquileno que tiene $C_2 - C_3$, tal como C_2H_2O o C_3H_4O ; $CH_2CH(OH)$;

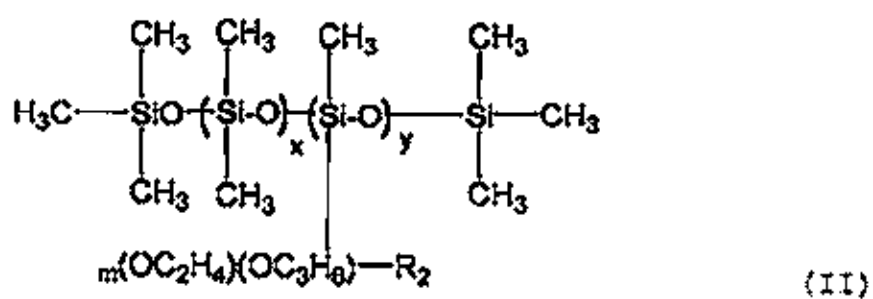
CONH, CO_2 , NH, CONH,  y , en donde v y z son respectivamente 1 a 16. Por ejemplo, R_2 puede ser seleccionado de PO_3H_2 , PO_3K_2 , PO_3Na_2 , PO_3Li_2 y $PO_3(NH_4)_2$, de fosfolípidos, tales como fosfatidil colina, ácido fosfatídico, fosfatidil inositol, fosfatidil etanolamina y similares.

142

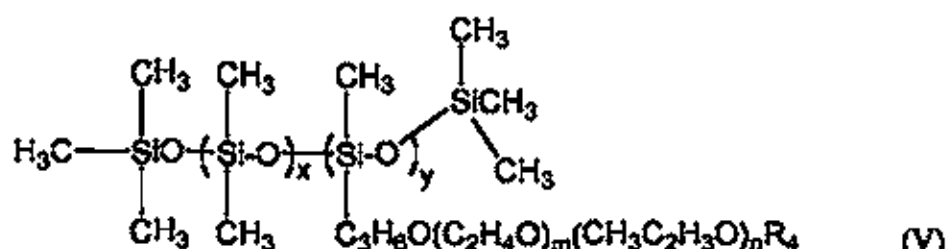
[0011] Unos polimeros de siloxano adecuados son divulgados en las Patentes de Estados Unidos Nos. 5.530.084 de Ihara y col.; 5.070.171 y 6.175.028 ambas de O'Lenick; 6.124.490 de Gormley y col.; 6.225.489, 5.849.313 y 5.688.496 todas de Fost y col.; y 5.859.161 de Imperante y col.

[0012] En algunas realizaciones, el polimero de siloxano que tiene una porción que contiene fosfato comprende un fosfato de copoliol de dimeticona del tipo divulgado en la Patente de Estados Unidos N° 5.070.171. Tales polimeros de siloxano tienen un grupo funcional de fosfato colgante y son preparados haciendo reaccionar una silicona que contiene hidroxilo con un reactivo de fosfatación.

[0013] En ciertas realizaciones, el polimero de siloxano que comprende una porción de fosfato es un compuesto que tiene la fórmula (II):



en donde R_2 es un grupo fosfato colgante, tal como $-\text{PO}_3\text{H}_2$ o $-(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{H}_3\text{O})_n\text{PO}_3\text{H}_2$, "x" es 0 a 100, "y" es 1 a 100, "m" es 0 a 15. En otras realizaciones, el polimero de siloxano comprende por lo menos un fosfato y por lo menos un grupo amina. Un ejemplo de un compuesto adecuado de tal polimero de siloxano que comprende un fosfolípido como la porción que contiene fósforo tiene la fórmula (III):



en donde en donde R_4 es seleccionado de H o $-\text{PO}_3\text{H}_2$, "x" es 0 a 100, "y" es 1 a 100, "m" es 0 a 15 y "n" es 0 a 15. Por ejemplo, un polímero de siloxano que tiene R_4 seleccionado para ser H está disponible en el comercio como DC-190 y puede ser obtenido de Dow-Corning Company, Midland, Michigan, Estados Unidos de América. Otros polímeros de siloxano adecuados que tienen regiones hidrófilas están disponibles en el comercio bajo las denominaciones comerciales DC-193 (copolímero de polietileno metilpolisiloxano o PEG-12 dimeticona) y DC-5103 (surfactantes de poliéter siloxilados con óxido de etileno y/o óxido de propileno) de Dow-Corning Company, Midland, Michigan, Estados Unidos de América.

[0018] En varias realizaciones, se cree que los polímeros de siloxano que comprenden por lo menos una región hidrófila funcionan como un agente anti-unión o anti-adhesión. Aunque no es limitante con respecto a la presente invención, se cree en general que los ingredientes activos anti-unión para el cuidado oral operan mediante uno cualquiera (o ambos) de dos mecanismos anti-unión predominantes. Las biopelículas (también mencionadas como película) son una matriz formada sobre una superficie oral, típicamente una superficie de tejido duro, que comprenden bacterias (generalmente aproximadamente 60-70% de la biomatriz), subproductos extracelulares bacterianos, proteínas, lípidos y

glicolípidos. La frase "superficie oral" abarca los tejidos duros y blandos dentro de la cavidad oral. Los tejidos duros incluyen los dientes, el soporte periodontal y similares. Las composiciones orales de las varias realizaciones pueden ser usadas en un sujeto mamífero, lo cual incluye a los seres humanos y otros animales vertebrados superiores de sangre caliente, tales como felinos y caninos.

[0019] Sin estar limitados por la teoría, se cree que las etapas tempranas de la formación de la biopelícula incluyen una capa inicial de bacterias que se une a una superficie oral, que se piensa en general que está unida por ligandos o adhesinas sobre la pared celular bacteriana que interactúa con los receptores sobre una superficie oral. Se cree que las células bacterianas se unen a las glicoproteínas salivales sobre la superficie oral, por ejemplo el esmalte. Las bacterias parecen formar una unión más fuerte generando polímeros de glucano extracelulares para adherirse a la superficie oral. Entonces las bacterias crecen y se dividen para formar una capa densa sobre la superficie oral. Después de que se llega a una densidad específica, se cree que las bacterias se reorganizan y comienzan a formar pilares y estructuras superficiales irregulares. Adicionalmente, se cree que la matriz de biopelícula tiene una asociación compleja de especies diversas y de capas múltiples que forman grupos celulares unidos a la bacteria de anclaje de la primera capa.

[0020] Sin estar limitados por alguna teoría en particular, se cree que un mecanismo mediante el cual operan los agentes anti-unión para el cuidado oral es cuando el agente anti-unión interactúa con la bacteria propiamente dicha para inhabilitar su

unión a la superficie oral, probablemente interactuando con las adhesinas, los ligandos u otras porciones sobre la superficie de la bacteria que ordinariamente facilitarían un enlace con un receptor u otra porción sobre la superficie oral.

[0021] Otro mecanismo anti-unión es uno en el cual los agentes interactúan con una superficie oral para formar una capa protectora, de tal modo que las bacterias y los componentes de la biopelícula no puedan adherirse a la superficie oral o dental, previniendo de ese modo que una capa de anclaje inicial se forme sobre la superficie oral. Tal agente anti-unión puede cubrir sustancialmente una superficie oral, y prevenir la unión de las bacterias u otros componentes de la matriz de biopelícula. Aunque no es limitante en cuanto a cualquier mecanismo particular por el cual la invención opera, se cree que los agentes activos de polímero de siloxano de las varias realizaciones de la descripción operan por medio de un mecanismo de ese tipo, recubriendo una superficie dental, alterando su energía superficial e inhibiendo la unión bacteriana.

[0022] Así, aunque no se desea tener la limitación de algún mecanismo particular, se cree que las composiciones para el cuidado oral que comprenden un siloxano que tiene una región hidrófila como un ingrediente activo, por ejemplo una porción que contiene fósforo, funcionan por medio de un mecanismo anti-unión que inhibe sustancialmente la unión bacteriana a una superficie dental. Por "inhibe sustancialmente" se quiere decir que la generación o proliferación de la biopelícula es impedida; sin embargo la extensión hasta la cual ocurre la inhibición depende de la concentración y distribución de los ingredientes activos

suministrados *in vivo* a la superficie oral, así como la cantidad de biopelícula presente antes del tratamiento con el ingrediente activo. Parece que ciertos polímeros de siloxano que tienen regiones hidrófilas alteran la energía superficial de los tejidos duros, tales como el esmalte (reduciendo la energía superficial) y, a su vez, previenen o reducen la adherencia y unión de microorganismos que pueden formar una biopelícula de placa sobre la superficie dental. Los polímeros de siloxano preferidos tienen sustantividad sobre la superficie dental, de modo que permanecen unidos por un período de tiempo suficiente para prevenir o reducir de manera efectiva el crecimiento de los microorganismos y/o la adherencia a la superficie dental, previniendo o reduciendo de ese modo la formación de biopelícula.

[0023] En algunas realizaciones, una composición oral comprende un ingrediente activo anti-placa y/o anti-sarro que es un polímero de siloxano que comprende por lo menos una región hidrófila que se cree que es un agente anti-unión que impide sustancialmente que las bacterias formen una biopelícula sobre una superficie dental. La región hidrófila comprende una porción seleccionada del grupo consistente en: óxidos de alquileo, fosfatos, fosfonatos, fosfolípidos, aminas y combinaciones de los mismos. Tales polímeros de siloxano incluyen aquéllos descritos anteriormente, entre otros. La eficacia del polímero de siloxano suministrado en una composición oral es suficiente de tal modo que no haya necesidad de un agente antibacteriano adicional. Por ejemplo, en ciertas realizaciones, la composición oral está sustancialmente libre de ingredientes activos lipófilos, tales como difenil éteres halogenados, eucaliptol, timol, mentol y similares. A este

respecto, las composiciones tienen una eficacia antiplaca elevada, requiriendo al mismo tiempo menor cantidad de ingredientes activos, los cuales pueden ser costosos y complejos de formular. Por "sustancialmente libre" se quiere decir que el componente o compuesto está ausente hasta el punto de que no puede ser detectado o aún es adecuado usar el producto para su propósito propuesto (en donde la ausencia de la característica o propiedad deseada es requerida). En ciertas realizaciones, sustancialmente libre significa que hay menos de aproximadamente 3% en peso de los ingredientes activos no iónicos o lipófilos, opcionalmente menos de aproximadamente 2%, opcionalmente menos de aproximadamente 1% y preferiblemente está enteramente libre del ingrediente activo. En ciertas realizaciones, la composición oral consiste esencialmente en un ingrediente activo anti-placa y/o anti-sarro que es un polímero de siloxano que comprende por lo menos una región hidrófila.

[0024] Tales composiciones orales pueden comprender opcionalmente otros ingredientes activos que son menos complejos de formular en una composición oral o proporcionan unos beneficios deseables particulares para el cuidado oral, por ejemplo compuestos anti-cálculo de polifosfato o agentes anticaries, como se discutirá con más detalle posteriormente. En ciertas realizaciones, la composición oral comprende un agente anti-placa o anti-sarro que consiste esencialmente en un polímero de siloxano que tiene por lo menos una región hidrófila.

[0025] En varias realizaciones, tal efecto anti-unión es obtenido a concentraciones relativamente bajas. Por ejemplo, la composición oral comprende un ingrediente activo que tiene un

polimero de siloxano que tiene una o más regiones hidrófilas que está presente en la composición oral a aproximadamente 0,001 hasta aproximadamente 3% en peso, de preferencia entre aproximadamente 0,5 y aproximadamente 2,5% en peso. En ciertas realizaciones, la composición oral comprende un polimero de siloxano que tiene una o más regiones hidrófilas a aproximadamente 1% en peso.

[0026] De acuerdo con varias realizaciones, la aplicación de composiciones orales que tienen un ingrediente activo que comprende un polimero de siloxano con una región hidrófila, como se proporciona en las varias realizaciones de la presente divulgación, promueve unos beneficios antiplaca más duraderos y más efectivos a unas concentraciones menores en comparación con muchos otros ingredientes antimicrobianos que son arrastrados en la cavidad oral acuosa. Tal reducción en la placa, a su vez, proporciona también un control del cálculo o sarro.

[0027] En varias realizaciones, una composición antiplaca y anti-cálculo altamente eficaz para el cuidado oral contiene los polímeros de siloxano que tienen una región hidrófila como el único ingrediente antiplaca/antibacteriano. Sin embargo, en ciertas realizaciones, uno o más ingredientes activos adicionales pueden ser incluidos en las composiciones para el cuidado oral. Cualesquiera agentes activos adicionales para ser usados con el polimero de siloxano deben ser cuidadosamente seleccionados. Si son añadidos, los ingredientes activos adicionales no deben reaccionar con los agentes de polimero de siloxano o perjudicar la eficacia y biodisponibilidad de estos últimos.

[0028] Unos ejemplos no limitativos de ingredientes activos para el cuidado oral, para las composiciones orales, incluyen, por

ejemplo, agentes para blanquear los dientes, agentes antimicrobianos, agentes anticaries, agentes anti-sarro, agentes antiplaca, agentes anti-adhesión, agentes desensibilizadores, agentes anti-inflamatorios, agentes para el control del mal olor, agentes de provisión de sabor, agentes colorantes, agentes anti-envejecimiento, estimulantes salivales, agentes activos periodontales, agentes acondicionadores, agentes de provisión de humedad, incluyendo emolientes, reactivos oclusivos y humectantes, extractos naturales y aceites esenciales, nutrientes, enzimas, proteínas, aminoácidos, vitaminas, analgésicos, antibióticos y mezclas de los mismos. Unos ejemplos de agentes activos para el cuidado oral entre aquéllos útiles en la presente son descritos en las Patentes de Estados Unidos Nos. 4.894.220 de Nabi y col., 5.288.480 y 5.776.435, ambas de Gaffar y col., 5.681.548 de Esposito y col., 5.912.274 y 5.723.500 ambas de Stringer y col., 6.290.933 de Durga y col. y 6.685.921 de Lawlor, así como en la Publicación de Solicitud de Patente de Estados Unidos N° 2003/0206874 de Doyle y col. Adicionalmente, una amplia variedad de ingredientes activos adecuados para composiciones para el cuidado oral y personal son enumeradas en Gottschalk y col. eds., Manual y Diccionario Internacional de Ingredientes Cosméticos, Décima Edición, Volumen 3 (2004). Tales ingredientes activos son muy conocidos por aquéllos versados en el arte.

[0029] Unas mezclas de ingredientes activos para el cuidado oral adicionales, incluyendo dentro de la misma clasificación, son contemplados por la presente descripción. En varias realizaciones, los ingredientes activos adicionales comprenden desde aproximadamente 0,0001% hasta aproximadamente 10%,

52

preferiblemente desde aproximadamente 0,001% hasta aproximadamente 5%, de preferencia desde aproximadamente 0,01% hasta aproximadamente 3% en peso de la composición oral, dependiendo de la concentración de los compuestos activos y la forma de la composición oral.

[0030] En varias realizaciones, se prefiere que los ingredientes activos adicionales sean no lipófilos o no iónicos. Sin embargo, para ciertas realizaciones, un agente antibacteriano no iónico es opcionalmente incluido en las composiciones orales, y puede incluir compuestos fenólicos y/o bisfenólicos, tales como difenil éteres halogenados, incluyendo triclosan (2,4,4'-tricloro-2'-hidroxidifeniléter), triclocarban (3,4,4-triclorocarbanilida), 2-fenoxietanol, ésteres de benzoato, carbanilidas, fenoles, timol, eugenol, hexil resorcinol y 2,2'-metilenobis(4-cloro-6-bromofenol).

[0031] El ingrediente activo también puede comprender opcionalmente un ingrediente activo catiónico. En ciertas realizaciones, el polímero de siloxano comprende un grupo o porción aniónico y es conveniente evitar los ingredientes activos fuertemente catiónicos, debido a que tales compuestos aniónicos pueden unirse al ingrediente activo catiónico reduciendo potencialmente su biodisponibilidad. En tales realizaciones, la composición oral que contiene un polímero de siloxano aniónico, tal como un polímero de siloxano aniónico que tiene una porción que contiene fósforo pendiente, está sustancialmente libre de ingredientes activos catiónicos.

[0032] Sin embargo, en otras realizaciones, unos ingredientes activos catiónicos pueden ser adecuados para ser usados en las

53

composiciones orales, particularmente cuando el polímero de siloxano es sólo suavemente aniónico o el ingrediente activo catiónico es sólo ligeramente catiónico. En varias realizaciones, unos ingredientes activos catiónicos adecuados incluyen, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario, tales como cloruro de benzalconio y cloruro de bencetonio; compuestos de piridinio e isoquinolinio, incluyendo cloruro de hexadecilpiridinio; derivados de pirimidina tales como hexetidina; derivados de amidina tales como isetionato de hexamidina; derivados de bispiridina tales como octenidina. Otros ingredientes activos catiónicos incluyen guanidas, tales como bis-guanidas, incluyendo clorhexidina y alexidina. Otros ingredientes activos opcionales que son compuestos catiónicos incluyen ésteres y sales de alquilo de N^o-acil aminoácido, incluyendo hidrocloreuro de éster de etil lauroil arginina (ELAH por sus siglas en inglés).

[0033] En algunas realizaciones, el ingrediente activo adicional comprende un ingrediente activo para el cuidado oral que es un agente de disolución de biopelícula. Un agente de disolución de biopelícula es generalmente un compuesto que previene la formación de una biopelícula y/o ataca una biopelícula (o película) ya formada sobre una superficie oral, e incluye enzimas que pueden hidrolizar proteínas, almidón y lípidos, que forman parte de una matriz de biopelícula. En ciertas realizaciones, tales ingredientes activos son enzimas, incluyendo, a modo de ejemplo, enzimas de proteasa, tales como cisteína proteasas o serina proteasas. Unos ejemplos son seleccionados más convenientemente del grupo consistente en: papaina (por ejemplo aislada del látex de la fruta verde y las hojas de *Carica papaya*), ficina (por

54

ejemplo aislada del látex de árboles de higo tropical *Ficus glabrata*), krillasa (por ejemplo aislada del krill de la Antártica), otras cisteína y serina proteasas, glucoamilasa, dextranasa, mutanasa, lisozima, lipasa de planta, lipasa gástrica, lipasa pancreática, tanasa, bromelaina, quimotripsina, alcalasa, amilases, lactoferrina, gingipainas, glucosa oxidasa, elastasas y/o celulasas pectinasa, y mezclas de las mismas. Otros ejemplos de agentes de disolución de biopelícula para la cavidad oral incluyen histatina sintética, furanona, derivados de furanona y mezclas de cualesquiera de los anteriores.

[0034] Otros ingredientes activos orales útiles incluyen fuentes de ion fluoruro, preferiblemente presentes en una cantidad suficiente para suministrar aproximadamente 25 ppm hasta aproximadamente 5.000 ppm de iones fluoruro, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluorosilicato de sodio, fluorosilicato de amonio, monofluorofosfato (MFP por sus siglas en inglés) de sodio y fluoruros de amina, incluyendo olaflur (N'-octadeciltrimetilenodiamina-N,N,N'-tris(2-etanol)-dihidrofluoruro). Los ingredientes activos también pueden incluir fuentes de ion estañoso y/o zinc. Unas fuentes de ion estañoso adecuadas incluyen, sin limitación, fluoruro estañoso, otros haluros estañosos tales como dihidrato de cloruro estañoso, pirofosfato estañoso, sales de carboxilato estañoso orgánico tales como formato, acetato, gluconato, lactato, tartrato, oxalato, malonato y citrato estañoso, glióxido de etileno estañoso y similares. Unas fuentes de ion zinc, tales como acetato de zinc, cloruro de zinc, citrato de zinc, gluconato de zinc, glicinato de zinc, óxido de zinc, sulfato de zinc, citrato de zinc y sodio y

55

similares son también adecuadas para ser usadas en las composiciones orales.

[0035] Ciertos tipos de ingredientes activos anti-cálculo útiles son las sales de polifosfato lineales molecularmente deshidratadas. Las sales de polifosfato son generalmente empleadas en forma de su sal de metal alcalino soluble en agua, neutralizada total o parcialmente (por ejemplo, sales de potasio, sodio o amonio, y cualesquiera mezclas de las mismas). Así, los compuestos de polifosfato lineales molecularmente deshidratados útiles como agentes anti-cálculo incluyen aquéllos tales como tripolifosfato de sodio, pirofosfato hexametafosfato de sodio, sales de pirofosfato de di- o tetra-metal alcalino tales como $\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$, $\text{K}_4\text{P}_2\text{O}_7$, $\text{Na}_2\text{K}_2\text{P}_2\text{O}_7$, $\text{Na}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$ y $\text{K}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$ y fosfatos cíclicos tales como tripolifosfato de sodio, trimetafosfato de sodio, o mezclas de los mismos. En varias realizaciones, tales ingredientes activos están presentes en concentraciones desde aproximadamente 0,001 hasta aproximadamente 10%, de preferencia entre aproximadamente 1 y aproximadamente 5% de la composición. Los polifosfatos también pueden ser usados, por ejemplo, como ingredientes activos en composiciones de limpieza y cuidado del hogar, como se discutirá con más detalles posteriormente.

[0036] Los policarboxilatos lineales aniónicos sintéticos son también muy conocidos como agentes mejoradores de la eficacia para ciertos ingredientes activos, en particular para mejorar la eficacia de los ingredientes para el cuidado oral, incluyendo agentes antibacterianos, anti-sarro u otros agentes activos dentro de la composición. Adicionalmente, tales compuestos también pueden ser usados para formar películas, como se describe más

adelante. Tales policarboxilatos aniónicos son generalmente empleados en forma de sus ácidos libres, o sales de amonio o metal alcalino (por ejemplo potasio y preferiblemente sodio) solubles en agua, preferiblemente neutralizadas parcialmente o de preferencia neutralizadas totalmente. Los copolímeros preferidos son copolímeros 1:4 a 4:1 de anhídrido o ácido maleico con otro monómero polimerizable etilénicamente insaturado, preferiblemente metil vinil éter (metoxietileno) que tiene un peso molecular (PM) de aproximadamente 30.000 hasta aproximadamente 5.000.000. Un copolímero preferible es metil vinil éter/anhídrido maleico. Unos ejemplos de estos copolímeros pueden ser obtenidos de ISP Corporation, Wayne, New Jersey, Estados Unidos de América, bajo la denominación comercial GANTREZ®, por ejemplo AN 139 (PM 1.100.000), AN 119 (PM 200.000), S-97 Grado Farmacéutico (PM 1.500.000), AN 169 (PM 2.000.000) y AN 179 (PM 2.400.000), en donde el copolímero preferido es S-97 Grado Farmacéutico (PM 1.500.000). En varias realizaciones en las cuales un policarboxilato aniónico sintético es incluido en la composición, está preferiblemente presente en desde aproximadamente 0,001% hasta aproximadamente 5% en peso.

[0037] Los agentes de estimulación de saliva son otros ingredientes activos convencionales e incluyen ácidos alimenticios tales como ácido cítrico, láctico, maleico, succínico, ascórbico, adípico, fumárico y tartárico, y mezclas de los mismos. Los antagonistas de receptor de histamina H_2 son otros ingredientes activos útiles. Los antagonistas de H_2 útiles en la presente incluyen cimetidina, etintidina, ranitidina, ICIA-5165, tiotidina, ORF-17578, lupititidina, donetidina, famotidina, roxatidina,

57

pifatidina, lamtidina, BL-6548, BMY-25271, zaltidina, nizatidina, mifentidina, BMY-52368, SKF-94482, BL-6341A, ICI-162846, ramixotidina, Wy-45727, SR-58042, BMY-25405, loxtidina, DA-4634, bisfentidina, sufotidina, ebrotidina, HE-30-256, D-16637, FRG-8813, FRG-8701, impromidina, L-643728, HB-408.4 y mezclas de los mismos. Unos agentes desensibilizadores útiles en la presente incluyen citrato de potasio, cloruro de potasio, tartrato de potasio, bicarbonato de potasio, oxalato de potasio, nitrato de potasio, sales de estroncio y mezclas de los mismos.

[0038] Las composiciones orales de la presente invención pueden opcionalmente comprender otros agentes de disolución de placa/anti-placa además de aquéllos expuestos anteriormente, incluyendo, sin limitación: fuentes de iones cobre, magnesio y estroncio, típicamente provistos en forma de sal; copolióles de dimeticona, tales como copoliol de cetil dimeticona; urea; lactato de calcio; glicerofosfato de calcio; poliacrilatos de estroncio; y mezclas de los mismos.

[0039] En ciertas realizaciones, el ingrediente activo es un agente anti-inflamatorio. Ciertos compuestos anti-inflamatorios útiles incluyen flavonoides, flavanos, partenolidos, tales como partenolidos de sesquiterpeno lactona, androstenediol (AED) y deshidroepiandrosterona (DHEA). Otros agentes anti-inflamatorios útiles son los medicamentos anti-inflamatorios no esteroideos (NSAID por sus siglas en inglés). Unos ejemplos de NSAID útiles incluyen indometacina, flurbiprofeno, ketoprofeno, ibuprofeno, naproxeno, ácido meclofenámico y mezclas de los mismos. Otros agentes anti-inflamatorios adecuados, útiles como agentes activos para el cuidado oral, incluyen extracto de orégano (por ejemplo,

CS

extracto de *Origanum vulgare* (comúnmente conocido como "orégano", "orégano silvestre" o "mejorana silvestre")) como se describe en la Solicitud de Patente de Estados Unidos Serie N° 11/256.788 de Worrell y col., presentada el 24 de octubre de 2005, o extracto de magnolia, derivado de plantas en la familia *Magnoliaceae*, tales como *Magnolia officinalis* como se describe en la Solicitud de Patente de Estados Unidos Serie N° 11/285.809 de Gaffar y col., presentada el 23 de noviembre de 2005. Alternativamente, o además, un analgésico local o sistémico tal como aspirina, codeína, acetaminofén, salicilato de sodio o salicilato de trietanolamina puede ser usado.

[0040] Adicionalmente, un ingrediente activo anti-inflamatorio adecuado, seguro para composiciones para el cuidado oral, comprende una combinación de por lo menos un flavonoide y por lo menos un flavano, un ejemplo siendo UNIVESTIN®, que es elaborado y vendido por Unigen Pharmaceuticals, Inc., Superior, Colorado, Estados Unidos de América. Una descripción completa de UNIVESTIN® puede ser encontrada en la Publicación de Solicitud de Patente de Estados Unidos N° 2003/0216481 de Jia.

[0041] Unos ejemplos de antioxidantes útiles como ingredientes activos incluyen hidroxianisol butilado (BHA), hidroxitolueno butilado (BHT), vitamina A, carotenoides, tocoferoles (vitamina E), flavonoides, polifenoles, Ácido ascórbico (vitamina C), antioxidantes herbales, clorofila, melatonina, cloruro, calcio, óxido de calcio, cloruro de calcio, ubiquinona de disodio (coenzima Q₁₀), galato de etil hexilo, peróxido de hidrógeno (también útil como un agente blanqueador), yodo, licopeno, ascorbato de magnesio, sulfito de potasio, bisulfito de sodio,

ácido tioláctico y mezclas de los mismos. Estos ingredientes activos son también usados en composiciones limpiadoras y para el cuidado personal.

[0042] En ciertas realizaciones, las composiciones comprenden ingredientes activos que son antibióticos, tales como augmentina, amoxicilina, tetraciclina, doxiciclina, minociclina, metronidazol, neomicina, kanamicina y clindamicina y mezclas de las mismas.

[0043] Unos nutrientes adecuados incluyen vitaminas, minerales, aminoácidos y mezclas de los mismos. Las vitaminas incluyen Vitaminas C y D, tiamina, riboflavina, pantotenato de calcio, niacina, ácido fólico, nicotinamida, piridoxina, cianocobalamina, ácido para-aminobenzoico, bioflavonoides y mezclas de los mismos. Los suplementos nutricionales incluyen aminoácidos (tales como L-triptofano, L-lisina, metionina, treonina, levocarnitina y L-carnitina), lipotrópicos (tales como colina, inositol, betaina y ácido linoleico), aceite de pescado (incluyendo componentes de los mismos tales como ácidos grasos poli-insaturados de omega-3 (N-3), ácido eicosa-pentaenoico y ácido docosahexaenoico), y mezclas de los mismos.

[0044] Las composiciones orales son preferiblemente proporcionadas en un portador o vehículo oralmente aceptable. El portador puede ser una fase líquida, semisólida o sólida, en forma de un enjuague bucal, dentífrico (incluyendo pastas de dientes, polvos dentales y pastas profilácticas), confites (incluyendo pastillas y gomas), medicamento, película o cualquier otra forma conocida por aquéllos versados en el arte. La selección de los componentes portadores específicos depende de la forma deseada del producto.

[0045] A modo de ejemplo, las composiciones que comprenden el material activo de siloxano pueden ser proporcionadas en una composición para el cuidado oral, la cual puede tener la forma de un dentífrico, tal como pastas dentales, polvos dentales y pastas profilácticas, confites, incluyendo gomas, cuentas y caramelos masticables, películas, productos aplicables, formulaciones para pulido profesional o cualquier otra forma conocida por aquéllos versados en el arte.

[0046] En varias realizaciones, un portador de dentífrico oralmente aceptable usado para preparar una composición oral comprende una fase acuosa. Los ingredientes convencionales que pueden ser usados para formar los portadores indicados anteriormente son muy conocidos por el profesional experimentado. Tal como será reconocido por aquéllos versados en el arte, las composiciones orales incluyen opcionalmente otros materiales además de aquellos componentes descritos previamente, incluyendo, por ejemplo, agentes activos superficiales, tales como surfactantes, emulsores y moduladores de espuma, modificadores de viscosidad y agentes de espesamiento, humectantes, diluyentes, agentes modificadores de pH, emolientes, humectadores, agentes de sensación en la boca, agentes edulcorantes, agentes de sabor, colorantes, preservativos, solventes tales como agua y combinaciones de los mismos. Queda entendido que, aunque los atributos generales de cada una de las categorías anteriores de materiales pueden diferir, puede haber algunos atributos comunes y cualquier material puede servir para múltiples propósitos dentro de dos o más de tales categorías de materiales. Preferiblemente, tales materiales portadores son seleccionadas por compatibilidad y

estabilidad con todos los constituyentes del ingrediente activo incluyendo el polímero de siloxano y cualquier compuesto activo adicional seleccionado para la composición oral.

[0047] Unos agentes activos superficiales útiles típicos son descritos en las referencias de patente mencionadas y discutidas anteriormente, incluyendo en la Patente de Estados Unidos N° 4.894.220 y en la Solicitud de Patente de Estados Unidos N° 11/256.788 de Morrell. Los agentes activos superficiales son generalmente un aspecto importante de la composición oral, ya que pueden funcionar como surfactantes, emulsores, moduladores de espuma y/o agentes de dispersión de ingredientes activos. Por ejemplo, en realizaciones en las cuales la composición oral tiene un ingrediente activo que comprende un ingrediente activo aniónico, se prefiere que el portador comprenda unos surfactantes que no sea fuertemente catiónicos, ya que tales compuestos aniónicos pueden unirse al ingrediente activo catiónico reduciendo potencialmente su biodisponibilidad. Dependiendo de la composición química del polímero de siloxano (por ejemplo, la identidad de los grupos R_1 y R_2 identificados en la Fórmula I anterior), el polímero de siloxano puede tener porciones o características aniónicas. Así, cuando el polímero de siloxano tiene un carácter aniónico en ciertas realizaciones, se prefiere que el portador esté sustancialmente libre de surfactantes no compatibles, tales como surfactantes fuertemente catiónicos.

[0048] Generalmente, unos agentes activos superficiales adecuados para portadores orales son aquéllos que son razonablemente estables y forman espuma en un amplio intervalo de pH. Estos compuestos son muy conocidos en el arte, e incluyen detergentes

sintéticos orgánicos diferentes al jabón, aniónicos (por ejemplo lauril sulfato de sodio (SLS por sus siglas en inglés), N-miristoil y N-palmitoil sarcosina), no iónicos (por ejemplo Polisorbato 20 (monolaurato de polioxietileno 20 sorbitan, TWEEN® 20) y Polisorbato 80 (mono-oleato de polioxietileno 20 sorbitan, TWEEN® 80), Poloxamer 407, que puede ser obtenido bajo la denominación comercial PLURONIC® F127 de BASF Corporation, Florham Park, New Jersey, Estados Unidos de América), catiónicos, zwitteriónicos (por ejemplo, cocoamidopropil betaina y lauramido propil betaina) y anfotéricos. En realizaciones en las cuales el ingrediente activo comprende un compuesto aniónico, el agente activo superficial es preferiblemente seleccionado del grupo consistente en: surfactantes no iónicos, surfactantes aniónicos, surfactantes anfotéricos y mezclas de los mismos. En ciertas realizaciones, uno o más agentes activos superficiales están presentes en la composición oral en el intervalo desde aproximadamente 0,001% hasta aproximadamente 5%, preferiblemente desde aproximadamente 0,5% hasta aproximadamente 2,5%.

[0049] Cualquier material de provisión de sabor o edulcorante adecuado puede ser también empleado. Unos ejemplos de constituyentes de provisión de sabor adecuados son los aceites de provisión de sabor, por ejemplo aceite de menta verde, menta, gaulteria, sasafrás, clavo de olor, salvia, eucalipto, mejorana, canela, limón, lima, naranja, toronja y salicilato de metilo. También son útiles los productos químicos tales como mentol, carvone y anetol. Unos agentes edulcorantes adecuados incluyen sucrosa, lactosa, maltosa, sorbitol, xilitol, ciclamato de sodio, perillartina, AMP (éster de metilo de aspartil fenil alanina),

sacarina y similares. Tal como se discutió anteriormente, en ciertas realizaciones, las composiciones orales están sustancialmente libres de agentes lipófilos, tales como agentes lipófilos de provisión de sabor. Sin embargo, en ciertas realizaciones, los agentes de provisión de sabor y edulcorantes pueden ser incorporados, individual o conjuntamente, a la composición oral a una concentración de aproximadamente 0,05 hasta aproximadamente 5% y preferiblemente aproximadamente 0,5 hasta aproximadamente 1,5%.

[0050] En las realizaciones en las cuales la composición oral tiene la forma de un enjuague bucal, un ejemplo de portador es sustancialmente líquido. La frase "enjuague bucal" incluye lavados bucales, atomizadores, enjuagues y similares. En tal preparación, el portador oralmente aceptable tiene típicamente una fase acuosa que comprende agua o una mezcla de agua y alcohol. Adicionalmente, en varias realizaciones, el portador oral tiene típicamente un humectante, un surfactante y un agente amortiguador del pH.

[0051] En realizaciones en las cuales la composición oral tiene la forma de un confite, un ejemplo de portador es sustancialmente sólido o semisólido. Los portadores de confites son muy conocidos en el arte. Para una pastilla, el portador comprende típicamente un material de base de pastilla (comprendiendo, por ejemplo, un poliol no cariogénico y/o un derivado de almidón/azúcar), un emulsor, un lubricante, un agente de provisión de sabor, un espesador y, opcionalmente, un material de recubrimiento). Los portadores de goma de mascar tienen generalmente una base de goma

de mascar, uno o más agentes plastificantes, un agente edulcorante y un agente de provisión de sabor.

[0052] En realizaciones en las cuales la composición oral tiene la forma de una película, un ejemplo de portador es sustancialmente sólido o semisólido. Generalmente, tales portadores de película comprenden un agente formador de película soluble o dispersable en agua, tal como un polímero hidrófilo. Opcionalmente, el portador de película puede también comprender polímeros hidrófobos formadores de película, ya sea como una capa de respaldo quitable, o mezclados con un polímero formador de película hidrófilo. Los portadores de película comprenden opcionalmente plastificantes, agentes activos superficiales, rellenos, agentes de volumen y agentes modificadores de viscosidad.

[0053] En realizaciones en las cuales una composición oral tiene la forma de un dentífrico, un ejemplo de portador es sustancialmente semisólido o un sólido. Los dentífricos contienen típicamente agentes activos superficiales, humectantes, agentes modificadores de viscosidad y/o espesadores, abrasivos, solventes tales como agua, agentes de provisión de sabor y agentes edulcorantes.

[0054] En varias realizaciones, una composición oral puede ser provista dentro de un solo componente o fase. En otras realizaciones, la composición oral incluye un primer componente y un segundo componente que son mantenidos separados. El mantenimiento de los componentes separados requiere solamente que los componentes sean mantenidos de manera tal a prevenir sustancialmente la interacción de un componente de la composición

65

oral con otro componente de la composición oral. Típicamente, una composición oral de dos componentes es empleada cuando hay uno o más ingredientes incompatibles incluidos en la composición oral. Por ejemplo, si el ingrediente activo comprende un ingrediente de polímero de siloxano que tiene una naturaleza aniónica, es ventajoso mantener separados los compuestos catiónicos de los componentes fuertemente aniónicos. La separación de componentes puede ser efectuada a través de cualquier medio conocido o a ser descubierto en el arte e incluye medios químicos, físicos y mecánicos de separación o cualquier combinación de los mismos. Por ejemplo, los componentes primero y segundo pueden ser combinados, pero ciertos componentes son mantenidos separados envolviendo o encapsulando uno o ambos en una película, recubrimiento, cápsula, micela y similares.

[0055] Así, cualquiera de las varias realizaciones de la composición para el cuidado oral descritas anteriormente son puestas en contacto con una superficie oral o aplicadas regularmente a la misma, preferiblemente por lo menos una vez al día, de preferencia en múltiples días en una semana, y de mayor preferencia en una base diaria a largo plazo.

[0056] Las composiciones orales pueden ser preparadas mezclando convenientemente los varios ingredientes. Por ejemplo, en la preparación de un enjuague bucal, el polímero de siloxano es dispersado en un solvente acuoso y/o alcohol y entonces añadido a una mezcla de humectantes, surfactantes y agua. El producto de enjuague resultante es entonces envasado.

[0057] Los dentífricos son típicamente preparados añadiendo varias sales (incluyendo sales de fluoruro, cuando son incluidas

en la composición) y edulcorantes (por ejemplo sacarina) y cualesquiera compuestos de ingredientes activos solubles en agua para el cuidado oral, al agua, en donde son mezclados. A otro recipiente, todos los humectantes, gomas y polímeros, incluyendo el ingrediente de polímero de siloxano, son añadidos conjuntamente. La mezcla a base de agua descrita anteriormente es añadida al recipiente con los humectantes, gomas y polímeros. Los ingredientes combinados son calentados opcionalmente hasta una temperatura superior a aproximadamente 40°C, por ejemplo desde aproximadamente 60°C hasta aproximadamente 70°C, para dispersar las gomas y los polímeros. La mezcla calentada es entonces enfriada hasta menos de aproximadamente 38°C (aproximadamente 100°F). La mezcla es entonces combinada con abrasivos, siendo mezclada a alta velocidad bajo vacío por aproximadamente 15 hasta aproximadamente 20 minutos. Cualquier aceite de sabor y cualesquiera ingredientes activos lipófilos para el cuidado oral son mezclados. Esta mezcla es mezclada con la mezcla basada en agua anterior, siendo mezcladas bajo alta velocidad y vacío hasta estar suficientemente dispersadas. Uno o más surfactantes son añadidos y la mezcla es nuevamente mezclada para dispersar. El polímero de siloxano puede ser opcionalmente añadido con los surfactantes, en vez de a la fase de polímero.

[0058] La composición oral puede ser incorporada a confites y tropos. Tales métodos para formar confites (por ejemplo goma) o tropos (por ejemplo pastillas) son muy conocidos por aquéllos versados en el arte, y pueden ser preparados agitando uno o más compuestos activos para el cuidado oral en una base de goma tibia o recubriendo la superficie externa de una base de goma (por

ejemplo jelutone, látex de caucho, resinas de vinilita, entre otros), convenientemente con plastificantes o suavizadores convencionales, azúcar u otros edulcorantes o carbohidratos tales como glucosa, sorbitol y similares. Preferiblemente, el polímero de siloxano es añadido a la base de goma.

[0059] Cuando la composición oral tiene la forma de una película, puede ser formada mediante cualquier número de procesos convencionales para la formación de películas, tales como procesos convencionales de extrusión o moldeado por solvente. Por ejemplo, para preparar una película mediante moldeado por solvente, un polímero formador de película es disuelto en una cantidad suficiente de un solvente que es compatible con el polímero. Después de que una solución ha sido formada, un plastificante puede ser añadido con agitación, y se puede aplicar calor, si es necesario, para ayudar en la disolución, hasta que una solución clara y homogénea ha sido formada, seguido por la adición de los ingredientes activos, incluyendo el polímero de siloxano, agentes activos superficiales, agentes de volumen y cualesquiera otros ingredientes tales como sabores y edulcorantes. Para facilidad de uso, la película seca puede ser cortada en pedazos de tamaño y forma adecuados y envasada en un recipiente adecuado.

[0060] Los siguientes ejemplos describen adicionalmente y demuestran varias realizaciones contempladas por la exposición.

Ejemplo 1

[0061] Tres composiciones orales son preparadas de acuerdo con varias realizaciones de la exposición, cada una conteniendo un polímero de siloxano distinto que tiene una porción hidrófila. Dos composiciones, designadas "Composición A" y "Composición B",

6A

contienen un polimero de siloxano que tiene porciones que contienen fósforo, a saber PECOSIL® WDS-200 y PECOSIL® PS-100, respectivamente. La "Composición C" contiene un polimero de siloxano que comprende una porción hidrófila que tiene óxido de polietileno y polipropileno, a saber DC-190. Cada uno de estos polimeros fue plenamente descrito anteriormente. Las Composiciones A, B y C son preparadas usando los ingredientes enumerados en la Tabla 1. Unos ingredientes activos adicionales incluidos en la composición son pirofosfato de tetrasodio (un ingrediente activo anti-cálculo) y fluoruro de sodio (un ingrediente activo anti-caries).

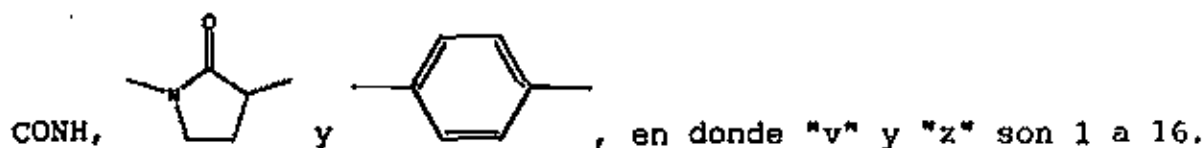
Tabla I

Fórmula de pasta dental con silicona (% en peso)			
Composición	A	B	C
Polietilenglicol	3,0	3,0	3,0
CMC de sodio	0,6	0,6	0,6
Pirofosfato de tetrasodio	0,5	0,5	0,5
Agua purificada	c.s.	c.s.	c.s.
Fluoruro de sodio	0,243	0,243	0,243
Sorbitol	53,9	53,9	53,9
Sacarina de sodio	0,3	0,3	0,3
ZEODENT® 115	25,5	25,5	25,5
Lauril sulfato de sodio	1,2	1,2	1,2
WDS-200	1,0	0	0
PS-100	0	1,00	0
DC-190	0	0	1,00
Azul #1 FD&C, solución al 1%	0,16	0,16	0,16
Sabor	0,72	0,72	0,72
TOTAL	100	100	100

[0062] Las composiciones de dentífricos que contienen los polímeros de siloxano que tienen por lo menos una región hidrófila tienen buena actividad anti-placa. Las composiciones orales son aplicadas a una o más superficies orales en la cavidad oral, y promueven una salud oral general, incluyendo inhibición de formación de placa, gingivitis, periodontitis, caries y similares. Por ejemplo, cuando una composición para el cuidado oral comprende un polímero de siloxano que tiene por lo menos una región hidrófila, la composición oral inhibe de manera efectiva la formación de placa y el crecimiento de varias bacterias orales sobre una superficie oral. En ciertas realizaciones, la composición oral proporciona adicionalmente por lo menos una actividad seleccionada de: actividad anti-sarro, anti-caries, disolución de biopelícula y/o anti-inflamatoria. Así, ciertas composiciones orales proporcionan múltiples beneficios de cuidado oral simultáneamente.

en donde R_1 es seleccionado del grupo consistente en: alquilo, arilo, amida, éster, pirrolidona, vinilo, acrilato, siloxano, uretano, carbonato, alcohol vinílico, óxido de alquileo y combinaciones de los mismos; y R_2 comprende una porción seleccionada del grupo consistente en: fosfato, fosfonato, fosfolípidos, un grupo que contiene fosfato y combinaciones de los mismos; "x" es 0 a 100 y "y" es 1 a 100.

4. Una composición de acuerdo con la reivindicación 3, en la cual R_1 tiene la fórmula: $-(CH_2)_v-(Q)_z$, en donde Q es por lo menos un grupo seleccionado de: C_2H_5O , C_3H_7O , $CH_2CH(OH)$, $CONH$, CO_2 , NH ,



5. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende aproximadamente 0.001 hasta aproximadamente 3% en peso del polímero de siloxano.

6. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde la composición comprende un ingrediente seleccionado del grupo consistente en: agentes activos superficiales, modificadores de viscosidad, espesadores, humectantes, diluyentes, rellenos, agentes modificadores de pH, plastificantes, ceras, modificadores de textura, agentes de provisión de sabor, agentes edulcorantes, agentes colorantes, preservativos, solventes y mezclas de los mismos.

7. Una composición de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende adicionalmente un ingrediente activo seleccionado del grupo consistente en un agente antimicrobiano, un agente anti-sarro, un agente anti-placa, un agente anti-caríes, un agente de

disolución de biopelícula, un antioxidante, un agente anti-inflamatorio, un agente para blanquear los dientes, un agente anti-adhesión, un agente desensibilizador, un agente para el control del mal olor, un agente de provisión de sabor, un agente colorante, un agente anti-envejecimiento, un estimulador salival, un ingrediente activo periodontal, un agente acondicionador, un extracto natural, un aceite esencial, un nutriente, una enzima, una proteína, un aminoácido, una vitamina, un analgésico y mezclas de los mismos.

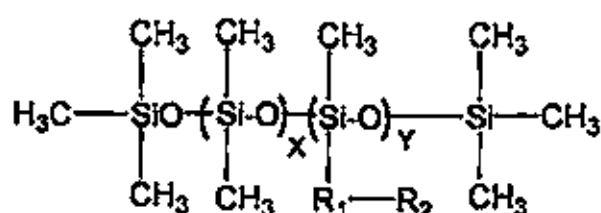
8. Una composición para el cuidado oral que comprende un polímero de siloxano que tiene una porción que contiene fósforo, en donde el polímero de siloxano es un agente anti-unión que inhibe sustancialmente que las bacterias formen una biopelícula sobre una superficie dental.

9. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 8, en la cual la porción que contiene fósforo es seleccionada del grupo consistente en: fosfato, fosfonato, fosfolípidos, un grupo que contiene fosfato y combinaciones de los mismos.

10. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 9, en la cual el polímero de siloxano comprende un alquil fosfato siloxano.

11. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 9, en la cual el polímero de siloxano comprende un fosfato de polidimetilsiloxano.

12. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 8, en la cual el polímero de siloxano comprende un compuesto que tiene la fórmula:

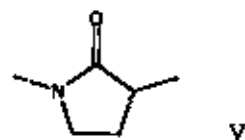


en donde R_1 es seleccionado del grupo consistente en: alquilo, arilo, amida, éster, pirrolidona, vinilo, acrilato, siloxano, uretano, carbonato, alcohol vinílico, óxido de alquileo y combinaciones de los mismos; y R_2 comprende una porción seleccionada del grupo consistente en: fosfato, fosfonato, fosfolípidos, un grupo que contiene fosfato y combinaciones de los mismos; "x" es 0 a 100 y "y" es 1 a 100.

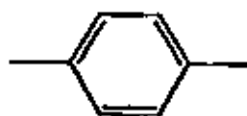
13. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 12, en la cual R_1 tiene la fórmula:

$-(\text{CH}_2)_v-(\text{Q})_z$, en donde Q es por lo menos un grupo seleccionado de:

$\text{C}_2\text{H}_2\text{O}$, $\text{C}_3\text{H}_6\text{O}$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})$, CONH , CO_2 , NH , CONH ,

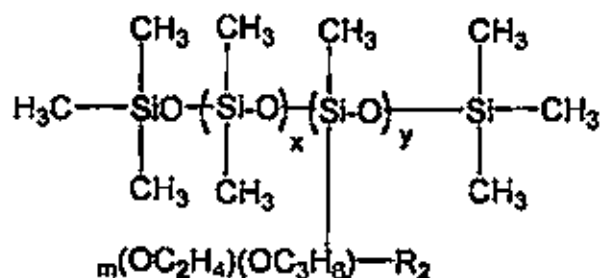


y



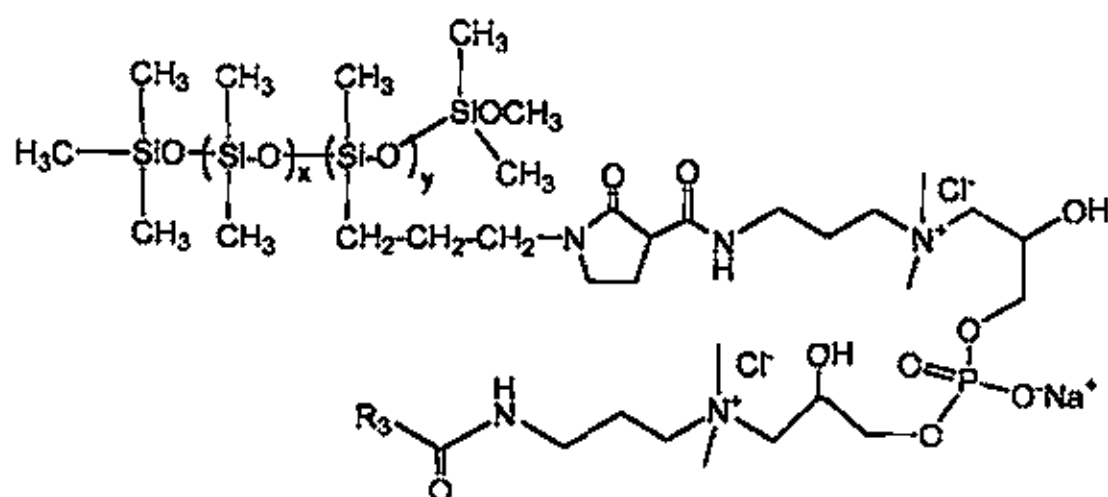
, en donde "v" y "z" son 1 a 16.

14. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 8, en la cual el polímero de siloxano comprende un compuesto que tiene la fórmula:



en donde R_2 es $-\text{PO}_3\text{H}_2$ o $-(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{H}_3\text{O})_n\text{PO}_3\text{H}_2$, "x" es 0 a 100, "y" es 1 a 100 y "m" es 0 a 15.

15. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 8, en la cual el polímero de siloxano comprende un compuesto que tiene la fórmula:



en donde R_1 es un grupo alquilo, "x" es 0 a 100 y "y" es 1 a 100.

16. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 15, en la cual R_1 es un grupo alquilo C_{16} .

17. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 8, que comprende aproximadamente 0,001 hasta aproximadamente 3% en peso del polímero de siloxano.

18. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 8, que comprende adicionalmente un ingrediente activo seleccionado del grupo consistente en un agente antimicrobiano, un agente anti-sarro, un agente anti-placa, un agente anti-caríes, un agente de disolución de biopelícula, un antioxidante, un agente anti-inflamatorio, un agente para blanquear los dientes, un agente anti-adhesión, un agente desensibilizador, un agente para el control del mal olor, un agente de provisión de sabor, un agente colorante, un agente anti-

75

envejecimiento, un estimulador salival, un ingrediente activo periodontal, un agente acondicionador, un extracto natural, un aceite esencial, un nutriente, una enzima, una proteína, un aminoácido, una vitamina, un analgésico y mezclas de los mismos.

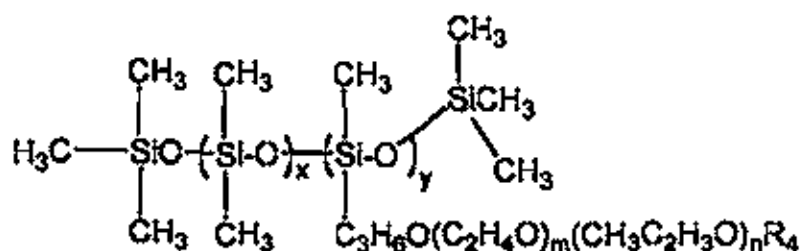
19. Una composición para el cuidado oral de acuerdo con la reivindicación 8, que comprende adicionalmente un ingrediente portador seleccionado del grupo consistente en agentes activos superficiales, modificadores de viscosidad, espesadores, humectantes, diluyentes, rellenos, agentes modificadores de pH, emolientes, humidificadores, agentes de sensación en la boca, agentes edulcorantes, agentes de provisión de sabor, solventes, agua, colorantes, preservativos y mezclas de los mismos.

20. Una composición para el cuidado oral que comprende un ingrediente activo anti-placa y/o anti-sarro que comprende un polímero de siloxano que tiene por lo menos una región hidrófila, en donde el polímero de siloxano es un agente anti-unión que inhibe sustancialmente que las bacterias formen una biopelícula sobre una superficie dental, y en donde la composición está sustancialmente libre de ingredientes activos lipófilos.

21. Una composición oral de acuerdo con la reivindicación 20, en la cual la región hidrófila comprende una porción seleccionada del grupo consistente en: óxidos de alquileo, fosfatos, fosfonatos, fosfolípidos, aminas y combinaciones de los mismos.

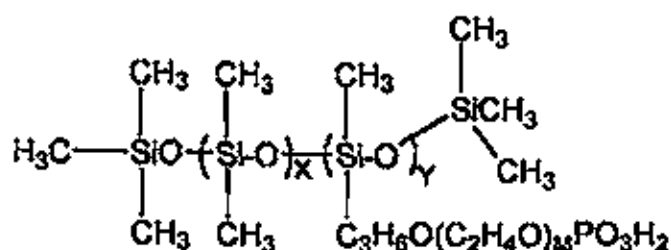
22. Una composición oral de acuerdo con la reivindicación 20, en la cual el polímero de siloxano comprende un compuesto que tiene la fórmula:

76



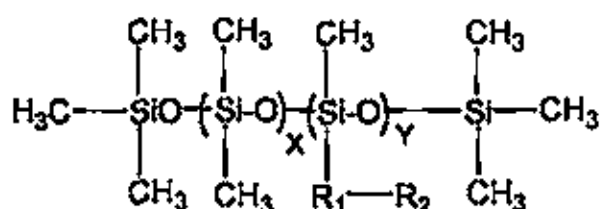
en donde R_4 es seleccionado de H o $-\text{PO}_3\text{H}_2$, "x" es 0 a 100, "y" es 1 a 100, "m" es 0 a 15 y "n" es 0 a 15.

23. Una composición oral de acuerdo con la reivindicación 20, en la cual el polímero de siloxano comprende un compuesto que tiene la fórmula:



en donde "x" es 0 a 100, "y" es 1 a 100 y "m" es 0 a 15.

24. Una composición oral de acuerdo con la reivindicación 20, en la cual el polímero de siloxano comprende un compuesto que tiene la fórmula:



en donde R_1 es seleccionado del grupo consistente en: alquilo, arilo, amida, éster, pirrolidona, vinilo, acrilato, siloxano, uretano, carbonato, alcohol vinílico, óxido de alquileo y combinaciones de los mismos; y R_2 comprende una porción seleccionada del grupo consistente en: fosfato, fosfonato, fosfolípidos, un grupo que contiene fosfato y combinaciones de los mismos, "x" es 0 a 100 y "y" es 1 a 100.

2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO				
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES				
PATENTE	☐	PCT/US2007/067495	MODELO DE UTILIDAD ☐	DISEÑO INDUSTRIAL ☐
SOLICITANTE/S. RAZON SOCIAL O APELLIDOS Y NOMBRES		COLGATE-PALMOLIVE COMPANY		
DOMICILIO		NEW YORK, NY, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA		
APODERADO		JUAN PABLO CADENA SARNIENTO		
TITULO		COMPOSICIONES ORALES QUE COMPRENDEN POLIMEROS DE SILOXANO		
		CLASIFICACION		
EXPEDIENTE No.		FECHA DE SOLICITUD	ROLLO MICROFILM	
CERTIFICADO No.		FECHA DE CONCESION	VIGENCIA DESDE	HASTA
PRORROGA		CAMBIO DE NOMBRE		
TRASPASO A				
INVENTOR (ES)	THOMAS J. BOYD.			
OTROS				

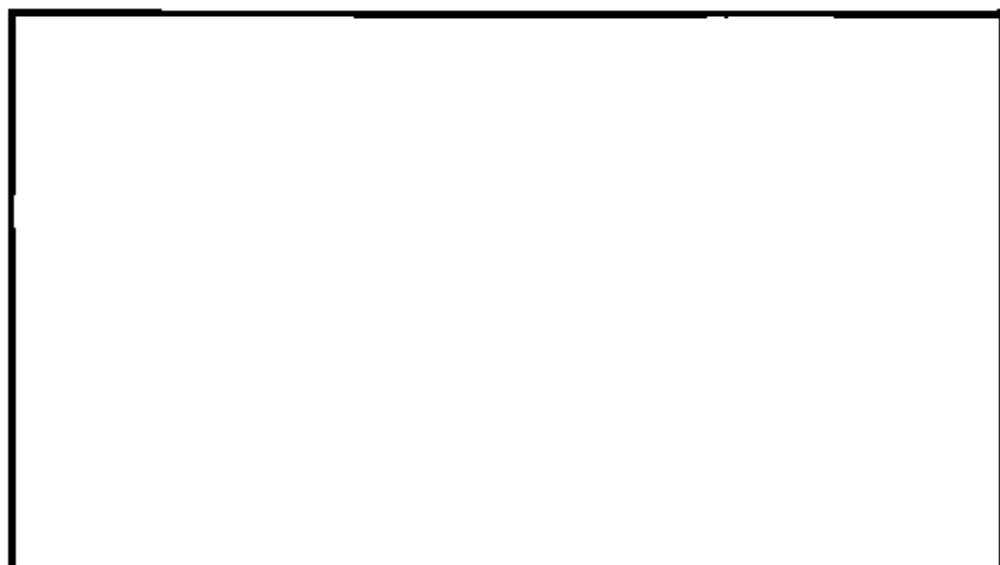
OFICINA DE COMUNICACIONES

10

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud. \$ 501.000
- ☒ Documento que acredite 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: 
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.

3 2

2

108.731
5

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
15 November 2007 (15.11.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/130841 A2

(81) International Patent Classification:
A61Q 11/00 (2006.01) A61K 8/00 (2006.01)

(21) International Application Number:
PCT/US2007/067495

(22) International Filing Date: 26 April 2007 (26.04.2007)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/796,334 1 May 2006 (01.05.2006) US

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

(72) Inventor: and

(73) Inventor/Applicant (for US only): BOYD, Thomas, J.
[US/US]; 226 High Street, Metuchen, NJ 08840 (US)

(74) Agents: BULLOCK, Kristyue, A.; Colgate-palmolive
Company, 909 River Road, P.O. Box 1343, Piscataway, NJ
08854 (US).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): AB, AC, AL, AD, AE,
AF, AG, AI, AJ, AK, AM, AN, AO, AP, AQ, AR, AS, AT, AU, AZ, BA,
BB, BC, BD, BE, BF, BG, BH, BI, BJ, BK, BL, BM, BN, BO, BP,
BQ, BR, BS, BT, BU, BV, BW, BY, BZ, CA, CC, CD, CE, CF, CG,
CH, CI, CJ, CK, CL, CM, CN, CO, CP, CQ, CZ, DD, DE, DF, DG, DH,
DI, DJ, DK, DL, DM, DN, DO, DP, DQ, DR, DS, DT, DU, DV, DW,
DX, EY, FZ, GA, GB, GD, GE, GF, GH, GI, GJ, GK, GL, GM, GN, GP,
GQ, GR, GS, GT, GU, GV, GW, GY, HA, HB, HC, HD, HE, HF, HG,
HH, HI, HJ, HK, HL, HM, HN, HO, HP, HQ, HR, HS, HT, HU, HV, HW,
HX, IY, JZ, KA, KB, KC, KD, KE, KF, KG, KH, KI, KM, KN, KP, KR,
KS, KU, KV, KW, KY, KZ, LA, LB, LC, LD, LE, LF, LG, LH, LI, LJ,
LK, LM, LN, LO, LP, LQ, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, ME, MF,
MG, MH, MI, MJ, MK, ML, MN, MO, MP, MQ, MR, MS, MT, MU, MV,
MW, MX, MY, MZ, NA, NC, ND, NE, NF, NG, NH, NI, NJ, NK, NL, NM,
NN, NO, NP, NQ, NR, NS, NT, NU, NV, NW, NX, NY, NZ, OA, OB,
OC, OD, OE, OF, OG, OH, OI, OJ, OK, OL, OM, ON, OO, OP, OQ, OR,
OS, OT, OU, OV, OW, OX, OY, OZ, PA, PB, PC, PD, PE, PF, PG, PH,
PI, PJ, PK, PL, PM, PN, PO, PP, PQ, PR, PS, PT, PU, PV, PW, PX,
PY, PZ, QA, QB, QC, QD, QE, QF, QG, QH, QI, QJ, QK, QL, QM, QN,
QO, QP, QQ, QR, QS, QT, QU, QV, QW, QX, QY, QZ, RA, RB, RC, RD,
RE, RF, RG, RH, RI, RJ, RK, RL, RM, RN, RO, RP, RQ, RR, RS, RT,
RU, RV, RW, RX, RY, RZ, SA, SB, SC, SD, SE, SF, SG, SH, SI, SJ,
SK, SL, SM, SN, SO, SP, SQ, SR, SS, ST, SU, SV, SW, SX, SY, SZ,
TA, TB, TC, TD, TE, TF, TG, TH, TI, TJ, TK, TL, TM, TN, TO, TP, TQ,
TR, TS, TT, TU, TV, TW, TX, TY, TZ, UA, UB, UC, UD, UE, UF, UG, UH,
UI, UJ, UK, UL, UM, UN, UO, UP, UQ, UR, US, UT, UV, UW, UX, UY,
UZ, VA, VB, VC, VD, VE, VF, VG, VH, VI, VJ, VK, VL, VM, VN, VO,
VP, VQ, VR, VS, VT, VU, VV, VW, VX, VY, VZ, WA, WB, WC, WD, WE,
WF, WG, WH, WI, WJ, WK, WL, WM, WN, WO, WP, WQ, WR, WS, WT,
WU, WV, WX, WY, WZ, XA, XB, XC, XD, XE, XF, XG, XH, XI, XJ, XK,
XL, XM, XN, XO, XP, XQ, XR, XS, XT, XU, XV, XW, XX, XY, XZ, YA,
YB, YC, YD, YE, YF, YG, YH, YI, YJ, YK, YL, YM, YN, YO, YP, YQ,
YR, YS, YT, YU, YV, YW, YX, YY, YZ, ZA, ZB, ZC, ZD, ZE, ZF, ZG,
ZH, ZI, ZJ, ZK, ZL, ZM, ZN, ZO, ZP, ZQ, ZR, ZS, ZT, ZU, ZV, ZW,
ZX, ZY, ZZ.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, CH, GM, KH, 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, MT, NL, PL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CI, CG, CM, 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.

(84) Title: ORAL COMPOSITIONS COMPRISING SILOXANE POLYMERS

(57) Abstract: Oral compositions are provided that comprise an active ingredient comprising a siloxane polymer having at least one hydrophilic region. The oral care composition comprises a siloxane polymer having a phosphorus-containing moiety. A source of fluoride ions and/or other oral care actives can be included in the oral care composition. Methods of making and using the oral compositions are also provided.

WO 2007/130841 A2

TITLE OF THE INVENTION
ORAL COMPOSITIONS COMPRISING SILOXANE POLYMERS
CROSS REFERENCE TO RELATED APPLICATION

[0001] This application claims the benefit of United States Provisional Patent Application No. 60/796,384 filed May 1, 2006, the contents of which is incorporated herein by reference.

BACKGROUND OF THE INVENTION

[0002] Dental plaque or plaque biofilm is a soft deposit that forms on teeth and is implicated in the occurrence of gingivitis, periodontitis, caries and other forms of periodontal disease. A plaque biofilm provides a locus for calculus or tartar formation, which is a hard mineralized solid formed on the teeth when crystals of calcium phosphate are deposited in the pellicle and extracellular matrix of the dental plaque biofilm and become crystalline hydroxyapatite. While regular brushing helps to prevent rapid build-up of these deposits, even regular brushing is not sufficient to remove all of the calculus deposits which adhere to the teeth.

[0003] Various antibacterial agents have found to have the clinical ability to retard the growth of bacterial and hence have the ability to minimize plaque formation, oral infections and diseases associated therewith. However, many antibacterial agents are incompatible or unstable with other oral care active ingredients, difficult to deliver *in vivo*, or may inactivate other desirable additional oral care ingredients. Some antibacterial agents are difficult to formulate in oral compositions or are expensive.

[0004] It would be desirable to develop highly efficacious oral compositions that prevent or combat plaque formation, as well as other detrimental oral health implications, by using a stable antiplaque and/or antitartar active agent. Thus, there is a need for an oral care composition that effectively reduces the development or progression of oral disease, preferably by having an active ingredient that functions to diminish the effects of oral disease by preventing or reducing multiple etiological factors that contribute to and/or exacerbate oral disease. Further, there is a need to use

stable oral care actives in an oral composition, so that their functionality and bioavailability as delivered to a subject *in vivo* is preserved and stabilized.

DETAILED DESCRIPTION OF THE INVENTION

[0005] The following description is merely exemplary in nature and is not intended to limit the present disclosure, application, or uses.

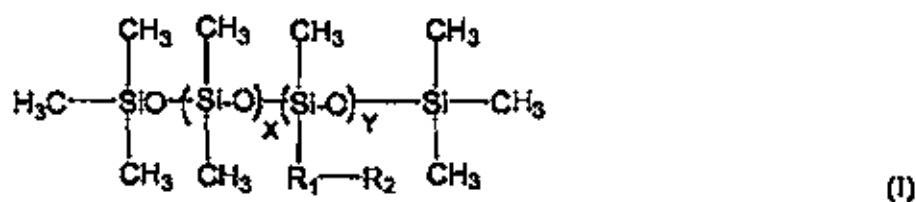
[0006] In various embodiments, oral care compositions are provided with an active ingredient that comprises a siloxane polymer that provides various oral care benefits, such as antiplaque effects and tartar control, among others. A "siloxane polymer" refers to a polymer that has a basic backbone of silicon and oxygen with side constituent groups that may be the same or different, generally described by the structural repeating unit $(-O-SiR'R'')_n$, where R and R' may be the same or different side constituent groups, and n may be any value above 2 designating the repetition of the SRU in the polymer backbone. Siloxane polymers are also known in the art as "silicone" polymers. Siloxane polymers may include polyheterosiloxanes, where side groups and/or structural repeating units may be different entities (having different side constituent groups), such as, for example, the siloxane co-polymer described by the nominal SRU formula, $(-O-SiR'R'')_n - (-O-Si-R''R''')_m$, wherein R and R' are distinct side groups from R'' and R''' and m is an integer. Further R and R' may be different from one another; likewise the same may be true for R'' and R'''. Such siloxane polymers may terminate in any variety of terminal groups, such as for example, trimethyl silyl $((CH_3)_3Si)$ terminated siloxane, or ethyl vinyl terminated siloxane. Often, the siloxane polymer is crosslinked, for example, in a hydrosilylation reaction where ethylenically unsaturated groups react with hydride groups.

[0007] Conventional polyorganosiloxane polymers are hydrophobic. However, in accordance with various aspects of the disclosure, the active ingredient comprises a siloxane polymer that has at least one hydrophilic region. In various embodiments, the hydrophilic region comprises one or more hydrophilic moieties, such as alkylene oxides, amines or phosphorus-containing groups. In certain embodiments, the hydrophilic region includes a moiety comprising phosphorus. Exemplary

phosphorus containing moieties include, by way of example, phosphates, phosphonates, phospholipids, and the like, as will be described in more detail below.

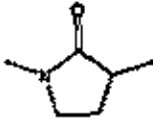
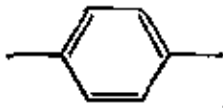
[0008] In certain embodiments, the siloxane polymer comprises has pendent alkyl groups. The siloxane polymer further comprises a phosphorus-containing moiety, for example, a phosphate. In this regard, a suitable siloxane polymer for use as an oral care active ingredient comprises a phosphate and one or more alkyl groups, and is broadly referred to as an alkyl phosphate siloxane polymer. In certain embodiments, the alkyl groups are selected to be methyl groups and the siloxane polymer comprises a polydimethylsiloxane having a phosphate group.

[0009] In certain embodiments, the siloxane polymer comprises a compound according to the nominal general formula (I):



where R_1 is selected from the group consisting of: alkyl, aryl, amide, ester, pyrrolidone, vinyl, acrylate, siloxane, urethane, carbonate, vinyl alcohol, alkylene oxide, and combinations thereof; and R_2 comprises a moiety selected from the group consisting of: phosphate, phosphonate, phospholipids, a phosphate-containing group, and combinations thereof. In certain embodiments, R_1 alkyl and/or aryl groups range from $C_1 - C_{30}$, and in some embodiments have lower alkyl/aryl groups, for example having from $C_2 - C_{10}$, optionally from $C_2 - C_4$. In certain embodiments, alkylene oxides can range from $C_2 - C_4$, thus including ethylene oxide, propylene oxide, and butylene oxide, of which multiple groups may be provided. "x" ranges from 0 to 100 and "y" from 1 to 100.

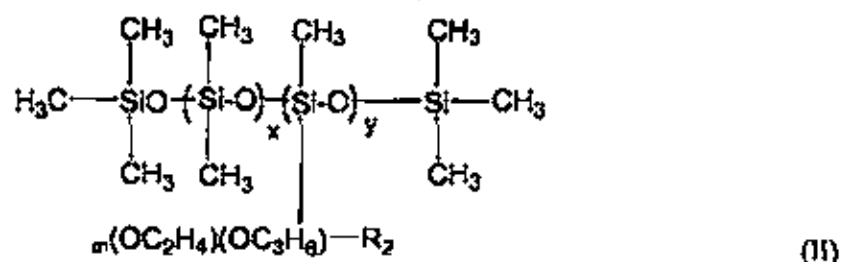
[0010] In certain embodiments, R_1 comprises $-(CH_2)_n-(Q)_m$, where Q is at least one group selected from: an alkylene oxide having $C_2 - C_4$, such as C_2H_4O or C_3H_6O ;

CH₂CH(OH); CONH, CO₂ NH, CONH,  and , wherein v and z are respectively 1 to 16. For example, R₁ can be selected from PO₃H₂, PO₃K₂, PO₃Na₂, PO₃Li₂ and PO₃(NH₄)₂, from phospholipids, such as phosphatidyl choline, phosphatidic acid, phosphatidyl inositol, phosphatidyl ethanolamine, and the like.

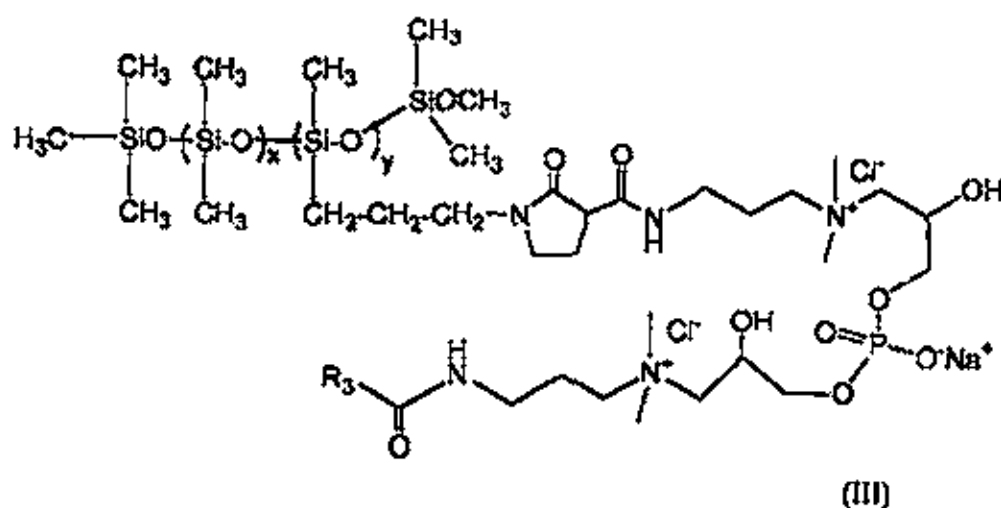
[0011] Suitable siloxane polymers are disclosed in United States Patent Nos. 5,530,084 to Ihara *et al.*; 5,070,171 and 6,175,028 both to O'Lenick; 6,124,490 to Gormley *et al.*; 6,225,489, 5,849,313, and 5,688,496 all to Fost *et al.*; and 5,859,161 to Imperante *et al.* All references cited in the detailed description, including those listed above, are expressly incorporated by reference in their entireties.

[0012] In some embodiments, the siloxane polymer having a phosphate-containing moiety comprises a dimethicone copolyol phosphate of the type disclosed in United States Patent No. 5,070,171. Such siloxane polymers have a pendant phosphate functional group and are prepared by reacting a hydroxyl-containing silicone with a phosphating reagent.

[0013] In certain embodiments, the siloxane polymer comprising a phosphate moiety is a compound having the formula (II):



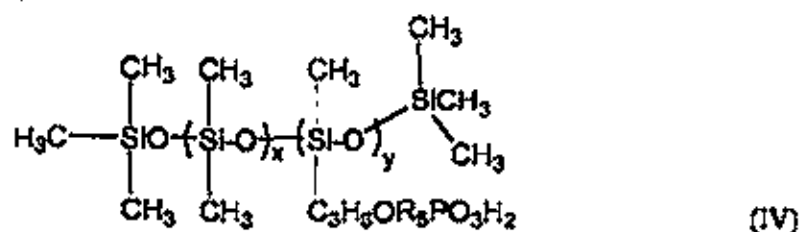
where R₂ is a pendant phosphate group, such as -PO₃H₂ or -(CH₂CH₂H₃O)_nPO₃H₂, "x" is 0 to 100, "y" is 1 to 100, "m" is 0 to 15. In other embodiments, the siloxane polymer comprises at least one phosphate and at least one amine group. An example of a suitable compound of such a siloxane polymer comprising a phospholipid as the phosphorus-containing moiety has the formula (III):



where R₃ is an alkyl group ranging from C₁ to C₃₀, "x" is 0 to 100, "y" is 1 to 100. In some embodiments, R₃ is a C₁₈ alkyl group.

[0014] Non-limiting examples of siloxane polymers comprising a moiety comprising phosphorus suitable for use in oral care and/or personal care compositions include phosphated siloxane polymers that are available commercially from Phoenix Chemical of Somerville, New Jersey, United States of America under the trade designations PECOSIL® PS-100 (a dimethicone polyethylene glycol (PEG-7) phosphate), PS-200 (a dimethicone polyethylene glycol (PEG-10) phosphate), WDS-100 (a dimethicone polyethylene glycol/polypropylene glycol (PEG/PPG-7/4) phosphate), WDS-200 dimethicone polyethylene glycol/polypropylene glycol (PEG/PPG-12/4) phosphate), and PECOSIL® PSQ-418 (Steardimonium hydroxypropyl PEG-7 dimethicone).

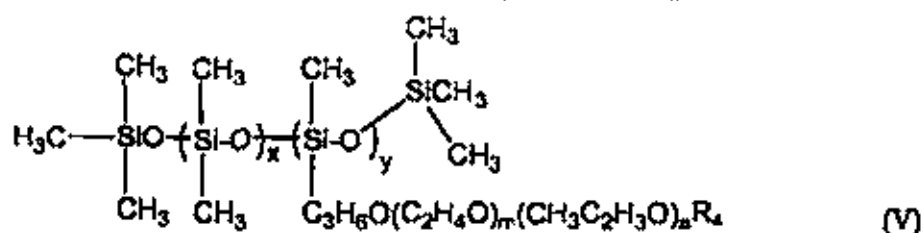
[0015] These commercially available phosphated siloxane polymers generally have the following structural formulas (IV):



where R_3 is $(C_2H_4O)_a$, where "a" varies based on the desired ethylene glycol (PEG) chain length/desired molecular weight; and PECOSIL® WDS-100 and WDS-200 are $(CH_3C_2H_5O)_b(C_2H_4O)_c$, where "b" and "c" vary based on the selected chain length of the propylene glycol (PPG) and ethylene glycol (PEG) respectively. Polymers of this general class have "x" of 0 to 100 and "y" of 1 to 100.

[0016] Another siloxane polymer having a hydrophilic region including a phosphorus-containing moiety useful as active ingredients for oral compositions is linoleamidopropyl PG-dimonium chloride phosphate dimethicone available commercially under the trade name MONASIL™ PLN (also available as ARLASILK™ Phospholipid PLN) from Uniqema Inc., of Wilmington, Delaware, United States of America. This polymer has the structure previously shown in Formula III above, and polymers of this general class include in certain embodiments, R_3 representing C_{12} , "x" from 0 to 100, and "y" from 1 to 100.

[0017] In some embodiments, the hydrophilic region of the siloxane polymer comprises one or more hydrophilic groups, such as alkylene oxides and/or amines, where the siloxane polymer comprises a compound having the formula (V):



where R_4 is selected from H or $-\text{PO}_3\text{H}_2$, "x" is 0 to 100, "y" is 1 to 100, and "m" is 0 to 15, and "n" is 0 to 15. For example, a siloxane polymer having R_4 selected to be H is commercially available as DC-190 and is available from the Dow-Corning Company, Midland, Michigan, United States of America. Other suitable siloxane polymers having hydrophilic regions are commercially available under the trade names DC-193 (polyethylene methylpolysiloxane copolymer or PEG-12 dimethicone) and DC-5103

(siloxylated polyether surfactants with ethylene oxide and/or propylene oxide from Dow-Corning Company, Midland, Michigan, United States of America.

[0018] In various embodiments, the siloxane polymers comprising at least one hydrophilic region are believed to function as an antiattachment or antiadhesion agent. While not limiting as to the present invention, antiattachment oral care active ingredients are generally believed to operate by either (or both) of two predominant anti-attachment mechanisms. Biofilms (also referred to as pellicle) are a matrix formed on an oral surface, typically on a hard tissue surface, comprising bacteria (generally about 60-70% of the biomatrix), bacterial extracellular byproducts, proteins, lipids, and glycolipids. The term "oral surface" encompasses hard and soft tissues within the oral cavity. Hard tissues include the teeth, periodontal support, and the like. Soft tissues comprise gums, the tongue, surfaces of the buccal cavity, and the like. The oral compositions of the various embodiments can be used in a mammalian subject, which includes humans and other warm blooded higher level vertebrate animals, such as felines and canines.

[0019] Without being bound by theory, it is believed that early stages of biofilm formation include an initial bacteria layer that attaches to an oral surface, generally believed to be attached by ligands or adhesins on the bacterial cell wall that interact with receptors on an oral surface. It is believed that the bacterial cells attach to the salivary glycoproteins on the oral surface, e.g., enamel. The bacteria appear to form a stronger attachment by generating extracellular glucan polymers to adhere to the oral surface. The bacteria then grow and divide to form a dense layer on the oral surface. After a specific density is reached, it is believed that the bacteria reorganize and begin to form pillars and irregular surface structures. Further, the biofilm matrix is believed to have a complex association of multi-layered and diverse species that form cell clusters attached to the anchoring bacteria of the first layer.

[0020] Without being bound by any particular theory, it is believed that one mechanism by which anti-attachment oral care agents are believed to operate is where the anti-attachment agent interacts with the bacteria itself to disable it from attaching to

the oral surface, likely by interacting with the adhesins, ligands, or other moieties on the surface of the bacteria that would ordinarily facilitate a linkage with a receptor or other moiety on the oral surface.

[0021] Another anti-attachment mechanism is one where agents interact with an oral surface to form a protective layer, such that the bacteria and biofilm components cannot adhere to the oral or tooth surface, thereby preventing an initial anchoring layer from forming on the oral surface. Such an anti-attachment agent may substantially cover an oral surface, and prevent attachment of the bacteria and other components of the biofilm matrix. While not limiting as to any particular mechanism by which the invention operates, it is believed that the siloxane polymer active agents of the various embodiments of the disclosure operate via such a mechanism, coating a tooth surface, altering its surface energy, and inhibiting bacterial attachment.

[0022] Thus, while not wishing to be limited to any particular mechanism it is believed that oral care compositions comprising a siloxane having a hydrophilic region as an active ingredient, e.g., a phosphorus-containing moiety, function via an anti-attachment mechanism that substantially inhibits bacterial attachment to a tooth surface. By "substantially inhibit" it is meant that the biofilm generation or proliferation is impeded; however the extent to which the inhibition occurs depends upon concentration and distribution of the active ingredient as delivered *in vivo* to the oral surface, as well as the amount of biofilm present prior to treatment with the active ingredient. It appears that certain siloxane polymers having hydrophilic regions alter the surface energy of hard tissues, such as enamel (by reducing the surface energy), and in turn, prevent or reduce adherence and attachment of microorganisms that may form a plaque biofilm on the tooth surface. Preferred siloxane polymers have substantivity on the tooth surface, such that they remain attached for a sufficient period of time to effectively prevent or reduce microorganisms' growth and or adherence to the tooth surface, thereby preventing or reducing biofilm formation.

[0023] In some embodiments, an oral composition comprises an anti-plaque and/or anti-tartar active ingredient that is a siloxane polymer comprising at least one

hydrophilic region that is believed to be an anti-attachment agent that substantially inhibits bacteria from forming a biofilm on a tooth surface. The hydrophilic region comprises a moiety selected from the group consisting of: alkylene oxides, phosphates, phosphonates, phospholipids, amines, and combinations thereof. Such siloxane polymers include those described above, *inter alia*. The efficacy of the siloxane polymer as delivered in an oral composition is sufficient such that there is no need for an additional antibacterial agent. For example, in certain embodiments, the oral composition is substantially free of lipophilic active ingredients, such as halogenated diphenyl ethers, eucalyptol, thymol, menthol and the like. In this regard, the compositions have high antiplaque efficacy, while requiring fewer active ingredients, which can be costly and complex to formulate. By "substantially free" it is meant that the component or compound is absent to the extent that it cannot be detected or it is still suitable to use the item for its intended purpose (where the absence of the desired characteristic or property is required). In certain embodiments, substantially free means that there is less than about 3% by weight of the non-ionic or lipophilic active ingredients, optionally less than about 2%; optionally less than about 1%, and preferably entirely free of the active ingredient. In certain embodiments, the oral composition consists essentially of an anti-plaque and/or antitartar active ingredient that is a siloxane polymer comprising at least one hydrophilic region.

[0024] Such oral compositions can optionally comprise other active ingredients that are less complex to formulate in an oral composition or provide particular desirable oral care benefits, for example, polyphosphate anticalculus compounds or anticaries agents, as will be discussed in more detail below. In certain embodiments, the oral composition comprises an antiplaque or antitartar agent that consists essentially of a siloxane polymer having at least one hydrophilic region.

[0025] In various embodiments, such an antiattachment effect is obtained at relatively low concentrations. For example, the oral composition comprises an active ingredient having a siloxane polymer having one or more hydrophilic regions that is present in the oral composition at about 0.001 to about 3% by weight, more preferably

between about 0.5 to about 2.5% by weight. In certain embodiments, the oral composition comprises a siloxane polymer having one or more hydrophilic regions at about 1% by weight.

[0026] In accordance with various embodiments, the application of oral compositions having an active ingredient comprising a siloxane polymer with a hydrophilic region, as provided in the various embodiments of the present disclosure, promotes longer and more effective anti-plaque benefits at lower concentrations in comparison with many other antimicrobial ingredients which are washed away in the aqueous oral cavity. Such a reduction in plaque, in turn, provides calculus or tartar control, as well.

[0027] In various embodiments, a highly efficacious antiplaque and anticalculus oral care composition contains the siloxane polymers having a hydrophilic region as the sole antiplaque/antibacterial ingredient. However, in certain embodiments, one or more additional active ingredients may be included in the oral care compositions. Any additional active agents for use with the siloxane polymer should be carefully selected. If added, the additional active ingredients should not react with or detract from the efficacy and bioavailability of the siloxane polymer agents.

[0028] Non-limiting examples of oral care active ingredients for oral compositions, include for example, tooth whitening agents, antimicrobial agents, anti-carries agents, antitartar agents, anti-plaque agents, anti-adhesion agents, desensitizing agents, anti-inflammatory agents, malodor control agents, flavoring agents, coloring agents, anti-aging agents, salivary stimulants, periodontal actives, conditioning agents, moisturizing agents, including emollients, occlusive reagents and humectants, natural extracts and essential oils, nutrients, enzymes, proteins, amino acids, vitamins, analgesics, antibiotics, and mixtures thereof. Exemplary oral care actives among those useful herein are disclosed in United States Patent Nos. 4,894,220 to Nabi *et al.*, 5,288,480 and 5,776,435, both to Gaffar *et al.*, 5,681,548 to Esposito *et al.*, 5,912,274 and 5,723,500 both to Stringer *et al.*, 6,290,933 to Durga *et al.*, and 6,683,921 to Lawlor, as well as in United States Patent Application Publication No. 2003/0206874 to Doyle *et al.* Further,

a wide variety of suitable active ingredients for both oral and personal care compositions are listed in Gottschalk *et al.* eds., International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook, Tenth Edition, Volume 3 (2004). Such active ingredients are well known to one of skill in the art.

[0029] Mixtures of additional oral care active ingredients, even within the same classification, are contemplated by the present disclosure. In various embodiments, the additional active ingredients comprise from about 0.0001% to about 10%, preferably from about 0.001% to about 5%, more preferably from about 0.01% to about 3% by weight of the oral composition, depending on the concentration of the active compounds and form of the oral composition.

[0030] In various embodiments, it is preferred that the additional active ingredients are non-lipophilic or non-ionic. However, for certain embodiments, a non-ionic antibacterial agent is optionally included in oral compositions, and may include phenolic and/or bisphenolic compounds, such as, halogenated diphenyl ethers, including triclosan (2,4,4'-trichloro-2'-hydroxy-diphenylether, triclocarban (3,4,4-trichlorocarbanilide), 2-phenoxyethanol, benzoate esters, carbanilides, phenols, thymol, eugenol, hexyl resorcinol and 2,2'-methylene bis (4-chloro-6-bromophenol).

[0031] The active ingredient may also optionally comprise a cationic active ingredient. In certain embodiments, the siloxane polymer comprises an anionic group or moiety and it is desirable to avoid strongly cationic active ingredients, because such anionic compounds can bind to the cationic active ingredient potentially reducing its bioavailability. In such embodiments, the oral composition containing an anionic siloxane polymer, such as an anionic siloxane polymer having a pendant phosphorus-containing moiety, is substantially free of cationic active ingredients.

[0032] However, in other embodiments, cationic active ingredients can be suitable for use in oral compositions, particularly when the siloxane polymer is only mildly anionic or the cationic active is only slightly cationic. In various embodiments, suitable cationic actives include, for example, quaternary ammonium compounds, such as, benzalkonium chloride and benzethonium chloride; pyridinium and isoquinolinium

compounds, including hexadecylpyridinium chloride; pyrimidine derivatives such as hexetidine; amidine derivatives such as hexamidine isethionate; bispyridine derivatives such as octenidine. Other cationic actives include guanides, such as bis-biguanides include chlorhexidine and alexidine. Other optional active ingredients that are cationic compounds include N^ω-acyl amino acid alkyl esters and salts, including ethyl lauroyl arginine ester hydrochloride (ELA-H).

[0033] In some embodiments, the additional active ingredient comprises an oral care active that is a biofilm disruption agent. A biofilm disruption agent is generally a compound that prevents formation of and/or attacks a biofilm (or pellicle) already formed on an oral surface and includes enzymes that can hydrolyze proteins, starch and lipids, which form a part of a biofilm matrix. In certain embodiments, such active ingredients are enzymes, including by way of example, protease enzymes, such as cysteine proteases or serine proteases. Examples are most desirably selected from the group: papain (for example, isolated from the latex of the green fruit and leaves of *Carica papaya*), ficin (for example, isolated from the latex of tropical fig trees *Ficus glabrata*), krillase (for example, isolated from Antarctic krill), other cysteine and serine proteases, glucoamylase, dextranase, mutanase, lysozyme, plant lipase, gastric lipase, pancreatic lipase, tannase, bromelain, chymotrypsin, alcalase, amalyseca, lactoferrin, gingipains, glucose oxidase, elastases and/or cellulases pectinase, and mixtures thereof. Other exemplary biofilm disruption agents for the oral cavity include synthetic histatin, furanone, derivatives of furanone, and mixtures of any of the above.

[0034] Other useful oral active ingredients include fluoride ion sources, preferably present in an amount sufficient to supply about 25 ppm to about 5,000 ppm of fluoride ions, such as sodium fluoride, potassium fluoride, sodium fluorosilicate, ammonium fluorosilicate, sodium monofluorophosphate (MFP), and amine fluorides, including olaflur (N'-octadecyltrimethylendiamine-N,N,N'-tris(2-ethanol)-dihydrofluoride). Actives can also include stannous and/or zinc ion sources. Suitable stannous ion sources include without limitation stannous fluoride, other stannous halides such as stannous chloride dihydrate, stannous pyrophosphate, organic stannous

carboxylate salts such as stannous formate, acetate, gluconate, lactate, tartrate, oxalate, malonate and citrate, stannous ethylene glyoxide and the like. Zinc ion sources, such as zinc acetate, zinc chlorite, zinc citrate, zinc gluconate, zinc glycinate, zinc oxide, zinc sulfate, sodium zinc citrate and the like are also suitable for use in oral compositions.

[0035] Certain types of useful anticalculus active ingredients are linear molecularly dehydrated polyphosphate salts. Polyphosphate salts are generally employed in the form of their wholly or partially neutralized water soluble alkali metal (e.g., potassium, sodium or ammonium salts, and any mixtures thereof). Thus, linear molecularly dehydrated polyphosphate compounds useful as antitartar agents include those such as sodium tripolyphosphate, sodium hexametaphosphate pyrophosphate, dialkali or tetraalkali metal pyrophosphate salts such as $\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$, $\text{K}_4\text{P}_2\text{O}_7$, $\text{Na}_2\text{K}_2\text{P}_2\text{O}_7$, $\text{Na}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$ and $\text{K}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$, and cyclic phosphates such as sodium tripolyphosphate sodium trimetaphosphate, or mixtures thereof. In various embodiments, such active ingredients are present at concentrations from about 0.001 to about 10%, more preferably between about 1 to about 5% of the composition. Polyphosphates may also be used, for example, as active ingredients in home care and cleansing compositions, as will be discussed in more detail below.

[0036] Synthetic anionic linear polycarboxylates are also well known as efficacy enhancing agents for certain active ingredients, in particular for enhancing efficacy of oral care ingredients, including antibacterial, antitartar or other active agents within the composition. Further, such compounds may also be used to form films, as described below. Such anionic polycarboxylates are generally employed in the form of their free acids, or preferably partially neutralized or more preferably fully neutralized water soluble alkali metal (e.g., potassium and preferably sodium) or ammonium salts. 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 5,000,000. One preferable copolymer is methylvinylether/maleic anhydride. Examples of these copolymers are available from ISP Corporation, Wayne, New Jersey, United

States of America, 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). In various embodiments where a synthetic anionic polycarboxylate is included in the composition, it is preferably present from about 0.001% to about 5% weight.

[0037] Saliva stimulating agents are other conventional active ingredients and include food acids such as citric, lactic, maleic, succinic, ascorbic, adipic, fumaric and tartaric acids, and mixtures thereof. H₂ histamine receptor antagonists are other useful active ingredients. H₂ antagonists useful herein include cimetidine, etitidine, ranitidine, ICIA-5165, tiotidine, ORF-17578, lupitidine, donetidine, famotidine, roxatidine, pifatidine, lamtidine, BL-6548, BMY-25271, zaltidine, nizatidine, mifentidine, BMY-52368, SKP-94482, BL-6341A, ICI-162846, ramixotidine, Wy-45727, SR-58042, BMY-25405, loxitidine, DA-4634, bisfentidine, sufotidine, ebrotidine, HE-30-256, D-16637, FRG-8813, FRG-8701, impromidine, L-643728, HB-408.4, and mixtures thereof. Desensitizing agents useful herein include potassium citrate, potassium chloride, potassium tartrate, potassium bicarbonate, potassium oxalate, potassium nitrate, strontium salts, and mixtures thereof.

[0038] The oral compositions of the present invention can optionally comprise other anti-plaque/plaque disrupting agents in addition to those set forth above, including without limitation: copper, magnesium, and strontium ion sources, typically provided in salt form; dimethicone copolyols such as cetyl dimethicone copolyol; urea; calcium lactate; calcium glycerophosphate; strontium polyacrylates; and mixtures thereof.

[0039] In certain embodiments, the active ingredient is an anti-inflammatory agent. Certain useful anti-inflammatory compounds include flavonoids, flavans, parthenolides, such as sesquiterpene lactone parthenolides, androstenediol (AED) and dehydroepiandrosterone (DHEA). Other useful anti-inflammatory agents are non-steroidal anti-inflammatory drugs (NSAIDs). Examples of useful NSAIDs include

indomethacin, flurbiprofen, ketoprofen, ibuprofen, naproxen, meclofenamic acid, and mixtures thereof. Other suitable anti-inflammatory agents useful for oral care active agents include oregano extract (for example, extracts from *Origanum vulgare* (commonly known as "oregano", "wild oregano", or "wild marjoram")) as disclosed in United States Patent Application Serial No. 11/256,788 to Worrell *et al.*, filed October 24, 2005, or magnolia extract, derived from plants in the *Magnolaceae* family, such as *Magnolia Officinalis* as described in United States Patent Application Serial No. 11/285,809 to Gaffar *et al.*, filed November 23, 2005. Alternatively or in addition, a local or systemic analgesic such as aspirin, codeine, acetaminophen, sodium salicylate or triethanolamine salicylate can be used.

[0040] Further, a suitable anti-inflammatory active ingredient safe for oral care compositions comprises a combination of at least one flavonoid and at least one flavan, such an example is UNIVESTIN®, which is manufactured and sold by Unigen Pharmaceuticals, Inc., Superior, Colorado, United States of America. A full description of UNIVESTIN® can be found in United States Patent Application Publication No. 2003/0216481 to Jia.

[0041] Exemplary antioxidants useful as active ingredients include butylated hydroxyanisole (BHA), butylated hydroxytoluene (BHT), vitamin A, carotenoids, tocopherols (vitamin E), flavonoids, polyphenols, ascorbic acid (vitamin C), herbal antioxidants, chlorophyll, melatonin, chloride, calcium, calcium oxide, calcium chloride, disodium ubiquinone (coenzyme Q₁₀), ethylhexyl gallate, hydrogen peroxide (also useful as a whitening agent), iodine, lycopene, magnesium ascorbate, potassium sulfite, sodium bisulfite, thiolactic acid, and mixtures thereof. These active ingredients are also used in personal care and cleansing compositions.

[0042] In certain embodiments, the compositions comprise active ingredients that are antibiotics, such as augmentin, amoxicillin, tetracycline, doxycycline, minocycline, metronidazole, neomycin, kanamycin and clindamycin; and mixtures thereof.

[0043] Suitable nutrients include vitamins, minerals, amino acids, and mixtures

thereof. Vitamins include Vitamins C and D, thiamine, riboflavin, calcium pantothenate, niacin, folic acid, nicotinamide, pyridoxine, cyanocobalamin, para-aminobenzoic acid, bioflavonoids, and mixtures thereof. Nutritional supplements include amino acids (such as L-tryptophan, L-lysine, methionine, threonine, levocarnitine and L-carnitine), lipotropics (such as choline, inositol, betaine, and linoleic acid), fish oil (including components thereof such as omega-3 (N-3) polyunsaturated fatty acids, eicosapentaenoic acid and docosahexaenoic acid), and mixtures thereof.

[0044] The oral compositions are preferably provided in an orally acceptable carrier or vehicle. The carrier can be a liquid, semi-solid, or solid phase, in the form of a mouth rinse, dentifrice (including toothpastes, toothpowders, and prophylaxis pastes), confectionaries (including lozenges, and gum), medicament, film, or any other form known to one of skill in the art. Selection of specific carrier components is dependant on the desired product form.

[0045] By way of example, the compositions comprising the siloxane active material can be provided in an oral care composition, which can be in the form of a dentifrice, such as toothpastes, toothpowders, and prophylaxis pastes, confectionaries, including gums, beads and chews, films, paint-on products, professional polishing formulations or any other form known to one of skill in the art.

[0046] In various embodiments, an orally acceptable dentifrice carrier used to prepare an oral composition comprises a water-phase. Conventional ingredients that can be used to form the carriers listed above are well known to the skilled artisan. 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, surface active agents, such as surfactants, emulsifiers, and foam modulators, viscosity modifiers and thickeners, humectants, diluents, pH modifying agents, emollients, moisturizers, mouth feel agents, sweetening agents, flavor agents, colorants, preservatives, solvents, such as water 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. Preferably, such carrier materials are selected for compatibility and stability with all of the constituents of the active ingredient, including siloxane polymer and any additional active compounds selected for the oral composition.

[0047] Typical useful surface active agents are disclosed in the patent references referenced and discussed above, including in United States Patent No. 4,894,220 and United States Patent Application No. 11/236,788 to Worrell. Surface active agents generally are an important aspect of the oral composition, as they can function as surfactants, emulsifiers, foam modulators, and/or active ingredient dispersion agents. For example, in embodiments where the oral composition has an active ingredient comprising an anionic active ingredient, it is preferred that the carrier comprises surfactants that are not strongly cationic, as such anionic compounds can bind to the cationic active ingredient potentially reducing its bioavailability. Depending on the chemical composition of the siloxane polymer (for example, the identity of the R₁ and R₂ groups identified in Formula 1 above), the siloxane polymer may have anionic portions or characteristics. Thus, where the siloxane polymer has an anionic character in certain embodiments, it is preferred that the carrier is substantially free of non-compatible surfactants, such as strongly cationic surfactants.

[0048] Generally, suitable surface active agents for oral carriers are those which are reasonably stable and foam 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, Florham Park, New Jersey, United States of America, cationic, zwitterionic (e.g., cocoamidopropyl betaine and lauramido propyl betaine), and amphoteric organic synthetic detergents. In embodiments where the active ingredient comprises an anionic compound, the surface active agent is preferably selected from the group consisting of: non-ionic surfactants,

anionic surfactants, amphoteric surfactants and mixtures thereof. In certain embodiments, one or more surface active agents are present in the oral composition in the range from about 0.001 % to about 5%, preferably from about 0.5% to about 2.5%.

[0049] Any suitable flavoring or sweetening material may also be employed. Examples of suitable flavoring constituents are flavoring oils, e.g. oil of spearmint, peppermint, wintergreen, sassafras, clove, sage, eucalyptus, marjoram, cinnamon, lemon, lime, orange, grapefruit, and methyl salicylate. Also useful are such chemicals as menthol, carvone, and anethole. Suitable sweetening agents include sucrose, lactose, maltose, sorbitol, xylitol, sodium cyclamate, perillartine, AMP (aspartyl phenyl alanine, methyl ester), saccharine and the like. As discussed above, in certain embodiments, the oral compositions are substantially free of lipophilic agents, such as lipophilic flavorants. However, in certain embodiments, the flavor and sweetening agents may each or together be incorporated into the oral composition at a concentration of about 0.05 to about 5% and preferably about 0.5 to about 1.5%.

[0050] In embodiments where the oral composition is in the form of a mouthrinse an exemplary carrier is substantially liquid. The term "mouth rinse" includes mouth washes, sprays, rinses, and the like. In such a preparation, the orally acceptable carrier typically has an aqueous phase comprising either water, or a water and alcohol mixture. Further, in various embodiments, the oral carrier typically has a humectant, surfactant, and a pH buffering agent.

[0051] In embodiments where the oral composition is in the form of a confectionary, an exemplary carrier is substantially solid or semi-solid. Confectionary carriers are well known in the art. For a lozenge, the carrier typically comprises a lozenge base material (for example, comprising a non-cariogenic polyol and/or starch/sugar derivative), an emulsifier, a lubricant, a flavoring agent, a thickener, and optionally, a coating material. Chewing gum carriers generally have a chewing gum base, one or more plasticizing agents, a sweetening agent, and a flavoring agent.

[0052] In embodiments where the oral composition is in the form of a film, an exemplary carrier is substantially solid or semi-solid. Generally, such film carriers

comprise a water soluble or dispersible film forming agent, such as a hydrophilic polymer. Optionally, the film carrier may also comprise hydrophobic film forming polymers, either as a removable backing layer, or mixed with a hydrophilic film forming polymer. Film carriers optionally comprise plasticizers, surface active agents, fillers, bulking agents, and viscosity modifying agents.

[0053] In embodiments where an oral composition is in the form of a dentifrice, an exemplary carrier is substantially semi-solid or a solid. Dentifrices typically contain surface active agents, humectants, viscosity modifying agents and/or thickeners, abrasives, solvents, such as water, flavoring agents, and sweetening agents.

[0054] In various embodiments, an oral composition may be provided within a single component or phase. In other embodiments, the oral composition includes both a first and a second component that are separately maintained. Maintaining the components separately requires only that the components are maintained in such a way as to substantially prevent the interaction of one component of the oral composition with another component of the oral composition. Typically, a dual component oral composition is employed where there are one or more incompatible ingredients included in the oral composition. For example, if the active ingredient comprises a siloxane polymer ingredient that has an anionic nature, it is advantageous to separately maintain cationic compounds from strongly anionic components. The separation of components can be accomplished through any means known or to be discovered in the art and includes chemical, physical, and mechanical means of separation of any combination of these. For example, the first and second components may be combined but certain components are separately maintained by wrapping or encapsulating one or both in a film, coating, capsule, micelle, and the like.

[0055] Thus, any of the various embodiments of the oral care composition described above are contacted with or applied regularly to an oral surface, preferably at least one time a day, more preferably on multiple days in a week, and most preferably on a long-term daily basis.

[0056] The oral compositions may be prepared by suitably admixing the various ingredients. For instance, in the preparation of a mouthrinse, the siloxane polymer is dispersed in an aqueous solvent and/or alcohol and then added to a mixture of humectants, surfactants, and water. The resulting rinse product is then packaged.

[0057] Dentifrices are typically prepared by adding various salts (including fluoride salts, when included in the composition), and sweeteners (e.g., saccharin), and any water-soluble oral care active ingredient compounds to water, where it is mixed. Into another container, all humectants, gums, and polymers, including the siloxane polymer ingredient, are added together. The water based mixture described above is added to the container with the humectants, gums, and polymers. The combined ingredients are optionally heated to a temperature of greater than about 40°C, for example from about 60°C to about 70°C, to disperse the gums and polymers. The heated mixture is then cooled to less than approximately 38°C (about 100°F). The mixture is then combined with abrasives, where it is mixed at high speed under a vacuum for about 15 to about 20 minutes. Any flavor oil and any lipophilic oral care active ingredients are admixed. This mixture is admixed to the water based mixture above, where it is mixed under high speed and vacuum until sufficiently dispersed. The surfactant(s) are added and the mixture is again mixed to disperse. The siloxane polymer may optionally be added with the surfactants, rather than into the polymer phase.

[0058] The oral composition can be incorporated into confectionary and tropes. Such methods of forming confectionary (e.g., gum) or tropes (e.g., lozenges) are well known by one of skill in the art, and can be prepared by stirring the other oral care active compound(s) into a warm gum base or coating the outer surface of a gum base (for example, jelutone, rubber latex, vinylite resins, *inter alia*), desirably with conventional plasticizers or softeners, sugar or other sweeteners or carbohydrates such as glucose, sorbitol and the like. Preferably, the siloxane polymer is added to the gum base.

[0059] Where the oral composition is in the form of a film, it can be formed by any number of conventional film forming processes, such as conventional extrusion or solvent casting processes. For example, to prepare a film by solvent casting, a film forming polymer is dissolved in a sufficient amount of a solvent which is compatible with the polymer. After a solution has been formed, a plasticizer can be added with stirring, and heat can be applied, if necessary, to aid dissolution, until a clear and homogeneous solution has been formed, followed by the addition of the active ingredients, including the siloxane polymer, surface active agents, bulking agents, and any other ingredients such as flavors and sweeteners. For ease of use, the dry film can be cut into pieces of suitable size and shape and packed into a suitable container.

[0060] The following examples further describe and demonstrate various embodiments contemplated by the disclosure.

Example I

[0061] Three oral compositions are prepared in accordance with various embodiments of the disclosure, with each containing a distinct siloxane polymer having a hydrophilic portion. Two compositions designated "Composition A" and "Composition B" contain siloxane polymer having phosphorus-containing moieties, namely the PECOSIL®WDS-200 and PECOSIL® FS-100, respectively. "Composition C" contains a siloxane polymer comprising a hydrophilic portion having polyethylene and polypropylene oxide, namely DC-190. Each of these polymers was fully described above. Compositions A, B, and C are prepared using the ingredients listed in Table I. Additional active ingredients included in the composition are tetrasodium pyrophosphate (an anti-calculus active ingredient) and sodium fluoride (an anticaries active ingredient).

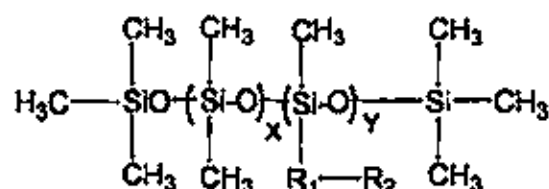
TABLE I			
Toothpaste formula with silicone (Weight %)			
Composition	A	B	C
Polyethylene glycol	3.0	3.0	3.0
Sodium CMC	0.6	0.6	0.6
Tetrasodium pyrophosphate	0.5	0.5	0.5
Purified water	q.s.	q.s.	q.s.
Sodium fluoride	0.243	0.243	0.243
Sorbitol	53.9	53.9	53.9
Sodium saccharin	0.3	0.3	0.3
ZEODENT® 115	25.5	25.5	25.5
Sodium lauryl sulfate	1.2	1.2	1.2
WDS-200	1.0	0	0
PS-100	0	1.00	0
DC-190	0	0	1.00
FD&C Blue #1 1% solution	0.16	0.16	0.16
Flavor	0.72	0.72	0.72
Total	100	100	100

[0062] Dentifrice compositions containing the siloxane polymers having at least one hydrophilic region have good antiplaque activity. The oral compositions are applied to one or more oral surfaces in the oral cavity, and promote overall oral health, including inhibition of plaque formation, gingivitis, periodontitis, caries, and the like. For example, where an oral care composition comprises a siloxane polymer having at least one hydrophilic region, the oral composition effectively inhibits plaque formation and growth of various oral bacteria on an oral surface. In certain embodiments, the oral composition further provides at least one of: antitartar, anti-caries, biofilm disruption and/or anti-inflammatory activity. Thus, certain oral compositions provide multiple oral care benefits simultaneously.

CLAIMS

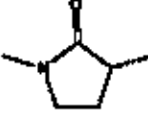
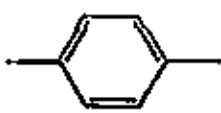
We claim:

1. An oral care composition comprising a siloxane polymer having a phosphorus-containing moiety.
2. A composition according to claim 1, wherein at least one of the moieties comprising phosphorus is selected from the group consisting of: phosphate, phosphonate, phospholipids, a phosphate-containing group, and combinations thereof.
3. A composition according to claim 1, wherein the siloxane polymer comprises a compound having the formula:



wherein R_1 is selected from the group consisting of: alkyl, aryl, amide, ester, pyrrolidone, vinyl, acrylate, siloxane, urethane, carbonate, vinyl alcohol, alkylene oxide, and combinations thereof; and R_2 comprises a moiety selected from the group consisting of: phosphate, phosphonate, phospholipids, a phosphate-containing group, and combinations thereof, "x" is 0 to 100 and "y" is 1 to 100.

4. A composition according to claim 3, wherein R_1 has the formula: $-(\text{CH}_2)_v-(\text{Q})_z$, where Q is at least one group selected from: $\text{C}_2\text{H}_5\text{O}$, $\text{C}_3\text{H}_5\text{O}$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})$;

CONH, CO_2 , NH, CONH,  and , wherein "v" and "z" are 1 to 16.

5. An oral care composition according to claim 1 comprising about 0.001 to about 3% by weight of the siloxane polymer.

6. A composition according to claim 1, wherein the composition comprises an ingredient selected from the group consisting of: surface active agents, viscosity modifiers, thickeners, humectants, diluents, fillers, pH modifying agents, plasticizers, fillers, waxes, texture modifiers, flavoring agents, sweetening agents, coloring agents, preservatives, solvents, and mixtures thereof.

7. A composition according to claim 1, further comprising an active ingredient selected from the group consisting of an antimicrobial agent, an antitartar agent, an anti-plaque, an anticaries agent, a biofilm disruption agent, an antioxidant, an anti-inflammatory agent, a tooth whitening agent, an anti-adhesion agent, a desensitizing agent, a malodor control agent, a flavoring agent, a coloring agent, an anti-aging agent, a salivary stimulant, a periodontal active, a conditioning agent, a natural extract, an essential oil, a nutrient, an enzyme, a protein, an amino acid, a vitamin, an analgesic, and mixtures thereof.

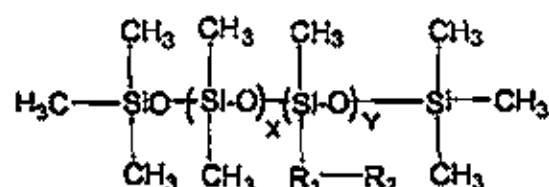
8. An oral care composition comprising a siloxane polymer having a phosphorus-containing moiety, wherein the siloxane polymer is an anti-attachment agent that substantially inhibits bacteria from forming a biofilm on a tooth surface.

9. An oral care composition according to claim 8, wherein the moiety containing phosphorus is selected from the group consisting of: phosphate, phosphonate, phospholipids, a phosphate-containing group, and combinations thereof.

10. An oral care composition according to claim 9, wherein the siloxane polymer comprises an alkyl phosphate siloxane.

11. An oral care composition according to claim 9, wherein the siloxane polymer comprises a polydimethylsiloxane phosphate.

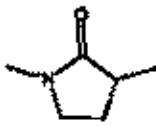
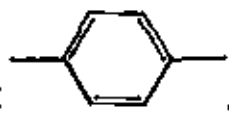
12. An oral care composition according to claim 8, wherein the siloxane polymer comprises a compound having the formula:



wherein R_1 is selected from the group consisting of: alkyl, aryl, amide, ester, pyrrolidone, vinyl, acrylate, siloxane, urethane, carbonate, vinyl alcohol, alkylene oxide, and combinations thereof; and R_2 comprises a moiety selected from the group consisting of: phosphate, phosphonate, phospholipids, a phosphate-containing group, and combinations thereof, "x" is 0 to 100 and "y" is 1 to 100.

13. An oral care composition according to claim 12, wherein R_1 has the formula:

$-(\text{CH}_2)_v-(\text{Q})_z$, where Q is at least one group selected from: $\text{C}_2\text{H}_2\text{O}$, $\text{C}_3\text{H}_4\text{O}$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})$;

CONH, CO₂, NH, CONH,  and , wherein "v" and "z" are 1 to 16.

17. An oral care composition according to claim 8 comprising about 0.001 to about 3% by weight of the siloxane polymer.

18. An oral care composition according to claim 8, further comprising an active ingredient selected from the group consisting of an antimicrobial agent, an antitartar agent, an anti-plaque, an anticaries agent, a biofilm disruption agent, an antioxidant, an anti-inflammatory agent, a tooth whitening agent, an anti-adhesion agent, a desensitizing agent, a malodor control agent, a flavoring agent, a coloring agent, an anti-aging agent, a salivary stimulant, a periodontal active, a conditioning agent, a natural extract, an essential oil, a nutrient, an enzyme, a protein, an amino acid, a vitamin, an analgesic, and mixtures thereof.

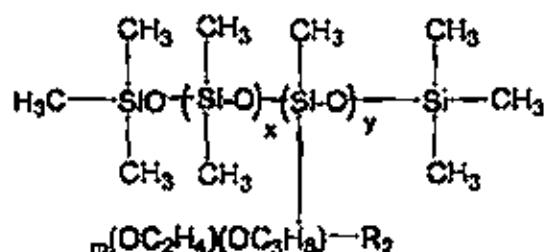
19. An oral care composition according to claim 8, further comprising a carrier ingredient selected from the group consisting of surface active agents, viscosity modifiers, thickeners, humectants, diluents, pH modifying agents, emollients, moisturizers, mouth feel agents, sweetening agents, flavoring agents, solvent, water, colorants, preservatives, and mixtures thereof.

20. An oral composition comprising an anti-plaque and/or antitartar active ingredient comprising a siloxane polymer having at least one hydrophilic region, wherein the siloxane polymer is an anti-attachment agent that substantially inhibits bacteria from forming a biofilm on a tooth surface, and wherein the composition is substantially free of lipophilic active ingredients.

21. An oral composition according to claim 20, wherein the hydrophilic region comprises a moiety selected from the group consisting of: alkylene oxides, phosphates, phosphonates, phospholipids, amines, and combinations thereof.

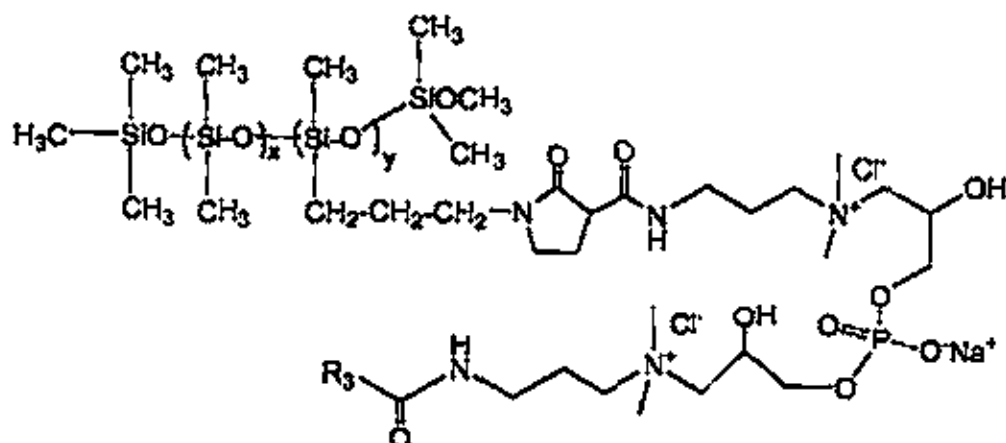
wherein R₁ is selected from the group consisting of: alkyl, aryl, amide, ester, pyrrolidone, vinyl, acrylate, siloxane, urethane, carbonate, vinyl alcohol, alkylene oxide, and combinations thereof; and R₂ comprises a moiety selected from the group consisting of: phosphate, phosphonate, phospholipids, a phosphate-containing group, and combinations thereof, "x" is 0 to 100 and "y" is 1 to 100.

25. An oral composition according to claim 20, wherein the siloxane polymer comprises a compound having the formula:



wherein R_2 is $-PO_3H_2$ or $-(CH_2CH_2H_3O)_nPO_3H_2$, "x" is 0 to 100, "y" is 1 to 100, and "m" is 0 to 15.

26. An oral composition according to Claim 20, wherein the siloxane polymer comprises a compound having the formula:



(18) Organización Mundial de Propiedad
Intelectual
Oficina Internacional



(43) Fecha de Publicación Internacional
16 de Noviembre de 2007 (16.11.2007)

PCT

(10) Número de Publicación Internacional
WO 2007/130841 A2

- (51) Clasificación Internacional de Patentes:
A61Q 11/00 (2006.01) A61K 8/396 (2006.01)
- (21) Número de Solicitud Internacional:
PCT/US2007/067498
- (22) Fecha de Presentación Internacional:
26 de Abril de 2007 (26.04.2007)
- (25) Lenguaje de entrega: Inglés
- (26) Lenguaje de Publicación: Inglés
- (30) Datos de la Prioridad:
60796,384 01 de Mayo de 2006 (01.05.2006) 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
- (73) Inventores/Solicitantes (solo para los Estados
Unidos): BOYD, Thomas, J. [EU/EU]; 226 High
Street, Metuchen, NJ 08840 (EU).
- (74) Agente: BILLOCK, Kristyna, A.; Colgate-
palmolive Company, 909 River Road, P.O. Box
1343, 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), Euroasiáticos (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 para volverlo a
publicar cuando se reciba estas modificaciones

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

(84) Título: COMPOSICIONES ORALES QUE COMPRENDEN POLÍMEROS DE SILOXANO

(57) Resumen: Se proporcionan unas composiciones orales que comprenden un ingrediente activo que comprende un polímero de siloxano que tiene por lo menos una región hidrófila. La composición para el cuidado oral comprende un polímero de siloxano que tiene una porción que contiene fósforo. Una fuente de iones fluoruro y/o otros ingredientes activos para el cuidado oral puede ser incluida en la composición para el cuidado oral. También se proporcionan unos métodos para elaborar y usar las composiciones orales.

COMPOSICIONES ORALES QUE COMPRENDEN POLÍMEROS DE SILOXANO

---oo0oo---

RESUMEN

Se proporcionan unas composiciones orales que comprenden un ingrediente activo que comprende un polímero de siloxano que tiene por lo menos una región hidrófila. La composición para el cuidado oral comprende un polímero de siloxano que tiene una porción que contiene fósforo. Una fuente de iones fluoruro y/o otros ingredientes activos para el cuidado oral puede ser incluida en la composición para el cuidado oral. También se proporcionan unos métodos para elaborar y usar las composiciones orales.

REFERENCIA RECÍPROCA A SOLICITUDES RELACIONADAS

[0001] Esta solicitud reclama el beneficio de la Solicitud de Patente Provisional de Estados Unidos N° 60/796.384 presentada el 1° de mayo de 2006, cuyo contenido es incorporado en la presente por referencia.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

[0002] La placa dental o biopelícula de placa es un depósito blando que se forma sobre los dientes y está implicada en la ocurrencia de gingivitis, periodontitis, caries y otras formas de enfermedad periodontal. Una biopelícula de placa proporciona un sitio para la formación de cálculo o sarro, el cual es un sólido desmineralizado duro formado sobre los dientes cuando unos cristales de fosfato de calcio se depositan en la película y matriz extracelular de la biopelícula de placa dental y se convierten en hidroxiapatita cristalina. Aunque un cepillado regular ayuda a prevenir la rápida acumulación de estos depósitos,

27

incluso un cepillado regular no es suficiente para quitar todos los depósitos de cálculo que se adhieren a los dientes.

[0003] Se ha encontrado que varios agentes antibacterianos tienen la capacidad clínica de retardar el crecimiento de las bacterias y por lo tanto tienen la capacidad de minimizar la formación de placa, las infecciones orales y las enfermedades asociadas con la misma. Sin embargo, muchos agentes antibacterianos son incompatibles o inestables con otros ingredientes activos para el cuidado oral, difíciles de entregar *in vivo*, o pueden desactivar a otros ingredientes adicionales deseables para el cuidado oral. Algunos agentes antibacterianos son difíciles de formular en composiciones orales o son costosos.

[0004] Sería conveniente desarrollar unas composiciones orales altamente eficaces que prevengan o combatan la formación de placa, así como otras implicaciones perjudiciales para la salud oral, usando un agente activo antiplaca y/o antisarro estable. Así, existe la necesidad de una composición para el cuidado oral que reduzca de manera efectiva el desarrollo o la progresión de una enfermedad oral, preferiblemente al tener un ingrediente activo que funciona para disminuir los efectos de la enfermedad oral previniendo o reduciendo los múltiples factores etiológicos que contribuyan a la enfermedad oral y/o la agravan. Adicionalmente, existe la necesidad de usar ingredientes activos para el cuidado oral estables en una composición para el cuidado oral, de modo que su funcionalidad y su biodisponibilidad al ser entregados a un sujeto *in vivo* sean preservadas y estabilizadas.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION