

P 94 01644

77244

64.081/BE

KÖZZÉTÉVE

K I V O N A T

Fog és szájdápolására szolgáló
~~Szájban alkalmazható~~ készítmények

THE PREOCTER & GAMBLE COMPANY, CINCINNATI, OHIO, US

A bejelentés napja: 1995.12.08.

Elsőbbsége: 9425933.0, 1994.12.22., GB

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/US95/16252

A nemzetközi közzététel száma: WO 96/19192

A találmány ^{szerinti} ~~tárgyat~~ kitűnő tisztítási teljesítménnyel, fizikai tulajdonságokkal és használatbeli tulajdonságokkal együtt, ~~megnövelt~~ plak-ellenes aktivitású, szájban használható készítmények, például fogpaszták, fogporok, folyékony fogápolószerek, szájvizek, fogsortisztító szerek, rágógumik, cukorkák ~~és hason-~~
~~lók képezik.~~

~~A találmány szerinti~~ előnyös orális készítmények egy illatkomponenst, ~~egy~~ lipofil baktérium ellenes vegyületet, ~~egy~~ fogcsiszoló szert, ~~és egy~~ fluoridion-forrást ~~tartalmaznak~~ és 0,1-2+%-amino-alkil-sziloxán tartalmú amino-alkil-szilikont tartalmaznak egy ismétlődő egységre vonatkoztatva.

h

S.B.G. & K.
Nemzetközi
Szabadalmi Iroda
H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 34-24-950, Fax: 34-24-323

PG70684

KÖZZÉTÉVE

34 13

64.081/BE

Szájban alkalmazható készítmények

THE PROCTER & GAMBLE COMPANY, CINCINNATI, Ohio, US

Feltaláló:

HUGHES Iain Allan, WEYBRIDGE, SURREY, GB

A bejelentés napja: 1995.12.08.

Elsőbbsége: 9425933.0, 1994.12.22, GB

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/US95/16252

A nemzetközi közzététel száma: WO 96/19192

A találmány tárgyát szájban használható készítmények, például fogpaszták, fogporok, folyékony fogápolószerek, szájvizek, fogsortisztító szerek, rágógumik, cukorkák és hasonlóké képezik. A találmány tárgyát különösen a kitűnő tisztítási teljesítménnyel, fizikai tulajdonságokkal és használatbeli tulajdonságokkal együtt, megnövelt plakk ellenes aktivitású, szájban alkalmazható készítmények képezik.

A plakk akkor kezdődik, amikor a fog felületén a lepedékhez fehérjetartalmú filmet formáló baktériumok tapadnak. A megtapadt baktériumok étel alkotórészeket metabolizálnak, és reprodukálódnak és aggregálódnak, a plakk-ként ismert, tapadós lerakódást képezve. A plakk általában baktériumokból, bakteriális végtermékekből, például poliszacharidokból, szerves sókból és nyálfehérjékből áll. A plakkból levő baktériumok szerves savakká erjesztik a táplálékbeli szénhidrátokat, amelyek a fogzománcból eltávolítják az ásványi anyagokat, a fogban romlást eredményezve.

A fogkő lényegében kalcium-foszfátsókkal elásványosodott plakk. Mivel a fogkő megéri és megkeményedik, a táplálék kromogének abszorpciója következtében észlelhető elszíneződésre hajlamos. Nem szép megjelenésén kívül, a fogíny-vonalnál lerakódó fogkő hozzájárul a fogínygyulladás és periodontális betegségek kialakulásához. A kutatás kimutatta, hogy a plakkból származó higiéniai és egészségi problémák mellett, a rossz szájíz elsődleges forrása a normális, egészséges száj által folyamatosan leválasztott holt sejtanyag visszatartása és azt követő lebontása.

A korszerű fog-higiéniai és fogsor készítmények jellemzően plakk ellenes és/vagy fogkő ellenes szereket, valamint baktérium ellenes szereket és illatosító anyagokat tartalmaznak. A baktérium ellenes hatás a plakk képződést vagy a szájbán/fogsoron levő baktériumok számának csökkentésével vagy a további szaporodás és metabolizmus megakadályozására, a filmbe bezárt baktériumok elpusztításával befolyásolhatja.

Az illatosító anyagok a rossz szájszag problémáját egy szagtalanító hatáson keresztül csökkenthetik. Néhány baktérium ellenes szer, például mentol, is szolgálhat lehetőséget szagtalanító szerként. A baktérium ellenes szerek hatékonysága azonban nagy mértékben függ a szájon/fogsoron belüli, különösen a fogak vagy fogsorok felületén – ahol a plakk képződik – való megtartásuktól.

Az ismert dentális készítmények egy jellemző hátránya, hogy a készítményekben levő baktérium ellenes szerek számára, hatásuk kifejtéséhez csak viszonylag rövid idő áll rendelkezésre, mielőtt a fogakat tisztítjuk vagy a szájat öblítjük. A helyzetet bonyolítja az a tény, hogy a fogápolószer készítményeket ritkán használjuk: a legtöbbet naponta egyszer vagy esetleg kétszer. A populáció többsége számára következésképpen a fogmosások közötti hosszú időszak optimális plakk formálási körülményeket biztosít.

Szükséges ennél fogva egy olyan szájbán alkalmazható készítmény kifejlesztése, amely elnyújtott, megmaradó baktérium ellenes és/vagy illatot kölcsönző hatású.

A szájápolási készítményekbe, állítólagosan a fogak bevonására és fogromlás és elszíneződés megakadályozására, szilikonok

bekeverése ismert. A GB-A-689 679 számú szabadalmi irat egy szerves polisziloxánt, a fogakhoz tapadás megakadályozására vagy azokról kátrányok, színezékek, fogkő és élelmiszer részecskék eltávolítására tartalmazó szájvizet közöl. A szájvíz fertőtlenítő szereket, például timolt és aroma anyagokat és illatosító szereket tartalmazhat.

Az US.-A-2 806 814 számú szabadalmi irat hatóanyagként egy aminosav vegyület nagyobb alifás acil-amidját, és egy szilikonvegyületet kombináltan tartalmazó fogászati készítményeket közöl. A szabadalmi leírásban megjegyzik, hogy a szilikonvegyületeket a tapadás megakadályozására vagy a fogakról kátrányok, színezékek, kő és hasonló eltávolítására javasolják. A szilikonvegyületről azt közlik, hogy szinergistaként működik a hatóanyag alkotórész baktérium ellenes és savgátló aktivitásának javításában. Különösen hatékonynak tartják a dimetil-polisziloxánokat. Tartalmazhat illatosító olajokat és/vagy mentolt.

Az US-A-3624120 számú szabadalmi irat kationos felületaktív anyagokként, baktericidekként és szuvasodás elleni szerként való alkalmazásra gyűrűs sziloxán polimerek kvaterner ammóniumsóit közli.

Ennek megfelelően a találmány tárgyát a plakkokra, nyálkás és baktériumos lerakódásokra jobb hatékonyságú orális készítmények képezik, amelyek ugyanakkor kitűnő tisztítási teljesítményt, fizikai tulajdonságokat és használatbeli teljesítmény tulajdonságokat biztosítanak.

A találmány tárgyát képezik továbbá egy lipofil vegyületet, például egy illatosító anyagot, fiziológiai hűtőszert vagy bak-

térium ellenes szert tartalmazó szájbán használható készítmények, amelyek tartósabbak, jobban megtapadnak és/vagy hatékonyabbak a fogakon és fogsorokon.

A találmány tárgyát – első szempontja szerint – olyan, fogkrém, por, folyékony fogápolószer, szájvíz, fogsortisztító szer, rágógumi vagy cukorka formájában levő szájbán használható készítmény képezi, amely egy vagy több, csiszolóanyagokból, kötőanyagokból, nedvesítő szerekből, felületaktív anyagokból, fluoridion-forrásokból, fogkő elleni szerekből és édesítőszerekből kiválasztott orális készítmény komponenst, és továbbá egy, az ismétlődő egysége körülbelül 0,1-2 % amino-alkil-sziloxán tartalmú amino-alkil-szilikont tartalmaz.

A találmány tárgyát, egy további szempontja szerint olyan, fogkrém, por, folyékony fogápolószer, szájvíz, fogsortisztító szer, rágógumi vagy cukorka formájában levő szájbán használható készítmény képezi, amely egy illatosító anyagokból, fiziológiai hűtő szerekből és baktérium ellenes szerekből kiválasztott lipofil vegyületet és egy, az ismétlődő egysége vonatkoztatva körülbelül 0,1-2 % amino-alkil-sziloxán tartalmú amino-alkil-szilikont tartalmaz.

A leírásban az összes százalék és arány a teljes készítmény tömegére vonatkozik, hacsak másként nem jelezzük.

A találmány szerinti szájbán alkalmazható készítmények így egy amino-alkil-szilikon plakk ellenes szert tartalmaznak, míg az előnyös készítmények továbbá egy lipofil vegyületet és/vagy egy vagy több, csiszolóanyagokból, kötőanyagokból, nedvesítő szerekből, felületaktív anyagokból, fluoridion-forrásokból, fog-

kő elleni szerekből és édesítőszerekből kiválasztott orális készítmény komponensét tartalmazzák. Ezeket sorjában mind megtárgyaljuk.

Az amino-alkil-szilikonokat általánosságban nem gyűrűs, hidrofób amino-alkil-szilikonokból választjuk ki, amelyek a következő két alapegységet tartalmazó összetételűek:

1) $(R^1)_m(R)_nSiO_{(4-m-n)/2}$ általános képletű egység, –

amely képletben

$m + n$ értéke 1, 2 vagy 3;

n értéke 1, 2 vagy 3;

m értéke 0, 1, 2; és

2) $(R^1)_a(R^2)_bSiO_{(4-a-b)/2}$ általános képletű egység, –

amely képletben

$a + b$ értéke 1, 2 vagy 3, és **a** és **b** értéke egész szám,

amely képletekben

R^1 és R^2 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, körülbelül 1-10 szénatomos, adott esetben fluoro- vagy ciano-csoportokkal, hidroxil-, alkoxi- és acetoxi csoportokkal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport, például amelyekben R^1 és R^2 jelentése egymástól függetlenül metil-, etil-, fenil-, vinil-, trifluoro-propil- és ciano-propil-csoportokból kiválasztott csoport, és

R jelentése



általános képletű csoport, –

amely képletekben

R^3 jelentése egy körülbelül 1-20, előnyösen körülbelül 3-5 szén-atomos, adott esetben oxigénatomokkal szubsztituált vagy megszakított kétértékű alkilénecsoporthoz;

R^4 , R^5 és R^6 azonos vagy eltérő lehet, és jelentése hidrogénatom, körülbelül 1-20, előnyösen körülbelül 1-10, még előnyösebben körülbelül 1-4 szénatomos, adott esetben nitrogén- és/vagy oxigénatomokkal szubsztituált vagy megszakított alkil-csoport, és

X^- jelentése egy egyértékű anion, például halogenid, hidroxid és tozilát,

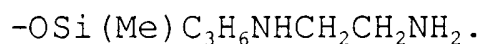
az illető amino-alkil-szilikon az ismétlődő egységre vonatkoztatva körülbelül 0,1-2 %, előnyösen körülbelül 0,5-2 % (1) egységet tartalmaz.

Egy előnyös megvalósításban az amino-alkil-szilikonok amodimetikonokat tartalmaznak. Az amodimetikonok amino-alkilcsoportokat tartalmazó poli(dimetil-sziloxán) polimerek. Az amino-alkilcsoportok toldalékként vagy a poli(dimetil-sziloxán) lánc egy vagy több végén lehetnek jelen. Azok az amino-alkil-szilikonok előnyösek, amelyekben az R csoportot $(CH_2)_3NH_2$, $(CH_2)_3NHCH_2CH_2NH_2$, $(CH_2)_3N(CH_2CH_2OH)_2$, $(CH_2)_3NH_3^+X^-$ és $(CH_2)_3N(CH_3)_2(C_{18}H_{37})^+X^-$ csoportok, és különösen $(CH_2)_3NH_2$ és $(CH_2)_3NHCH_2CH_2NH_2$ csoportok közül választjuk ki. Szintén előnyösek a körülbelül 5000 és ennél nagyobb, előnyösen körülbelül 5000-100000, még előnyösebben körülbelül 5000-30000 közötti átlagos molekulatömegű amino-alkil-szilikonok.

Jól ismertek a találmányban való alkalmazásra megfelelő ami-

no-alkil-szilikon vegyületek. Az amino-alkil-szilikonok előállítási eljárásai adottak például az US-A-2 930 809 számú szabadalmi iratban.

Az amodimetikonok közé tartozik például az OSI-féle Magnosoft folyadék. Ezek a polimerek egy túlnyomórészt poli(metil-sziloxán) szerkezethez erősített amino-alkilcsoportokat tartalmaznak. A Magnosoft amino-alkilcsoport tartalmú egységeinek jellemző szerkezete



Az amino-alkil-szilikon általában körülbelül 0,01-25 tömeg%, előnyösen körülbelül 0,1-5 tömeg%, még előnyösebben körülbelül 0,5-1,5 tömeg% mennyiségben van jelen.

A találmány szerinti orális készítmények előnyösen egy lipofil vegyületet is tartalmaznak. A találmányban való alkalmazásra megfelelő lipofil vegyületek általánosságban olajszerű anyagok, amelyek 25°C-on amino-alkil-szilikonban előnyösen legalább körülbelül 1 tömeg%-ban, még előnyösebben legalább 5 tömeg%-ban oldódnak vagy oldhatóvá tehetők. Előnyös lipofil vegyületeket illatosító szerek, fiziológiai hűtő szerek és baktérium ellenes szerek közül választunk ki. Az amino-alkil-szilikon a fogakon és/vagy fogsorokon a lipofil vegyület tartósságát növelve hat, ezáltal megnövelt és/vagy fenntartott illaterősséget és baktérium ellenes hatékonyságot biztosítva.

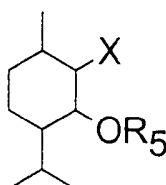
A találmányban való alkalmazásra megfelelő illatosító anyagok egy vagy több, gaulteria-olajból, oregánó-olajból, babérlevél-olajból, mentaolajból, fodormentaolajból, szegfűszegolajból, zsájaolajból, szasszafrász babérolajból, citromolajból, narancs-

olajból, ánizsolajból, benzaldehidből, keserűmandula-olajból, kámforból, cédruslevél-olajból, majoránna-olajból, citronella-olajból, levendulaolajból, mustárolajból, fenyőolajból, fenyőtű-olajból, rozmaringolajból, kakukkfűolajból, fahéjlevél-olajból és ezek keverékeiből kiválasztott illatkomponenst tartalmaznak.

A találmányban való alkalmazásra megfelelő lipofil baktérium ellenes vegyületek a timol, mentol, triklozán, 4-hexil-rezorcín, fenol, eukaliptol, benzoésav, benzoil-peroxid, butil-paraben, metil-paraben, propil-paraben, szalicil-amidok és ezek keverékei.

A találmányban való alkalmazásra megfelelő fiziológiai hűtő szerek a karboxamidok, mentán-észterek és mentán-éterek és ezek keverékei.

A találmányban való alkalmazásra megfelelő mentán-étereket az



általános képletű –

amely képletben

R_5 jelentése egy adott esetben hidroxil-csoporttal szubsztituált, legfeljebb 25 szénatomos, előnyösen legfeljebb 5 szénatomos alifás csoport, és

X jelentése hidrogénatom vagy hidroxil-csoport –

mentán-éterek, például a kereskedelemben a Takasago International Corporation-től, Takasago márkanéven kaphatók közül választjuk ki. A találmány szerinti készítményekben való alkalma-

zásra különösen előnyös hűtőszer a Takasago 10 [3-1-mentoxi-propán-1,2-diol (MPD)]. MPD az 1-mentol monoglicerin származéka, és kitűnő hűtési aktivitású.

Az US-A-4 136 163 számú (Wason et al.) és US-A-4 230 688 számú (Rawsell et al.) szabadalmi iratokban közölt karboxamidoakat találtuk a legalkalmazhatóbbaknak.

A találmány szerinti készítményekben a lipofil vegyület mennyisége általában körülbelül 0,01-10 tömeg%, előnyösen körülbelül 0,05-5 tömeg%, még előnyösebben körülbelül 0,1-3 tömeg%.

A fogkrémek, fogsortisztító folyadékok és paszták és hasonló formájában levő készítmények általában egy kötőanyagot vagy sűrítőszert tartalmaznak. A találmányban való alkalmazásra megfelelő kötőanyagok karboxi-vinil polimereket, karragenant, (hidroxi-etil)-cellulózt és cellulóz-éterek vízben oldható sóit, például (karboxi-metil)-cellulóz nátriumsót és (karboxi-metil)-(hidroxi-etil)-cellulóz nátriumsót tartalmaznak. Természetes gumikat, például Karaya-gumit, xantán-gumit, gumi arábikumot és tragakantmézsgát is alkalmazhatunk. További szerkezetjavításra a sűrítőszer részeként kolloidális magnézium-alumínium-szilikátot vagy finoman aprított szilikagélt alkalmazhatunk. A kötőanyagokat/sűrítőszereket a teljes készítmény tömegére körülbelül 0,1-5,0 %, előnyösen körülbelül 0,1-1 % mennyiségben alkalmazhatjuk.

Az is kívánatos, hogy egy fogpasztába tegyünk valamennyi nedvesítőszert, a levegőnek kitett készítmény megkeményedéstől való védelmére. Bizonyos nedvesítő szerek egy kívánatos édes ízt is kölcsönözhetnek a fogpaszta készítményeknek. Folyékony fogápolószer és szájvizek is tartalmazhatnak egy nedvesítőszer

menyiséget. Megfelelő nedvesítőszerek a glicerin, szorbit, xilit, polietilén-glikol, propilén-glikol, egyéb ehető, kettőnél több hidroxil-csoportot tartalmazó alkoholok és ezek keverékei. A találmány szerinti készítmények tömegére a nedvesítőszerek, amennyiben jelen vannak, általában körülbelül 10-70 %-ot tesznek ki.

A folyékony vagy pasztaformában levő fogpaszták, folyékony fogápolószerek és fogsortisztító szerek általában egy csiszoló hatású fényezőanyagot tartalmaznak. A találmányban való alkalmazásra szánt csiszoló hatású fényezőanyag bármilyen anyag lehet, amely nem dörzsöli túlzottan a fogállományt vagy fogsor-akrilt. Ezek közé tartoznak például a xerogéleket, hidrogéleket, aerogéleket és csapadékokat magukban foglaló szilikagélek, kalcium- és magnézium-karbonátok, kalcium orto-, piro-, meta- és polifoszfátok, például dikalcium-ortofoszfát—víz(1/2), kalcium-pirofoszfát, trikalcium-foszfát és kalcium-polimetafoszfát, oldhatatlan nátrium-polimetafoszfát, alumínium-oxid és hidrátjai, például α -alumínium-oxid—víz(1/3), alumínium-szilikátok, például kalcinált alumínium-szilikát és alumínium-szilikát, magnézium- és cirkónium-szilikátok, például magnézium-triszilikát és hőre keményedő polimerizált gyanták, például karbamid és formaldehid, poli(metil-metakrilát), porított polietilén és egyéb, például az US-A-3 070 510 számú szabadalmi iratban közöltek szemcsés kondenzációs termékei. Csiszolóanyagok keverékeit is alkalmazhatjuk. A csiszoló hatású fényezőanyagok általában körülbelül 0,1-30 μ , előnyösen körülbelül 5-15 μ átlagos részecskeméretűek.

A különböző típusú kavasav fogcsiszoló szerek kivételes fog

tisztítási és fényesítési teljesítményt nyújtanak a fogzománc vagy fogállomány túlzott dörzsölése nélkül. A kovasav csiszolószerek kicsapott kovasav vagy szilikagélek, például az US-A-3 538 230 számú (Pader et al.) és US-A-3 862 307 számú (Di Giulio) szabadalmi iratokban közölt kovasav-xerogélek, például a Grace & Company, Davison Chemical Division által „Syloid” márkaneven forgalmazott kovasav-xerogélek lehetnek. Megfelelő kicsapott kovasav anyagok a J. M. Huber Corporation „Zeodent” márkaneven forgalmazott anyagai, különösen „Zeodent 119” jelzést viselő kovasav. Ezeket a kovasav csiszolóanyagokat az US-A-4 340 583 számú szabadalmi iratban közlik.

A plakkk ellenes szerrel való kitűnő összeférhetőséggel kombinált jó tisztítási teljesítmény szempontjából a találmányban nagyon előnyösek a kalcium-karbonát csiszolóanyagok.

A találmány szerinti fogápolószer készítményekben a csiszolóanyag általában körülbelül 10-70 tömeg%, előnyösen körülbelül 15-25 tömeg% mennyiségben van jelen.

A találmány szerinti készítmények felületaktív anyagokat is tartalmazhatnak. Azok a megfelelő felületaktív anyagok, amelyek egy széles pH érték tartományban ésszerűen stabilak és habzanak, beleértve a nem szappan anionos, nemionos, kationos, ikerionos és amfoter szerves szintetikus tisztító hatású anyagokat. Ezek közül sok megfelelő szert közölnek az US-A-4 051 234 számú (Gieske et al.) szabadalmi iratban.

Megfelelő felületaktív anyagok például az alkil-szulfátok; etilén-oxid zsírsavakkal, zsíralkoholokkal, zsír-amidokkal, két-tőnél több hidroxici csoportot tartalmazó alkoholokkal (például

szorbitán-monosztearáttal, szorbitán-oleáttal), alkil-fenolokkal (például Tergitollal) és polipropilénoxiddal vagy poli(oxi-buti-lén)-nel (például Pluronic-al) alkotott kondenzációs termékei; amin-oxidok, például dimetil-kókamin-oxid, dimetil-(lauril-a-min)-oxid és kókusz-alkil-(dimetil-amin)-oxid (Aromox); poli-szorbátok, például Tween 40 és Tween 80 (Hercules), szorbitán-sztearátok, szorbitán-monoaleát, stb.; szarkozinátok, például nátrium-kokoil-szarkozinát, nátrium-lauroil-szarkozinát (Hamp-syl-95 W. R. Grace-től); kationos felületaktív anyagok, például cetil-piridínium-klorid, cetil-(trimetil-ammónium)-bromid, di-izobutil-fenoxi-etoxi-(etil-dimetil)-benzil-ammónium-klorid és kókusz-alkil-(trimetil-ammónium)-nitrát.

A találmány szerinti készítményekbe egy oldható fluoridion-forrást is beletehetünk. Az oldható fluoridion-forrást körülbe-lül 50-3500 ppm fluorid biztosítására elegendő mennyiségekben alkalmazzuk. Előnyös fluoridok a nátrium-fluorid, ón-fluorid, indium-fluorid, cink-ammónium-fluorid, ón-ammónium-fluorid, kal-cium-fluorid és nátrium-monofluoro-foszfát. Ilyen sókat, vala-mint másokat közölnek az US-A-2 946 735 számú (Norris et al.) és US-A-3 678 154 számú (Widder et al.) szabadalmi iratokban.

A találmány szerinti készítmények egy fogkő ellenes szert is tartalmaznak. Megfelelő fogkő ellenes szerek a di- és tetra-alkálifém-pirofoszfátok, ahogyan az EP-A-097476 számú szabadalmi iratban nyilvánosságra hozzák. Jellemző sók közé tartoznak a tetra-alkálifém-pirofoszfát, dialkálifém-disav-pirofoszfát, tri-alkálifém-monosav-pirofoszfát és ezek keverékei, amelyekben az alkálifémek nátrium vagy kálium. A sókat alkalmazhatjuk mind

hidratált, mind nem hidratált formájukban. Ez és a készítményekben alkalmazható pirofoszfátsó mennyiség bármilyen hatékony, és a készítmény tömegére általában legalább 1,0 %, előnyösen körülbelül 1,5-10 %, még előnyösebben körülbelül 3-6 % pirofoszfátion biztosításához elégséges mennyiség lehet. A pirofoszfátsókat részletesebben közlik Kirk & Othmer; Encyclopedia of Chemical Technology, második kiadás, 15. kötetében, Interscience Publishers (1968).

A találmányban megfelelő egyéb fogkő ellenes szerek a cinksók. Cinksókat az US-A-4 100 269, US-A-4 416 867, US-A-4 425 325 és US-A-4 339 432 számú szabadalmi iratokban közölnek. A cinkválasztékból egy előnyös szer a cink-citrát. A cinkvegyületek előnyösen körülbelül 0,01-4 tömeg%, előnyösen körülbelül 0,05-1 tömeg% cinkiont biztosító mennyiségben lehetnek jelen.

Más megfelelő fogkő ellenes szerek a szintetikus anionos polimerek [beleértve a poliakrilátokat és maleinsavanhidrid vagy sav és metil-vinil-éter (például Gantrez) kopolimerjeit, ahogyan az US-A-4 627 977 számú szabadalmi iratban közlik, a poliaminopropánszulfonsavat, polifoszfátokat (például tripolifoszfátot, hexametafoszfátot)], difoszfónátok (például EHDP, AHP), polipeptidek (például poliaszparagin- és poliglutaminsavak) és ezek keverékei.

Az alkalmazható édesítőszerek az aszpartám, aceszulfám, szacharin, dextróz, levulóz és nátrium-ciklamát. Az édesítőszereket általában a készítmény tömegére körülbelül 0,005-2 % mennyiségben alkalmazzuk.

A találmányban való alkalmazásra szolgáló egyéb, adott eset-

ben használható komponensek a vízben oldható baktérium ellenes szerek, például klór-hexidin-glükonát, kvaterner ammónium baktérium ellenes vegyületek és bizonyos fémionok, például cink, réz, ezüst és ón (például cink-, réz- és ón-klorid és ezüst-nitrát); pigmentek, például titán-dioxid; orálisan elfogadható festékek/ színező anyagok, például FD&C kék #1, FD&C sárga #10, FD&C vörös #40; antioxidánsok; vitaminok, például C és E vitamin, más plakk ellenes szerek, például ónsók, rézsók, stronciumsók és magnéziumsók; pH értéket beállító szerek, fogszuvasodás elleni szerek, például karbamid, kalcium-glicerofoszfát, nátrium-trimetáfoszfát, növényi extraktok, érzékeny fogak érzékenységét csökkentő szerek, például kálium-nitrát és kálium-citrát és ezek keverékei.

A szájvizek jellemzően egy víz/alkohol oldatot, illatanyagot, nedvesítőszert, édesítőszert, habfokozó szert és színező anyagot tartalmaznak, ahogyan az előzőekben közöltük. A szájvizek 0-60 tömeg%, előnyösen 5-30 tömeg% mennyiségben etil-alkoholt tartalmazhatnak.

A találmány szerinti fogsortisztító készítmények továbbá egy vagy több fehéritőszert, szerves peroxisav prekuzort, pezsgés fejlesztőt, kelátképzőszert, stb. tartalmazhatnak.

A fehéritőszer egy szervetlen persó formáját öltheti fel, és a fogsortisztító szerekben való alkalmazásra jól ismert fehéritőszerek bármelyike lehet, például az alkálifém- és ammónium-perszulfátok, -perborátok -perkarbonátok és -perfoszfátok, és az alkálifém- és alkáliföldfém-peroxidok. Megfelelő fehéritőszerek például a kálium-, ammónium-, nátrium- és lítium-perszulfá-

tok és a -perborát mono- és tetrahidrátok, nátrium-pirofoszfát-peroxihidrát és magnézium-, kalcium-, stroncium- és cink-peroxidok. A találmányban való alkalmazásra ezek közül azonban az alkálifém-perszulfátok, -perborátok és ezek keverékei előnyösek, nagyon előnyösek az alkálifém-perborátok. A találmány egy jellemzője valóban, hogy a találmány szerinti tabletta készítmények kitűnő baktérium ellenes aktivitást biztosítanak még alkálifém-perszulfátok hiányában is.

A teljes készítményben a fehérítőszer mennyisége általában körülbelül 5-70%, előnyösen körülbelül 10-50%. Az alkálifém-perszulfátok és -perborátok keverékét tartalmazó készítményekben a teljes perszulfát:perborát arány megfelelően körülbelül 5:1 - 1:5 közötti, még jellemzőbben körülbelül 2:1 - 1:2 közötti.

A fogsor tisztító készítmények egy pezsgés-fejlesztőt is tartalmazhatnak, azaz egy anyagot, amely víz jelenlétében pezsgés közben szén-dioxidot vagy oxigént szabadít fel. A pezsgés-fejlesztőt olyan fejlesztőkből választhatjuk ki, amelyek hatékonyak savas, semleges vagy alkálikus pH érték körülmények között, de előnyösen egy savas vagy semleges pH körülmények között hatékony vagy leghatékonyabb generátor és egy alkálikus pH körülmények között hatékony vagy leghatékonyabb generátor kombinációjából áll. A savas vagy semleges pH körülmények között hatékony pezsgés-fejlesztők legalább egy alkálifém-karbonát vagy -dikarbonát, például nátrium-dikarbonát, nátrium-karbonát, nátrium-szeszkvikarbonát, kálium-karbonát, kálium-dikarbonát vagy ezek keverékeinek egy kombinációját legalább egy nem toxikus, fiziológiailag elfogadható szerves savval, például borkő-, fűmár-,

citrom-, alma-, malein-, glükon-, borostyánkő-, szalicil-, adipin- vagy szulfaminsavval, nátrium-fumaráttal, nátrium- vagy kálium-savfoszfátokkal, betain hidrokloriddal vagy ezek keverékeivel összekeverten tartalmazzák. Ezek közül legelőnyösebb az almasav. Az alkális pH körülmények között hatékony pezsgés-fejlesztők persókat tartalmaznak, például alkáli- és alkáli-földfém-peroxo-borátokat, valamint perborátokat, perszulfátokat, perkarbonátokat, perfoszfátokat és ezek keverékeit tartalmazzák, ahogyan az előzőekben közöltük, például egy alkálifém-perborát (vízmentes, mono- vagy tetrahidrát) egy monoperszulfáttal, például E. I. du Point de Nemours Co. által forgalmazott Carcoat[®]-rel alkotott keverékét, amely monoperszulfát, kálium-szulfát és kálium-diszulfát 2:1:1 arányú keveréke és körülbelül 4,5 % aktív oxigéntartalommal rendelkezik.

Előnyös, tablettá formájú fogsor tisztító készítményekben a pezsgést fejlesztő anyag egy szilárd alapanyag formáját veszi fel, amely víz jelenlétében pezsgés közben szén-dioxidot vagy oxigént bocsát ki. A szilárd alapanyag megfelelően egy (hidrogén-)karbonát/sav pezsgő párt, adott esetben egy perborát/perszulfát oxigénes pezsgést fejlesztő anyaggal kombináltan tartalmaz. A pezsgést előidéző anyagok kombinációja az optimális oldódási tulajdonságok elérésére és az optimális tisztítási és baktérium ellenes aktivitás eléréséhez szolgáló pH érték körülményekre értékelhető. A (di)karbonát komponensek általában a teljes készítménynek körülbelül 5-65 %-át, előnyösen körülbelül 25-55 %-át; a sav komponensek általában a teljes készítménynek körülbelül 5-50 %-át, előnyösen körülbelül 10-30 %-át teszik ki.

A találmány szerinti fogsor tisztító készítményeket ilyen készítmények egyéb ismert komponenseivel kiegészíthetjük. Egy különösen előnyös további komponens egy szerves peroxisav prekurzor, amelyet általánosságban a következő persav formálási próbában egy legalább 1,5 ml 0,05 M nátrium-tioszulfát titerű vegyületként határozhatunk meg.

A következő anyagok 1000 ml desztillált vízben való oldásával egy kísérleti oldatot állítunk elő:

nátrium-pirofoszfát

[$\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$ —víz (1/10)] 2,5 g

nátrium-perborát

10,4 % hozzáférhető oxigénnel rendelkező

[$\text{NaBO}_2 \cdot \text{H}_2\text{O}_2$ —víz (1/3)] 0,615 g

nátrium-dodecil-benzolszulfonát 0,5 g

Ehhez az oldathoz 60°C-on úgy adunk hozzá egy aktivátor mennyiséget, hogy minden egyes atom jelenlevő, hozzáférhető oxigénre az aktivátor egy molekuláris ekvivalensét visszük be.

Az aktivátor hozzáadásával nyert keveréket erőteljesen keverjük és 60°C-on tartjuk. Az adagolás után 5 perccel az oldat 100 ml-ét kivesszük és azonnal 250 g aprított jég és 15 ml jég-ecet keverékére pipettázzuk. 0,4 g kálium-jodidot adunk azután hozzá és a felszabadult jód azonnal titráljuk keményítő indikátor mellett 0,05 M nátrium-tioszulfáttal, a kék szín első eltűnéséig. A fehéritő aktivátor titere a használt nátrium-tioszulfát oldat mennyisége, ml-ben kifejezve.

A szerves persav prekurzorok, jellemzően egy vagy több, perhidrolízisre érzékeny savcsoportot tartalmazó vegyületek. Az

előnyös aktivátorok N-acil vagy O-acil vegyület típusok, amelyek egy R-CO acilcsoportot tartalmaznak, amelyben az R jelentése egy előnyösen körülbelül 1-20 szénatomos szénhidrogén- vagy szubsztituált szénhidrogén-csoport.

Megfelelő persav prekursorok például:

1) Az $RCONR_1R_2$ általános képletű -

amely képletben

RCO jelentése egy karbonsav-csoport,

R_1 jelentése egy savcsoport, és

R_2 jelentése egy szerves csoport, ahogyan az US-A-3 117 148 számú szabadalmi iratban közlik -

sav-organo-amidok. Ebbe a csoportba tartozó vegyületek például:

a) N,N-diacetil-anilin és N-acetil-ftalimid;

b) N-acil-hidantoinok, például

N,N'-diacetil-5,5-dimetil-hidantoin;

c) Poliacilezett alkilén-diaminok, például

N,N,N',N'-tetraacetil-etilén-diamin (TAED) és a megfelelő hexametilén-diamin (TAHD) származékok, ahogyan a GB-A-907 356, GB-A-907 357 és GB-A-907 358 számú szabadalmi iratokban közlik;

d) Acilezett glikol-urilok, például tetraacetil-(glikol-uril), ahogyan a GB-A-1 246 338, GB-A-1 246 339 és GB-A-1 247 429 számú szabadalmi iratokban közlik.

2) Acilezett szulfonamidok, például N-metil-N-benzoil-metán-szulfonamid és N-fenil-N-acetil-metán-szulfonamid, ahogyan a GB-A-3 183 266 számú szabadalmi iratban közlik.

3) Karbonsav-észterek, ahogyan a GB-A-836 988, GB-A-963 135 és

GB-A-1 147 871 számú szabadalmi iratokban közlik. Ilyen típusú vegyületek például a fenil-acetát, nátrium-acetoxi-benzolszulfonát, triklór-etil-acetát, szorbit-hexaacetát, fruktóz-pentaacetát, p-nitro-benzaldehid-diacetát, izopropenil-acetát, acetil-aceto-hidroxaminsav és acetil-szalicilsav. Mások például egy fenolnak vagy szubsztituált fenolnak egy α -klórozott, kisebb alifás karbonsavval, például klór-acetil-fenollal és klór-acetil-szalicilsavval alkotott észterei, ahogyan az US-A- 3 130 165 számú szabadalmi iratban közlik.

4) Az AcL általános képletű –

amely képletben

Ac jelentése egy adott esetben szubsztituált, lineáris vagy el-

ágazó, 6-20 szénatomos alkil- vagy alkenilcsoportot vagy egy

6-20 szénatomos alkil-szubsztituált arilcsoportot tartalmazó

szerves karbonsav és

L jelentése egy kilépő csoport, amelynek konjugált sava 4-13

tartományba eső pKa értékű, például oxi-benzolszulfonát vagy

oxi-benzoát –

karbonsav-észterek. Azok az előnyös ilyen típusú vegyületek, amelyekben:

a) Ac jelentése R_3 -CO általános képletű csoport, és

R_3 jelentése egy 6-20, előnyösen 6-12, még előnyösebben

7-9 szénatomos, lineáris vagy elágazó alkilcsoport, és

a leghosszabb lineáris alkillánc a karbonilcsoport

szénatomját is beleértve 5-18, előnyösen 5-10 szénato-

mos, R_3 adott esetben klóratommal, brómatommal, oxi-

-metil- vagy oxi-etilcsoporttal (előnyösen a karbonil-

-csoporthoz képest α -helyzetben) szubsztitált lehet.

Ezen anyagcsoport példái 3,5,5-trimetil-hexanoil-oxi-benzolszulfonát nátriumsója, 3,5,5-trimetil-hexanoil-oxi-benzoát nátriumsója, 2-etil-hexanoil-oxi-benzolszulfonát nátriumsója, nonaoil-oxi-benzolszulfonát nátriumsója és oktanoil-oxi-benzolszulfonát nátriumsója, az acil-oxi-csoport minden egyes esetben p-szubsztituált;

- b) Az Ac csoport $R_3(AO)_mXA$ általános képletű, - amely képletben

R_3 jelentése az alkilcsoportban 6-20, előnyösen 6-15 szénatomos lineáris vagy elágazó, alkil- vagy alkil-arilcsoport,

R_5 adott esetben klóratommal, brómatommal, oxi-metil- vagy oxi-etilcsoporttal szubsztituált,

AO jelentése oxi-etilén- vagy oxi-propiléncsoport,

m értéke 0-100 közötti,

X jelentése oxigénatom, NR_4 vagy $CO-NR_4$ általános képletű csoport és

A jelentése CO, CO-CO képletű, R_6-CO , $CO-R_6-CO$ vagy $CO-NR_4-R_6-CO$ általános képletű csoport, - amely képletekben

R_4 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, és

R_6 jelentése az alkilén- vagy alkenilén-csoportban 1-8 szénatomos alkilén-, alkenilén-, arilén- vagy alkil-arilén-csoport.

Az ilyen típusú fehérítő aktivátor vegyületek közé az

$R_3(AO)_mCOL$ általános képletű karbonsav származékok,
 $R_3OCO(CH_2)_2COL$ általános képletű borostyánkősav származékok,
 R_3OCH_2COL általános képletű glikolsav származékok,
 $R_3OCH_2CH_2COL$ hidroxipropionsav származékok,
 $R_3OCOCOL$ általános képletű oxálsav származékok,
 $R_3OCH=CHCOL$ általános képletű maleinsav és fumársav származékok,
 $R_3CONR_1(CH_2)_6COL$ általános képletű acilglicin származékok és $R_3CON(R_1)CO(CH_2)_4COL$ általános képletű amino-6-oxo-kapronsav származékok tartoznak.

Az előző képletekben

m értéke 0-10 közötti, és

R_1 jelentése előnyösen 6-12, még előnyösebben 6-10

szénatomos alkilcsoport, ha m értéke nulla, és 9-15 szénatomos, ha m értéke nem nulla.

L kilépő csoport jelentése korábbiak szerint definiált.

5) Akril-cianurátok, például triacetil- vagy tribenzoil-cianurátok, ahogyan a 3 332 882 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi bejelentésben közlik.

6) Benzoésav és ftálsav adott esetben szubsztituált anhidridjei, például benzoésavanhidrid, m-klór-benzoésavanhidrid és ftálsavanhidrid.

Az összes előző vegyület közül az 1(c) és 4(a) típusú szerves persav prekursorok előnyösek.

A peroxisav fehérítő prekursor mennyisége, amennyiben jelen van, a teljes készítmény tömegére előnyösen körülbelül 0,1-10 %, még előnyösebben körülbelül 0,5-5 %, és általában egy fehérítő prekursor agglomerátum formájában adagoljuk.

A találmányban való alkalmazásra megfelelő fehérítő prekursor agglomerátum általában körülbelül 5-40 tömeg%, még jellemzőbben körülbelül 10-30 tömeg% mennyiségű kötőanyagot vagy agglomeráló szert tartalmaz. Megfelelő agglomeráló szerek a 20000-500000 molekulatömegű poli(vinil-pirrolidon), poli(oxi-etilén), a körülbelül 1000-50000 molekulatömegű polietilén-glikolok, 4000-20000 molekulatömegű Carbowax, nemionos felületaktív anyagok, zsírsavak, nátrium-(karboxi-metil)-cellulóz, zselatin, zsíralkoholok, foszfátok és polifoszfátok, agyagok, alumínium-szilikátok és polimer polikarboxilátok. Az előzőek közül nagyon előnyösek a polietilén-glikolok, különösen a körülbelül 1000-30000, előnyösen 2000-körülbelül 10000 molekulatömegűek.

Az optimális oldódás és pH tulajdonságok szempontjából azok az előnyös fehérítő prekursor agglomerátumok, amelyek körülbelül 10-75 tömeg%, előnyösen körülbelül 20-60 tömeg% peroxisav fehérítő prekuzort, körülbelül 5-60 tömeg%, előnyösen körülbelül 5-50 tömeg%, még előnyösebben körülbelül 10-40 tömeg% (di)karbonát/sav pezsgő párt, körülbelül 0-20 tömeg% peroxo-borátot és körülbelül 5-40 tömeg%, előnyösen körülbelül 10-30 tömeg% agglomeráló szert tartalmaznak.

A kész fehérítő prekursor szemcsék kívánatos módon körülbelül 500-1500, előnyösen körülbelül 500-1000 μm átlagos részecskeméretűek, ezt az optimális oldódási teljesítmény és esztétika szempontjából értékeljük. A fehérítő prekursor agglomerátum mennyisége továbbá előnyösen körülbelül 1-20 %, még előnyösebben körülbelül 5-15 % a készítmény tömegére.

A találmány szerinti fogsortisztító készítmények paszta,

tabletta, szemcsés vagy por formájúak lehetnek, bár a találmányban a tablettá formájú készítmények nagyon előnyösek. A tablettá formájú készítmények egy vagy több rétegű tabletták lehetnek.

A találmány szerinti fogsortisztító készítményeket kiegészíthetjük ilyen készítmények egyéb szokásos komponenseivel, különösen felületaktív anyagokkal, kelátképző szerekkel, enzimekkel, illatosító anyagokkal, fiziológiai hűtő szerekkel, baktérium ellenes vegyületekkel, festékanyagokkal, édesítőszerekkel, tablettá kötőanyagokkal és töltőanyagokkal, habzáscsökkentőkkel, például dimetil-polisziloxánokkal, habstabilizátorokkal, például zsírsav-cukorészterekkel, tartósítószerekkel, kenőanyagokkal, például talkummal, magnézium-sztearáttal, finoman aprított amorf pirogén szilikátokkal, stb. A végső készítmény szabad nedvességtartalma kívánatos módon körülbelül 1 %-nál és jellemzően körülbelül 0,5 %-nál kisebb.

A találmányban való alkalmazásra megfelelő tablettá kötőanyagok és töltőanyagok a 20000-500000 molekulatömegű poli(vinil-pirrolidon), poli(oxi-etilén), a körülbelül 1000-50000 molekulatömegű polietilénglikolok, 4000-20000 molekulatömegű Carbowax, nemionos felületaktív anyagok, zsírsavak, nátrium-(karboximetil)-cellulóz, zselatin, zsíralkoholok, agyagok, polimer polikarboxilátok, nátrium-karbonát, kalcium-karbonát, kalcium-hidroxid, magnézium-oxid, magnézium-hidroxid-karbonát, nátrium-szulfát, fehérjék, cellulóz-éterek, cellulóz-észterek, poli(vinil-alkohol), algin-sav-észterek, pszeudokolloid jellegű növényi zsír-anyagok. Az előzőek közül nagyon előnyösek a polietilénglikolok, különösen a körülbelül 1000-30000, előnyösen körülbe-

lül 12000-30000 molekulatömegűek.

A találmány szerinti fogsortisztító készítményekben alkalmazott felületaktív szert a sok rendelkezésre álló, a fogsortisztító szer egyéb alkotórészeivel kompatibilis, mind száraz állapotú, mind oldatban levő anyagból kiválszthatjuk. Úgy véljük, hogy az ilyen anyagok javítják a készítmény többi komponensének hatékonyságát, elősegítve a fogsor belső felületeibe való beszívargásukat. Ezek az anyagok elősegítik a fogakhoz tapadt ételmaradékok eltávolítását is. A készítménybe beletehetünk például a száraz készítmény tömegére 0,1-5 % száraz port vagy szemcsés anionos felületaktív szert, például nátrium-lauril-szulfátot, nátrium-N-lauroil-szarkozinátot, nátrium-lauril-szulfo-acetátot vagy dioktil-nátrium-szulfo-szukcinátot vagy ricinoleil-nátrium-szulfo-szukcinátot, és a készítmény előnyösen 0,5-4 tömeg% felületaktív szert tartalmaz.

Megfelelő kationos, nemionos és amfolit felületaktív szerek például a kvaterner ammónium-vegyületek, például (cetil-trimetil)-ammónium-bromid, alkilén-oxidok, például etilén- vagy propilén-oxid kondenzációs termékei zsíralkoholokkal, fenolokkal, zsír-aminokkal vagy zsírsav-alkanol-amidokkal, a zsírsav-alkanol-amidok önmagukban, hosszú láncú (8-22 szénatomos) zsírsavak észterei polialkoholokkal vagy cukrokkal, például gliceril-monosztearát vagy szacharóz-monolaurát vagy szorbit-polioxi-etilén-mono- vagy -disztearát, betainok, szulfo-betainok vagy hosszú láncú alkil-aminokarbonsavak.

A kelátképző szerek előnyösen elősegítik a tisztítási és fehérítési stabilitást a fémionoknak, például kalcium, magnézium

és nehézfém kationoknak oldatban tartásával. Megfelelő kelátképző szerek például nátrium-tripolifoszfát, savas nátrium-pirofoszfát, tetranátrium-pirofoszfát, amino-polikarboxilátok, például nitrilo-trieecetsav és etilén-diamin-tetraecetsav és ezek sói, és polifoszfónatok és amino-polifoszfónatok, például (hidroxietán)-difoszfonsav, etilén-diamin-tetrametilén-foszfonsav, dietilén-triamin-pentametilén-foszfonsav és ezek sói. A kiválasztott kelátképzőszert nem kritikus, kivéve, hogy a fogsortisztító szer egyéb alkotórészeivel száraz állapotban és vizes oldatban kompatibilisnek kell lennie. A kelátképzőszert a készítményeknek 0,1-60 tömeg%-a és előnyösen körülbelül 0,5-30 tömeg%-a. A foszfonsav kelátképzőszerek azonban a készítménynek körülbelül 0,1-1 tömeg%-át, előnyösen körülbelül 0,1-0,5 tömeg%-át teszik ki.

A találmányban való alkalmazásra megfelelő enzimek például a proteázok, alkalázok, amilázok, lipázok, dextranázok, mutanázok, glükánázok, stb.

A következő példák továbbá a találmány oltalmi körén belül levő előnyös megvalósításokat közlik és szemléltetik.

1- 5. példa

A következők a találmány szerinti fogsortisztító tablettákat szemléltetik. A százalékok a teljes tablettátömegére vonatkoznak. A tablettákat a granulált komponensek keverékének egy nyomó és színező tablettázó présben, körülbelül 10^5 kPa nyomáson való préselésével állítjuk elő.

	<u>I.</u>	<u>II.</u>	<u>III.</u>	<u>IV.</u>	<u>V.</u>
Almasav	12	10	15	-	14
Citromsav	-	10	-	15	-
Nátrium-karbonát	10	8	10	6	10
Szulfaminsav	5	-	-	3	3
Peg 20000	-	3	7	8	5
PVP 40000	6	3	-	-	-
Nátrium-dikarbonát	22	25,2	25	13,9	23
Nátrium-perborát—víz (1/1)	15	12	16	30	15
Kálium-monoperszulfát	15	18	13	-	14
Pirogén kovasav	-	0,3	0,1	0,1	-
Talkum	2	-	-	-	-
EDTA	-	-	1	-	3
EDTMP ¹	1	-	-	1	-
Illatanyag ⁵	2	1	2	1	2
Magnasoft folyadék ⁴	1	1,5	5	10	1
Fehérítő prekurzor agglomerátum	9	8	10	12	10

Fehérítő prekurzor agglomerátum	<u>I.</u>	<u>II.</u>	<u>III.</u>	<u>IV.</u>	<u>V.</u>
TAED ²	2	-	4	5	2,5
TMHOS ³	2	3	-	-	-
Szulfaminsav	2	2	2	2	3,5
Nátrium-dikarbonát	0,5	0,2	0,2	0,5	2
PEG 6000	2,5	2	2,4	2,5	1,5
Festék	-	0,8	1,4	2	0,5

1. Etilén-diamin-tetrametilén-foszfonsav
2. Tetraacetyl-etylén-diamin
3. 3,5,5-trimetyl-(hexanoil-oxi)-benzolszulfonát
4. Magnosoft folyadék - OSI által forgalmazott
5. Borsmenta alapú illatanyag

Az előző 1-5. példákban a teljes tablettatömeg 3 g; az átmérő 25 mm.

Az 1-5. példabeli fogsortisztító tabletták kitűnő kohéziós és más fizikai és használatbeli teljesítmény tulajdonságokkal együtt jobb plakk ellenes, tisztító és baktérium ellenes aktivitást mutatnak.

6 - 8. példa

A következők a találmány szerinti fogpasztákat/fogsortisztító pasztákat szemléltetik. A százalékok a teljes készítmény tömegére vonatkoznak.

	<u>VI.</u>	<u>VII.</u>	<u>VIII.</u>
Kalcium-karbonát	20	25	15
Glicerín	10	12	8
(Karboxi-metil)-cellulóz nátriumsó	3,5	3	4
Titán-dioxid	0,7	0,5	0,6
Metil/propil-parabének	0,1	0,1	0,1
Nátrium-szacharinát	0,3	0,4	0,2
Illatanyag ⁵	1	1	2
Magnosoft folyadék ⁴	1	1,5	0,5
Triklózán	-	0,5	-
Víz		100-ra	

A 6-8. példabeli fogpaszták/fogsor tisztító paszták kitűnő tisztítási tulajdonságokkal együtt jobb plakk ellenes, tisztító és baktérium ellenes aktivitást mutatnak.

S Z A B A D A L M I I G É N Y P O N T O K

1. Egy fogpaszta, por, folyékony fogápolószer, szájvíz, fogsortisztító szer, rágógumi vagy cukorka formájában levő, szájban alkalmazható készítmény, amely egy illatosító anyagokból, fiziológiai hűtő szerekből és baktérium ellenes vegyületekből kiválasztott lipofil vegyületet és egy ismétlődő egységre vonatkoztatva körülbelül 0,1-2 % amino-alkil-sziloxán tartalmú amino-alkil-szilikon tartalmaz.

2. Egy 1. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy az amino-alkil-szilikon egy nem ciklikus, hidrofób amino-alkil-szilikon, amely két alapegységet tartalmazó összetételű:

1) $(R^1)_m(R)_nSiO_{(4-m-n)/2}$ általános képletű egység, -

amely képletben

$m + n$ értéke 1,2 vagy 3;

n értéke 1,2 vagy 3;

m értéke 0, 1 2; és

2) $(R^1)_a(R^2)_bSiO_{(4-a-b)/2}$ általános képletű egység, -

amely képletben

$a + b$ értéke 1, 2 vagy 3, és **a** és **b** értéke egész szám,

amely képletekben

R^1 és R^2 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, körülbelül

1-10 szénatomos, adott esetben fluoro- vagy cianocsoportok-

kal, hidrox-, alkoxi- és acetoxi csoportokkal szubsztituált

alkil- vagy alkenilcsoport, és

R jelentése



általános képletű csoport, -

amely képletekben

R^3 jelentése egy körülbelül 1-20, adott esetben oxigénatomokkal szubsztituált vagy megszakított kétértékű alkilénecsopott;

R^4 , R^5 és R^6 azonos vagy eltérő lehet, és jelentésük hidrogén-

atom, körülbelül 1-20, adott esetben nitrogén- és/vagy oxigénatomokkal szubsztituált vagy megszakított alkilcsoport,

és X^- jelentése egy egyértékű anion,

az illető amino-alkil-szilikon, egy ismétlődő egységre vonatkoztatva körülbelül 0,1-2 % (1) egységet tartalmaz.

3. Egy 2. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy az amino-alkil-szilikon legalább körülbelül 5000, előnyösen körülbelül 5000-100000 molekulatömegű.

4. Egy 1-3. igénypontok bármelyike szerinti, körülbelül 0,01-25 tömeg%, előnyösen körülbelül 0,1-5 tömeg% amino-alkil-szilikont tartalmazó készítmény.

5. Egy 1-4. igénypontok bármelyike szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy a lipofil vegyület egy, egy vagy több, gaulteria-olajból, oregánó-olajból, babérlevél-olajból, menta-olajból, fodormentaolajból, szegfűszegolajból, zsájaolajból, szasszafrász babérolajból, citromolajból, narancsolajból, ánizsolajból, benzaldehidből, keserűmandula-olajból, kámforból, cédruslevél-olajból, majoránna-olajból, citronella-olajból, le-

vendulaolajból, mustárolajból, fenyőolajból, fenyőtű-olajból, rozmaringolajból, kakukkfűolajból, fahéjlevél-olajból és ezek keverékeiből kiválasztott illatkomponenst tartalmazó illatosítószert tartalmaz.

6. Egy 1-5. igénypontok bármelyike szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy a baktérium ellenes szert timolból, mentolból, triklozánból, 4-hexil-rezorcinból, fenolból, eukaliptolból, benzoesavból, benzoil-peroxidból, buril-parabenből, metil-parabenből, propil-parabenből, szalicil-amidokból és ezek keverékeiből választjuk ki.

7. Egy 1-6. igénypontok bármelyike szerinti, körülbelül 10-70 tömeg%, kovasavból, alumínium-oxidból, alumínium-szilikátokból, magnézium- és cirkónium-szilikátokból, kalcium-orto-, -piro-, -meta- és -polifoszfátokból, kalcium- és magnézium-karbonátokból, oldhatatlan metafoszfátokból és hőre keményedő polimerizált gyantákból kiválasztott fogcsiszoló szert tartalmazó készítmény.

8. Egy 1-7. igénypontok bármelyike szerinti, 50-3500 ppm fluoridion biztosításához elégséges mennyiségű fluoridion-forrást tartalmazó készítmény.

9. Egy 1-8. igénypontok bármelyike szerinti, körülbelül 0,1-1 tömeg% kötőanyagot tartalmazó készítmény.

A meghatalmazott:

Hollósi László
vezető igazgató
