



República Federativa do Brasil
Ministério do Desenvolvimento, Indústria
e do Comércio Exterior
Instituto Nacional da Propriedade Industrial.

(21) **PI 0713831-8 A2**

(22) Data de Depósito: 30/07/2007
(43) Data da Publicação: 26/12/2012
(RPI 2190)



(51) *Int.Cl.:*
A61K 8/11
A61Q 11/00
A61K 8/25

(54) **Título:** COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL E MÉTODO DE FABRICAR CÁPSULAS

(30) **Prioridade Unionista:** 03/08/2006 EP 06118389.3

(73) **Titular(es):** UNILEVER N.V

(72) **Inventor(es):** BRIAN JOSEPH GROVES

(74) **Procurador(es):** KÁTIA JANE FERREIRA EVANGELISTA

(86) **Pedido Internacional:** PCT EP2007057829 de 30/07/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2008/015186de 07/02/2008

(57) **Resumo:** COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL E MÉTODO DE FABRICAR CÁPSULAS. Uma composição de cuidado oral compreendendo d e 0,01 a 50% em peso da composição de uma cápsula, a cápsula compreendendo um núcleo e um revestimento para o núcleo, o revestimento compreendendo uma cera dotada de um ponto de fusão de pelo menos 70 graus C, um óleo e um opacificante e o núcleo compreendendo um óleo, um pigmento e um estruturante de redução de cisalhamento.

“COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL E MÉTODO DE FABRICAR CÁPSULAS”

A presente invenção se refere a uma composição de cuidado oral compreendendo um pigmento e também a um método para a fabricação de cápsulas compreendendo um pigmento.

WO 2005/123023 (Ribi) descreve uma composição de pasta de dentes compreendendo um material que é capaz de mudar de cor em uma mudança de pH.

Em um primeiro aspecto a presente invenção é proporcionada uma composição de cuidado oral compreendendo de 0,01 a 50% em peso da composição de uma cápsula, a cápsula compreendendo um núcleo e um revestimento para o núcleo, o revestimento compreendendo uma cera dotada de um ponto de fusão de pelo menos 70 graus C, um óleo e um opacificante e o núcleo compreendendo um óleo, um pigmento e um estruturante de redução de cisalhamento. A referida composição proporciona uma indicação útil para o usuário que a escovação dos dentes ocorreu por um tempo predeterminado, por exemplo, o profissionalmente recomendado dois minutos.

Em um segundo aspecto da presente invenção, é proporcionado um método de fabricação de cápsulas compreendendo pigmento, o referido método compreendendo dispersar um pigmento em óleo e adicionar um estruturante de redução de cisalhamento ao gel de dispersão; aquecer um óleo, uma cera de ponto de fusão de pelo menos 70 graus C, e um opacificante para formar uma dispersão de fluxo livre do opacificante em cera derretida/óleo; e encapsular a dispersão gelificada de pigmento em óleo dentro da dispersão de opacificante em cera derretida/óleo.

A natureza das cápsulas usadas na presente invenção permite boa contenção do pigmento no interior de uma cápsula até o cisalhamento ocasionado durante a escovação dos dentes conduzir à ruptura das cápsulas e

a liberação do pigmento. Para que as cápsulas funcionem da maneira correta, apresentando cor apenas após um tempo desejado, tanto a natureza do revestimento como a natureza do núcleo das cápsulas são importantes. Assim, é importante que o revestimento compreenda uma cera como aqui descrita, um
5 óleo, e um opacificante e é importante que o núcleo compreenda um óleo, um pigmento, e um estruturante de redução de cisalhamento.

As cápsulas estão presentes em uma quantidade que varia a partir de 0,01 a 50% em peso da composição. Preferivelmente, as mesmas compreendem de 0,5 a 10% em peso da composição. A referida quantidade
10 proporciona o senso ótimo durante o uso e também um perfil ótimo de liberação de pigmento quando as cápsulas são rompidas durante a escovação dos dentes.

Tipicamente, o revestimento das cápsulas compreende de 20 a 60% do peso total das cápsulas, preferivelmente de 30 a 50%, e mais
15 preferivelmente em torno de 40%.

A cera presente no revestimento é preferivelmente uma com um ponto de fusão superior a 70 graus C, mais preferivelmente superior a 80 graus C. As referidas ceras incluem cera de carnaúba, Cera de inseto chinês, cera candilila, cera de rícino, cera Japão, goma laca, ouricouri e ceras sintéticas tais
20 como cera parafina de alto peso molecular e cera microcristalina.

Um revestimento de cápsula preferivelmente compreende de 20 a 60% em peso de cera com um ponto de fusão superior a 70 graus C e mais preferivelmente de 30 a 50%.

O óleo, tanto no revestimento como no núcleo, é preferivelmente
25 obtido de uma fonte animal, vegetal ou mineral. Fontes preferidas incluem fontes vegetais tais como frutas e sementes de plantas. Óleos preferidos incluem óleo de oliva, óleo de borragem, óleo de primula, óleo de amendoim, óleo de canola, óleo de açafrão, óleo de arroz, óleo de amendoim e outros

óleos de sementes de plantas incluindo óleo de girassol (semente) óleo. O óleo de girassol mais preferido é o assim chamado óleo de girassol de alta oleato que apresenta uma maior resistência a mofo.

O óleo no revestimento pode ser diferente do óleo no núcleo.

5 Um revestimento de cápsula preferivelmente compreende de 35 a 75% em peso de óleo e mais preferivelmente de 50 a 65%.

A proporção preferida entre a cera e o óleo no revestimento é de 20:80 a 80:20, mais preferivelmente de 30:70 a 40:60. As referidas proporções proporcionam uma cápsula com a melhor resistência à fratura durante
10 processamento e ainda o melhor perfil de liberação de pigmento.

Preferivelmente o opacificante está presente em uma quantidade para mascarar qualquer cor no núcleo, preferivelmente isto é de 1 a 10% em peso do revestimento, mais preferivelmente de 3 a 7% em peso do revestimento. Preferivelmente o opacificante é dióxido de titânio.

15 Tipicamente, o núcleo compreende de 40 a 80% em peso de uma cápsula, preferivelmente de 50 a 70% e mais preferivelmente em torno de 60% em peso da cápsula.

O óleo está presente de 50 a 95% em peso do núcleo, preferivelmente de 60 a 90 e mais preferivelmente de 70 a 80% em peso do
20 núcleo.

O núcleo também compreende um pigmento. Os pigmentos preferidos são azul, vermelho, verde, amarelo, roxo ou laranja. O mais preferido é azul. Especialmente preferidos são aqueles selecionados a partir de CI 14720, CI 15985, CI 16035, CI 16255, CI 19140, CI 42051, CI 42053, CI 42090, CI
25 47005, CI 73360, CI 74160, CI 74260, CI 75470, CI 75810, CI 77007, CI 77491 e CI 77492. Os referidos pigmentos apresentam o melhor perfil sensorio durante a escovação dos dentes.

O pigmento está presente de 1 a 50% em peso do núcleo,

preferivelmente de 10 a 30% em peso do núcleo.

O estruturante de redução de cisalhamento presente no núcleo das cápsulas é importante para se alcançar a desejada liberação retardada do pigmento. A presença do estruturante de redução de cisalhamento também
5 ajuda na fabricação das cápsulas usadas na presente invenção.

O estruturante de redução de cisalhamento está presente no núcleo de 1 a 40% em peso do núcleo, preferivelmente de 2 a 10 e mais preferivelmente de 4 a 6% em peso do núcleo.

Um estruturante de redução de cisalhamento preferido é sílica
10 fumada. As cápsulas preferivelmente apresentam uma média de peso de tamanho de partícula de 350 a 800 μm , mais preferivelmente de 400 a 600 μm . O referido apresenta o melhor sensorio para o usuário durante a escovação dos dentes.

As cápsulas de acordo com a invenção proporcionam a melhor
15 carga de pigmento sem comprometer a integridade da cápsula uma vez que o núcleo interno altamente viscoso é improvável que vaze de uma cápsula quando o revestimento é rompido. O pigmento irá apenas vazar quando a cápsula for completamente rompida, isto é durante a escovação.

A composição oral preferivelmente compreende não mais do que
20 0,3% em peso de pigmento com base em seu peso em pó, preferivelmente não mais do que 0,2% em peso.

A composição oral de acordo com a invenção pode compreender ingredientes adicionais os quais são comuns na técnica, tais como:

Agentes antimicrobianos, por exemplo, triclosan, clorhexidina,
25 cobre, zinco, e sais estanosos tais como citrato de zinco, sulfato de zinco, glicinato de zinco, citrato de sódio zinco e pirofosfato estanoso, extrato de sanguinarina, metronidazola, compostos de amônia quaternária, tais como cloreto de cetilpiridínio; bis-guanidas, tais como clorhexidina digluconato,

hexetidina, octenidina, alexidina; e compostos bisfenólicos halogenados, tais como 2,2' metilenobis-(4-cloro-6-bromofenol);

Agentes antiinflamatórios tais como ibuprofeno, flurbiprofeno, aspirina, indometacina etc.;

5 Agentes anti-cáries tais como fluoreto de sódio- e estanoso, aminofluoretos, monofluorofosfato de sódio, sódio trimeta fosfato e caseína;

Tampões de placa tais como uréia, lactato de cálcio, glicerofosfato de cálcio e poliacrilatos de estrôncio;

Vitaminas tais como Vitaminas A, C e E;

10 Extratos de planta;

Agentes de dessensibilização, por exemplo, citrato de potássio, cloreto de potássio, tartrato de potássio, bicarbonato de potássio, oxalato de potássio, nitrato de potássio e sais de estrôncio;

15 Agentes anti-tártaro, por exemplo, pirofosfatos de metal alcalino, polímeros contendo hipofosfito, fosfonatos orgânicos e fosfocitratos etc.;

Biomoléculas, por exemplo, bacteriocinas, anticorpos, enzimas, etc.;

Aromas, por exemplo, óleos de hortelã e menta;

Materiais protéicos tais como colágeno;

20 Conservantes;

Agentes opacificantes;

Agentes colorantes;

Agentes de ajuste de pH;

Agentes adoçantes;

25 Veículos farmaceuticamente aceitáveis, por exemplo, amido, sucrose, água ou sistemas de água/álcool etc.;

Tensoativos, tais como tensoativos aniônicos, não iônicos, catiônicos e zwitteriônicos ou anfotéricos;

Materiais abrasivos particulados tais como sílicas, aluminas, carbonatos de cálcio, dicálcio fosfatos, pirofosfatos de cálcio, hidróxiapatitas, trimetafosfatos, hexametafosfatos insolúveis e assim por diante, incluindo materiais abrasivos particulados capsulados, em geral em quantidades entre 3 e 60% em peso da composição de cuidado oral.

Umectantes tais como glicerol, sorbitol, propilenoglicol, xilitol, lactitol etc.;

Agentes de ligação e espessantes tais como carboximetil-celulose de sódio, goma xantano, goma arábica etc. assim como polímeros sintéticos tais como poliacrilatos e polímeros carboxivinila tais como Carbopol®;

Compostos poliméricos que podem aumentar o envio de ingredientes ativos tais como agentes antimicrobianos podem também ser incluídos. Exemplos dos referidos polímeros são copolímeros de polivinilmetiléter com anidrido malêico e outros polímeros similares de aumento de envio, por exemplo, aqueles descritos em DE-A-3, 942, 643 (Colgate);

Tampões e sais para tamponar o pH e a resistência iônica da composição de cuidado oral; e outros ingredientes opcionais que podem ser incluídos são por exemplo, agentes alvejantes tais como compostos peróxi, por exemplo, peroxidifosfato de potássio, sistemas efervescentes tais como de bicarbonato de sódio/ácido cítrico, sistemas de mudança de cor, e assim por diante.

Lipossomos podem também ser usados para aprimorar o envio ou a estabilidade dos ingredientes ativos.

As composições orais podem ser de qualquer forma comum na técnica, por exemplo, pasta de dentes, gel, mousse, aerossol, goma, pastilha, pó, creme, etc. e podem também ser formuladas em sistemas para uso em dispensadores do tipo de compartimento duplo.

EXEMPLOS

A Tabela 1 indica as formulações das cápsulas como usadas de

acordo com a presente invenção. Quantidades de componentes são percentuais em peso e as proporções do núcleo:revestimento indicadas são também em peso.

TABELA 1

	Exemplo			
	1	2	3	4
Núcleo:				
Óleo de oliva	--	--	72,5	--
Óleo de girassol	75	70	--	80
Pigmento	20	24	23,5	14
Sílica fumada	5	6	4	6
Revestimento:				
Cera de rícino	--	--	40	--
Cera de carnaúba	38,4	32	--	45
Óleo de girassol	57,6	65	53	50
Dióxido de titânio	4	3	7	5
Núcleo:revestimento	50:50	40:60	70:30	60:40

5 O processo a seguir foi usado para produzir as cápsulas do Exemplo 1.

Pigmento (10 g) foi disperso em óleo de girassol (28,8 g) usando um agitador superior. Sílica fumada hidrófoba (2,5 g) foi então adicionada à dispersão de modo a gelificar a mesma.

10 Em um recipiente separado, cera de carnaúba (19,2 g) foi aquecida a 85 - 90°C de modo a fundir a mesma e óleo de girassol (28,8g) e dióxido de titânio (2 g) foram então misturados usando um agitador superior.

A dispersão gelificada do pigmento e óleo de girassol foi agitada em água (4 L) mantida a 85 - 90°C. A esta mistura foi adicionada a mistura

aquecida de cera de carnaúba, óleo de girassol, dióxido de titânio, com agitação. Quando a referida adição foi concluída, a suspensão aquosa de encapsulados foi rapidamente resfriada abaixo do ponto de fusão da cera de carnaúba, os encapsulados foram extraídos, e secos.

5 Em um processo de fabricação alternativo, aplicável a toda co-extrusão, encapsulação é usada. No referido processo, há duas alimentações aquecidas (linhas protegidas ou com rastreamento de calor elétrico) que alimentam, por meio de bombas controláveis, a um bocal de co-extrusão que consiste de um tubo interno que porta o material de núcleo e um tubo externo
10 que porta o material de revestimento. O bocal em geral é dotado de meios de aquecimento de modo a evitar a solidificação da cera fundida no revestimento.

 Para controlar o tamanho particular das cápsulas, um meio para romper a dupla corrente de materiais que saem do bocal de co-extrusão é empregado. Meios típicos são vibratórios ou o uso de ar quente pressurizado.

15 Para solidificar os encapsulados, um meio de resfriamento é empregado. Um meio típico é um túnel de resfriamento, embora um “banho de coleta” de água resfriada possa alternativa ou adicionalmente ser empregado.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, que compreende de 0,01 a 50% em peso da composição de uma cápsula, a cápsula compreendendo um núcleo e um revestimento para o núcleo, o revestimento
5 compreendendo uma cera dotada de um ponto de fusão de pelo menos 70 graus C, um óleo e um opacificante e o núcleo compreendendo um óleo, um pigmento e um estruturante de redução de cisalhamento.

2. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com a reivindicação 1, onde a cera é dotada de um ponto de fusão de pelo menos 80
10 graus C.

3. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com a reivindicação 1 ou 2, onde o óleo é óleo de girassol.

4. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, onde o óleo é óleo de girassol
15 oleato superior.

5. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, onde a cera é cera de carnaúba.

6. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, onde a proporção em peso entre
20 a cera e o óleo no revestimento é de 20:80 a 80:20, preferivelmente de 30:70 a 40:60.

7. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, onde o opacificante é dióxido de titânio.

25 8. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes onde o estruturante de redução de cisalhamento é sílica fumada.

9. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com

qualquer uma das reivindicações precedentes, onde o pigmento é selecionado de - CI 14720, CI 15985, CI 16035, CI 16255, CI 19140, CI 42051, CI 42053, CI 42090, CI 47005, CI 73360, CI 74160, CI 74260, CI 75470, CI 75810, CI 77007, CI 77491 e CI 77492.

5 10. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, onde o tamanho de partícula de peso médio das cápsulas é de 350 a 800 μm , preferivelmente de 400 a 600 μm .

 11. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, onde a quantidade total de
10 pigmento não é superior a 0,3% em peso, preferivelmente não mais do que 0,2% em peso.

 12. COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, onde a composição compreende uma primeira fase e uma segunda fase e, onde a cápsula está presente apenas
15 na primeira fase.

 13. MÉTODO DE FABRICAR CÁPSULAS, compreendendo pigmento o referido método compreende dispersar um pigmento em óleo e adicionar um estruturante de redução de cisalhamento para gelificar a dispersão; aquecer um óleo, uma cera de ponto de fusão de pelo menos 70
20 graus C, e um opacificante para formar uma dispersão de fluxo livre do opacificante e m cera derretida/óleo; e encapsular a dispersão gelificada do pigmento em óleo dentro da dispersão de opacificante em cera derretida/óleo.

RESUMO**“COMPOSIÇÃO DE CUIDADO ORAL E MÉTODO DE FABRICAR
CÁPSULAS”**

Uma composição de cuidado oral compreendendo de 0,01 a
5 50% em peso da composição de uma cápsula, a cápsula compreendendo um
núcleo e um revestimento para o núcleo, o revestimento compreendendo uma
cera dotada de um ponto de fusão de pelo menos 70 graus C, um óleo e um
opacificante e o núcleo compreendendo um óleo, um pigmento e um
estruturante de redução de cisalhamento.