

A1

**DEMANDE  
DE BREVET D'INVENTION**

(21)

**N° 81 06668**

(54)

Composition thérapeutique utile notamment dans le traitement et la prévention des inflammations du parodonte et renfermant du Ta<sub>2</sub>O<sub>5</sub>.

(51)

Classification internationale (Int. Cl. <sup>3</sup>). A 61 K 33/00; C 01 G 35/00.

(22)

Date de dépôt..... 2 avril 1981.

(33) (32) (31)

Priorité revendiquée :

(41)

Date de la mise à la disposition du  
public de la demande..... B.O.P.I. — « Listes » n° 40 du 8-10-1982.

(71)

Déposant : Société anonyme dite : ASULAB, SA, résidant en Suisse.

(72)

Invention de : Rudolf Hatschek.

(73)

Titulaire : *Idem* (71)

(74)

Mandataire : Cabinet Beau de Loménie,  
55, rue d'Amsterdam, 75008 Paris.

Composition thérapeutique utile notamment dans le traitement et la prévention des inflammations du parodonte et renfermant du  $Ta_2O_5$

---

5 La présente invention concerne une composition thérapeutique utile notamment dans le traitement et la prévention des inflammations du parodonte et renfermant du pentoxyde de tantale en tant qu'ingrédient actif.

10 On sait que la plaque dentaire est à l'origine des caries et des infections du parodonte, et que les infections du parodonte marginal résultent très vraisemblablement de mécanismes inflammatoires, enzymatiques, cytotoxiques, chimiotactiques et immunologiques, qui se produisent au niveau du liseré gingival (en allemand "Saumpithel") interne.

15 Pour lutter et prévenir les infections et inflammations du parodonte, on sait que plusieurs solutions techniques ont déjà été préconisées depuis 1950 sans grand succès toutefois, eu égard à la prolifération des caries et des parodontopathies chez l'homme: les enzymes ont échoué du point de vue clinique; les fluorures auraient, à côté de leurs effets sur l'émail, un caractère bactériostatique, mais les preuves cliniques sérieuses et concordantes font toujours défaut; en dehors des antibiotiques peu recommandables, il ne reste que des agents désinfectants, tels que notamment la chlorhexidine, qui peuvent être utilisés en tant qu'inhibiteurs possibles de la plaque dentaire, mais leur utilisation de longue durée est déconseillée.

25 Selon l'invention, on préconise une nouvelle solution technique qui repose sur l'utilisation de  $Ta_2O_5$ . Il a été trouvé à présent, de façon surprenante, que  $Ta_2O_5$  agit en tant qu'inhibiteur de la plaque dentaire et est utile dans le domaine de l'hygiène bucco-dentaire pour prévenir les caries et les infections et inflammations du parodonte.

30 Plus précisément, on préconise selon l'invention une composition thérapeutique, utile notamment dans le traitement et la

prévention des inflammations du parodonte, qui est caractérisée en ce qu'elle renferme, en association avec un excipient physiologiquement acceptable, de 0,5 à 5 % en poids de pentoxyde de tantalum, le diamètre des particules de  $Ta_2O_5$  étant inférieur ou égal à 25  $\mu$ .

De façon avantageuse, l'excipient physiologiquement acceptable de la composition selon l'invention, comprendra un gel macromoléculaire destiné à la mise en suspension des fines particules de  $Ta_2O_5$ . Parmi les gels macromoléculaires qui conviennent, on peut faire appel à ceux qui sont notamment utilisés dans le domaine des pâtes dentifrices.

Selon un mode préféré de mise en oeuvre, la composition selon l'invention renfermera 0,5 à 1 % en poids de  $Ta_2O_5$  et la granulométrie sera telle que les particules de  $Ta_2O_5$  auront un diamètre compris entre 1 et 20  $\mu$ , et encore plus avantageusement un diamètre compris entre 1 et 5  $\mu$ .

La composition selon l'invention peut notamment se présenter sous la forme d'une pâte dentifrice, d'une pâte gingivale, ou d'un chewing-gum.

Des exemples de formulation nullement limitatifs ont été donnés ci-après pour illustration.

Exemple 1 :

Formulation pour pâte dentifrice

$Ta_2O_5$ (granulométrie de 1-5 $\mu$ ) .....	1 g
Excipient aromatisé comprenant une substance macromoléculaire pour la mise en suspension de $Ta_2O_5$ .....	q.s.p. 100 g

Exemple 2 :

Formulation pour pâte dentifrice

$Ta_2O_5$ (granulométrie : 1-5 $\mu$ ) .....	0,75 g
Excipient glycéринé et aromatisé .....	q.s.p. 100 g

Exemple 3 :Formulation pour pâte dentifrice

	Ta <sub>2</sub> O <sub>5</sub> (granulométrie 1-5 $\mu$ ) .....	0,5 g
	Alumine trihydratée.....	50 g
5	Substance macromoléculaire pour la mise en suspension de Ta <sub>2</sub> O <sub>5</sub> .....	0,5-1 g
	Autres composants de l'excipient aromatisé qsp 100 g	

On a résumé ci-après les résultats des essais qui ont été entrepris au moyen de Ta<sub>2</sub>O<sub>5</sub> dans le domaine bucco-dentaire.

10 Ta<sub>2</sub>O<sub>5</sub> a été administré à des sujets volontaires (8 de sexe féminin et 12 de sexe masculin) âgés de 14 à 18 ans sous la forme de pâte dentifrice renfermant 1 % en poids de Ta<sub>2</sub>O<sub>5</sub> (9 sujets, application de la pâte par trois brossages quotidiens pendant 24 jours) et sous forme de chewing-gum renfermant 1 % en poids de Ta<sub>2</sub>O<sub>5</sub>

15 (11 sujets, trois prises par jour pendant 24 jours).

On a mesuré avant puis après traitement la valeur du PBI ("Parodontal Bleeding Index" - indice de saignement du parodonte) qui enregistre le saignement (symptôme le plus important de l'inflammation gingivale) selon la technique de SCHUH, et l'indice

20 OHI-S ("Oral Hygiene Index" - indice de l'hygiène orale) selon la technique de GREEN et VERMILLON pour évaluer quantitativement la plaque dentaire.

La moyenne des résultats obtenus pour les 20 sujets donnée ci-après démontre l'intérêt de l'utilisation de Ta<sub>2</sub>O<sub>5</sub> dans le

25 domaine de l'hygiène dentaire et plus précisément le domaine du traitement des inflammations du parodonte puisque les indices PBI et OHI-S diminuent, dès lors que :

- avant traitement on a :

PBI = 28,6

30 OHI-S = 1,86

- et après traitement on a :

PBI = 19

OHI-S = 1,56

## REVENDEICATIONS

1. Composition thérapeutique utile notamment dans le traitement et la prévention des inflammations du parodonte, caractérisée en ce qu'elle renferme, en association avec un excipient physiologiquement acceptable, de 0,1 à 5 % en poids de pentoxyde de tantale, le diamètre des particules de  $Ta_2O_5$  étant inférieur ou égal à 25  $\mu$ .  
5
2. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle renferme de 0,1 à 5 % en poids de  $Ta_2O_5$  en suspension dans un gel macromoléculaire.
- 10 3. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce qu'elle renferme de 0,5 à 1 % en poids de  $Ta_2O_5$ .
4. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce que les particules de  $Ta_2O_5$  ont un diamètre compris entre 1 et 20  $\mu$ .
- 15 5. Composition selon la revendication 1, caractérisée en ce que les particules de  $Ta_2O_5$  ont un diamètre compris entre 1 et 5  $\mu$ .