



(19)대한민국특허청(KR)
(12) 등록특허공보(B1)

(51) Int. Cl.

A61K 8/896 (2006.01)
A61Q 11/00 (2006.01)
A61K 8/72 (2006.01)

(45) 공고일자 2007년04월16일
(11) 등록번호 10-0708239
(24) 등록일자 2007년04월10일

(21) 출원번호	10-2004-7018057	(65) 공개번호	10-2004-0106509
(22) 출원일자	2004년11월09일	(43) 공개일자	2004년12월17일
심사청구일자	2004년11월09일		
번역문 제출일자	2004년11월09일		
(86) 국제출원번호	PCT/US2003/014694	(87) 국제공개번호	WO 2003/094877
국제출원일자	2003년05월09일	국제공개일자	2003년11월20일

(30) 우선권주장 60/378,994 2002년05월09일 미국(US)

(73) 특허권자 더 프록터 앤드 갬블 캄파니
 미국 오하이오 45202 신시내티 프록터 앤드 갬블 플라자 1

(72) 발명자 마제티사트야나라야나
 미국 45044 오하이오주 미들타운 체리 로럴 드라이브 8305

 리노엘리자베스앤브라운
 미국 45014 오하이오주 페어필드 비너스 레인 5553

 코박스스티븐앤드라스
 미국 45140 오하이오주 러브랜드 러빈우드 테라스 112

 올리에필리쁘
 프랑스 에프-69007 리옹 그랑데 튀 드 라 기요띠에르 177

 글랜드르프윌리엄마이클
 미국 45040 오하이오주 메이슨 키너랜드 웨이 6933

(74) 대리인 특허법인코리아나

심사관 : 정영자

전체 청구항 수 : 총 6 항

(54) 다이카르복시 관능화 폴리오르가노실록산을 함유하는 구강케어 조성물

(57) 요약

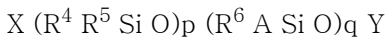
본 발명은 표면의 처리 및 개질을 위한, 그리고 음이온성 기, 특히 카르복실산기를 포함하는 웬던트 부분으로 관능화된 실록산 중합체를 함유하는 조성물로 처리된 표면으로의 활성제의 전달을 향상시키기 위한 조성물 및 방법을 개시한다. 카르

복시 관능화 실록산 중합체를 함유하는 본 발명의 조성물은 적합한 표면에 도포될 때 처리된 표면 상에 실질적으로 소수성인 코팅을 형성한다. 이러한 중합체는 중합체의 음이온성기와 결합 또는 연결을 형성할 수 있는 양이온성 부위를 가지는 표면에 효과적으로 침착된다. 처리된 표면은 카르복시 관능화 실록산 중합체의 침착으로 인하여 소수성으로 되는데, 이는 그 후 상기 표면에 세정의 용이성, 착색 제거 및 방지, 미백 등과 같은 다양한 최종 사용 이득을 부여한다. 카르복시 관능화 실록산 중합체는 또한 표면 상으로 활성제를 침착시키고 처리된 표면 상에서 상기 활성제의 보유성 및 효능을 개선하는 담체로서 작용한다. 본 발명의 조성물은 구강 케어, 모발 및 피부 케어, 개인 케어, 화장품과, 천 및 경성 표면 세정 및 컨디셔닝을 포함하는 다양한 용도에 유용하다. 예로는 천연 치아 및 인공 보철의 세정 및 미백에서 사용하기 위한 구강용 조성물; 치아 상의 플라크, 치석 및 표면 침착된 착색물의 방지, 감소 또는 제거를 위한 구강 조성물; 및 광택, 매끄러움 및 긍정적인 느낌 상의 이득을 치아에 제공하는 조성물이 있는데, 본 조성물은 치아 및 기타 구강 표면에 다이카르복시 관능화 실록산 중합체를 효과적으로 침착시키는 제형 중 약 0.1 중량% 이상의 다이카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유한다.

특허청구의 범위

청구항 1.

구강용으로 허용가능한 담체 및 하기 식의 0.1 중량% 내지 80 중량%의 다이카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유하는 것을 특징으로 하는, 대상의 치아 또는 인공 보철의 세정 및 미백용 구강 케어 조성물:



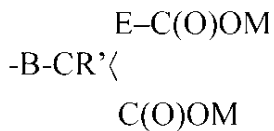
여기서,

X는 식 $R^1R^2R^3SiO-$ 의 트라이오르가노실록실 말단기, 또는 Z 말단기 - 여기서, Z는 $-OH$ 를 나타냄 - 를 나타내며;

Y는 식 $-SiR^3R^2R^1$ 의 트라이오르가노실릴 말단기 또는 W 말단기 - 여기서, W는 수소임 - 를 나타내며;

동일하거나 상이할 수 있는 R1 내지 R6 각각은 선형 또는 분지형 C1-C8 알킬 라디칼을 나타내며;

A는 하기 식:



(여기서,

B는 1 내지 30개의 탄소 원자를 가지는 하나 이상의 알킬 라디칼로 선택적으로 치환되며 2 내지 30개의 탄소 원자를 가지는 알킬렌 잔기를 나타내며,

R'은 수소 원자를 나타내며,

E는 존재하지 않거나 1 내지 30개의 탄소 원자를 가지는 하나 이상의 알킬 라디칼로 선택적으로 치환되며 1 내지 5개의 탄소 원자를 가지는 알킬렌 잔기이며,

M은 H 또는 알칼리 금속, 알칼리 토금속 및 치환 또는 비치환 암모늄, 피페리디늄 또는 알칸올아민으로 구성된 군으로부터 선택되는 양이온임)의 다이카르복시산 라디칼을 나타내며;

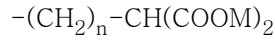
p는 0 내지 500 범위의 평균 값을 나타내며;

q는 1 내지 100 범위의 평균 값이며;

Z 및 W 말단기의 갯수 대 X 및 Y 말단기의 총 갯수의 비는 0/100 내지 75/100임.

청구항 2.

제1항에 있어서, 다이카르복시 관능화 실록산 중합체가



또는



(여기서, n은 2 내지 30이고, M은 제1항에서 정의한 바와 같음)로부터 선택되는 하나 또는 조합의 다이카르복시산 펜던트기를 포함하는 것을 특징으로 하는 구강 케어 조성물.

청구항 3.

제1항에 있어서, 탈색제, 치아 색상 변경제, 효소, 결석 방지제, 플루오라이드 이온 공급원, 향미생물제, 항염증제, H2 길항제, 진통제, 항바이러스제, 의치용 접착제, 착향제 및 그의 혼합물로 구성된 군으로부터 선택되는 구강 케어제를 더 함유하는 것을 특징으로 하는 구강 케어 조성물.

청구항 4.

제3항에 있어서, 구강 케어제가 조성물의 중량을 기준으로 0.1% 내지 20.0%의 양의 탈색제인 것을 특징으로 하는 구강 케어 조성물.

청구항 5.

제4항에 있어서, 탈색제가 과산화물, 과불산염, 과탄산염, 퍼옥시산, 과황산염, 아염소산염, 및 그의 혼합물로 구성된 군으로부터 선택되는 것을 특징으로 하는 구강 케어 조성물.

청구항 6.

제5항에 있어서, 탈색제가 과산화수소, 과산화우레아, 과산화칼슘, 과탄산나트륨, 아염소산나트륨, 아염소산칼륨 및 그의 혼합물로 구성된 군으로부터 선택되는 것을 특징으로 하는 구강 케어 조성물.

청구항 7.

삭제

청구항 8.

삭제

청구항 9.

삭제

청구항 10.

삭제

명세서

기술분야

본 발명은 표면의 처리 및 변경을 위한, 그리고 음이온성 기, 구체적으로는 카르복시기를 포함하는 펜던트 부분으로 관능화된 실록산 중합체를 함유하는 조성물로 처리된 표면으로의 활성화제의 전달을 향상시키기 위한 조성물 및 방법을 제공한다. 카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유하는 본 발명의 조성물은 적합한 표면에 도포될 때 처리된 표면 상에 실질적으로 소수성인 코팅을 형성한다. 이러한 중합체는 중합체의 음이온성 기와 결합 또는 연결을 형성할 수 있는 양이온성 부위를 가지는 표면 상에 효과적으로 침착된다. 처리된 표면은 카르복시 관능화 실록산 중합체의 침착으로 인하여 소수성으로 되는데, 이는 그 후 세정의 용이성, 착색 제거 및 방지, 미백 등과 같은 다양한 최종 사용 이득을 상기 표면에 부여한다. 카르복시 관능화 실록산 중합체는 또한 표면 상으로의 활성화제의 침착을 향상시키고 처리된 표면 상에서의 상기 활성화제의 보유성 및 효능을 개선하는 작용을 한다. 본 발명의 조성물은 구강 케어, 모발 및 피부 케어, 개인 케어, 화장품과, 천 및 경성 표면의 세정 및 컨디셔닝을 포함하는 다양한 용도에 유용하다.

배경기술

세정의 용이성; 오염, 착색 및 박테리아의 부착과 기타 원하지 않는 침착에 대한 저항성; 발수성과; 미백, 윤기, 부드러움, 매끄러움 및 반들반들함을 포함하는 외관 및 결(texture) 상의 이득을 포함하는 특성을 표면에 부여하기 위하여 이들 표면을 개질(modify)시키는 수단을 가지는 것이 바람직하다. 본 기술 분야에는 상기 이득 중 하나 이상을 제공하려는 무수히 많은 제품이 충분히 많이 있지만 이러한 이득을 전달하기 위한 개선된 수단에 대한 조사가 계속되고 있다.

특히 표면을 소수성으로 개질시키는 것이 전술한 이득의 제공에 있어서 유리하다. 예를 들어, 소수성 표면은 대부분의 오염물 및 착색물을 밀어내는 경향이 있으며 따라서 세정을 더욱 용이하게 한다. 천, 세라믹, 자기, 유리 및 치아와 같은 표면은 세정의 용이성 및 착색 방지 이득을 위하여 소수성으로 개질될 수 있다. 천, 종이, 가죽, 피부 및 모발 상의 소수성 코팅은 부드러움, 매끄러움 및 윤활성을 포함하는 바람직한 결 특징을 또한 제공한다.

폴리다이메틸실록산(PDMS)과 같은 폴리알킬실록산을 포함하는 실리콘 오일은 그의 소수성 성질 때문에 모두 힐(Hill) 등에게 허여된 미국 특허 제5,032,387호, 제5,165,913호 및 제5,057,308호에 기술되어 있는 것과 같이 치아에 음식 조각, 세포 잔해 및 플라크 전구체가 부착하는 것을 억제하기 위해 예를 들어 구강 위생 제제에 함유시키는 것이 제안되어 왔다. 롤라(Rolla) 등의 미국 특허 제5,422,098호에는 PDMS와 같은 액체 실리콘 오일과, 향균제의 타액 내로의 느린 방출로 인하여 플라크 형성에 대한 치아 보호에 유용한 것으로 기술되어 있는 상기 오일에 용해된 지용성 향균제를 함유하는 치약이 개시되어 있다. 그러나 PDMS 중합체는 일반적으로 치아 표면 상에서의 PDMS의 열악한 부착 및 보유성 때문에 치아의 코팅에 성공적으로 사용되지는 못하였다. 표면 상으로의 실리콘의 부착을 개선하기 위하여 카르복시, 무수물, 폴리올 및 아미노기와 같은 관능기의 부가에 의해 실리콘을 변성시키는 것이 제안되었다. 이러한 변성 실리콘은 섬유, 직물, 가죽, 모발 및 피부, 치아, 종이, 플라스틱, 목재, 금속, 유리, 돌 및 콘크리트를 포함하는 다양한 표면의 개질을 위하여 제안되었다. 예를 들어, 아미노알킬 실리콘이 모두 체세브로-폰즈(Chesebrough-Ponds)에게 양도된 미국 특허 제5,078,988호, 제5,154,915호, 제5,188,822호 및 제5,427,770호와, 모두 프록터 앤드 갬블(Procter & Gamble)에게 양도된 미국 특허 제6,153,567호, 제6,129,906호 및 제6,024,891호에 기술되어 있다. 카르복실 또는 무수물 기를 포함하는 실리콘이 모두 다우 코닝(Dow Corning)에게 양도된 미국 특허 제4,501,619호, 제4,563,347호, 제4,587,320호, 제4,944,978호, 제5,063,044호 및 제5,280,019호와, 도레이 실리콘(Toray Silicone)에게 양도된 미국 특허 제4,857,212호와, 모두 바스프(BASF)에게 양도된 미국 특허 제4,701,269호, 제4,931,062호, 제5,702,490호 및 제6,007,801호와, 치쏘(Chisso)에게 양도된 미국 특허 제4,658,049호와, 질레트(Gillette)에게 양도된 미국 특허 제4,844,888호와, 둘 모두 실테크(Siltech)에게 양도된 미국 특허 제5,248,783호 및 제5,296,625호와, 워커 쉘미(Wacker Chemie)에게 양도된 미국 특허 제5,015,700호 및 제5,504,233호와, 카오(Kao)에게 양도된 일본 특허 공개 공보 제04/120014호 및 미국 특허 제5,210,251호와, 피피지(PPG)에게 양도된 미국 특허 제4,876,152호와, 로레알(L Oreal)에게 양도된 미국 특허 제4,342,742호와, 둘 모두 쓰리엠(3M)에게 양도된 미국 특허 제5,536,304호 및 제5,888,491호에 개시되어 있다. 다이메틸콘 코폴리올이 모두 프록터 앤드 갬블에게 양도된 미국 특허 제5,759,523호, 제5,827,505호, 제5,856,282호, 제6,004,538호 및 제6,129,906호에 개시되어 있다.

심지어 이 분야의 연구 실체에서도, 표면 상에 침착되어 이들 표면의 특징을 변경시킴으로써 그 표면에 전술한 다양한 이득을 제공할 수 있는 지속성(substantive) 중합체를 계속하여 찾아야 한다. 따라서, 본 발명은 예를 들어 치아 및 구강의 기타 표면의 보호를 위한 용도에 있어서 유용성이 발견되는 지속성 표면 개질 실록산 중합체 및 이러한 중합체를 함유하는 조성물을 제공한다.

사람의 치아는 상아질로 불리는 연성의 내층 및 이 내부 구조를 보호하며 법랑질로 불리는 경성의 외층으로 구성된다. 치아의 법랑질 층은 선천적으로는 반투명성의 백색이거나 약간 회백색이다. 전형적인 상태 하에서는 법랑질 표면은 피막(pellicle)으로 불리는 얇은 타액 단백질 층으로 코팅되어 있다. 법랑질 또는 피막 또는 이들 둘 모두는 변색되거나 착색될 수 있으며 외부에 바람직하지 못한 외관으로 존재할 수 있다. 또한 치아의 법랑질 층은 다공성 표면 구조를 생성하는 하이드록시아파타이트 미네랄 결정으로 주로 만들어진다. 법랑질의 다공성 성질은 착색 성분 및 변색 물질이 치아 구조 내로 침투되게 하여 치아 구조가 착색된 것으로 보이게 하는 것으로 믿어진다. 치아 변색은 법랑질/피막 상에서 외인성이거나 법랑질 및 상아질 또는 이들 둘 모두를 관통하는 내인성의 것일 수 있다.

구강 건강을 보증하는 효과적인 구강 세정은 치아 플라크 및 치석의 조절을 필요로 한다. 치아 플라크 및 치석의 형성은 치아 우식, 치은염, 치주 질환 및 치아 손상의 주요 원인이 된다. 치아 플라크는 박테리아, 상피 세포, 백혈구, 대식세포 및 기타 구강 삼출물의 혼합 매트릭스이다. 박테리아는 플라크 매트릭스의 약 3/4을 구성한다. 어떤 플라크 샘플은 400종 이상의 다양한 미생물을 포함할 수 있다. 이러한 혼합물은 호기성 및 혐기성 세균, 진균류 및 원생동물을 포함한다. 바이러스가 또한 플라크 샘플 중에서 발견되어 왔다.

이러한 유기체 및 구강 분비물의 매트릭스는 계속해서 확장되어 가까이에 위치한 다른 플라크 성장체와 합해지게 된다. 박테리아는 미생물에 대한 에너지를 제공하는 구강 내의 슈크로스로부터 레반(levans) 및 글루칸(glucans)을 합성한다. 이러한 글루칸, 레반 및 미생물은 플라크의 계속된 증식에 대한 점착성 골격을 형성한다.

플라크는 다시 치석의 형성을 위한 핵으로 작용한다. 치석 또는 때로 칭해지는 바와 같이 결석은 치은 가장자리에서 치아의 표면 상에 형성되는 침착물이다. 치은연상 치석은 주로 타액선관의 오리피스에 인접한 영역, 예를 들어 하부 전치부의 혀 표면, 상부 제1 및 제2 어금니의 볼 표면, 및 후방 어금니의 말단 표면상에서 나타난다. 충분히 진행된 치석은 무기물로 이루어져 있으며, 이는 대부분 뼈, 법랑질 및 상아질과 유사한 하이드록시아파타이트 결정 격자 구조 내에 있는 칼슘 포스페이트이다. 유기물 부분이 또한 존재하며, 유기물 부분은 탈락된 상피 세포, 백혈구, 타액 침전물, 음식물 잔해 및 다양한 유형의 미생물로 구성된다. 또한 발달 중인 플라크는 비교적 불규칙한 표면, 예를 들어 치석에 의해 제공되는 표면에서 가장 용이하게 부착될 수 있다. 치석이 성숙하여 경화되면, 치석은 음식의 색원체의 흡수로 인하여 착색되거나 변색되지 않는 한 색상이 가시적으로 백색으로 되거나 누르스름해진다. 미적 차원에서 보기 흉하고 바람직하지 않은 것 이외에도, 충분히 진행된 치석 침착은 항상 잇몸 염증의 원인이 된다.

플라크 및 치석의 증식을 지연 또는 중단시키지 못하면 구강 건강에 해롭다. 치아 플라크 및 치석의 형성은 치아 우식, 치은염, 치주질환 및 궁극적인 치아 손상을 초래할 수 있다. 부가적으로, 치석 및 플라크는 행동 및 환경적 요인과 함께 치아의 미적 외관에 상당한 영향을 미치는 치아 착색 형성을 초래하게 된다. 치아의 착색 성향에 기여하는 행동 및 환경적 요인으로는 커피, 차, 콜라 또는 담배 제품의 규칙적인 복용 및 또한 착색을 촉진하는 구강 제품, 예컨대 클로르헥시딘의 복용이 포함된다.

특정의 카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유하는 본 발명의 조성물은 치아 상에 소수성 코팅을 침착시킴으로써 플라크 방지, 치석 방지 및 착색 방지 이득을 제공하는데, 이 소수성 코팅은 오염, 착색 및 박테리아 부착과 다른 원하지 않는 침착물에 대한 저항성을 제공하기에 충분한 시간 동안 치아 상에 보유된다. 또한, 본 발명의 조성물은 구강 케어 활성제, 예를 들어 탈색제의 치아 표면으로의 전달 및 보유 특성을 향상시키며, 따라서 미백 및 착색 제거 특성을 개선시킨다.

발명의 요약

본 발명은 천연 치아 및 인공 보철의 세정 및 미백화에서 사용하기 위한 것으로, 치아 상의 플라크, 치석 및 표면 침착된 착색의 방지, 감소 또는 제거를 위한 구강 조성물을 제공하는데, 본 조성물은 치아 및 기타 구강 표면에 카르복시 관능화 실록산 중합체를 효과적으로 침착시켜 그 위에서의 보유 시간이 연장된 지속성 코팅을 형성하는 제형 중 약 0.1 중량% 이상의 카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유한다. 본 발명의 중합체는 카르복시기를 포함하는 펜던트 부분을 가지는 소수성 실록산 골격을 포함하며 극성 표면, 즉 양이온성 부위를 가지는 극성 표면 상으로 침착되는 능력을 가진다. 본 조성물은 수성 기재이거나 본질적으로 비수성 기재일 수 있으며 하나 이상의 구강 케어 활성제, 예를 들어 탈색제 및 색상 변경제를 포

함하는 치아 미백제, 향미생물제, 효소, 플루오라이드, 탈감작제 및 착향제를 더 함유할 수 있다. 본 발명은 또한 본 발명의 조성물의 투여에 의해 천연 치아 및 인공 보철을 세정 및 미백화하고, 플라크, 우식증(caries), 결석 및 표면 침착된 치아 착색을 방지, 감소 또는 제거하고, 광택, 매끄러움 및 긍정적 치아 느낌의 이득을 제공하는 방법에 관한 것이다.

본 발명의 상기 및 기타 특징과 태양 및 이점은 하기의 발명의 상세한 설명으로부터 당업자에게 명백하게 될 것이다.

발명의 상세한 설명

본 명세서는 본 발명을 구체적으로 지시하며 명확하게 청구하는 청구의 범위로 결론을 맺지만, 본 발명은 이하의 상세한 설명으로부터 더 잘 이해될 것으로 생각된다.

본원에서 사용되는 모든 비율 및 비는, 달리 명시되지 않는 한 전달되는 전체 구강 제형이 아닌 특정 구강 조성물의 중량을 기준으로 한 것이다. 모든 측정은 달리 명시되지 않는 한 25°C에서 이루어진 것이다.

본 명세서에서, 용어 "포함하는"은 최종 결과물에 영향을 미치지 않는 다른 단계 및 성분들이 첨가될 수 있음을 의미한다. 이 용어는 "구성되는" 및 "본질적으로 구성되는"이란 용어를 포함한다.

"구강 조성물"은, 통상적인 용도에 있어서 특정 치료제의 전신 투여 목적으로 의도적으로 삼켜지는 것이 아니라, 구강 활성화의 목적으로 치아 표면 및/또는 구강 조직의 사실상 전부와 접촉하기에 충분한 시간 동안 구강에서 보유되는 제품을 의미한다. 본 발명의 구강 조성물은 크림형 치약, 치약, 치분, 치아용 겔, 치은하용 겔, 구강 세정액(mouthrinse), 의치용 제품, 구강 스프레이, 로젠지, 구강용 정제 또는 추잉 껌의 형태일 수 있다. 구강 조성물은 구강 표면으로의 직접적인 도포 또는 부착을 위한 스트립 또는 필름 상에 혼입될 수도 있다.

본 명세서에서 사용되는 바와 같이, 용어 "치약"은 달리 명시되지 않는 한 페이스트, 겔 또는 액체 제형을 의미한다. 치약 조성물은 단일상 조성물일 수 있거나 2 이상의 개별적인 치약 조성물의 조합일 수 있다. 치약 조성물의 형태는 어떤 원하는 형태이든 가능하며, 예컨대 딥 스트라이프 형태(deep striped), 표면 스트라이프 형태(surface striped), 다층화된 형태, 페이스트를 둘러싸는 겔을 갖는 형태 또는 이의 임의의 조합일 수 있다. 둘 이상의 개별 치약 조성물을 포함하는 치약 중에서 각각의 치약 조성물은 디스펜서의 물리적으로 분리된 구획 내에 보유되어 나란히 분배될 수 있다.

본 명세서에서 사용되는 바와 같이 "디스펜서"라는 용어는 치약과 같은 조성물의 분배에 적합한 임의의 펌프, 튜브 또는 용기를 의미한다.

본 명세서에서 사용되는 용어 "치아"는 인공 치아 또는 인공 보철 뿐만 아니라 천연 치아를 의미한다.

본 명세서에서 사용되는 용어 "구강용으로 허용가능한 담체"는 본 발명의 조성물로 사용하기에 안전하고 효과적인 임의의 물질을 의미한다. 이러한 물질은 플루오라이드 이온 공급원, 치석 방지제, 완충제, 연마제, 과산화물 공급원, 알칼리 금속 중탄산염, 증점제, 흡습제, 물, 계면활성제, 이산화티타늄, 착향제 시스템, 감미제, 자일리톨, 착색제 및 그의 혼합물을 포함한다.

본 명세서에서, 용어 "결석"(tartar) 및 "치석"(calculus)은 교호적으로 사용되며, 무기화된 치아 플라크 침전물을 의미한다.

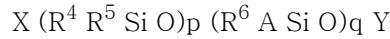
본 발명에 따르면, 치아, 세라믹, 피부, 천, 모발, 유리 및 종이와 같은 극성 표면에 도포하기 위한, 카르복실산기로 관능화된 하나 이상의 실록산 중합체를 필수 성분으로 함유하는 조성물이 제공된다. 본 조성물은 처리된 표면에 카르복시 관능화 실록산 중합체를 효과적으로 침착시키는 제형 중 약 0.1 중량% 이상의 카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유한다. 본 발명의 중합체는 소수성 실록산 골격과 카르복시기를 포함하는 음이온성의 펜던트 부분을 포함하며 세정 및 세제 조성물과 같은 수성계 제형과 본질적으로 비수성계인 제형으로부터 표면 상으로 침착되는 능력을 가진다. 카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유하는 본 발명의 조성물은 적합한 표면에 도포될 때 처리된 표면에 실질적으로 소수성인 코팅을 형성하는데, 이 코팅은 그 표면에서의 보유 시간이 연장된 특성을 가진다.

본 발명에서 유용한 카르복시 관능화 실록산 중합체는 그 자체가 극성 표면에 부착하여 정전기적 상호작용에 의해 그 위에 코팅을 형성하는 것으로 생각되는데, 즉 중합체의 펜던트 카르복시기와 처리 표면 상의 양이온 또는 일부 다른 양 하전된 부위 사이에서 복합체를 형성하는 것으로 생각된다. 예를 들어, 구강 용도의 경우 카르복시기는 치아에 존재하는 칼슘 이

온과 상호 작용하는 것으로 생각된다. 천의 경우 상호 작용은 칼슘 이온 또는 셀룰로오스기와 일어날 수 있으며, 모발 또는 피부의 경우에는 단백질 잔류물과 일어날 수 있으며, 유리 또는 세라믹의 경우에는 칼슘 또는 기타 금속 이온과 일어날 수 있다. 이와 같이 카르복시기는 실록산 중합체 골격을 표면 상에 고착시킴으로써 그 표면을 소수성으로 개질시키는 역할을 한다.

바람직하게는 폴리실록산 주쇄로부터의 관능기 펜던트는 2개의 카르복시기를 포함하며, 이럼으로써 특히 양 하전된 칼슘 이온을 포함하는 치아와 같은 표면 상에서의 중합체의 침착 및 보유 특성을 개선시킨다. 카르복시기와 치아 표면 사이의 상호 작용은 사실상 음이온성 카르복시기가 양 하전된 칼슘 이온과 복합체를 형성하는 정전기적 상호 작용이다.

본 발명에 유용한 다이카르복시산 관능화 폴리오르가노실록산은 하기 식을 가진다:



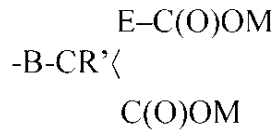
여기서,

X 말단기는 식 $R^1 R^2 R^3 Si O^-$ 의 트라이오르가노실록실 말단기, 또는 Z 말단기(여기서, Z는 $-OH$ 를 나타냄)를 나타내며;

Y 말단기는 식 $-Si R^3 R^2 R^1$ 의 트라이오르가노실릴 말단기, 또는 W 말단기(여기서, W는 $-H$ 를 나타냄)를 나타내며;

동일하거나 상이할 수 있는 R^1 내지 R^6 각각은 선형 또는 분지형 C1-C8 알킬 또는 페닐 라디칼, 바람직하게는 메틸을 나타내며;

A는 하기 식:



(여기서,

B는 1 내지 30개의 탄소 원자를 가지는 하나 이상의 알킬 라디칼로 선택적으로 치환되며, 2 내지 30개, 바람직하게는 3 내지 8개의 탄소 원자를 가지는 알킬렌 잔기를 나타내며,

R'은 수소 원자 또는 1 내지 30개의 탄소 원자를 가지는 알킬 라디칼을 나타내며,

E는 존재하지 않거나, 1 내지 30개의 탄소 원자를 가지는 하나 이상의 알킬 라디칼로 선택적으로 치환되며 1 내지 5개, 바람직하게는 1 내지 3개의 탄소 원자를 가지는 알킬렌 잔기이며,

M은 H, 양이온, 또는 하이드록시 또는 알콕시기로 선택적으로 치환되며 1 내지 4개의 탄소원자를 가지는 알킬 라디칼임)의 다이카르복시산 라디칼을 나타내며;

p는 0 내지 1000, 바람직하게는 0 내지 500, 더 바람직하게는 5 내지 200 범위의 평균 값이며;

q는 1 내지 100, 바람직하게는 1 내지 50의 평균 값이며;

Z 및 W 말단기의 갯수 대 X 및 Y 말단기의 총 갯수의 비는 0/100 내지 75/100, 바람직하게는 0/100 내지 30/100 범위이다.

바람직한 실시 형태에 있어서 p/q 비는 1/3 내지 99/1(실록실 단위와 비교하여 펜던트 2산기 1-75%에 상응함), 바람직하게는 1/1 내지 10/1이다. Z가 $-OH$ 이고/이거나 Y가 H인 생성물은 부산물이다.

다이카르복시 라디칼의 양이온성 염은 알칼리 금속(나트륨, 칼륨, 리튬) 염, 알칼리 토금속(칼슘, 바륨) 염, 비치환 또는 치환 암모늄(메틸-, 다이메틸-, 트라이메틸-, 또는 테트라메틸암모늄, 다이메틸피페리디늄) 염일 수 있거나, 알칸올아민(모노에탄올아민, 디에탄올아민, 트라이에탄올아민)으로부터 유도될 수 있다.

다이카르복시 라디칼의 모노- 또는 다이에스테르 유도체 (M = 알킬) 외에도 본 발명은 아마이드 및 다이아미드 유도체를 포함한다.

본 발명의 다이카르복시 관능화 실록산 중합체는 일반적으로 예를 들어 미국 특허 제3,159,601호, 제3,159,662호 및 제3,814,730호에 기술되어 있는 바와 같이 유효량의 하이드로실릴화 금속 촉매(백금)의 도움으로 폴리알킬하이드로젠실록산과 다이카르복시 A 기의 전구체인 알파-올레핀 무수물의 하이드로실릴화 반응, 이어서 무수물 기의 가수분해에 의해 제조된다.

하이드로실릴화 반응은 20 내지 200°C, 바람직하게는 60 내지 120°C의 온도에서, 바람직하게는 백금 KARSTEDT 촉매 (Pt의 중량을 기준으로 1 내지 300 ppm, 바람직하게는 5 내지 50 ppm)의 도움으로 실시될 수 있다. 폴리알킬하이드로젠실록산 및 알파 알케닐 무수물의 상대적인 양은 알파 알케닐 무수물의 화학량론적 과량에 상응한다 (폴리알킬하이드로젠실록산 1 몰당 알파 알케닐 무수물이 많아야 5 몰, 바람직하게는 폴리알킬하이드로젠실록산 1 몰당 알파 알케닐 무수물이 많아야 2 몰).

가수분해 반응은 실온 내지 150°C, 바람직하게는 40 내지 120°C 범위의 온도에서 촉매와 함께 또는 촉매 없이 물을 이용하여 실시될 수 있다. 이 반응에 적합한 촉매는 0.05 내지 5% 범위의 양의 루이스(Lewis) 산, 예를 들어 TiCl₄, ZnCl₂, MgCl₂, 또는 브뢴스테드(Bronstedt) 산 또는 염기, 예를 들어 CH₃COOH, H₂SO₄, HCl, KOH, NaHCO₃일 수 있다.

바람직한 중합체는 하기의 다이카르복시산 펜던트 기 중 하나 또는 상기 기의 조합을 포함한다:



여기서, n은 2 내지 30이다.

바람직한 실시 형태에 있어서, 관능화 폴리오르가노실록산 중 2산 펜던트 기 A는 $-(CH_2)_3-CH(COOM)-CH_2COOM$ 이며, 중합체는 폴리알킬하이드로젠실록산 및 알릴 식신산 무수물의 하이드로실릴화 반응과 이에 이어지는 무수물 기의 가수분해에 의해 제조된다. 바람직하게는 폴리알킬하이드로젠실록산은 폴리다이메틸하이드로젠실록산이며 중합체는 트라이메틸실릴기로 종결된다.

카르복실산기는 정전기적 상호 작용, 수소 결합 또는 양이온과의 복합화를 통하여 양이온성의 하전된 표면에 용이하게 결합/연결될 수 있다. 이러한 결합에 의해 중합체는 도포시 용이하게 침착되어 처리된 표면 상에 코팅을 형성하는데, 전하 상호 작용이 구동력이 되며 동시에 결합력이 더 강해질수록 코팅의 보유성 또는 내구성이 더 길어진다. 폴리실록산 골격은 표면을 소수성으로 개질시키는데, 이는 발수성, 더욱 신속한 건조성, 착색 방지성, 세정의 용이성, 부드러움 및 윤활성을 포함하는 특성을 표면에 부여한다. 본 발명의 중합체는 PDMS와 같은 비관능화 폴리실록산에 비하여 침착의 용이성 및 코팅의 보유성 측면에서 뿐만 아니라 저수준의 통상의 계면활성제를 필요로 하며 통상의 계면활성제로 제형화 및 유화시키는 것이 용이하다는 측면에서도 더욱 우수하게 수행된다. 더욱 더 유리하게는, 본 발명의 중합체는 다른 활성제, 예를 들어 탈색제 및 색상 변경제를 포함하는 치아 미백제, 향미생물제, 우식 방지제, 효소, 화장 성분, 착향제 및 방향제를 위한 담체로 작용하는 능력을 가지며, 따라서 활성제를 그의 활성이 필요한 표면에 지속적으로 방출하기 위한 아주 효과적인 매트릭스로 작용할 수 있다. 중합체 코팅의 다른 중요한 이점은 장시간 동안 표면에 결합 또는 부착하는 지속성(substantivity) 또는 능력이다. 구체적으로는, 지속성은 중합체 코팅이 처리 표면 상에 보유됨으로써 표면 위에 침착된 활성제가 급속히 세척되는 것을 방지하는 보호 장벽으로 작용하는 능력을 말한다. 지속성은 활성제가 처리 표면과 장기간 접촉하게 하기 때문에 중요하다. 그 결과 표면에 전달되는 탈색, 향미생물, 우식 방지 또는 기타 활성 효과가 향상된다. 본 발명은 원하는 이득을, 특히 반복된 사용으로 원하는 이득을 전달하기에 충분한 시간 동안 보유되는 지속성의 소수성 코팅을 치아 또는 기타 구강 표면 상에 침착시키는 구강 케어 조성물을 제공한다.

특히 치약 또는 구강 세정액과 같이 매일 사용하는 구강 케어 조성물로부터의 탈색제 전달과 관련하여, 소수성의 폴리실록산 골격과 다이카르복시기를 포함하는 펜던트 부분을 가지는 본 발명의 중합체는 두드러진 미백 이득을, 특히 본 조성물을 반복 사용하여 두드러진 미백 이득을 제공하기에 충분한 시간 동안 치아 상에서의 탈색제의 전달 및 보유를 돕는 데에 비길바 없이 적합하다. 본 발명자들은 탈색제를 포함하는 종래의 치약이 미백 이득을 제공하는 데에 일반적으로 효과가 없다는 것을 밝혀냈는데, 그 이유는 탈색제가 충분히 오랜 기간 동안 치아 상에 보유되지 않기 때문이다. 따라서, 연장된 접촉 시간 동안 탈색제를 침착 및 보유하는 지속성 중합체를 사용하는 본 발명의 방법은 신규한 접근법을 나타낸다.

본 명세서에서 기술한 특정 폴리실록산 구조에도 불구하고, 적합하게 관능화되어 치아에 침착 및 부착되며 탈색 활성제의 전달 및 보유를 돕는 다른 소수성 중합체가 바람직한 미백 이득을 제공할 것으로 기대된다. "적합하게 관능화된"이라는 것은 중합체가 칼슘 이온과의 복합화에 의한 것과 같이 치아 표면과 상호 작용하여 치아 상에 지속성의 소수성 코팅을 형성하는 관능기를 포함한다는 것을 의미한다. 표면 상에 "지속성의 소수성 코팅"을 형성하는 이라는 것은 표면의 소수성 특징이 예를 들어 표면의 물 접촉각이 약 15도 이상 증가하는 것으로 측정되는 바와 같이 증가하며, 증가된 소수성 특징은 약 5분 이상의 기간 동안 유지된다는 것을 의미한다. 예를 들어 본 발명의 다이카르복시 관능화 폴리실록산을 함유하는 조성물을 이용한 처리 후 치아 법랑질의 물 접촉각은 pH, 구강 환경 상태 및 치아 표면 특징을 포함하는 다수의 인자에 따라 약 20도 내지 약 50도로 증가할 수 있다.

하나의 태양에 있어서, 본 발명은 구강용으로 허용가능한 담체 중에 치아 상에 소수성 코팅을 침착시키는 다이카르복시 관능화 실록산 중합체 약 0.1% 이상을 함유하는 매일 사용하기 위한 구강 케어 조성물을 제공하는데, 이 코팅은 각각의 사용 이후 약 5분 내지 약 8시간의 기간 동안 보유된다. 본 발명의 구강 조성물은 천연 치아 및 인공 보철의 향상된 전체적인 세정, 플라크의 억제, 미백, 착색 제거 및 착색 방지 효과를 제공한다. 특징의 작용 기전에 구애됨이 없이, 본 발명의 관능화 실록산 중합체의 카르복시기는 치아 표면 상에 존재하는 양으로 하전된 칼슘 이온과 복합체를 형성하는 것으로 생각된다. 칼슘/중합체 복합체는 중합체가 이가 칼슘 이온과 복합체를 형성하여 5-, 6- 및 7-원의 고리 구조를 형성하는 2개 이상의 카르복시기를 포함할 경우 특히 안정하다. 이러한 복합체 형성은 치아 상의 중합체 코팅의 침착 및 보유의 구동력이 된다. 치아 상의 중합체 코팅은 착색 및 플라크 형성을 방지하는 장벽으로 작용하는 것으로 생각된다. 착색 물체(coloring body) 또는 착색 물질, 예를 들어 폴리페놀계 화합물(카테콜 및 탄닌)은 다양한 식품, 예를 들어 차, 커피, 와인, 콜라 및 다양한 과일 및 과실류의 성분이다. 이러한 식품의 섭취는 치아 상으로의 착색 물질의 침착을 유발하는 것으로 알려져 있다. 본 발명의 조성물을 칫솔질 또는 헹굼과 같은 방법에 의해 구강에 적용할 경우 소수성 실록산 중합체 코팅이 치아 상에 침착된다. 따라서, 착색 물체가 구강에 도입될 경우 이들은 치아 표면 대신 실록산 중합체 코팅과 접촉하게 되고, 이렇으로써 착색물이 치아 상에 형성되는 것을 방지한다. 치아 상에서의 새로운 플라크의 형성이 또한 방지될 수 있으며, 부가적으로 중합체 코팅은 플라크가 차, 맥주, 레드 와인 등과 같이 섭취된 음식물로부터 착색 성분을 흡수하여 치아 상에 착색물을 형성하는 것을 억제한다.

또한 본 발명의 다이카르복시 관능화 중합체는 구강 케어 활성제, 예를 들어 탈색제 및 기타 치아 미백제, 항미생물제, 플루오라이드, 탈감작제 및 착향제를 위한 담체로 작용하여 계획된 기능을 수행할 수 있는 구강 표면 상에 이들 활성제가 침착 및 보유되는 것을 돕는 능력을 가진다. 중합체 코팅은 구강 케어 활성제를 구강 표면과 밀접하게 접촉하도록 보유함으로써 탈색 또는 항미생물 효과와 같은 활성이 더욱 오랫동안 지속되도록 하는 보호 장벽으로도 작용하는 것으로 생각된다. 효과적인 탈색에 의해 착색물이 제거되어 더욱 하얀 치아가 되게 된다. 구강 표면 상의 항미생물제의 보유성 향상에 의해 치은염, 치주 질환, 및 치아 플라크를 포함하는 다양한 치과 질환을 야기하는 세제이거나 상기 질환과 관련되어 있는 구강 미생물이 감소된다.

그러므로, 본 발명의 추가의 태양에 있어서, 구강용으로 허용가능한 담체 중 약 0.1% 이상의 카르복시-관능화 실록산 중합체 및 약 0.1% 내지 약 20.0%의 치아 미백제, 바람직하게는 약 1% 내지 약 10%의 치아 미백제의 조합물을 함유하며 사람의 치아 및 인공 보철 상에서 전체적인 세정, 미백, 착색 제거 및 착색물 형성 방지를 위해 사용하기 위한 조성물이 제공된다.

본 발명에서 사용하기에 적합한 공중합체는 실록산 중합체인데, 이는 프로필 석신산 펜던트 기를 포함하며 평균 분자량 (average molecular weight, AMW)이 약 300 내지 약 300,000 범위이며 로디아(Rhodia)로부터 입수가 가능하다. 바람직한 중합체는 평균 분자량이 1000 내지 100,000 범위이며 실록실 단위에 대하여 약 1% 내지 75%의 펜던트 2산 기를 가지는 것이다. 중합체는 본 발명의 치약, 헹굼액, 추잉검 등의 조성물에 약 0.1 중량% 내지 약 20 중량%, 바람직하게는 약 0.5 중량% 내지 약 5 중량%로 혼입된다. 도포형(paint-on) 또는 잔류형(leave-on) 겔과 같은 구강용 겔 또는 의치 접착제용으로는 약 80%에 이르는 더욱 많은 양이 사용될 수 있다.

본 발명의 구강 케어 조성물에 사용될 수 있는 치아 미백 활성제는 탈색제 또는 산화제, 예를 들어 과산화물, 과불산염, 과탄산염, 퍼옥시산, 과황산염, 금속 아황산염, 및 그의 조합을 포함한다. 적합한 과산화 화합물에는 과산화수소, 과산화우레아, 과산화칼슘 및 이들의 혼합물이 포함된다. 바람직한 과탄산염은 과탄산 나트륨이다. 기타 적합한 미백제로는 과황산 칼륨, 과황산 암모늄, 과황산 나트륨 및 과황산 리튬; 과불산 일수화물 및 사수화물; 및 소듐 피로포스페이트 퍼옥시하이드레이트가 포함된다. 적합한 금속 아염소산염에는 아염소산 칼슘, 아염소산 바륨, 아염소산 마그네슘, 아염소산 리튬, 아염소산 나트륨 및 아염소산 칼륨이 포함된다. 바람직한 아염소산염은 아염소산 나트륨이다. 추가의 미백 활성제는 하이포아염소산염 및 이산화염소일 수 있다.

본 발명의 구강 조성물은 치약, 크립형 치약, 치분, 국소 구강용 겔, 구강 세정액, 의치 제품, 구강 스프레이, 로젠지, 구강용 정제 또는 추잉검의 형태일 수 있다. 구강용 조성물은 구강 표면으로의 직접적인 적용 또는 부착을 위한 스트립 또는 필름 상에 혼입될 수도 있다.

수용액 형태의 본 발명의 구강 케어 조성물의 최적 pH는 약 4.0 내지 약 10.0 범위이다. 본 조성물의 바람직한 pH는 약 5.0 내지 약 8.0이다.

본 발명의 구강 케어 조성물은 상기한 성분 외에도 하기 단락에서 기술되는 추가 성분을 함유할 수도 있다.

구강용으로 허용가능한 담체

구강용으로 허용가능한 담체는 국소 구강 투여에 적합한 하나 이상의 양립가능한 고체 또는 액체 충전 희석제 또는 캡슐화 물질(encapsulating substances)을 포함한다. 본 명세서에서 사용되는 바와 같이, 용어 "양립가능한"은 조성물의 성분들이 조성물의 안정성 및/또는 효능을 상당히 감소시키는 방식으로 상호작용하지 않고서도 혼합될 수 있다는 것을 의미한다.

본 발명의 담체 또는 부형제(excipients)는 이하에서 더욱 자세히 기술되는 바와 같이 치약(비연마성 겔 및 치은연하 도포용 겔을 포함), 구강 세정액, 구강 스프레이, 추잉검 및 로젠지(입냄새용 민트 포함)의 일반적인고 통상적인 성분들을 포함한다.

사용될 담체의 선택은 기본적으로 조성물이 구강 내로 도입되는 방식에 의해 결정된다. 크립형 치약(치아용 겔 등을 포함)이 사용되는 경우, 베네틱트(Benedict)의 미국 특허 제3,988,433호에 개시된 "크립 치약용 담체"(예를 들어, 연마제, 거품제, 결합제, 흡습제, 착향제 및 감미제 등을 포함)가 선택된다. 구강 세정액이 사용되는 경우, 예를 들어 베네틱트의 미국 특허 제3,988,433호에 개시된 바와 같이 "구강 세정액용 담체"(예를 들어, 물, 착향제 및 감미제 등을 포함)가 선택된다. 이와 유사하게, 구강 스프레이가 사용되는 경우 "구강 스프레이용 담체"가 선택되며; 로젠지가 사용되는 경우 "로젠지용 담체"가 선택되는데(예를 들어 캔디 베이스), 이 캔디 베이스는 그라벤스테터(Grabenstetter) 등의 미국 특허 제4,083,955호에 개시되어 있으며; 추잉 검이 사용되는 경우 그라벤스테터 등의 미국 특허 제4,083,955호에 개시되어 있는 바와 같이 "추잉 검용 담체"가 선택된다(예를 들어 검 베이스, 착향제 및 감미제를 포함함). 봉제(sachet)가 사용되는 경우, "봉제 담체"(예를 들어, 봉제백, 착향제 및 감미제)가 선택된다. (활성제를 치주낭 또는 치주낭 주위로 전달하기 위한) 치은하용 겔이 사용되는 경우, 다마니(Damani)에게 1993년 3월 30일에 허여된 미국 특허 제5,198,220호 및 다마니에게 1993년 9월 7일에 허여된 미국 특허 제5,242,910호에 개시되어 있는 바와 같이 "치은하 겔용 담체"가 선택된다. 기타 유용한 담체는 루카코빅(Lukacovic) 등의 미국 특허 제5,213,790호(1993.5.23), 제5,145,666호(1992.9.8) 및 제5,281,410호(1994.1.25)와, 샤페어(Schaefer)의 미국 특허 제4,849,213호 및 제4,528,180호에 개시된 바와 같은 2상성(biphasic)의 치약 제형을 포함한다. 본 발명의 조성물 제조에 적합한 담체들은 본 기술 분야에 널리 공지되어 있다. 이들의 선택은 맛, 비용 및 저장 안정성 등과 같은 이차적 고려 사항을 참고하여 결정될 것이다.

본 발명의 조성물은 수성 또는 비수성일 수 있는, 치은연하 겔을 포함하는 비연마성 겔의 형태일 수 있다. 수성 겔은 일반적으로 증점제(약 0.1 내지 약 20%), 흡습제(약 10 내지 약 55%), 착향제(약 0.04 내지 약 2%), 감미제(약 0.1 내지 약 3%), 착색제(약 0.01 내지 약 0.5%) 및 나머지 물을 포함한다. 본 발명의 조성물은 충치 방지제(플루오라이드 이온으로서 약 0.05 내지 약 0.3%) 및 치석 방지제(약 0.1 내지 약 13%)를 포함할 수 있다.

본 발명의 조성물은 또한 크립형 치약, 치아용 겔 및 치분과 같은 치약의 형태일 수 있다. 이러한 크립형 치약 및 치아용 겔의 성분으로는 일반적으로 치과용 연마제(약 5 내지 약 50%), 계면활성제(약 0.5 내지 약 10%), 증점제(약 0.1 내지 약 5%), 흡습제(약 10 내지 약 55%), 착향제(약 0.04 내지 약 2%), 감미제(약 0.1 내지 약 3%), 착색제(약 0.01 내지 약 0.5%

) 및 물(2 내지 약 45%) 중 하나 이상이 포함된다. 이러한 크립형 치약 또는 치아용 겔은 또한 충치 방지제(플루오라이드 이온으로서 약 0.05 내지 약 0.3%) 및 치석 방지제(약 0.1% 내지 약 13%) 중 하나 이상을 포함할 수 있다. 물론, 치분은 실질적으로 모두 비액체 성분을 함유한다.

본 발명의 다른 바람직한 조성물은 구강 스프레이를 포함한 구강 청결제이다. 이러한 구강 청결제 및 구강 스프레이의 성분은 통상 물(약 45 내지 약 95%), 에탄올(약 0 내지 약 25%), 흡습제(약 0 내지 약 50%), 계면활성제(약 0.01 내지 약 7%), 착향제(약 0.04 내지 약 2%), 감미제(약 0.1 내지 약 3%) 및 착색제(약 0.001 내지 약 0.5%) 중 하나 이상을 포함한다. 상기 구강 청결제 및 구강 스프레이는 또한 충치 방지제(플루오라이드 이온으로서 약 0.05 내지 약 0.3%) 및 치석 방지제(약 0.1 내지 약 3%) 중 하나 이상을 포함할 수 있다.

본 발명의 다른 바람직한 조성물은 세척액(irrigation fluid)을 포함한 치과용 용액이다. 이러한 치과용 용액의 성분으로는 일반적으로 물(약 90 내지 약 99%), 보존제(약 0.01 내지 약 0.5%), 증점제(0 내지 약 5%), 착향제(약 0.04 내지 약 2%), 감미제(약 0.1 내지 약 3%) 및 계면활성제(0 내지 약 5%) 중 하나 이상이 포함된다.

추잉 껌 조성물은 통상 껌 베이스(약 50 내지 약 99%), 착향제(약 0.4 내지 약 2%) 및 감미제(약 0.01 내지 약 20%) 중 하나 이상을 포함한다.

본 명세서에서 사용되는 바와 같이 "로젠지"라는 용어는 구취 제거 민트(breath mint), 트로키, 향정(pastille), 마이크로캡슐 및 동결 건조 형태(케이크, 웨이퍼, 박막, 정제) 및 압축형 정제를 포함하는 급용해 고체형을 포함한다. 본 명세서에서 사용되는 용어 "급용해 고체형"은 고체 투여형(dosage form)이 구강 내에 위치된 후 약 60초 미만, 바람직하게는 약 15초 미만, 더욱 바람직하게는 약 5초 미만 내에 용해되는 것을 의미한다. 급용해 고체형은 공히 본 출원인에게 양도된 WO 95/33446 및 WO 95/11671, 미국 특허 제4,642,903호, 미국 특허 제4,946,684호, 미국 특허 제4,305,502호, 미국 특허 제4,371,516호, 미국 특허 제5,188,825호, 미국 특허 제5,215,756호, 미국 특허 제5,298,261호, 미국 특허 제3,882,228호, 미국 특허 제4,687,662호 및 미국 특허 제4,642,903호에 개시되어 있다.

로젠지는 착향제 베이스 중에 치료제를 포함하는 원판형 고형물을 포함한다. 이 베이스는 단단한 슈가 캔디, 글리세린화 젤라틴 또는 슈가와 형태를 제공하기에 충분한 점액성 물질의 조합일 수 있다. 이러한 투여 형태는 일반적으로 문헌 [Remington: The Science and Practice of Pharmacy, 19th Ed., Vol. II, Chapter 92, 1995]에 기술되어 있다. 로젠지 조성물(압축된 정제 형태)은 일반적으로 하나 이상의 충전제(압축성 슈가), 착향제 및 윤활제를 포함한다. 본 발명에서 고려되는 마이크로캡슐의 형태는 1994년 12월 6일에 허여된 피터슨(Peterson) 등의 미국 특허 제5,370,864호에 개시되어 있다.

또 다른 태양에 있어서, 본 발명은 본 발명의 조성물이 함유된 치과용 기구를 제공한다. 이 치과용 기구는 구강 내의 치아 및 기타 조직과 접촉하기 위한 기구를 포함하며, 상기 기구에는 본 발명의 다이카르복시 관능화 실록산 중합체를 함유하는 조성물이 함유된다. 이 치과용 기구는 치과용 플로스(floss) 또는 테이프, 칩, 스트립, 필름 및 중합체 섬유를 포함하는 함입 섬유일 수 있다.

발명의 조성물 중에 함유될 수 있는 담체 또는 구강 케어용 부형제의 유형이 비제한적인 구체예와 함께 이하에 기술된다.

연마제

본 발명의 조성물의 국소형 구강 담체에 유용한 치과용 연마제로는 여러가지 상이한 물질들이 포함된다. 선택되는 물질은 관심 조성물 내에서 양립할 수 있는 물질이어야 하며, 상아질을 과도하게 마모시키지 않아야 한다. 적합한 연마제의 예로는 겔 및 침전물을 포함하는 실리카, 불용성 소듐 폴리메타포스페이트, 수화된 알루미늄, 탄산칼슘, 다이칼슘 오르토포스페이트 다이하이드레이트, 칼슘 피로포스페이트, 트라이칼슘 포스페이트, 칼슘 폴리메타포스페이트 및 우레아와 포르말데히드의 미립 축합 생성물과 같은 수지성 연마 물질이 포함된다.

본 발명의 조성물에서 사용하기 위한 다른 연마제류로는 1962년 12월 25일에 쿨리 및 그라벤스테터(Cooley & Grabenstetter)에게 허여된 미국 특허 제3,070,510호에 기술되어 있는 미립자형의 열경화성 중합 수지이다. 적합한 수지로는 예를 들어 멜라민, 페놀, 우레아, 멜라민-우레아, 멜라민-포르말데히드, 우레아-포르말데히드, 멜라민-우레아-포르말데히드, 가교된 에폭사이드 및 가교된 폴리에스테르를 들 수 있다.

다양한 유형의 실리카 치과용 연마제는 치아 법랑질 또는 상아질의 과도한 마모 없이 이례적인 치아 세척 및 폴리싱 성능의 특유한 효과를 제공하기 때문에 바람직하다. 다른 연마제 뿐만 아니라, 본 명세서에 개시된 실리카 연마 폴리싱 물질은 일반적으로 약 0.1 내지 약 30 마이크로, 바람직하게는 약 5 내지 약 15 마이크로미터의 평균 입자 크기를 갖는다. 연마제는 1970년 3월 2일에 허여된 패이더(Pader) 등의 미국 특허 제3,538,230호 및 1975년 1월 21일에 허여된 디기울리오(DiGiulio)의 미국 특허 제3,862,307호에 기술되어 있는 실리카 크세로겔(xerogel)과 같은 침전 실리카 또는 실리카 겔일 수 있다. 바람직한 것은 더블유.알. 그레이스 앤드 컴퍼니, 데이비슨 케미칼 디비전(W.R. Grace & Company, Davison Chemical Division)으로부터 상표명 "실로이드"(Syloid)로 시판되고 있는 실리카 크세로겔이다. 또한 바람직한 것은 제이.엠. 후버 코퍼레이션(J. M. Huber Corporation)이 상표명 제오덴트(Zeodent(등록상표))로 시판하는 것과 같은 침전 실리카 물질, 특히 명칭이 Zeodent(등록상표) 119, Zeodent(등록상표) 118, Zeodent(등록상표) 128, Zeodent(등록상표) 109 및 Zeodent(등록상표) 129인 실리카이다. 본 발명의 크림형 치약에서 유용한 치과용의 실리카 연마제의 유형은 1982년 7월 29일에 허여된 웨이슨(Wason)의 미국 특허 제4,340,583호와; 본 출원인에게 공히 양도된 미국 특허 제5,603,920호(1997년 2월 18일에 허여), 제5,589,160호(1996년 12월 31일에 허여), 제5,658,553호(1997년 8월 19일에 허여), 제5,651,958호(1997년 7월 29일에 허여), 제5,716,601호(1998년 2월 10일에 허여) 및 가출원 제60/300766호(2001년 6월 25일에 출원)에 더욱 상세하게 기술되어 있다.

연마제의 혼합물이 사용될 수 있다. 본 발명의 치약 조성물 중의 연마제의 총량은 조성물의 중량을 기준으로 바람직하게는 약 6% 내지 약 70% 범위이며; 크림형 치약은 조성물의 중량을 기준으로 약 10% 내지 약 50%의 연마제를 함유한다. 본 발명의 용액, 구강 스프레이, 구강 청결제 및 비연마성 겔 조성물의 경우에는 통상 연마제를 함유하지 않는다.

계면활성제

본 발명의 선택적 제제 중 하나는 계면활성제이며, 바람직하게는 사코시네이트 계면활성제, 이세티온산염 계면활성제 및 타우레이트 계면활성제로 구성된 군으로부터 선택되는 것이다. 본 발명에서 사용하기에 바람직한 것은 이들 계면활성제의 알칼리 금속 또는 암모늄 염이다. 본 발명에서 가장 바람직한 것은 라우로일 사코시네이트, 미리스토일 사코시네이트, 팔미토일 사코시네이트, 스테아로일 사코시네이트 및 올레오일 사코시네이트의 나트륨 및 칼륨 염이다.

이러한 계면활성제는 본 발명의 조성물 중에 전체 조성물의 중량을 기준으로 약 0.1 내지 약 2.5 %, 바람직하게는 약 0.3 내지 약 2.5 %, 더욱 바람직하게는 약 0.5 내지 약 2 %로 존재할 수 있다.

다른 적합한 양립가능한 계면활성제가 본 발명의 조성물 중에 선택적으로 사용되거나 사코시네이트 계면활성제와 조합되어 사용될 수 있다. 적합한 선택적 계면활성제가 1976년 5월 25일에 허여된 아그리콜라(Agricola) 등의 미국 특허 제3,959,458호, 1976년 2월 10일에 허여된 하에펠레(Haefele)의 미국 특허 제3,937,807호, 및 1988년 9월 27일에 허여된 기에스케(Gieske) 등의 미국 특허 제4,051,234호에 보다 상세히 기술되어 있다.

본 발명에 유용한 바람직한 음이온성 계면활성제는 알킬 라디칼 중에 10 내지 18개의 탄소 원자를 가지는 알킬 설페이트의 수용성 염 및 10 내지 18개의 탄소 원자를 가지는 지방산의 설포화 모노글리세리드의 수용성 염을 포함한다. 소듐 라우릴 설페이트 및 소듐 코코넛 모노글리세리드 술포네이트는 이러한 유형의 음이온성 계면활성제의 예이다. 음이온성 계면활성제의 혼합물도 이용될 수 있다.

본 발명에 유용한 바람직한 양이온성 계면활성제는 광범위하게는 탄소 원자수가 약 8 내지 18개인 하나의 긴 알킬 사슬을 갖는 지방족 4차 암모늄 화합물의 유도체로서 정의될 수 있으며, 그 예로는 라우릴 트라이메틸암모늄 클로라이드, 세틸 피리디늄 클로라이드, 세틸 트라이메틸암모늄 브로마이드, 다이-이소부틸페녹시에틸-다이메틸벤질암모늄 클로라이드, 코코넛 알킬트라이메틸암모늄 니트라이드, 세틸 피리디늄 플루오라이드 등이 있다. 바람직한 화합물은 브리너(Briner) 등의 미국 특허 제3,535,421호(1970.10.20)에 개시된 4차 암모늄 플루오라이드이며, 상기 4차 암모늄 플루오라이드는 세정 성질을 갖는다. 일부 양이온성 계면활성제는 본 명세서에 개시된 조성물 중에서 살균제로서 작용할 수 있다. 클로르헥시딘과 같은 양이온성 계면활성제는 본 발명에 사용하기에는 적합할지라도, 구강의 경질 조직을 착색시킬 수 있기 때문에 바람직하지 않다. 본 기술 분야의 당업자는 이러한 가능성을 인지하고 양이온성 계면활성제를 제한되게 사용하여야 한다.

본 발명의 조성물중에 사용될 수 있는 바람직한 비이온성 계면활성제는 광범위하게는 알킬렌 옥사이드기(친수성)와 지방족 또는 알킬방향족일 수 있는 유기 소수성 화합물의 축합에 의해 생성된 화합물로서 정의될 수 있다. 적합한 비이온성 계면활성제의 예로는 플루로닉(Pluronic), 알킬 페놀의 폴리에틸렌 옥사이드 축합생성물, 프로필렌 옥사이드와 에틸렌 다이

아민의 반응생성물과 에틸렌 옥사이드의 축합으로부터 유도된 생성물, 지방족 알콜의 에틸렌 옥사이드 축합생성물, 긴 사슬 3차 아민 옥사이드, 긴 사슬 3차 포스포인 옥사이드, 긴 사슬 다이알킬 술폰옥사이드 및 이러한 재료들의 혼합물이 포함된다.

본 발명에 유용한 바람직한 쓰비터이온성 합성 계면활성제는 광범위하게 지방족 4차 암모늄, 포스포늄 및 술폰늄 화합물의 유도체로서 정의될 수 있으며, 여기에서 지방족 라디칼은 직쇄형 또는 분지형일 수 있고, 지방족 치환체 중 하나는 약 8 내지 18개의 탄소 원자를 함유하고 하나는 음이온성의 수용해성 기, 예를 들어 카르복시, 술포네이트, 술페이트, 포스페이트 또는 포스포네이트를 함유한다.

바람직한 베타인 계면활성제가 1993년 1월 19일에 허여된 폴레프카(Polefka) 등의 미국 특허 제5,180,577호에 개시되어 있다. 전형적인 알킬 다이메틸 베타인은 데실 베타인 또는 2-(N-데실-N,N-다이메틸암모니오) 아세테이트, 코코베타인 또는 2-(N-코코-N,N-다이메틸 암모니오) 아세테이트, 미리스틸 베타인, 팔미틸 베타인, 라우릴 베타인, 세틸 베타인, 스테아릴 베타인 등을 포함한다. 아마미도베타인의 예로는 코코아미도에틸 베타인, 코코아미도프로필 베타인, 라우르아미도프로필 베타인 등이 있다. 그중에서 바람직한 베타인은 코코아미도프로필 베타인이며, 더욱 바람직한 것은 라우르아미도프로필 베타인이다.

치석 방지제

본 발명의 조성물은 치석 방지제, 바람직하게는 예를 들어 가파르(Gaffar) 등의 미국 특허 제4,627,977호에 기술되어 있는 바와 같이 말레산 무수물 또는 말레산 및 메틸 비닐 에테르의 공중합체 및 폴리아크릴레이트를 포함하는 합성 음이온성 중합체(예를 들어 간트레즈(Gantrez))와; 예를 들어 폴리아미노 프로판 설폰산(AMPS), 시트르산아연 3수화물, 폴리펩티드(예를 들어 폴리아스파르트산 및 폴리글루탐산), 및 그의 혼합물을 함유할 수도 있다.

킬레이팅제

다른 바람직한 임의의 제제는 타르타르산 및 그의 약학적으로 허용가능한 염, 시트르산 및 알칼리 금속의 시트르산염 및 이들의 혼합물과 같은 킬레이팅제이다. 킬레이팅제는 박테리아의 세포벽 내에서 발견된 칼슘을 착물화시킬 수 있다. 킬레이팅제는 또한 바이오매스(biomass)를 온전하게 유지시키는 데에 도움이 되는 칼슘 브리지로부터 칼슘을 제거함으로써 플라크를 분해할 수 있다. 그러나, 칼슘에 대한 친화도가 너무 높은 킬레이팅제를 사용하는 것은 바람직하지 않는데, 그 이유는 치아 탈염을 초래할 수 있어 본 발명의 목적 및 의도와 상충되기 때문이다.

소듐 및 칼륨 시트레이트는 바람직한 알칼리 금속의 시트르산염이며, 그중에서도 소듐 시트레이트가 가장 바람직하다. 또한, 바람직한 것은 시트르산/알칼리 금속 시트르산염의 조합이다. 본 발명에 바람직한 것은 타르타르산의 알칼리 금속 염이다. 본 발명에 사용하기에 가장 바람직한 것은 다이소듐 타르트레이트, 다이칼륨 타르트레이트, 소듐 칼륨 타르트레이트, 소듐 하이드로젠 타르트레이트 및 칼륨 하이드로젠 타르트레이트이다. 본 발명에서 사용하기에 적합한 킬레이팅제의 양은 약 0.1% 내지 약 2.5%, 바람직하게는 약 0.5% 내지 약 2.5%, 더 바람직하게는 약 1.0% 내지 약 2.5%이다. 타르타르산 염 킬레이팅제는 단독으로, 또는 다른 선택적 킬레이팅제와 조합되어 사용될 수 있다. 바람직하게는, 이러한 킬레이팅제는 약 10¹ 내지 10⁵의 칼슘 결합 상수를 가져 세정력이 향상되게 하며 플라크 및 치석 형성이 감소되게 한다.

본 발명에 사용하기에 적합한 킬레이팅제의 또 다른 가능한 그룹은 음이온성 중합 폴리카르복실레이트이다. 이러한 물질은 본 기술 분야에 널리 공지되어 있으며, 이의 유리산, 또는 부분적으로 또는 바람직하게는 완전히 중화된 수용성 알칼리 금속(예를 들어, 칼륨 및 바람직하게는 나트륨) 또는 암모늄 염의 형태로 사용된다. 바람직한 것은 1:4 내지 4:1의 말레산 무수물 또는 말레산과 다른 중합성의 에틸렌계 불포화 단량체, 바람직하게는 평균 분자량(AMW)이 약 30,000 내지 약 1,000,000인 메틸 비닐 에테르(메톡시에틸렌)의 공중합체이다. 이러한 공중합체는 예를 들어 간트레즈 AN 139 (AMW 500,000), AN 119 (AMW 250,000), 바람직하게는 지에이에프 케미칼즈 코포레이션(GAF Chemicals Corporation)의 S-97 제약 등급 (AMW 70,000)으로 입수가 가능하다.

다른 작용성의 중합체성 폴리카르복실레이트는 말레산 무수물과 에틸 아크릴레이트, 하이드록시에틸 메타크릴레이트, N-비닐-2-피롤리돈 또는 에틸렌의 1:1 공중합체, 및 아크릴산과 메틸 또는 하이드록시에틸 메타크릴레이트, 메틸 또는 에틸 아크릴레이트, 이소부틸 비닐 에테르 또는 N-비닐-2-피롤리돈의 1:1 공중합체를 포함하며, 말레산 무수물과 에틸렌의 1:1 공중합체는 예를 들어 몬산토(Monsanto) EMA No. 1103 (AMW 10,000) 및 EMA 등급 61로서 입수가 가능하다.

추가적 작용성의 중합체성 폴리카르복실레이트는 1979년 2월 6일에 허여된 가파르의 미국 특허 제4,138,477호 및 1980년 1월 15일에 허여된 가파르 등의 미국 특허 제4,183,914호에 개시되어 있으며, 말레산 무수물과 스타이렌, 아이소부틸렌 또는 에틸 비닐 에테르의 공중합체, 폴리아크릴산, 폴리이타콘산 및 폴리말레산과, AMW가 1,000만큼 작으며 유니로얄(Uniroyal) ND-2로 입수가 가능한 설폰아크릴 올리고머를 포함한다.

플루오라이드 공급원

추가적 충치 방지 효과를 제공하기 위해, 25°C에서 및/또는 사용시 치약 및 기타 구강용 조성물 중에 약 0.0025 내지 약 5.0 중량%, 바람직하게는 약 0.005 내지 약 2.0 중량%의 플루오라이드 이온 농도를 제공하기에 충분한 양으로 추가적 수용성 플루오르화 화합물이 상기 조성물에 포함되는 것이 일반적이다. 매우 다양한 플루오라이드 이온 생성 물질이 본 발명의 조성물에 가용성 플루오라이드의 공급원으로서 사용될 수 있다. 적합한 플루오라이드 이온 생성 물질의 예는 1970년 10월 20일에 허여된 브라이너(Briner) 등의 미국 특허 제3,535,421호 및 1972년 7월 18일에 허여된 와이드더(Widder) 등의 미국 특허 제3,678,154호에서 발견된다. 대표적인 플루오라이드 이온 공급원은 플루오르화주석, 플루오르화나트륨, 플루오르화칼륨, 일불소인산나트륨 및 다수의 기타 물질들을 포함한다. 플루오르화주석, 플루오르화나트륨 및 이들의 혼합물이 특히 바람직하다.

치아 미백 활성제 및 치아 색상 변경 물질

본 발명에서 유용한 구강 케어 활성제 중에서 치아 미백제로서의 탈색제 외에도 치아 색상 변경 물질이 고려될 수 있다. 이러한 물질은 치아의 색상을 변경하여 소비자를 만족시키는 데에 적합하다. 이 물질은 치아 표면에 도포시 치아 표면을 광 흡수 및/또는 반사 측면에서 개질하는 입자를 포함한다. 이러한 입자는 이를 포함하는 필름이 치아(들)의 표면에 적용될 때 외관 상의 이득을 제공한다.

본 발명에서 가장 유용한 입자는 화장품 분야에서 일상적으로 사용되는 안료 및 착색제를 포함한다. 본 발명의 조성물에서 사용되는 안료 및/또는 착색제에 대해서는 치아 표면 상에서 광원에 대한 영향에 관련된 제한 외에는 다른 특성의 제한이 존재하지 않는다. 안료 및 착색제는 무기 백색 안료, 무기 착색 안료, 필화제, 충전제 분말 등을 포함하는데, 1997년 4월 15일에 공개된 일본 특개평 제9-100215호를 참조하라. 구체에는 활석, 운모, 탄산마그네슘, 탄산칼슘, 규산마그네슘, 규산마그네슘알루미늄, 실리카, 이산화티타늄, 산화아연, 레드 산화철, 브라운 산화철, 옐로우 산화철, 블랙 산화철, 페릭 암모늄 페로시아나이드, 망간 바이올렛, 울트라마린, 나일론 분말, 폴리에틸렌 분말, 메타크릴레이트 분말, 폴리스타이렌 분말, 실크 분말, 결정질 셀룰로오스, 전분, 티타네이트화 운모, 산화철 티타네이트화 운모, 산염화비스무쓰, 및 그의 혼합물로 구성된 군으로부터 선택된다. 가장 바람직한 것은 이산화티타늄, 산염화비스무쓰, 산화아연 및 그 혼합물로 구성된 군으로부터 선택되는 것이다. 일반적으로 안전하다고 인식되는 안료가 문헌[C.T.F.A. Cosmetic Ingredient Handbook, 3rd Ed., Cosmetic and Fragrance Assn., Inc., Washington D.C. (1982)]에 열거되어 있다.

안료는 일반적으로 불투명화제 및 착색제로 사용된다. 이러한 안료는 처리 입자 또는 안료 원료 그 자체로 사용될 수 있다. 전형적인 안료의 수준은 소비자에 의해 요망되는 특정 효과(impact)에 대하여 선택된다. 예를 들어, 특히 어둡거나 착색된 치아에 있어서는 일반적으로 치아의 색을 밝게 하기에 충분한 양의 안료가 사용된다. 반면에, 개개의 치아 또는 치아 상의 반점이 다른 치아의 색보다 밝을 경우, 치아를 어둡게 하는 안료가 유용할 수 있다. 안료 및 착색제의 수준은 일반적으로 조성물의 약 0.05% 내지 약 20%, 바람직하게는 약 0.10% 내지 약 15%, 가장 바람직하게는 약 0.25% 내지 약 10%의 범위로 사용된다.

증점제

크림형 치약 또는 젤의 제조에 있어서, 조성물의 바람직한 주도(consistency), 사용시에 바람직한 활성제 방출 특성, 저장 안정성 및 조성물의 안정성 등을 제공하기 위해서는 약간의 증점제를 첨가하는 것이 필요하다. 바람직한 증점제로는 카르복시비닐 중합체, 카라기난(carrageenan), 하이드록시에틸 셀룰로오스, 라포나이트 및 셀룰로오스 에테르의 수용성 염, 예컨대 소듐 카르복시메틸셀룰로오스 및 소듐 카르복시메틸 하이드록시에틸 셀룰로오스가 있다. 천연 검, 예컨대 검 카라야, 잔탄 고무, 아라비아 고무 및 검 트래거캔스가 또한 사용될 수 있다. 콜로이드성 마그네슘 알루미늄 실리케이트 또는 미세 분리된 실리카가 조직(texture)을 더 개선시키기 위한 증점제의 일부로서 사용될 수 있다.

바람직한 증점제 또는 겔화제 부류에는 펜타에리트리톨의 알킬 에테르 또는 수크루오스의 알킬 에테르와 가교된 아크릴산의 단독 중합체 또는 카보머 부류가 포함된다. 카보머는 비.에프. 굿리치(B.F. Goodrich)사로부터 카보폴(Carbopol(등록 상표)) 시리즈로 시판되고 있다. 특히 바람직한 카보폴에는 카보폴 934, 940, 941, 956 및 이들의 혼합물이 포함된다.

(수평균으로) 약 1,000 내지 약 120,000의 분자량을 갖는 락티드 및 글리콜리드 단량체의 공중합체는 "치은하용 겔 담체"로서 치주낭 내로의 또는 그 주위로의 활성제의 운반에 유용하다. 이러한 중합체는 1993년 3월 30일에 허여된 다마니의 미국 특허 제5,198,220호 및 1993년 9월 7일에 허여된 다마니의 미국 특허 제5,242,910호와, 1984년 4월 17일에 허여된 마테이(Mattei)의 미국 특허 제4,443,430호에 기술되어 있다.

전체 크림형 치약 또는 겔 조성물의 약 0.1 내지 약 15 중량%, 바람직하게는 약 2 내지 약 10 중량%, 더욱 바람직하게는 약 4 내지 약 8 중량%의 양으로 증점제가 사용될 수 있다. 추잉 껌, 로젠지(입냄새용 민트 포함), 봉제, 비연마성 겔 및 치은연하 겔에 있어서는 더 높은 농도의 증점제가 사용될 수 있다.

흡습제

본 발명의 조성물의 국소 구강용 담체의 다른 선택적 성분은 흡습제이다. 흡습제는 크림형 치약 조성물이 공기에 노출되는 경우 경화되는 것을 방지하고 조성물이 구강에 촉촉한 느낌을 제공하는 역할을 하며, 특정 흡습제의 경우 크림형 치약 조성물에 대해 바람직한 단맛을 제공하는 역할을 한다. 흡습제는 일반적으로 순수 흡습제를 기준으로 하여, 본 발명의 조성물의 약 0 내지 약 70 중량%, 바람직하게는 약 5 내지 약 25 중량%로 포함된다. 본 발명의 조성물에 사용하기에 적합한 흡습제로는 먹을 수 있는 다가 알코올, 예컨대 글리세린, 소르비톨, 자일리톨, 부틸렌 글리콜, 폴리에틸렌 글리콜 및 프로필렌 글리콜이 포함되며, 특히 소르비톨 및 글리세린이 바람직하다.

착향제 및 감미제

착향제가 또한 본 발명의 조성물에 첨가될 수 있다. 적합한 착향제에는 윈터그린유, 박하유, 스피아민트유, 클로브 버드유, 멘톨, 아네톨, 메틸 살리실레이트, 유칼립톨, 카시아, 1-멘틸 아세테이트, 세이지(sage), 유제놀, 파슬리유, 옥사논, 알파-이리손, 마요람(marjoram), 레몬, 오렌지, 프로페닐 구아에톨, 시나몬, 바닐린, 티몰, 리날올, CGA로 알려진 신남알데히드 글리세롤 아세탈 및 이들의 혼합물이 포함된다. 착향제는 일반적으로 상기 조성물의 약 0.001 내지 약 5 중량% 수준으로 조성물에 사용된다.

본 발명에 사용될 수 있는 감미제로는 수크로스, 글루코오스, 사카린, 텍스트로스, 레볼로스, 락토오스, 만니톨, 소르비톨, 프룩토오스, 말토오스, 자일리톨, 사카린 염, 타우마틴, 아스파탐, D-트립토판, 다이하이드로찰콘, 아세숄페임 및 시클라메이트 염, 특히 소듐 시클라메이트 및 소듐 사카린, 및 이들의 혼합물이 포함된다. 감미제는 상기 조성물의 약 0.1 내지 약 10 중량%, 바람직하게는 약 0.1 내지 약 1 중량%로 조성물에 포함된다.

착향제 및 감미제 이외에도, 냉각제, 타액 분비제(salivating agent), 가운제 및 마취제가 본 발명의 조성물에 임의의 성분으로서 사용될 수 있다. 이들 임의의 성분들은 조성물에 상기 조성물의 약 0.001 내지 약 10 중량%, 바람직하게는 약 0.1 내지 약 1 중량%의 수준으로 포함된다.

냉각제는 아주 다양한 물질 중 어느 하나가 사용될 수 있다. 카르복스아미드, 멘톨, 케탈, 디올 및 이들의 혼합물이 이러한 물질에 포함된다. 본 발명의 조성물 중의 바람직한 냉각제는 파라멘탄 카르복스아미드, 예컨대 "WS-3"으로 상용적으로 알려져 있는 N-에틸-p-멘탄-3-카르복스아미드, WS-23으로 상용적으로 알려져 있는 N-2,3-트라이메틸-2-이소프로필부탄아미드 및 이들의 혼합물이다. 다른 추가의 바람직한 냉각제는 멘톨, 타카사고(Takasago)사 제품 TK-10으로 알려진 3-1-멘톡시프로판-1,2-디올, 하르만 앤드 라이머(Haarmann and Reimer)사 제품 MGA로 알려진 멘톤 글리세롤 아세탈, 및 하르만 앤드 라이머사 제품 프레스콜라트(Frescolat)(등록상표)로 알려진 멘틸 락테이트이다. 본 명세서에서 사용되는 용어 멘톨 및 멘틸은 상기 화합물의 우회전성 및 좌회전성 이성질체 및 이들의 라세믹 혼합물을 포함한다. TK-10은 1984년 10월 7일에 허여된 아마노(Amano) 등의 미국 특허 제4,459,425호에 기술되어 있다. WS-3 및 기타 제제가 1979년 1월 23일에 허여된 왓슨(Watson) 등의 미국 특허 제4,136,163호에 기술되어 있다.

본 발명의 바람직한 타액 분비제로는 타카사고사 제품 잠부(Jambu(등록상표))가 포함된다. 바람직한 가운제로는 캅시킴 및 니코티네이트 에스테르, 예컨대 벤질 니코티네이트가 포함된다. 바람직한 마취제로는 벤조카인, 리도카인, 클로브 버드유 및 에탄올이 포함된다.

알칼리 금속 중탄산염

본 발명은 또한 알칼리 금속 중탄산염을 포함할 수 있다. 알칼리 금속 중탄산염은 수용성이며, 안정화되지 않는 한 수성계에서 이산화탄소를 방출하는 경향이 있다. 중탄산 나트륨(또한, 베이킹 소다로 공지되어 있음)이 바람직한 알칼리 금속 중탄산염이다. 본 발명의 조성물은 약 0.5 내지 약 30 %, 바람직하게는 약 0.5 내지 약 15 %, 가장 바람직하게는 약 0.5 내지 약 5 %의 알칼리 금속 중탄산염을 함유할 수 있다.

다양한 담체

시판되는 적당한 구강용 조성물의 제조에 사용되는 물은 바람직하게는 이온 함량이 낮아야 하고 유기 불순물이 없어야 한다. 물은 일반적으로 본 발명의 수성 조성물의 약 5 내지 약 70 중량%, 바람직하게는 약 20 내지 약 50 중량%를 포함한다. 이러한 양의 물은 소르비톨과 같은 기타 물질과 함께 도입되는 자유수 및 첨가되는 자유수를 포함한다.

폴록사머가 본 발명의 조성물에 이용될 수 있다. 폴록사머는 비이온성 계면활성제로 분류된다. 폴록사머는 또한 유화제, 결합제, 안정제 및 기타 관련 기능 물질로 기능할 수 있다. 폴록사머는 분자량이 1,000 내지 15,000 초과이며 일차 하이드록실기로 종결되는 2관능성 블록 중합체이다. 폴록사머는 바스프(BASF)에 의해 상표명 플루로닉스(Pluronics) 및 플루라플로(Pluraflo)로 시판된다. 본 발명에 있어서 바람직한 폴록사머는 폴록사머 407 및 플루라플로 L4370이다.

본 발명의 조성물에 사용될 수 있는 다른 유화제는 중합체성 유화제, 예를 들어 비.에프. 굤리치(B.F. Goodrich)로부터 입수가능하며 소수성 물질의 유화제로 유용한 고분자량의 폴리아크릴산 중합체가 주류를 이루는 페무렌(Pemulen(등록상표)) 시리즈를 포함한다.

이산화티타늄이 또한 본 발명의 조성물에 포함될 수 있다. 이산화티타늄은 본 발명의 조성물에 불투명성을 추가하는 백색 분말이다. 이산화티타늄은 일반적으로 치약 조성물의 약 0.25 내지 약 5 중량%로 포함된다.

본 조성물의 pH는 바람직하게는 완충제의 사용으로 조절된다. 본 명세서에서 사용되는 바와 같이 완충제는 본 조성물의 pH를 약 pH 4.0 내지 약 pH 10.0의 범위로 조절하는 데에 사용될 수 있는 완충제를 말한다. 완충제는 제1인산나트륨, 제3인산나트륨, 수산화나트륨, 탄산나트륨, 산성 피로인산나트륨, 시트르산, 및 시트르산나트륨을 포함한다. 완충제는 본 발명의 조성물의 약 0.5 내지 약 10 중량%의 수준으로 사용될 수 있다. 치약 조성물의 pH는 3:1의 수성 슬러리의 치약, 예를 들어 3부의 물 대 1부의 치약으로부터 측정된다.

본 발명의 조성물에 사용될 수 있는 다른 임의의 제제로는 알킬- 및 알콕시-다이메티콘 코폴리올, 예컨대 C12 내지 C20 알킬 다이메티콘 코폴리올 및 이들의 혼합물로부터 선택되는 다이메티콘 코폴리올이 포함된다. 아주 바람직한 것은 상표명 아빌(Abil) EM90으로 시판되는 세틸 다이메티콘 코폴리올이다. 일반적으로 다이메티콘 코폴리올은 약 0.01 중량% 내지 약 25 중량%, 바람직하게는 약 0.1 중량% 내지 약 5 중량%, 더 바람직하게는 약 0.5 중량% 내지 약 1.5 중량%의 수준으로 존재한다. 다이메티콘 코폴리올은 좋은 치아 느낌 효과를 갖도록 하는 데에 도움이 된다.

기타 활성제

본 발명의 구강용 조성물은 기타 활성제, 예를 들어 항미생물제도 함유할 수 있다. 이러한 제제로는 수용용성의 비양이온성 항미생물제, 예컨대 할로겐화된 다이페닐 에테르, 페놀 및 이의 동족체를 포함하는 페놀 화합물, 모노알킬 및 폴리알킬 및 방향족 할로페놀, 레소시놀 및 이의 유도체, 비스페놀 화합물 및 할로겐화된 살리실아닐리드, 벤조산 에스테르 및 할로겐화된 카르바닐리드가 포함된다. 수용성의 항균제로는 기타 물질 중에서 4차 암모늄염 및 비스-비쿠아니드 염이 포함된다. 트라이클로산 모노포스페이트는 추가 수용성 항미생물제이다. 4차 암모늄 제제로는 4차 질소 상의 한개 또는 두개의 치환체가 약 8 내지 약 20개, 통상 약 10 내지 약 18개의 탄소 원자를 갖는 탄소 사슬 길이(통상 알킬기)를 갖는 한편 나머지 다른 치환체들(통상 알킬 또는 벤질기)은 더 작은 수의 탄소 원자, 예컨대 약 1 내지 약 7개의 탄소 원자, 통상 메틸 또는 에틸기를 갖는 것들이 포함된다. 도데실 트라이메틸 암모늄 브로마이드, 테트라데실피리디늄 클로라이드, 도미펜 브로마이드, N-테트라데실-4-에틸 피리디늄 클로라이드, 도데실 다이메틸 (2-페녹시에틸) 암모늄 브로마이드, 벤질 다이메틸 스테아릴 암모늄 클로라이드, 세틸 피리디늄 클로라이드, 4차화 5-아미노-1,3-비스(2-에틸-헥실)-5-메틸-헥사하이드로피리미딘, 벤즈알코늄 클로라이드, 벤즈에토늄 클로라이드 및 메틸 벤즈에토늄 클로라이드가 전형적인 4차 암모늄 항균제의 예이다. 다른 화합물로는 베일레이(Bailey)의 미국 특허 제4,206,215호(1980. 6. 3)에 개시된 비스[4-(R-아미노)-1-피리디늄]알칼이 있다. 구리 비스글리시네이트, 구리 글리시네이트, 시트르산아연 및 락트산아연과 같은 다른 항미생물제가 또한 포함될 수 있다. 효소는 본 발명의 조성물에 사용될 수 있는 다른 유형의 활성제이다. 유용한 효소는 프로테아제, 용해 효소, 플라크 매트릭스 억제제 및 옥시다제의 카테고리에 속하는 것을 포함한다. 프로테아제는 파파인, 펩신, 트립신, 피신, 브로멜린을 포함하며; 세포벽 용해 효소는 라이소자임을 포함하며; 플라크 매트릭스 억제제는 텍스트라나제,

뮤타나제를 포함하며; 옥시다제는 글루코스 옥시다제, 락테이트 옥시다제, 갈락토스 옥시다제, 요산 옥시다제, 서양 고추냉이 퍼옥시다제, 마이엘로퍼옥시다제, 락토펜옥시다제, 클로로퍼옥시다제를 포함하는 퍼옥시다제를 포함한다. 옥시다제는 항미생물 특성 외에도 미백/세정 활성을 또한 가진다. 이러한 제제는 1960년 7월 26일에 허여된 노리스(Norris) 등의 미국 특허 제2,946,725호 및 1977년 9월 27일에 허여된 기에스케(Gieske) 등의 미국 특허 제4,051,234호에 개시되어 있다. 다른 항미생물제는 클로르헥시딘, 트라이클로산, 트라이클로산 모노포스페이트 및 티몰과 같은 항유를 포함한다. 트라이클로산 및 이러한 유형의 기타 제제가 1991년 5월 14일에 허여된 패런 주니어(Parran, Jr.) 등의 미국 특허 제 5,015,466호 및 1990년 1월 16일에 허여된 나비(Nabi) 등의 미국 특허 제4,894,220호에 개시되어 있다. 플라크 방지 효과를 제공하는 이들 제제들은 치약 조성물의 약 0.01 내지 약 5.0 중량%의 수준으로 존재할 수도 있다.

사용 방법

본 발명은 또한 치아를 세척하고 닦아 치아 법랑질 상의 착색, 플라크, 치은염 및 치석의 발생을 감소시키는 방법에 관한 것이다.

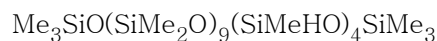
본 발명에서의 사용 방법은 본 발명에 따른 구강 조성물로 치료 대상의 치아 법랑질 표면 및 구강 점막에 접촉시키는 단계를 포함한다. 상기 사용 방법은 치약으로 칫솔질하거나, 치약 슬러리 또는 구강 세정액으로 세정하거나, 검 제품을 씹음으로서 가능하다. 다른 방법은 국소용 구강 겔, 구강 스프레이, 또는 스트립 또는 필름과 같은 다른 형태의 것을 치료 대상의 치아 또는 구강 점막과 접촉시키는 단계를 포함한다. 본 조성물은 치아, 잇몸 또는 기타 구강 표면에 칫솔, 펜 도포기, 도즈 풋 애플리케이션어(dose foot applicator) 등으로, 또는 심지어 손가락으로 직접 도포될 수 있다. 치료 대상은 치아 표면이 구강 조성물과 접촉하게 되는 사람 또는 기타 동물일 수 있다. "기타 동물"은 가족의 애완 동물 또는 기타 가축, 또는 감금 상태의 동물을 포함하는 것을 의미한다. 예를 들어, 사용 방법은 치약 조성물 중 하나로 개의 이빨을 칫솔질하는 것을 포함할 수 있다. 다른 사용 방법의 예로는 효과를 볼 수 있는 충분한 시간 동안 구강 조성물로 고양이의 입을 세정하는 것이 포함된다. 검류 및 장난감 같은 애완 동물 케어 제품은 본 발명의 구강 조성물을 함유하도록 구체화될 수 있다. 본 발명의 공중합체를 포함하는 조성물은 비교적 유연하지만 강하고 견고한 재질, 예컨대 생가죽, 천연 또는 합성 섬유로 제조된 밧줄, 및 나일론, 폴리에스테르 또는 열가소성 폴리우레탄으로 제조된 중합체 제품내로 혼입된다. 동물이 이 제품을 씹거나, 핥거나 물에 뜬음에 따라, 혼입된 활성 성분은 효과적인 칫솔질 또는 세정에 필적할 정도로 동물의 구강 내의 타액 매체로 배출된다.

실시예

다음 실시예는 본 발명의 범위 내에서 실시예들을 더욱 상세히 기술하고 설명한다. 실시예는 단지 예시의 목적으로 제시되는 것이지 본 발명을 제한하려는 것이 아니며, 여러 변형이 본 발명의 범주 및 범위 내에서 가능하다. 달리 표시하지 않는 한 본 명세서에서 사용되는 모든 백분율은 조성물의 중량을 기준으로 한다.

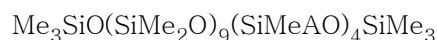
실시예 1. 펜던트 $-(CH_2)_3-CH(COOH)-CH_2COOH$ 기를 가지는 다이카르복시 관능화 폴리다이메틸실록산의 제조

93.7 g(즉, 0.67 mol)의 알릴 석신산 무수물, 52 g의 톨루엔 및 1.01 g의 카데트(Kardtedt) 촉매 용액(헥사메틸다이실록산 중 0.1%의 Pt)을 500 ml의 반응기에 첨가한다. 반응물을 90°C에서 가열하고; 하기 식:



을 가지며 3.75 mol의 SiH/kg을 포함하는 120 g(즉, 0.45 mol의 SiH)의 폴리다이메틸하이드로게노실록산을 3시간에 걸쳐 첨가한다. 첨가의 마지막에 변환되는 SiH의 양(가조메트리(gazometry)로 측정)은 96.1%이며; 첨가의 마지막의 2시간 후에는 100%가 된다. 휘발물을 진공(3 mbar) 하에 150°C에서 10시간에 걸친 증발에 의해 제거한다. 이어서 15 g의 탈광물화 물을 첨가하여 석신산 무수물 관능기를 가수분해시킨다. 가수분해 반응에 이어 적외선 분석을 행한다(산 밴드는 1714 cm^{-1} 에서 나타나며, 무수물 밴드는 1863 및 1782 cm^{-1} 에서 나타남). 가수분해 반응의 완료(48 시간)후, 100g의 톨루엔을 첨가하여 물을 공비적 방법으로 제거한다. 133.5 g(82%의 수율에 상응함)의 점성 오일을 회수한다.

NMR 분석에 의해 수득되는 하기 일반 구조식의 생성물을 확인하였다:



여기서, A는 $-(CH_2)_3-CH(COOH)-CH_2COOH$ 을 나타낸다.

실시예 2. 펜던트 $-(CH_2)_3-CH(COOH)-CH_2COOH$ 기를 가지는 다이카르복시 관능화 폴리다이메틸실록산의 제조

49.8 g(즉, 0.36 mol)의 알릴 석신산 무수물, 44 g의 톨루엔 및 1.139 g의 카데트 촉매 용액(헥사메틸다이실록산 중 0.1%의 Pt)을 500 ml의 반응기에 첨가한다. 반응물을 90°C에서 가열하고; 하기 식:



을 가지며 1.77 mol의 SiH/kg을 포함하는 150.3 g(즉, 0.266 mol의 SiH)의 폴리다이메틸하이드로게노실록산을 1시간에 걸쳐 첨가한다. 첨가의 마지막에 변환되는 SiH의 양(가조메트리(gazometry)로 측정)은 86%이며; 첨가의 마지막의 16시간 후에는 100%가 된다. 휘발물은 진공(6 mbar) 하에 150°C에서 10시간에 걸친 증발에 의해 제거한다. 101 g의 톨루엔을 첨가하고, 반응물을 여과시킨다. 이어서 6.7 g의 탈광물화 물을 첨가하여 석신산 무수물 관능기를 가수분해시킨다. 가수분해 반응에 이어 적외선 분석을 행한다(산 밴드는 1714 cm^{-1} 에서 나타나며, 무수물 밴드는 1866 및 1788 cm^{-1} 에서 나타남). 가수분해 반응의 완료(6일)후 물을 공비적 방법으로 제거한다. 146.3 g(80%의 수율에 상응함)의 점성 오일을 회수한다.

NMR 분석에 의해 수득되는 하기 구조식의 생성물을 확인하였다:



여기서, A는 $-(CH_2)_3-CH(COOH)-CH_2COOH$ 를 나타낸다.

실시예 3. 소의 폴리싱된 범랑질 표면 상에 1% 용액으로 도포한 관능화 실록산 중합체의 보유성

소의 폴리싱된 범랑질 표면 상에 1% 용액으로 도포한 본 발명에 따른 다이카르복시 관능화 실록산 중합체의 침착성 및 보유성을 다른 관능기를 포함하는 다른 실록산 중합체와 비교한다. 상이한 실록산 중합체의 용액을 MIBK(메틸 아이소부틸 케톤) 중 1% 농도로 제조하였다. 각각의 용액 6 μl 을 표면적이 대략 1 cm^2 이고 수지 중에 세팅된 청결한 소의 폴리싱된 범랑질 표본에 직접 도포하였다. 용매를 주변 조건 하에서 증발시키고 초기 물 접촉각(water contact angle, WCA)을 크루스(Kruss) DSA-10 시스템을 사용하여 측정하였다. 이어서, 범랑질 표본을 매우 순수한(ultra pure) 물에 5분 동안 적시고, 공기 건조시킨 후 물 접촉각을 재측정하였다. 이어서, 표본을 치아 마모도 측정기(brushing machine)(150g의 가압에서 오랄-비(Oral-B) 평판 헤드 칫솔이 갖추어진 V-8 크로스오버(crossover)) 상에서 물로 1분 및 10분 동안 칫솔질하고, 각각의 기간에서 WCA를 재측정하였다. 처리되지 않은 범랑질 표본을 본 연구에서 대조로 포함시켰다. 그 결과를 하기 표 I에 요약하였다. 더욱 소수성인 표면을 나타내는 비교적 큰 WCA 값에 의해 입증되듯이 산 무수물 및 그의 가수분해 2산으로 관능화된 실록산 중합체가 소 범랑질 칫솔질 모델에서 가장 우수한 보유 특성을 나타내었는데, 이 중합체는 심지어 10분 동안의 칫솔질 후에도 유지되었다.

[표 I]

관능화 실록산 중합체로 처리한 소 법랑질 표면의 물 접촉각

실록산 중합체의 관능기	평균 MW	처리후 WCA	5분 H2O 적심	1분 동안의 칫솔질	10분 동안의 칫솔질
폴리에테르	15000	25.70	34.35	35.32	
아민	17000	65.86	61.12	54.56	
폴리에테르/폴리올	14000	83.19	85.01	51.68	
프로필석신산 무수물	1600	92.31	90.00	91.46	92.51
프로필석신산 무수물	360	93.96	92.15	86.52	65.28
프로필석신산	10000	86.38	96.83	83.08	84.75
프로필석신산	1700	28.19	70.34	82.9	86.53
법랑질 대조		48.39	50.75	42.97	54.86

실시에 4. 소의 폴리싱된 법랑질 상에서 칫솔질된 1% 농도의 치약 슬러리로서 도포된 관능화 실록산 중합체의 침착성 및 보유성

관능화 실록산 중합체를 크레스트(Crest(등록상표)) 충치 공격 처방 치약 및 물을 혼합(1:3)하여 각각의 중합체를 슬러리 중 1% 농도로 포함하는 치약 슬러리를 생성한다. 수지 중에 세팅되며 표면적이 대략 1 cm²인 소의 청결한 폴리싱된 법랑질 표본을 각각의 슬러리에 적하하여 5분 동안 적신다. 표본을 옮기고 이어서 초음파 처리하고 매우 순수한 물에서 행구었다. 이어서, 표본을 공기 건조시키고 법랑질 표면 상에서 물 접촉각(WCA) 측정을 행하였다. 표본을 치아 마모도 측정기(150g의 가압에서 오랄-비 평판 헤드 칫솔이 갖추어진 V-8 크로스오버) 상에 탑재하고 제조한 슬러리로 1분 및 10분 동안 칫솔질하였다. 기술한 것과 동일한 방법을 사용하여 각각의 시간 후 WCA를 재측정하였다. 미처리된 법랑질 표본을 본 연구에서 대조로 포함시켰다. 그 결과를 하기 표 II에 요약하였다. 본 발명에 따른 2산 관능화 실록산 중합체는 시험한 다른 관능화 실록산 중합체보다 더 우수하게 법랑질 상에 침착 및 보유되었는데, 프로필석신산 관능화 중합체(AMW= 1700)의 침착성 및 보유성이 가장 우수하였다. 소수성이 보존되지 않는다고 해도 무수물 관능화 중합체와 2산 관능화 중합체는 비교적 큰 WCA 값에 의해 나타내어지는 바와 같이 소수성 표면을 또한 유지하였다. 코폴리올 관능화 중합체는 이러한 칫솔질 조건 하에서 법랑질 상에서 낮은 보유성을 가졌다.

[표 II]

치약에 혼입된 관능화 실록산 중합체로 처리된 소 법랑질 표면의 물 접촉각

관능기	AMW	물 접촉각 측정		
		5분 적심	1분 동안의 칫솔질	10분 동안의 칫솔질
프로필석신산	1700	82.33	98.85	98.77
프로필석신산	10000	53.19	55.87	49.77
프로필석신산 무수물	1600	84.0	70.0	68.0
폴리올/폴리에테르	14000	57.0	25.0	25.0
처리되지 않은 법랑질 대조		26.0	25.0	25.0

실시에 5. 소 법랑질 상의 외인성 착색물에 대한 프로필석신산 관능화 실록산 중합체 및 카바마이드 피옥사이드(CP)의 혼합물의 탈색 성능

2산 관능화 실록산 중합체 및 10% 카바마이드 피옥사이드를 함유하는 본 발명에 따른 조성물의 외인성 착색물에 대한 탈색 성능을 카보폴 겔 또는 물 및 동일한 수준의 카바마이드 피옥사이드를 함유하는 조성물의 성능과 비교한다. 소 법랑질 표본을 수지 중에 장착하고 착색 용액에 노출시켜 법랑질 표면 상에 어두운 착색을 유도하였다. 기준 CIE (국제 조명 위원

회(International Commission of Illumination)) L*a*b* 값을 편광 필터가 갖추어진 조절된 조명 조건 하에서(D55 라이트, 광원 후지(Fuji) HC1000 디지털 카메라를 사용하여 측정하였다. 카바마이드 피옥사이드(과산화수소 우레아, 시그마(Sigma) U-1753)를 10% 농도로 하기 시험 물질과 혼합시켰다: 프로필석신산 관능화 실록산 중합체(AMW=1700); 5% 카보폴 겔; 및 매우 순수한 물. 대략 10 mg의 각 시험 물질 혼합물을 소 표면의 법랑질 표면에 도포하고, 이어서 이 표본을 15mL의 매우 순수한 물이 담긴 개별 바이알에 두고, 이어서 이 바이알을 37°C로 설정한 인큐베이터 내의 로커(rocker) 상에 30분 동안 두었다. 30분의 마지막에 표면을 MIBK로 부드럽게 훔침(swab)으로써 처리물을 제거하였다. 이 표본을 블로팅 건조시키고 3차원 색상 공간의 수치적 표현인 L*, a* 및 b* - 여기서, L*은 y 축 상에서의 밝기를 나타내고, a*는 x 축 상에서의 채도(레드-그린)를 나타내며, b*는 z 축 상에서의 채도(옐로우-블루)를 나타냄 - 의 변화에 대하여 측정하였다. 이어서 후속적인 처리를 동일한 방식으로 적용하고 이 절차를 총 7시간의 노출 시간 동안 14 처리물에 대하여 반복하였다. 요약한 결과를 델타 L* 대 기준의 변화로서 하기 표 III에 예시하였다. 2산 관능화 실록산 중합체는 수용액 조건 하에서 동일한 농도의 카바마이드 피옥사이드를 포함하는 카보폴 겔 또는 물에 대하여 외인성 착색에 대한 향상된 탈색 이득을 제공한다.

[표 III]

ΔL* 대 소의 외인성 착색 법랑질의 기준

처리	처리 시간			
	1시간	3시간	5시간	7시간
프로필석신산 관능화 실록산 중합체 + 10% CP	3.5	12	22	29
카보폴 겔 + 10% CP	0	5	9	12
매우 순수한 물 + 10% CP	0	1	3	5

실시에 6. 프로필석신산 관능화 실록산 중합체 및 카바마이드 피옥사이드(CP)를 함유하는 치약을 이용한 칫솔질 후 내인성 변색된 사람의 발치된 치아의 탈색

발치된 사람의 어금니로부터 모든 연성 조직을 깨끗하게 벗겨내고 폴리싱/프로피드(prophied)하여 모든 결석 또는 외인성 착색물을 제거하였다. 이러한 어금니를 수지 중에 장착하고 기준 CIE L*a*b* 값을 편광 필터가 갖추어진 조절된 조명 조건 하에서(D55 라이트, 광원 후지 HC1000 디지털 카메라를 사용하여 측정하였다. 카바마이드 피옥사이드(과산화수소 우레아, 시그마 U-1753)를 프로필석신산 관능화 실록산 중합체(AMW=1700)가 용해된 메틸 아이소부틸 케톤(MIBK) 용액에 첨가하였다. 용매를 증발시켜 제거하고 이어서 CP/중합체 잔류물을 크레스트(Crest) 충치 보호 치약의 슬러리에 첨가하여 최종 슬러리가 10%의 CP 및 5%의 중합체를 포함하도록 하였다. 단지 10%의 CP를 포함하는 비교 슬러리도 제조하였다. 오랄 비 평판 헤드 칫솔을 슬러리 내로 담그고 슬러리를 50회의 핸드 스트로크(hand stroke) 동안 어금니의 한 면에 칫솔질하였다. 이를 치아의 모든 면에 대하여 반복하였다(볼 쪽, 혀에서 먼 쪽 및 입술 쪽의 면 각각에 50회의 스트로크를 받게 함). 이어서 이 표본을 15mL의 매우 순수한 물이 담긴 개별 바이알 내에 두고, 이어서 바이알을 37°C로 설정된 인큐베이터 내의 로커 상에 1시간 동안 두었다. 1시간의 마지막에 표면을 MIBK로 부드럽게 훔침으로써 처리물을 제거하였다. 비교 슬러리를 받은 표본을 동일한 방식으로 처리하였다. 치아를 가볍게 블로팅 건조시키고 L*, a*, b* 색상 공간에서의 변화에 대하여 측정하였다. 이어서 후속적인 처리물을 동일한 방식으로 적용하고 이 절차를 총 7시간의 노출 시간 동안 반복하였다. 그 결과를 델타 L* 대 기준의 변화로서 하기 표 IV에 예시하였다. 이 결과에 의하면 2산 관능화 실록산 중합체를 함유하는 본 발명의 조성물은 치약 슬러리로부터 치아 표면으로 전달시 단독의 카바마이드 피옥사이드에 대한 발치된 사람 치아의 내인성 변색/착색물 상에서 유의하게 더 큰 탈색 이득을 제공하고 치아 표면 상에서의 카바마이드 피옥사이드의 보유를 돕는다는 것이 입증되었다. 본 결과에 의하면 2산 관능화 실록산 중합체가 치아 표면 상에서의 카바마이드 피옥사이드의 보유를 도와 전시간에 걸쳐 탈색 효과가 더욱 커지게 한다는 것도 입증되었다.

[표 IV]

ΔL* 대 사람의 내인성 착색 범랑질의 기준

처리	처리 시간			
	1시간	3시간	5시간	7시간
5% 프로필석신산 실록산 중합체(AMW=1700) + 10% CP	1	2	3	4
10% CP	0.5	1	1	1

실시예 7- 국소용 구강 겔

본 발명에 따른 국소용 구강 겔을 이하에 예시한다. 이들 조성물은 통상의 방법으로 제조하였다.

성분	7A	7B	7C	7D	7E	7F	7G
착향제	5.000	5.000	0.500	0.500	0.500	0.500	0.500
멘틀	0.200	0.200					
사카린	0.200	0.200	0.100	0.100	0.100	0.100	0.100
프로필석신산 폴리실록산 중합체(AMW=1700 또는 10000)	3.000	3.000	70.000	75.000	66.000	80.000	75.00
과산화 우레아	10.000		20.000	15.000	15.000		
트라이클로산						0.300	
세틸 피리디늄 염화물							1.00
페무렌 TR1	1.000	1.000					
제2인산나트륨	0.200	0.200					
폴록사머(Poloxamer) 407	9.000	10.500					
플루라플로 L4370	QS	QS					
PEG 600			QS	QS	QS	QS	QS

실시예 8 - 치약 조성물

본 발명에 따른 치약 조성물을 이하에 예시한다. 이들 조성물은 통상의 방법으로 제조하였다.

성분	8A	8B	8C	8D	8E	8F
컬러(Color) FD&C 블루(Blue)#1		0.300			0.200	0.200
카보머 956	2.000			2.000	0.300	0.300
시트르산			0.180			
착향제	0.900	1.100	1.000	0.900	1.200	0.800
사카린	0.300	0.400	0.450	0.400	0.300	0.350
글리세린	10.000	30.000	30.000	QS		
제1인산나트륨		0.500			0.590	0.500
트라이소듐 포스페이트					1.450	1.400
잔탄 고무					0.475	0.500
수산화나트륨(50% 용액)	1.100					
PEG 40 SDIS			1.240			
폴록사머 407, NF		15.000	15.000	5.000		
분말화 폴리에틸렌		20.000	15.430			
실리카				10.000	20.000	15.000
주석산나트륨			0.090			
플루오르화나트륨	0.243	0.243	0.243	0.243	0.243	0.243
소르비톨 (70% 용액)					50.000	40.000
소듐 알킬 설페이트 (28% 용액)	3.000				4.000	5.000
프로필석신산 폴리실록산 중합체		5.000		3.000		1.000
프로필석신산/프로필렌 글리콜 에스테르 폴리실록산 중합체	3.000		2.000		4.000	
과산화 우레아	10.000			4.000		
과산화수소 (35% 용액)		5.000	3.000			
트라이클로산	0.300				0.300	
세틸 피리디늄 클로라이드			0.530			
비타민 E						2.000
불, 정제된 USP	QS	QS	QS		QS	QS

실시예 9 - 추잉 검 조성물

본 발명에 따른 코팅 추잉 검 함유 추잉 검 조성물(9C)을 이하에 예시한다.

성분	9A	9B
자일리톨	16.700	16.700
검 베이스(예를 들어, 카포사(Cafosa) 제품인 Prestige-PL)	28.000	28.000
프로필석신산 관능화 폴리실록산 (AMW=1700)	5.000	5.000
과산화수소 우레아		10.000
수소화된 녹말 가수분해물 (85% 고형물)	8.000	8.000
글리세린	7.000	7.000
만니톨	5.000	5.000
착향제	1.600	1.600
아스파탐	0.200	0.200
분무 건조된 멘톨	0.150	0.150
소르비톨	QS	QS

9C 성분	코어	코팅	총계
	1g / 피이스	0.35g / 피이스	1.35g / 피이스
소르비톨	49.35	-	36.56
검 베이스 ¹	25.0	-	18.52
프로필석신산 관능화 실록산 중합체 (AMW=1700)	5.0		3.70
과산화수소 우레아	5.0	-	3.70
플루오르화나트륨	-	0.08	0.02
자일리톨	-	-	-
수소화된 녹말 가수분해물	5.0	-	3.70
만니톨	2.0	-	1.48
글리세린	5.0	-	3.70
이산화티타늄	-	2.0	0.52
착향제	2.0	2.0	2.00
추가 분무 건조된 착향제	1.5	-	1.11
수크랄로스(sucralose)	0.05	0.03	0.05
칼륨 아세솔페임	0.10	0.10	0.10
소르비톨 ²	-	95.25	24.70
폴리소르베이트 60	-	0.30	0.08
먹을 수 있는 불용성의 클리터 ³ (Brilliant Blue)	-	0.04	0.01
왁스 ⁴	-	0.20	0.05

¹미국 뉴저지주 에디슨 파크 에비뉴 3775 소재의 엘.에이. 드레이푸스 컴퍼니(L. A. Dreyfus Company) 및 스페인 바르셀로나 08029 칼라브리아 267 소재의 카포사 검(Cafosa Gum)과 같은 공급자로부터 미리 공급된 검 베이스를 포함하는 여러 성분을 함유함.

²소르비톨의 수준은 건조 후의 절대 수준을 말하며, 소르비톨은 70% 수용액으로서 첨가됨.

³미국 코네티컷주 웨스트 헤븐 헤퍼난 드라이브 301에 소재한 왓슨 푸드 컴퍼니 인코포레이티드(Watson Foods Company Incorporated)에 의해 공급됨.

⁴왁스의 수준은 건조 후의 절대 수준을 말하며, 왁스는 28% 에탄올 용액으로서 첨가되고, 사용된 왁스는 독일 엘름손에 소재하는 카울 게엠베하(Kaul GmBH)로부터 공급되는 것과 같은 몇가지 성분들을 포함함.

제법--실시에 9A 및 9B

검 베이스를 약 45°C까지 가열하여 연화시킨다. 전체 혼합 과정 동안 혼합 용기 캐비티를 약 45°C에서 유지시킨다. 이중 시그마 블레이드 혼합기의 혼합 캐비티에 검 베이스를 첨가하고 5분 동안 혼합한다. 만니톨 및 분무 건조된 멘톨을 첨가한다. 2분 동안 혼합한다. 글리세린을 첨가하고 2분 동안 혼합한다. 50% 자일리톨을 첨가하고 2분 동안 혼합한다. 수소화된 녹말 가수분해물을 첨가하고 5분 동안 혼합한다. 50% 소르비톨을 첨가하고 3분 동안 혼합한다. 두번째의 50% 자일리톨, 실리콘 및 아스파탐을 첨가하고 3분 동안 혼합한다. 착향제를 첨가하고 3분 동안 혼합한다. 실시에 9B의 경우 실온에 가까운 온도에서 마지막에 탈색제를 첨가하여 활성 산소 손실을 최소화한다.

제법-실시에 9C

코어 제형:

검 베이스를 적당한 열로 연화시키고 만니톨, 분무 건조된 착향제, 글리세린, 50% 자일리톨, 수소화된 녹말 가수분해물, 50% 소르비톨을 첨가하고 완전히 혼합한다. 두번째의 50%의 자일리톨, 실록산 중합체 및 과산화수소 우레아(필요시)와 아스파탐, 나머지 착향제를 첨가하고 더 혼합시킨다. 롤링 및 스코어링(scoring) 장치를 이용하여 추잉 검 덩어리를 원하는 모양 및 크기의 별도 조각으로 형성한다.

코팅 용액:

70% 소르비톨 수용액에 이산화티타늄 및 폴리소르베이트 60을 첨가하고 혼합한다. 착향제에 이어 수크랄로오스 및 칼륨 아세살페임을 첨가하고 추가 혼합한다.

코어 제형의 코팅:

김 조각을 코팅 팬에 넣고, 코팅 용액을 가하고, 부분적으로 건조시킨다. 원하는 코팅 두께 또는 중량이 얻어질 때까지 코팅 단계를 반복한다. 투명한 70% 소르비톨 수용액을 가하여 축축하게 하는 한편, 생성물 표면에 얼룩을 건조 분무시키고, 건조시킨다. 투명한 70% 소르비톨 용액의 제2의 코팅액에 이어 왁스 코팅액을 가하고, 생성물을 완전히 건조시킨다.

실시에 10 - 구강 세정액

성분	중량 %
물	29.000
프로필렌 글리콜	53.459
소듐 벤조에이트	0.320
벤조산	0.021
소듐 사카린	0.700
프로필석신산 관능화 폴리실록산 (AMW=1700)	5.000
폴록사머 407	10.000
착향제	1.500

실시에 10의 구강 세정액을 하기와 같이 제조한다: 물, 폴록사머 및 프로필렌 글리콜을 혼합한다. 다음, 착향제, 벤조산, 및 실록산 중합체를 첨가한다. 마지막으로, 소듐 벤조에이트 및 소듐 사카린을 첨가하고 균질해질 때까지 혼합한다.

실시에 11 - 의치용 접착제 조성물

크림 형태의 의치용 접착제 조성물을 하기 성분과 함께 블렌딩함으로써 제조할 수 있다.

성분	11A	11B	11C	11D
백색 광유	23.93	23.93	23.93	0
백색 바셀린	21.77	20.87	11.87	0
카르복시메틸 셀룰로오스 소듐	20.00	20.00	20.00	20.00
콜로이드성 이산화규소	1.14	1.14	1.14	1.14
착색제 (Opatint Red Dye)	0.06	0.06	0.06	0.06
프로필석신산 관능화 폴리실록산(AMW=1700)	0.10	1.00	10.00	45.8
알킬 비닐 에테르/말레산(AVE/MA) 공중합체 염	33.00	33.00	33.00	33.00

유체 성분(적색 염료, 프로필석신산 폴리실록산, 바셀린, 광유)을 시각적으로 균일하게 될 때까지 50 내지 60°C에서 혼합한다. 이어서 분말 성분(콜로이드성 이산화규소, CMC, 임의의 AVE/MA 공중합체 혼합 염)을 함께 용기에서 진탕-블렌딩한다. 그 후 분말을 액체 내로 혼합시켜 균일한 분홍색 크림을 형성한다. 크림 조성물을 바셀린 및/또는 CMC의 AVE/MA 염 각각을 10 그램 이하로 증가 또는 감소시킴으로써 변경시킬 수 있다. 상기의 크림 조성물을 다양한 AVE/MA 혼합 중합체 염, 예를 들어 Ca/Zn 또는 Mg/Ca/Zn 염의 혼합물, 및/또는 산을 사용함으로써 또한 변경시킬 수 있다. 사용시 치료 대상은 0.1 내지 2 그램의 크림 조성물을 의치 상에 놓는다. 이어서, 치료 대상은 의치를 자신의 입에 넣고 의치를 제자리로 누른다.