



Pol 1620

**S. B. G. & K.**  
Szabadalmi Ügyvivői Iroda  
H-1062 Budapest, Andrásy út 113.  
Telefon: 461-1000, Fax: 461-1099

**KÖZZÉTETTE  
ANYAG**

3.9.71. BE

A2

## **Eltávolítható hátszalaggal ellátott adagoló rendszer organosziloxán gyantákat tartalmazó szájapoló készítményekhez**

A találmány tárgya adagoló rendszer szájapoló anyag vagy készítmény felhordására és kiadagolására a száj felületeire, így a fogzománcra. A készítmény filmet képez a felületen, amelyhez alkalmazták, és a szájapoló anyag hosszantartó felszabadítását biztosítja a filmből, tartós gyógyászati, profilaktikus és/vagy kozmetikai előnyöket eredményezve. Specifikusabban, a találmány olyan rendszerekre vonatkozik, amelyek eltávolítható hátszalagot tartalmaznak, hogy megkönnyítsék az organosziloxán gyantákat magukba foglaló készítmények felvitelét szájapoló anyagok kiadagolására a fogzománcra. Ezenkívül, úgy gondoljuk, hogy a készítmények további hosszantartó felszabadítási előnyöket biztosítanak más szájfelületekhez is, így a fogíny és a nyálkahártya szöveteihez, valamint a fogak felületeihez.

Előzőleg is ismertek voltak már olyan szájapoló termékek, amelyek különböző szájapoló anyagokat vagy hatóanyagokat tudnak kiadagolni a szájüreg lágy és kemény szöveteihez. Ilyen szájapoló készítmények például a fogak tisztítását segítő szerek, így a fogkrémek, szuvasodás elleni hatóanyagok, így fluorid vagy más hatóanyagok adagolásához a baktériumok csökkentésére, amelyek plakkok képződéséhez vezetnek, és szájvizek, amelyek a lehetet frissítő hatóanyagokat és baktériumellenes hatóanyagokat tartalmaznak. Ezenkívül kifejlesztettek fehérítő szereket, ilyen például a peroxid, amely közvetlenül a fogak felületeihez, vagyis a fogzománchoz alkalmazható.

Azt találtuk azonban, hogy az ilyen hagyományos termékformák nem elég tartósak ahhoz, hogy a hatóanyagokat a száj kemény és lágy szövetein tartsák olyan hosszú ideig, ami elegendő ahhoz, hogy elősegítsék vagy meghosszabbítsák a hatóanyagok által biztosított terápiás, profilaktikus és/vagy kozmetikai előnyöket. Ezek a hagyományos termékformák továbbá nem képesek a szájápoló hatóanyagok tartós kiadagolását biztosítani, anélkül, hogy ezeket ne kellene viszonylag rövid időtartamokban periodikusan újra felvinni, vagy egy speciális adagoló eszköz vagy tartóeszköz, így egy szájdarab nélkül.

Egy ilyen rendszert ismertet a WO 98 55709 számú nemzetközi közzétételi irat. Ez a rendszer magába foglalja egy, a szájüreg felületével közvetlenül érintkező szájápoló anyag és egy flexibilis anyagból készült szalag kombinációját, mely utóbbit a szájápoló anyag felett viselnek, hogy megvédje az anyagot a lekopástól, és attól, hogy a száj más felületeivel vagy nyállal érintkezzék. Ennél a rendszernél a szalagot abból a célból hordják, hogy a készítményt elég ideig a helyén tartsa ahhoz, hogy a hatóanyag kifejtse hatását a száj felületén.

Más kísérleteket is végeztek már, hogy elősegítsék a fehéritőszerek, baktericid anyagok és a szájápoló termékek egyéb hatóanyagainak a szubsztantivitását. Az USP 5,425,953 számú szabadalmi irat szerint például egy filmképző, vízoldható cellulóz-polimert használnak egy fehéritőszer kiadagolására a fogakhoz; az USP 5,438,076 számú szabadalmi iratban folyékony metakrilsav-kopolimer készítményeket használnak egy baktériumölő farmakológiai szer kiadagolására; és a PCT/CN97/00 számú nemzetközi sza-

badalmi bejelentés egy filmbevonatú készítményt ismertet, amely cellulózt, és polivinilacetált, kumaron-indol gyantát vagy selakot tartalmaz filmképzőként, fehérítőszerek adagolására a fogzománchoz.

A fenti rendszerek azonban vízoldhatók, vagyis a nyál könnyen oldja ezeket, általában 1-3 órával a felvitel után. Ezért ezek tartóssági foka csekély, és nem tudják a készítményben jelenlévő hatóanyag hosszú ideig tartó kiadagolását biztosítani. Ezenkívül, vízoldható jellegük eleve kizárja alkalmazásukat olyan szájápoló hatóanyagokkal, amelyek vízalapú filmekben instabilak lennének. Egy ilyen hatóanyag például, a nátrium-perkarbonát; ez egy vízalapú film magas pH-értékénél nem lenne stabil.

Abból a célból, hogy egy felhordott készítménynek viszonylag nagyfokú tartósságot biztosítsanak, ismertették a fogakra felvitt védőbevonatok alkalmazását. Így például a USP 5,401,528 számú szabadalmi iratban ismertetik, hogy organikusan módosított kovasav-polikondenzátumokat rétegeznek a fogakra, majd in-situ kikeményítéssel polimerizálják, bevonva a fogakat, hogy azokat a plakk-lerakódásoktól megvédjék. Ez a rendszer nem egy igazi adagoló rendszer, amely egy hatóanyagot szabadít fel az időben; hanem egy válaszfalat képez, amellyel a plakkokat okozó baktériumok káros hatásai csökkenthetők.

Egy ilyen védőbevonat ugyan előnyös a jobb tartósság szempontjából, de speciális berendezés használatát kívánja meg és komplex alkalmazást; így otthon nem kivitelezhető, és nem használható önkezelésre.

Látható tehát, hogy az előző kifejlesztések egyike sem tudja biztosítani egy szájápoló szer vagy hatóanyag hosszú ideig tartó kiadagolásának és az egyszerű alkalmazásnak, diszkrét önkezelésnek és az otthoni használatnak a kombinációját. A fentiekre alapozva, szükség van egy olyan megfelelő adagoló rendszerre különböző szájápoló anyagokhoz, amely könnyen alkalmazható, és amelynél a hatóanyagok szubsztantivitása fokozódik. A technika létező állásai körül egy sem biztosítja a találmány előnyeit és hasznát.

A találmány tárgya adagoló rendszer szájápoló anyag adagolására a szájüregbe. Az adagoló rendszer a következőkből áll: (a) eltávolítható hátszalagból, amely elég flexibilitással rendelkezik ahhoz, hogy könnyen alkalmazkodjék egy szájfelülethez, amikor az adagoló rendszert ennek ellenében elhelyezzük; és (b) egy szájápoló készítményből, felvive a szalag anyagára úgy, hogy amikor az adagoló rendszert a száj felületére helyezzük, a szájápoló készítmény érintkezik a száj felületével, ahol a szájápoló készítmény tartalmaz: (i) egy organosziloxán gyantát; (ii) egy reológiai módosítót; és (iii) legalább egy szájápoló anyagot; és a szájápoló készítmény a száj felületén marad, miután a hátszalagot eltávolítjuk.

A találmány tárgyát képezik azok a rendszerek is, amelyekben a szájápoló készítmény tartalmaz még folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimereket is. Az ilyen készítmények tartalmazhatnak továbbá hordozókat az organosziloxán gyanta és a folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimerek szolubilizálására.

A találmány tárgyát képezik továbbá az eljárások a fenti adagoló rendszer alkalmazására.

A találmánynak ezek és más jellemzői, szempontjai és előnyei a szakember számára nyilvánvalóak lesznek a leírás olvasásakor.

A leírás a csatolt igénypontokkal ugyan részletesen ismerteti és világosan igényli a jelen találmányt, de úgy gondoljuk, hogy a találmány jobban érthetővé válik a találmány előnyös kivitelezéseinek alábbi leírásából, összekapcsolva a kísérő ábrákkal, amelyeken az azonos hivatkozási számok azonos elemeket jelentenek.

Az 1. ábra lényegileg lapos hátszalag anyag távlati nézete.

A 2. ábra a találmány egy kivitelezésének távlati nézete, bemutatva az 1. ábra szerinti lapos hátszalagot, bevonva a fogak és/vagy az íny kezelésére szolgáló szájápoló anyaggal.

A 3. ábra a hátszalag keresztmetszeti nézete, a 2. ábra 3-3 metszésvonalára mentén véve a lapos hátszalag egy példáját szemlélítve, amelynek vastagsága kisebb, mint a rárétegezett bevonat.

A 4. ábra a találmány egy alternatív kivitelezésének keresztmetszeti nézete, lapos tasakokat mutatva a hátszalagban, amelyek mint tartályok működnek további szájápoló anyag felvitelére a szalagra.

Az 5. ábra keresztmetszeti felülnézet, amely egy alternatív kivitelezést mutat szájápoló anyagok felvitelére fogak kezelésére, amely a találmány szerinti hátszalaggal rendelkezik, a fogakhoz illeszkedve, és lehetővé téve a felvitelt tipikus fogazat-elrendezésű felületeken át.

A 6. ábra egy fog keresztmetszeti oldalnézete, az 5. ábra 6-6 metszésvonalára mentén véve, amely mutatja a találmány szerinti

hátszalagot a szájápoló hatóanyaggal, illeszkedve a fog profiljához az alkalmazás alatt.

A 7. ábra az 5. ábrához hasonló keresztmetszeti felülnézet, amely mutatja a találmány szerinti hátszalag illeszkedését a fogakhoz és a szomszédos lágy szövethez az alkalmazás alatt.

A 8. ábra keresztmetszeti oldalnézetét, a 7. ábra 8-8 metszésvonalára mentén véve, amely szemlélteti a találmány szerinti hátszalagot, amint illeszkedik mind a fogakhoz, mind pedig a szomszédos lágy szövethez az alkalmazás alatt.

A 9. ábra a találmány egy alternatív kivitelezésének távlati nézete, szemléltetve a 2. ábra szerinti lapos hátszalagot, bevonva egy szájápoló anyaggal, a fogak és a szomszédos lágy szövet kezelésére, amely egy tapadásgátló alátétet tartalmaz.

A 10. ábra a találmány egy alternatív kivitelezésének keresztmetszeti nézete, a 9. ábra 10-10 metszésvonalára mentén véve, szemléltetve a tapadásgátló alátétet, amely a hátszalaghoz a szájápoló anyaggal kapcsolódik a szalag anyagán.

A 11. ábra a találmány szerinti adagoló rendszer alkalmazásának egy példáját mutatja a fogakhoz, a hátszalagot lefejtve a fogokról.

A leírásban használt valamennyi százalékot és arányt tömegben adjuk meg a teljes készítményre, hacsak másképp nem írjuk elő.

Valamennyi mérést, amire a leírásban hivatkozunk, 25°C-on végezzük, hacsak másképp nem írjuk elő.

A leírásban használt „cm” rövidítés centimétert jelent. A leírásban használt „mm” rövidítés millimétert jelent.

A komponensek valamennyi százaléka, aránya és mennyisége, amelyre itt hivatkozunk, a komponens tényleges mennyiségén alapszik, és nem foglalja magába az oldószereket, töltőanyagokat vagy egyéb anyagokat, amelyekkel a komponens kombinálva lehet mint a kereskedelemben kapható termék, hacsak másképp nem írjuk elő.

Valamennyi említett közleményt, szabadalmi bejelentést és szabadalmi leírást teljes egészükben hivatkozással belefoglaljuk a leírásba. Valamely hivatkozás idézése nem tekinthető másnak, mint annak megállapításának, hogy az igényelt találmányhoz tartozó technika állásában jelen van.

A leírásban a „tartalmaz” kifejezés azt jelenti, hogy más műveletek és más komponensek is alkalmazhatók, amelyek a végeredményt nem befolyásolják. Ez a kifejezés magába foglalja az „áll valamiből” és „lényegileg áll valamiből” kifejezéseket is.

Az ábrákra hivatkozva, és kiváltképpen az 1. és 2. ábrára, ezek a találmány első előnyös kivitelezését szemléltetik, amit általánosságban 10 jelez, bemutatva egy adagoló rendszert egy szájápoló készítmény felviteléhez és kiadagolásához egy szájfelületre. A 10 adagoló rendszer a 12 hátszalag-anyaggal rendelkezik, amely kezdetben lényegileg lapos.

A 12 hátszalagra fel van hordva vagy rétegezve a 14 szájápoló készítmény, amit az előzőekben ismertettünk. A 14 szájápoló készítmény előnyösen homogén, egyenletesen és összefüggően van a 12 hátszalagra rétegezve, amint azt a 3. ábra szemlélteti. A 14 szájápoló készítmény azonban alternatívén lehet egy laminátum, vagy állhat külön rétegekből vagy komponensekből, komponensek

amorf keverékéből, külön szalagokból vagy foltokból, vagy különböző komponensek más mintáiból, vagy ezeknek a szerkezeteknek a kombinációiból, beleértve a 14 szájápoló készítmény összefüggő bevonatát a 12 hátszalag egy részének hossz tengelye mentén.

Amint azt a 4. ábra mutatja egy alternatív kivitelezésben a 12 hátszalag a lapos 18 tasakokat tartalmazhatja a szalagban ki képezve. Amikor a 14 szájápoló készítményt a 12 hátszalagnak a készítménnyel bevont oldalára rétegezzük, akkor további 14 szájápoló készítmény tölti ki a 18 lapos tasakokat, és így a 14 szájápoló készítmény részére tárolókat biztosít.

Az 5. és 6. ábra a találmány szerinti 24 adagoló rendszert szemlélteti, hozzáillesztve egy fog és számos szomszédos fog felületéhez az adagoló rendszer alkalmazása alatt. Beágyazva a szomszédos 20 lágy szövetbe, számos egymás mellett lévő 22 fog van. A szomszédos lágy szövet úgy definiálható mint lágy szövetfelületek, amelyek a fog szerkezetét körülveszik, ilyenek a papilla, a marginális foghús, az ínyhasadékok, a fogak közötti íny, a gingivális fogíny a nyelvi és száji felületeken, beleértve a nyálkahártya-fogíny egyesülést és a szájpadlást.

Az 5. és 6. ábrán a 24 adagoló rendszer a 12 hátszalagot jelenti és a 14 szájápoló készítményt, ahol a 14 szájápoló készítmény a 12 hátszalagnak a 22 fog felé néző oldalán van. A 14 szájápoló készítmény lehet előre felvíve a 12 hátszalagra, vagy felvihető a hátszalagra az adagoló rendszer felhasználója által. A 12 hátszalag mindkét esetben olyan vastagsággal és hajlítómerevséggel rendelkezik, ami lehetővé teszi, hogy illeszkedjék a 22 fog profilírozott felületeihez és a szomszédos 20 lágy szö-

vethez a 14 szájápoló készítmény alkalmazása alatt. A hátszalag elég flexibilis ahhoz, hogy a szájfelület körvonalaihoz alkalmazkodjék, ebben az alakzatban a felület a számos szomszédos fogat jelenti. A hátszalag könnyen illeszkedik a fogak felületeihez és a közbeeső fogközökhöz, permanes deformáció nélkül az alkalmazás alatt.

A 7. és 8. ábra a találmány szerinti 24 adagoló rendszert szemlélteti felvive a számos szomszédos 22 fog elülső és hátsó felületeire, valamint a határos 20 lágyszövetre, a szájápoló készítmény alkalmazása alatt. A 24 adagoló rendszer a 12 hátszalagot és a 14 szájápoló készítményt jelenti, ahol a 14 szájápoló készítmény a 12 hátszalagnak a 22 fog felé néző oldalán van elhelyezve.

A 9. és 10. ábra egy esetleges 27 tapadásgátló alátétét szemléltet. A 27 tapadásgátló alátét a 14 szájápoló készítménnyel van a 12 hátszalaghoz erősítve. A 14 szájápoló készítmény a 12 hátszalagnak a 27 tapadásgátló alátét felé néző oldalán helyezkedik el. Ezt az oldalt visszük fel a fog és íny felületeire, amikor a 27 tapadásgátló alátétet eltávolítottuk.

A 11. ábra a találmány szerinti adagoló rendszernek a fogakra való felvitelének egy példáját szemlélteti. A szájápoló anyagok a fogak felületén maradnak, miután a hátszalagot lefejtjük. Az adagoló rendszer egy másik alkalmazására példa (nem látható), amikor a hátszalag in-situ feloldódik. Ilyen kivitelezésnél nincs szükség arra, hogy a hátszalagot a szájfelületekről lefejtsük.

#### **A hátszalag-anyag**

A hátszalag-anyag arra szolgál, hogy hordozza a szájápoló

készítményeket, és megkönnyítse a szájápoló készítmények felvitelét a szájfelületekre. A találmány előnyös kivitelezéseiben a hátszalag eltávolítható, vagyis nem kell a szájüregben viselni, az alatt az idő alatt, amíg a szájápoló készítmény a szájüregben van. A leírásban használt „eltávolítható” kifejezés magába kívánja foglalni a hátszalag manuális eltávolítását, például lefejtéssel, valamint a hátszalag eltávolítását mint annak a szájüregben való in-situ feloldódásának az eredményét, vagyis ez a manuális lefejtés szükségessége nélkül történik.

A hátszalag-anyag állhat polimerekből, természetes vagy szintetikus szövött anyagokból, szövés nélküli anyagokból, fóliából, papírból, gumiból és ezek kombinációjából. A hátszalag lehet egyetlen anyagréteg vagy egynél több réteget tartalmazó laminátum. Tekintet nélkül a rétegek számára, a hátszalag lényegileg vízzel oldható (in-situ feloldódik) vagy vízben lényegileg oldhatatlan.

Egy vízben lényegileg oldhatatlan hátszalag esetében, a szalag eltávolítható lefejtéssel közvetlenül a felvitel után (lásd: 11. ábra), amikor a hatóanyagokat a fogakra és/vagy más szájfelületekre tapasztva hagyjuk, vagy lefejthető bizonyos idő eltelté után. Az anyag előnyösen egy polimer típus vagy polimerek kombinációja, amely rendelkezik a szükséges hajlítómerevséggel és kompatibilis a szájápoló anyagokkal. Megfelelő polimerek — de ezekre nem korlátozva — a polietilén, etil-vinil-acetát, poliészterek, etil-vinil-alkohol, pullulan fólia, és ezek kombinációi. Poliészterek például a Mylar® és a fluorozott műanyagok, így a Teflon®, mindkettő a DuPont cég gyártmánya. Az előnyös anyag a

polietilén. A hátszalag általában kevesebb mint körülbelül 1 mm vastag, előnyösen kevesebb mint körülbelül 0,05 mm vastag, és még előnyösebben körülbelül 0,001 - körülbelül 0,03 mm vastag. Egy polietilén hátszalag előnyösen kevesebb mint körülbelül 0,1 mm vastag, és előnyösebben körülbelül 0,005 - körülbelül 0,02 mm vastag.

A hátszalag készülhet egy lényegileg víz- és/vagy nyál-oldható anyagból, így agarfóliából, keményítős papírból, rizspapírból, természetes gumiból, pullulan papírból vagy ezek keverékeiből. Ezek a megoldások igen kényelmesek a fogyasztói alkalmazásra, mivel nincs szükség a hátszalag lefejtésére. Ezek fokozott biztonságot is jelentenek az éjszakai használat alatt, mivel nincs lehetőség az alvás alatt meglazult hátszalag véletlen lenyelésére.

A hátszalag lehet bármilyen alakú és méretű, amely a kívánt szájfelületet takarja. A hátszalag szélesség függ a befedni kívánt szájfelület területétől is. Egy példában a szalag szélessége körülbelül 0,5 cm - körülbelül 4 cm, és előnyösen körülbelül 1 cm - körülbelül 2 cm.

A hátszalag tartalmazhat lapos tasakokat. Amikor a szájápoló anyagot egy ilyen hátszalagra rétegezzük, további szájápoló anyag tölti meg a lapos tasakokat, tárolókat biztosítva az adalékos szájápoló anyaghoz. Ezenkívül, a lapos tasakok segítenek biztosítani az adagoló rendszer textúráját. A fólia előnyösen rendelkezik a lapos tasakok elrendezésével. A lapos tasakok általában körülbelül 0,4 mm szélesek és 0,1 mm mélyek. Ha lapos tasakokat alkalmazunk a hátszalagban, és szájápoló anyagokat viszünk fel különböző vastagságokban, akkor az adagoló rendszer

teljes vastagsága általában kevesebb mint körülbelül 1 mm. A teljes vastagság előnyösen kevesebb mint körülbelül 0,5 mm.

### **Szájápoló készítmények**

A szájápoló készítmény mennyisége amit felviszünk a szalaganyagra vagy a szájfelületre, függ az anyagdarab méretétől és kapacitásától, a hatóanyag koncentrációjától és az elérni kívánt haszontól. Általában kevesebb mint körülbelül 1 g szájápoló anyagra van szükség. Előnyösen körülbelül 0,05 g - körülbelül 0,5 g, előnyösebben körülbelül 0,1 g - körülbelül 0,4 g szájápoló készítményt használunk. Ekkor a szájápoló anyag mennyiség  $1 \text{ cm}^2$  anyagra kevesebb mint körülbelül  $0,2 \text{ g/cm}^2$ , előnyösen körülbelül 0,005 - körülbelül  $0,1 \text{ g/cm}^2$ , előnyösen körülbelül 0,005 - körülbelül  $0,1 \text{ g/cm}^2$ , és még előnyösebben körülbelül  $0,01 \text{ g/cm}^2$  - körülbelül  $0,04 \text{ g/cm}^2$ .

A találmány szerinti szájápoló készítmények lehetnek viszkózus folyadék, paszta, gél vagy oldat formájában, vagy más megfelelő formában, ami kielégítő adhéziót tud biztosítani. A szájápoló készítmény előnyösen ragasztós fólia alakjában van jelen. A szájápoló anyag viszkozitása körülbelül 200 - körülbelül 1.000.000 cP alacsony nyíróerőknél (kisebb mint 1/mp). A viszkozitás előnyösen körülbelül 100.000 - körülbelül 800.000 cP, és előnyösebben körülbelül 400.000 - körülbelül 600.000 cP.

A szájápoló készítmény egy előnyös kiviteli alakja egy organosziloxán gyantát, egy reológiai módosítót és legalább egy szájápoló anyagot tartalmaz.

A készítmény egy másik kiviteli alakja egy organosziloxán gyantát, egy folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimert, egy



reológiai módosítót és legalább egy szájápoló anyagot tartalmaz. Egy ilyen szájápoló készítmény egy másik előnyös kiviteli alakja tartalmaz továbbá egy hordozót, amely az organosziloxán gyantát és a folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimert szolubilizálni tudja.

Ezeket a komponenseket az alábbiakban részletesebben ismer-tetjük.

### **Organosziloxán gyanták**

A szilikongyanták erősen térhálósított polimer sziloxán rend-szerek. A térhálósítást háromfunkciós vagy négyfunkciós szilánok beépítésével vezetjük be, mono- vagy difunkciós vagy mindkét szilán-nal a szilikongyanta gyártása alatt. A mint az a technika állá-sából jól ismeretes, a térhálósítás mértéke, ami szükséges egy szilikongyantában, változni fog a szilikongyantába beépített spe-cifikus szilán egységeknek megfelelően. Azok a szilikonanyagok, amelyek elegendő mennyiségű trifunkciós és tetrafunkciós sziloxán-monomer egységgel, és így elegendő mértékű térhálósítással ren-delkeznek, általában merev, kemény filmmé száradnak meg, s ezeket szilikongyantáknak tartjuk. Az oxigénatomok aránya a szilíciumato-mokhoz jelzésértékű a térhálósítás mértékére egy speciális szili-konanyagban. Azokat a szilikon-anyagokat, amelyek legalább körül-belül 1,1 oxigénatomot tartalmaznak 1 szilíciumatomra, általában szilikongyantáknak nevezzük. Az oxigén és szilíciumatomok aránya előnyösen legalább körülbelül 1,2:1,0.

A szilikonanyagok és speciálisan a szilikongyanták célszerű-en azonosíthatók egy gyorsírási nomenklatura rendszerrel, amit a szakemberek „MDTQ” monemklatura néven jól ismernek. Ebben a

rendszerben a szilikonokat a különböző sziloxán monomer-egységek jelenléte alapján írják le, amelyek a szilikont felépítik. Röviden, az M szimbólum jelzi a  $(\text{CH}_3)_3\text{SiO}_2$  monofunkciós egységet; D jelzi a  $(\text{CH}_3)_2\text{SiO}$  difunkciós egységet; T jelzi a  $(\text{CH}_3)\text{Si}_{1,5}$  trifunkciós egységet; és Q jelzi a quadra- vagy tetra-funkciós  $\text{SiO}_2$  egységet. Megjegyezzük, hogy kis mennyiségű, legfeljebb körülbelül 5 % szilanol vagy alkoxi-funkcionalitás is jelen lehet a gyantaszervezetben, mint a feldolgozás eredménye.

A fő egység-szimbólumok, például az M', D', T és Q' más szubsztituenseket jelentenek mint metilcsoportot, és ezeket minden alkalommal specifikusan definiálni kell. Tipikus váltakozó szubsztituensek a vinyl-, fenil-, amino-, hidroxycsoportok, stb. A különböző egységek molarányai a szimbólumokhoz írt indexek alakjában, ami jelzi a szilikonban lévő minden egységtípus összes számát, vagy ezeknek egy átlaga, vagy mint specifikusan jelzett arányok, kombinálva a molekulatömeggel, egészítik ki a szilikonanyag leírását, az MDTQ rendszerben. A T, Q, T' és/vagy Q' nagyobb relatív molarányai a D, D', M és/vagy M'-höz egy szilikongyantában a térhálósítás magasabb szintjeit jelzik. Amint azt a fentiekben említettük azonban, a térhálósítás globális szintje jelezhető az oxigén-szilícium aránnyal is.

Az organisziloxán gyanták szilárdak körülbelül 25°C-on, és a gyanták közepes molekulatömege körülbelül 1.000 - körülbelül 10.000. A gyanták oldódnak szerves oldószerekben, így toluolban, xilolban, izoparaffinokban és ciklosziloxánokban vagy az alább leírt illó hordozókban, jelezve ha a gyanta nem eléggé térhálós, vagyis a gyanta oldhatatlan az illó hordozóban.

A találmány szerint használható előnyös szilikongyanták a MQ, MT, MTQ és MDTQ gyanták; az MQ gyantákat az U.S.P. 5,330,747 számú szabadalmi irat ismerteti. E szerint az előnyös szilikon-szubsztituens a metilcsoport. Kiváltképpen előnyösek azok az MQ gyanták, amelyekben az M:Q arány körülbelül 0,5:1,0 - 1,5:1,0. Az organosziloxán gyanták kaphatók a kereskedelemben, például a Wacker 803 és 804 a Wacker Silicones Corporation of Adrian, Michigan, US cégnél; és a G.E. 1170-002, a General Electric Company cégnél.

A készítményekben használt gyanta mennyisége függ oldhatóságának mértékétől a készítményben, kiváltképpen a használt oldószerekben. A találmány szerinti készítményekben használt gyanta általában körülbelül 5 % - körülbelül 70 %, előnyösen körülbelül 15 % - körülbelül 45 %, és még előnyösebben körülbelül 20 % - körülbelül 40 % tartományú.

#### **Folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimerek**

A fentiekben tárgyalt organosziloxán gyantákon kívül, a találmány szerinti készítmények tartalmazhatnak még egy folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimert is, az organosziloxán gyantákkal kombinálva. A találmány szerinti készítményekben használható ilyen folyékony diorganosziloxán-alapú polimerek igen széles viszkozitás-tartományúak, viszkozitásuk 25°C-on körülbelül 10 - körülbelül 10,000.000 cSt. A találmány szerinti készítményekben használható némely diorganosziloxán polimer viszkozitása több mint 10,000.000 cSt 25°C-on, és ezért ezeket a gyártó specifikus penetrációs vizsgálattal jellemzi. Ilyenek például az SE 30 és SE 63 GE szilikonanyagok, amelyek penetrációs előírása

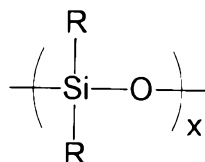


500-1.500, illetve 250-600 (tizedmilliméter).

A találmány szerinti folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimerek között vannak ismétlődő egységekkel rendelkező diorganopolisziloxán polimerek, ahol ezek az egységek az  $(R_2SiO)_n$  általános képletnek felelnek meg, a képletben R 1-6 szénatomos egyértékű szénhidrogéncsoport, előnyösen metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, izobutil-, terc-butil-, amil-, hexil-, vinil-, allil-, ciklohexil-, amino-alkil-, fenil-, fluor-alkil-csoport vagy ezek keverékei. A találmány szerinti készítményekben alkalmazott folyékony diorganopolisziloxán polimerek egy vagy több ilyen szénhidrogéncsoportot tartalmazhatnak mint szubsztituenteket a sziloxán polimer vázon. A folyékony diorganopolisziloxán polimerek végződhetnek az  $(R'_3Si)$  általános képletű triorganoszilil-csoportokkal, a képletben R' 1-6 szénatomos egyértékű szénhidrogéncsoport, hidroxicssoport, alkoxicssoport vagy ezek keverékei. A folyékony diorganopolisziloxán polimernek kompatibilisnek kell lenni oldatban az organosziloxán gyantával és az illó hordozóval. A „kompatibilis” kifejezés arra utal, hogy egyfázisú oldat keletkezik, ha a folyékony diorganopolisziloxán polimert az organosziloxán gyantát és az illékony hordozót a specifikus készítményhez szükséges arányokban összekeverjük. Így például, az alacsony viszkozitású folyékony diorganopolisziloxán polimerek (viszkozitás körülbelül 10-100 cSt) kiváltképpen hasznosak, ha etanolt használunk mint fő illékony hordozót. A nagyobb viszkozitású polimerekhez, például a poli-(dimetil-sziloxán)-hoz, amire itt mint PDMS-re hivatkozunk, vagy a szilikon-gumihoz, amelyek viszkozitása legalább 100.000 cSt, az etanoltól

eltérő illékony hordozók előnyösek.

A szilikongumi képlete az alábbi:



a képletben R metilcsoport.

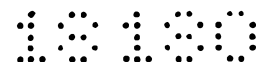
Folyékony diorganopolisziloxán polimerek kaphatók a kereskedelembe, például az SE 30 szilikongumi és az SF 96 szilikonfolyadék a General Electric Company cégnél. Hasonló anyagok kaphatók a Dow Corning és a Wacker Silicones cégektől is.

A találmány szerinti készítményekben előnyösen használható másik folyékony diorganosziloxán-alapú polimer a dimetikon kopolliol, a filmképző tulajdonságok kívánt módosítására. A dimetikon kopolliol továbbá úgy jellemezhető, mint polialkilén-oxiddal módosított poli(dimetil-sziloxán), amit a Witco Corporation Silwet márkanéven gyárt. Hasonló anyagok beszerezhetők a Dow Corning, a Wacker Silicones és a Goldschmidt Chemical Corporation cégektől, valamint más szilikongyártóktól.

A találmány előnyös kivitelezéseiben az organosziloxán gyanú és a folyékony diorganopolisziloxán polimer aránya előnyösen körülbelül 10:1 - körülbelül 1:10, előnyösebben körülbelül 2:1 - körülbelül 8:1, és még előnyösebben körülbelül 4:1 - 6:1.

#### **Reológiai módosítók**

A találmány szerinti készítmények tartalmazznak továbbá egy reológiai módosítót, ami megakadályozza a komponensek leülepedését és szétválását, vagy a leülepedést oly módon szabályozza, hogy megkönnyíti a rediszperziót, és szabályozhatja a reológiai



folyási tulajdonságokat a szalag készítéséhez. A megfelelő reológiai módosítók a szervesen módosított agyagok, szilícium-dioxidok, polietilén és ezek keverékei. Az előnyös organofil agyagok a quaternium-18-hektorit vagy sztearalkónium-hektorit, így a Bentone 27 és 38<sup>TM</sup> a Rheox cégtől, az organoagyag diszperziók, így a Bentone ISD gel<sup>TM</sup>; vagy a bentonit szervesen módosított agyagok, így a Bentone 34<sup>TM</sup> a Rheox cégtől, vagy a Claytone Series<sup>TM</sup> a Southern Clay Products cégtől; és ezek keverékei. Az előnyös szilícium-dioxidok lehetnek elgőzölögtetett szilícium-dioxidok, így az Aerosil<sup>TM</sup> sorozat a Degussa cégtől, vagy a Cab-o-sil<sup>TM</sup> sorozat a Cabot Corporation cégtől, szilikagélek, így a Sylodent<sup>TM</sup> vagy a Sylox<sup>TM</sup> sorozatok a W.R. Grace & Co. cégtől, vagy kicsapott szilícium-dioxidok, így a Zeothix 265 a J.M. Huber Corporation terméke.

A reológiai módosító a készítményben előnyösen körülbelül 0,1 % - körülbelül 30 %, előnyösebben körülbelül 0,5 % - körülbelül 10 %, és még előnyösebben körülbelül 1 % - körülbelül 3 % mennyiségben van jelen a készítményre.

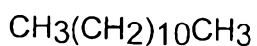
### **Hordozóanyagok**

Azok a szájapoló készítmények, amelyek folyékony diorganosziloxán-alapú polimert tartalmaznak, tartalmazhatnak továbbá egy hordozóanyagot is. A hordozót arra használjuk, hogy szolubilizáljuk az organosziloxán gyantát és a folyékon diorganosziloxán alapú polimert. Ha jelen van, akkor a hordozó előnyösen egy illó komponensből és egy nem-illó komponensből áll. Egy olyan adagoló rendszer előállítása alatt, amelyben a szájapoló készítmény egy ilyen hordozót tartalmaz, a készítménynek a hátszalagra való ki-

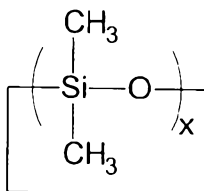
öntése után az illó komponens elillan, és a nem-illó komponens a készítményben marad, a hátszalagnak puhaságot és flexibilitást biztosítva.

A hordozó a készítménynek körülbelül 0 % - körülbelül 90 %-a, előnyösen körülbelül 0 - körülbelül 80 %-a, és még előnyösebben körülbelül 0 % - körülbelül 70 %-a. A találmány szerinti hordozót a szénhidrogén olajok, illékony szilikonok, nem-szénhidrogén oldószerek és ezek keverékei csoportjából választjuk.

A találmány szerint használható szénhidrogén olajok azok, amelyek forráspontja a 60-260°C tartományban van, és előnyösebben azok a szénhidrogén olajok, amelyek körülbelül 8 - körülbelül 20 szénatom hosszúságúak, a legelőnyösebbek a 8-20 szénatomos izoparaffinok. Ezek közül az izoparaffinok közül is a legelőnyösebbek az izodekán, izohexadekán, izoejkozán, 2,2,4-trimetil-pentán, 2,3-dimetil-hexán és ezek keverékei. A legelőnyösebb az izododekán, amely kapható például mint Permethyl 99A a Permethyl Corporation cégtől, és amely a következő képletű:



Előnyös illó szilikon-folyadékok a 3,4 és 5-tagú gyűrűszerkezetekkel rendelkező ciklometikonok, ezek a következő általános képlettel ábrázolhatók:



a képletben x körülbelül 3 - körülbelül 6. Ezek az illó szilikonok a 244 Fluid, 344 Fluid, 245 Fluid és 345 Fluid, valamennyi a Dow Corning Corporation gyártmánya.

A nem-szénhidrogén oldószerek általános osztályai az észterek, ketonok, alkoholok, fluor-szénhidrogének és fluor-szénhidrogén-éterek, amelyek forráspontja 60-200°C tartományú. A nem-szénhidrogén oldószerek vagy keverékeik közül kiváltképpen hasznosak azok, amelyek a gyantát és/vagy a diorganopolisziloxán-alapú polimert szolubilizálni tudják. Ilyen oldószerek — nem korlátozó jelleggel — az etanol, aceton, butanon, etil-acetát, propil-acetát, amil-acetát, etil-butirát, metil-nonafluor-izobutil-éter, metil-nonafluor-butyl-éter és ezek keverékei. Ezek a nem-szénhidrogén oldószerek könnyen beszerezhetők, így az etil-acetát és a metil-etil-keton, mindkettő a J.T. Baker of Phillipsburg, NJ cégtől, és a HFE (a metil-nonafluor-izobutil-éter és a metil-nonafluor-butyl-éter keveréke), amely a 3M Company terméke.

### **Szájápoló anyagok**

A szájápoló anyag előnyösen tartalmaz egy hatóanyagot, olyan mennyiségben, amelynél irányított alkalmazásnál a viselő által igényelt előnyt elősegíti, a szájfelület károsítása nélkül, amelyhez alkalmazzák. A száj állapotai, amelyeket ezek a hatóanyagok megcélznak — nem korlátozó jelleggel — a fogak külső megjelenése és szerkezeti változásai, fehérités, foltok szintelenítése, foltok eltávolítása, plakkok eltávolítása, fogkő eltávolítása, lyukak képződésének a megelőzése és ezek kezelése, gyulladt és/vagy vérző ínyek, sebek a nyálkahártyán, sérülések, fekélyek, aftás fekélyek, kiütések nátha következtében, fogtályogok, és a rossz szájszag megszüntetése, amelyeket a fenti állapotok és más okok, így a mikróbák elszaporodása, okoznak.

Megfelelő szájápoló anyag bármely olyan anyag, amely általá-

ban biztonságosnak tekinthető a szájüregben való alkalmazásra, és amely változásokat biztosít a globális megjelenéshez és/vagy a szájüreg egészséges voltához. A szájápoló anyag mennyisége a találmány szerinti készítményekben általában — hacsak specifikusan nincs előírva — körülbelül 0,01 - körülbelül 50 tömeg%, előnyösen körülbelül 0,1 - körülbelül 20 tömeg%, előnyösebben körülbelül 0,5 - körülbelül 10 tömeg%, és még előnyösebben körülbelül 1 - körülbelül 7 tömeg% a készítményre.

A találmány szerinti szájápoló készítmények vagy anyagok a szakirodalomban már ismerttetett számos hatóanyagot tartalmazhatnak. Az alábbi nem korlátozó jellegű felsorolása a találmány szerint használható szájápoló hatóanyagoknak.

### **1. Fogfehérítő hatóanyagok**

Fogfehérítő hatóanyagok lehetnek a találmány szerinti szájápoló anyagokban. A fehérítéshez megfelelő hatóanyagok a peroxidok, fém-kloritok, perborátok, perkarbonátok, peroxisavak, perszulfátok és kombinációik csoportjából választhatók. Megfelelő peroxid-vegyületek a hidrogén-peroxid, karbamid-peroxid, kalcium-peroxid és ezek keverékei. Legelőnyösebb a karbamid-peroxid. Megfelelő fém-kloritok a kalcium-klorit, bárium-klorit, magnézium-klorit, lítium-klorit, nátrium-klorit és kálium-klorit. További fehérítő hatóanyagok a hipoklorit és a klór-dioxid. Az előnyös klorit a nátrium-klorit. Előnyös perkarbonát a nátrium-perkarbonát. Előnyös perszulfátok az oxonok.

### **2. Fogkő elleni szerek**

A fogkő elleni szerek, amelyek a fogápoló termékekben ismertek, a foszfátok. A foszfátok lehetnek pirofoszfátok, poli-



foszfátok, polifoszfónatok és ezek keverékei. A pirofoszfátok a legjobban ismertek között vannak a fogápoló termékekben való alkalmazásra. A fogakhoz adagolt pirofoszfát- és polifoszfát-ionok a pirofoszfát- és polifoszfát-sókból származnak. A jelen készítményekben használható pirofoszfát sók a dialkálifém-pirofoszfát sók, a tetraalkálifém-pirofoszfát sók és keverékeik. A legelőnyösebb fajták a dinátrium-dihidrogén-pirofoszfát ( $\text{Na}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$ ), a tetranátrium-pirofoszfát ( $\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$ ) és a tetrakálium-pirofoszfát ( $\text{K}_4\text{P}_2\text{O}_7$ ), nem hidratált, valamint hidratált formáikban. A fent említett pirofoszfát sóknak ugyan bármelyike használható, de előnyös a tetranátrium-pirofoszfát só. Előnyösek például a nátrium-polifoszfát és a trietanolamin-polifoszfátok is.

A pirofoszfát sókat részletesebben ismerteti a Kirk & Othmer, Encyklopedia of Chemical Technology, Third Edition, Volume 17, Wiley-Interscience Publishers (1982). További fogkő elleni szerek az U.S.P. 4,590,066 számú szabadalmi iratban ismertetett pirofoszfátok vagy polifoszfátok; poliakrilátok és más polikarboxilátok, így azok, amelyek az U.S.P. 3,429,963, U.S.P. 4,304,766 és U.S.P. 4,661,341 számú szabadalmi iratok ismertettek; poli-epoxi-szukcinátok, így azok, amelyeket az U.S.P. 4,846,650 számú szabadalmi irat ismertet; etilén-diamin-tetraecetsav, amit a BP 490,384 számú szabadalmi irat ismertet; nitrilo-triecetsav és rokon vegyületek, amelyeket az U.S.P. 3,678,154 számú szabadalmi irat ismertet; polifoszfónatok, amelyeket az U.S.P. 3,737,533, 3,988,443 és 4,877,603 számú szabadalmi irat ismertet. Fogkő elleni foszfátok a kálium- és nátrium-pirofoszfátok; a nátrium-tripolifoszfát; difoszfónatok, így az etán-1-hidrox-1,1-di-

foszfonát, 1-aza-cikloheptán-1,1-difoszfonát és a lineáris alkil-difoszfonátok; lineáris karbonsavak; és a nátrium-cink-citrát.

Azok a szerek, amelyek a pirofoszfát sók helyett vagy azokkal kombinálva használhatók, olyan ismert anyagok mint a szintetikus anionos polimerek, így a poliakrilátok és a maleinsavanhidrid vagy maleinsav és metil-vinil-éter kopolimerei (például Gantrez), amelyeket például az U.S.P. 4,627,977 számú szabadalmi irat ismertet; valamint például a poliamino-propánszulfonsav (AMPS), cink-citrát-trihidrát, polifoszfatok (például tripolifoszfat; hexametafoszfát), difoszfonátok (például az EHDP; AHP), polipeptidek (így poliaszparginsavak és poliglutaminsavak) és ezek keverékei.

### **3. Fluoridion forrás**

A fluoridion források jól ismertek a szájjápoló készítményekben való használatra, mint szuvasodást gátló szerek. Fluoridionok vannak számos, ilyen célt szolgáló szájjápoló készítményben, főképpen a fogkrémekben. Ilyen fogkrémeket ismertetnek az U.S.P. 3,538,230, 3,689,637, 3,711,604, 3,911,104, 3,935,306 és 4,040,858 számú szabadalmi iratok.

A fluoridionok felvitele a fogzománcra arra szolgál, hogy megvédje a fogakat a romlás ellen. A fluoridionokat eredményező anyagok széles változata alkalmazható oldható fluorid forrásokként az azonnali hatású készítményekben. Megfelelő, fluoridionokat eredményező anyagok például ismertetve vannak az U.S.P. 3,535,421 és 3,678,154 számú szabadalmi iratokban. A találmány szerint használható előnyös fluoridion források a nátrium-fluorid, kálium-fluorid és ammónium-fluorid. A nátrium-fluorid kiváltképpen

előnyös. Az azonnal ható készítmények előnyösen körülbelül 50 ppm - 10.000 ppm, előnyösebben körülbelül 100-3.000 ppm fluorid-iont biztosítanak a készítményekben, amelyek érintkezésbe jutnak a fog felületeivel, ha ezeket a találmány szerinti adagoló rendszerrel használjuk.

#### **4. Mikrobaellenes szerek**

Mikrobaellenes szerek szintén jelen lehetnek a találmány szerinti szájjápoló készítményekben vagy anyagokban. Ezek a szerek — nem korlátozó jelleggel — az 5-klór-2-(2,4-diklórfenoxi)-fenol, amit általában triklozánnak neveznek, és amit a The Merck Index, 11<sup>th</sup> ed. (1989), pp. 1529 (entry no. 9573); az U.S.P. 3,506,720 számú szabadalmi irat és a 0,251,591 számú európai szabadalmi bejelentés ismerttetett; a ftálsav és sói, beleértve az U.S.P. 4,994,262 számú szabadalmi iratban leírtakat, de ezekre nem korlátozva, előnyös a magnézium-monokálium-ftalát, klórhexidin (Merck Index, No. 2090), alexidine (Merck Index, No. 222); hexetidine (Merck Index, No. 4624); sanguinarine (Merck Index, No. 8320); benzalkónium-klorid (Merck Index, No. 1066); szalicil-anilid (Merck Index, No. 8299); domifen-bromid (Merck Index, No. 3411); cetilpiridínium-klorid (CPC) (Merck Index, No. 2024); tetradecil-piridínium-klorid (TCP); N-tetradenil-4-etil-piridínium-klorid (TDEPC); oktenidin; delmopinol, oktapinol és más piperidin-származékok; nicin-készítmények; cink/ón iontartalmú szerek; antibiotikumok, így az augmentin, amoxicillin, tetraciklin, doxiciklin, minociklin és metronidazol; és a fentiek analógjai és sói; illóolajok, így a timok, geraniol, karvakrol, citrál, hinokitiol, eukaliptol (cineol), pirokatechin

(főleg a 4-allil-pirokatechin), és ezek keverékei; metil-szalicilát, hidrogén-peroxid; a kloritok fémsói és az összes fenti anyag keverékei.

### **5. Gyulladásgátló-szerek**

Gyulladásgátló szerek szintén jelen lehetnek a találmány szerinti szájápoló készítményekben vagy anyagokban. Ezek a szerek tartalmazhatnak — de ezekre nem korlátozva — nem-szteroidos gyulladásgátló szereket (NSAIDs), ilyenek a ketorolac, fluorbiprofen, ibuprofen, naproxen, indometacin, aszpirin, ketoprofen, piroxicam és meklofenaminsav. A nem-szteroidos gyulladásgátló szerek, így a ketorolac használatát az U.S.P. 5,626,838 számú szabadalmi irat ismerteti. Le vannak írva itt módszerek a szájüreg vagy szájgarat primer vagy kiújuló pikkelyen sejt-karcinómájának a megelőzésére és kezelésére, a szájüregbe vagy a szájgaratba egy NSAID hatásos mennyiségét helyileg alkalmazva.

### **6. Tápanyagok**

A tápanyagok javíthatják a szájüreg állapotát, és beépíthetők a találmány szerinti szájápoló készítményekbe vagy anyagokba. A tápanyagok magukba foglalják az ásványi anyagokat, vitaminokat, orális táplálékkiegészítőket, enterális táplálékkiegészítőket és ezek keverékeit.

Ásványi anyagok, amelyek beépíthetők a találmány szerinti készítményekbe, a kalcium, foszfor, fluorid, cink, mangán, kálium és ezek keverékei. Ezeket az ásványi anyagokat a szakirodalom ismertette: Drug Facts and Comparisons (loose leaf drug information service), Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo., © pp. 10-17 (1997).

A vitaminok bekeverhetők az ásványi anyagokkal vagy külön alkalmazhatók. A vitaminok a C vitamin és D vitamin, tiamin, riboflavin, kalcium-pantotenát, niacin, folsav, nikotinamid, piridoxin, cianokobalamin, p-amino-benzoészav, bioflavonoidok, és ezek keverékei. Ezeket a vitaminokat is ismertette a szakirodalom: Drugs Facts and Comparisons (loose leaf drug information service), Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo. © pp. 3-10. (1997).

Az orális táplálékkiegészítők az aminosavak, lipotrop anyagok, halolaj és ezek keverékei, amint az a szakirodalomban ismertette van: Drug Facts and Comparisons (loose leaf drug information service), Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo. © pp. 54-54e (1997). Az aminosavak például — de ezekre nem korlátozva — az L-triptofán, L-lizin, metionin, treonin, levokarnitin vagy L-karnitin és ezek keverékei. A lipotrop anyagok — nem korlátozó jelleggel — a kolin, inozit, betain, linolsav, linolénsav és ezek keverékei. A halolaj nagymennyiségű omega-3 (N-3)-polítelítetlen zsírsavakat, eikozapentaénsavat és dokozahexaénsavat tartalmaz.

Enterális táplálékkiegészítők — de ezekre nem korlátozva — a proteintermékek, glükóz-polimerek, kukoricacsíraolaj, pórsáfrányolaj, közepes láncú trigliceridek, amint ezeket a szakirodalom ismertette: Drugs Facts and Comparisons (loose leaf drug information service), Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo. © pp. 55-57. (1997).

### **7. Száj- és torok-termékek**

Egyéb anyagok, amelyek a találmány szerinti készítményekkel



használhatók, az általánosan ismert száj- és torok-termékek. Ezek a termékek a szakirodalomban ismertetve vannak: Drugs Facts and Comparisons (loose leaf drug information service), Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo. © pp. 520b-527. (1997). Ezek a termékek például — de ezekre nem korlátozva — a gombaellenes szerek, antibiotikumok és analgetikumok.

### **8. Antioxidánsok**

Az antioxidánsokról általában ismert, hogy hasznosak olyan készítményekben mint a találmány szerinti. Az antioxidánsok ismertetve vannak a szakirodalomban például: Cadenas and Packer, The Handbook of Antioxidants, © 1996 by Marcel Dekker, Inc. Antioxidánsok, amelyek a találmány szerinti szájápoló készítményekben vagy anyagokba beépíthetők — nem korlátozva ezekre — az E vitamin, aszkorbinsav, húgysav, karotinoidok, A vitamin, flavonoidok és polifenolok, növényi antioxidánsok, melatonin, amino-indolok, zsírsavak és ezek keverékei.

### **9. H-2 antagonisták**

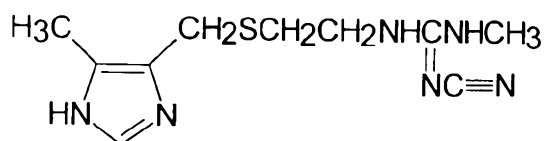
Hisztamin-2 (H-2 vagy H<sub>2</sub>) receptor antagonistá vegyületek (H-2 antagonisták) is használhatók a találmány szerinti szájápoló készítményekben. Ahogy itt alkalmazzuk, a szelektív H-2 antagonisták olyan vegyületek, amelyek blokkolják a H-2 receptorokat, de nincs jelentős hatásuk a hisztamin-1 (H-1 vagy H<sub>1</sub>) receptorok blokkolására. A szelektív H-2 antagonisták stimulálják különböző szervek, így a bél és a hörgők simaizmainak kontrakcióját; ez a hatás elnyomható mepiramin — egy tipikus antihisztamin szer — kis koncentrációival. A farmakológiai receptorok, amelyek ezekkel a mepiramin-érzékeny válaszokkal kapcsolatosak, úgy definiálhatók, mint H-1 receptorok [Ash, A.S.F.

& H.O. Schild, Brit. J. Pharmacol. Chemother. 27, 427 (1966)] . A hisztamin stimulálja továbbá a savkiválasztást a gyomor által [Loew, E.R. & O. Chichering, Proc. Soc. Exp. Biol. Med. 48, 65 (1941)]; fokozza a szívműködést [Trendelenburg, U., J. Pharmacol. 130, 450 (1960)]; és gátolja az összehúzódást patkányok méhében [Dews, P.B. & J.D.P. Graham, Brit. J. Pharmacol. Chemother., 1, 278 (1946)]; ezek a hatások nem antagonizálhatók mepiraminnal és hasonló szerekkel. A H-2 antagonisták, amelyek a szájápoló készítményekben vagy anyagokban használhatók, azok, amelyek blokkolják azokat a receptorokat, amelyek kapcsolatosak a mepiraminra nem-érzékeny, nem-H-1 (H-2) hisztamin válaszokkal, és nem blokkolják a mepiraminra érzékeny hisztamin válaszokkal kapcsolatos receptorokat.

Szelektív H-2 antagonisták azok a vegyületek, amelyek H-2 antagonistáknak bizonyultak teljesítményük alapján, a H-2 antagonistista funkcióra végzett klasszikus preklinikai szűrővizsgálatokban. A szelektív H-2 antagonisták olyan vegyületek, amelyekről bizonyítható, hogy mint a hisztamin által közvetített hatások kompetitív vagy nem-kompetitív inhibitorai működnek a H-2 receptor funkciótól specifikusan függő szűrőmodellekben, de nem mutatnak szignifikáns hisztamin antagonistista aktivitást a H-1 receptor funkciótól függő szűrőmodellekben. Specifikusan, ezek olyan vegyületek, amelyeket mint H-2 antagonistákat osztályozunk, ahogy Black, J.W., W.A.M. Duncan, C.J. Durant, C.R. Ganellin & E.M. Parsons, „Definition and Antagonism of Histamine H2-Receptors”, Nature, 236, 385-390 (1972) (Black) ismertette, kiértékelve, ahogyan Black leírta, tengerimalac spontán verő jobb szívpitvarával in vitro kísérletben és patkány

gyomorsav kiválasztásának in vivo kísérletben való vizsgálatával, de nem mutatnak szignifikáns H-1 antagonistá aktivitást a H-2 antagonistá aktivitáshoz viszonyítva, ha ezt kiértékeljük ahogy Black leírta, tengerimalac csípőbelének (ileum) kontrakciójával in vitro vizsgálatban, vagy patkány gyomorizmának kontrakciójával in vivo vizsgálatban. A szelektív H-2 antagonisták előnyösen nem mutatnak szignifikáns H-1 aktivitást elfogadható dózisokban a fenti H-1 vizsgálatokban. Tipikus elfogadható dózisszint az a legkisebb dózisszint, amellyel a hisztamin 90 %-os gátlása, előnyösen a hisztamin 99 %-os gátlása érhető el a fenti H-2 vizsgálatokban.

Szelektív H-2 antagonistákat, amelyek a fenti kritériumoknak megfelelnek, az U.S.P. 5,294,433 és 5,364,616 számú szabadalmi iratok ismertetik, ahol a szelektív H-2 antagonisták a cimetidin, etintidin, ranitidin, ICIA-5165, tiotidin, ORF-17578, lupitidin, donetidin, famotidin, roxatidin, pifatidin, lamtidin, BL-6548, BMY-25271, zaltidin, nizatidin, mifentidin, BMY-52368 (SKF-94482), BL-6341A, ICI-162846, ramixotidin, Wy-45727, SR-58042, BMY-25405, loxtidin, DA-4634, biszfentidin, szufotidin, ebrotidin, HE-30-256, D-16637, FRG-8813, FRG-8701, impromidin, L-643728 és HB-408.4. Kiváltképpen előnyös a cimetidin (SKF-92334), amely az N-ciano-N'-metil-N''-[2-[(5-metil-1H-imidazol-4-il)-metil]-tio]-etil]-guanidin, és képlete a következő:



A cimetidint a Merck Index 11. kiadása (1989) is ismerteti a 354. oldalon (entry no. 2279), és a Physicians Desk Reference, 73.971/BE

46. kiadás, 2228. oldal (1992). Hasonló előnyös H-2 antagonisták a burimamid és a metiamid.

### **10. Analgetikumok**

Fájdalomcsillapító és érzéstelenítő anyagok ugyancsak jelen lehetnek a találmány szerinti készítményekben vagy anyagokban. Ezek az anyagok például — de ezekre nem korlátozva — a stroncium-klorid, kálium-nitrát, és természetes növényi anyagok, így a cserzőgubacs, asarum, cubebin, galanga, scutellaria, liangmianzhen, baizhi, stb.

### **11. Vírusellenes hatóanyagok**

A találmány szerinti készítményekben használható vírusellenes hatóanyagok magukba foglalnak minden olyan ismert hatóanyagot, amit szokás szerint használnak vírusfertőzések kezelésére. Ezeket a vírusellenes hatóanyagokat a szakirodalom ismerteti [Drugs Facts and Comparisons (loose leaf drug information service), Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo. © 1997, pp. 402(a)-408(z). Specifikus példák azok a vírusellenes hatóanyagok, amelyeket az U.S.P. 5,747,070 számú szabadalmi irat ismertetett. Ez a szabadalmi irat ón(II)-sók használatát ismerteti vírusok ellen. Az ón(II)-sókat és más vírusellenes hatóanyagokat ismerteti részletesen a Kirk & Othmer, Encyclopedia of Chemical Technology, Third Edition, Vol. 23, Wiley, interscience Publishers (1982) pp. 42-71. Az ón(II)-sók, amelyek a találmány szerint alkalmazhatók, a szerves ón(II)-karboxilátok és a szervetlen ón(II)-halogenidek. Az ón(II)-fluorid használható ugyan, de tipikusan csak kombinálva használják egy másik ón(II)-halogeniddel, vagy egy vagy több ón(II)-karboxiláttal vagy más gyógyhatású anyaggal.

## **12. Egyéb komponensek**

A találmány szerinti készítmények fenti anyagain kívül kívánatos lehet számos más komponenst hozzáadni a szájapoló anyaghoz. Ilyen járulékos anyagok — nem korlátozó jelleggel — az ízanyagok, édesítőszeres, xilit, opálosító anyagok, színezékek, felületaktív anyagok és kelátképzők, így az etilén-diamin-tetraecetsav. Megfelelő ízanyagok — nem korlátozó jelleggel — a borsmenta olaj, szasszafrász olaj, szegfűszegrügy-olaj, menta, mentol, anetol, timol, metil-szalicilát, eukaliptusz, kasszia, l-metil-acetát, zsálya, eugenol, petrezselyemolaj, oxanon, gaulteria olaj, alfa-irizon, fodormenta olaj, majoranna, citrom, narancs, banán, propenil-guetol, fahéj és ezek keverékei.

Pigmentek szintén adhatók a találmány szerinti készítményekhez, hogy pontosabban jelezzük a helyeket, ahol a készítményeket valójában alkalmaztuk, ez lehetővé teszi a felhasználónak, hogy a készítményt alaposabban vagy egyenletesebben vigye fel. Ezek a pigmentek azonban nem arra vannak szánva, hogy elfedjék (maszkírozzák) a fogak felületein esetleg jelen lévő foltokat. Ezek a járulékos komponensek a fent tárgyalt vegyületek helyett is használhatók.

### **Tapadásgátló alátét**

Az adott esetben jelenlévő tapadásgátló alátét elkészíthető bármilyen anyagból, amely kisebb affinitást mutat a szájapoló anyag iránt, mint a szájapoló anyag mutat önmaga és a hátszalag iránt. A tapadásgátló alátét előnyösen egy merev lapanyag, így polietilén, papír, poliészter vagy más anyag, amit aztán bevonunk egy nem-ragadó típusú anyaggal. A tapadásgátló alátét anya-

gát bevonhatjuk viasszal, szilikonnal, teflonnal, fluorozott polimerekkel vagy más nem-ragadó típusú anyagokkal. Egy előnyös tapadásgátló alátét a Scotchpak®, amit a 3M cég gyárt. A tapadásgátló alátét lényegileg azonos méretre és alakra lehet vágva mint a hátszalag, vagy a tapadásgátló alátét nagyobbra lehet vágva mint a hátszalag, hogy könnyen hozzáférhető módot biztosítson az anyag lefejtéséhez a hátszalagról. A tapadásgátló kialakítható egy rideg (merev) anyagból, amely elhasad ha a hátszalagot meghajlítjuk, vagy több anyagdarabból, vagy egy beemcsézett (vagy pontozott) anyagdarabból. Alternatív, a tapadásgátló alátét állhat két átlapoló darabból, mint egy tipikus ragasztószalagos kötésforma. Tapadásgátló szerekként alkalmas anyagok további leírása található a szakirodalomban: Kirk-Othmer Encyclopedia of Chemical Technology, Fourth Edition, Vol. 21, pp. 207-218.

### **Példák**

Az alábbi példák tovább ismertetik és bemutatják a találmány szerinti kivitelezéseket. A példák kizárólag szemléltetésre szolgálnak, és nem a jelen találmány korlátozására, számos változat lehetséges a találmány szellemétől és tárgyától való eltérés nélkül.

Az előnyös hátszalag egy példája egy 0,013 mm vastag polietilén fóliadarab. A hátszalag ellátható lapos tasakok elrendezésével, amelyek tipikusan 0,4 mm keresztmetszetűek és 0,1 mm mélyek. A hátszalag hajlítómerevsége körülbelül 0,6 g/cm, úgynevezett Handle-O-Meter modell 211-300 segítségével mérve, amely a Thwing-Albert Instrument Co. of Philadelphia, PA gyártmánya; a

vizsgálati módszer az ASTM D2923-95.

Az előnyös hátszalag egy másik példája egy 0,3 mm vastag lényegileg vízzoldható anyagdarab, így rizspapír. Egy másik példája az előnyös hátszalagnak egy 0,3 mm vastag pullulan papír.

Az alábbiakban leírt bármely szájápoló készítmény használható bármely itt ismertetett hátszalaggal.

### 1. táblázat

Hidrofób szájápoló készítmény

| Komponens                           | 1. példa | 2. példa | 3. példa | 4. példa | 5. példa | 6. példa |
|-------------------------------------|----------|----------|----------|----------|----------|----------|
| Organosziloxán gyanta <sup>1)</sup> | 25       | 25       | 24,6     | 25       | 25       | 25       |
| Szilikongumi <sup>2)</sup>          | 12,5     | 4,2      | 3,5      | 2,5      | 1,8      | -        |
| Szájápoló anyag <sup>3)</sup>       | 17       | 17       | 17       | 17       | 17       | 17       |
| Hordozóanyag <sup>4)</sup>          | 44,5     | 52,8     | 53,9     | 54,5     | 55,2     | 57,0     |
| Bentone agyag                       | 1        | 1        | 1        | 1        | 1        | 1        |
| Összesen:                           | 100      | 100      | 100      | 100      | 100      | 100      |

1) Például MQ gyanta, kapható mint 1170-002 a General Electric-től.

2) Például dimetikon gumi, kapható mint SE 30 vagy SE 63 a General Electric-től.

3) Például nátrium-perkarbonát mint száraz por.

4) Például izododekán vagy etil-acetát és butanon 50/50 keveréke, vagy etil-acetát, propil-acetát és HFE keveréke. Az oldószerkeverék rendszerben minden egyedi oldószer-komponens százalékos aránya 0, illetve 100 % között változhat.

5) Bentone 27, kapható a Rheox cégnél.

## 2. táblázat

Hidrofób szájapoló készítmény

| Komponens                                     | 1. példa | 2. példa | 3. példa | 4. példa |
|-----------------------------------------------|----------|----------|----------|----------|
| Organosziloxán gyanta <sup>1)</sup>           | 33,43    | 33,43    | 35,14    | 33,43    |
| Szilikongumi <sup>2)</sup>                    | 5,57     | 5,57     | 5,86     | 5,57     |
| Szájapoló anyag <sup>3)</sup>                 | 19,00    | 12,00    | 19,00    | 19,00    |
| Etil-acetát                                   | 8,00     | 8,50     | 8,00     | 8,00     |
| Bentonegél <sup>4)</sup>                      | 10,00    | 10,00    | 10,00    | 10,00    |
| DC-200/350 cSt <sup>5)</sup>                  | 1,00     | 1,00     | 2,00     | 1,00     |
| HFE 7100 <sup>6)</sup>                        | 21,00    | 26,00    | -        | 19,50    |
| N-propil-acetát                               | 2,00     | 2,00     | -        | 2,00     |
| 2-butanon                                     | -        | -        | 19,00    | -        |
| Aerosil 200 <sup>7)</sup> (SiO <sub>2</sub> ) | -        | -        | 1,0      | -        |
| Ízanyag                                       | -        | 1,50     | -        | 1,50     |
| Összesen                                      | 100      | 100      | 100      | 100      |

1) Például MQ gyanta, kapható mint 1170-002 a General Electric-től

2) Például dimetikon gumi, kapható mint SE 30 General Electric-től.

3) Például nátrium-perkarbonát mint száraz por.

4) Bentone gel IPM, kapható a Rheox cégtől.

5) DC-200/350: dimetil-polisziloxán CAS # 9016-00-6, a Dow Corning cégtől.

6) HFE 7100 a metil-nonafluor-izobutil-éter, CAS # 163702-08-7 és metil-nonafluor-butyl-éter, CAS # 163702-07-6 keveréke, gyártja a 3M Co.

7) Aerosil 200, szilícium-dioxid (kémiaiilag előállítva), CAS # 112945-52-5, a Degussa AG-től.

### **Szájapoló készítmények előállítási eljárása**

Az 1. és 2. táblázat szerinti készítmények nem-vizesek. A szájapoló anyagokat diszpergáljuk vagy feloldjuk az organosziloxán gyantát, a folyékony diorganopolisziloxán polimert, a hordozót és a reológiai módosítót tartalmazó oldatban.

Az 1. és 2. táblázat szerinti hidrofób készítményeket célszerűen a következőképpen állítjuk elő.

300 g organosziloxán gyanta-oldatot (például 43,7 % MQ gyanta izododekánban, vagy etil-acetát és butanon 50/50 keverékében, vagy etil-acetát, propil-acetát és HFE keverékében) összekeverünk 147,30 g folyékony diorganopolisziloxán polimer-oldattal (például 50 % SE30 szilikongumi izododekánban, vagy etil-acetát és butanon 50/50 keverékében vagy etil-acetát, propil-acetát és HFE keverékében. Ezután szájapoló anyagokat diszpergáljuk a gyanta/gumi keverékben. Ez az eljárás elvégezhető szilikongumi jelenléte nélkül is.

Valamennyi szájapoló anyag, amit ismertetünk, a fenti módon állítható elő.

3. táblázat

## Fehérítő készítmények

| Komponens                           | 1. példa | 2. példa | 3. példa |
|-------------------------------------|----------|----------|----------|
| Organosziloxán gyanta <sup>1)</sup> | 48,00    | 48,00    | 36,00    |
| Szilikongumi <sup>2)</sup>          | 8,00     | 6,86     | 9,00     |
| Szájápoló anyag <sup>3)</sup>       | 19,00    | 12,00    | 19,00    |
| Reológiai módosító <sup>4)</sup>    | 13,00    | 15,00    | 10,00    |
| DC-200/350cSt <sup>5)</sup>         | 5,00     | 10,00    | 25,00    |
| Felületaktív anyag <sup>6)</sup>    | 6,00     | 8,14     | -        |
| Ízanyag                             | 1,00     | -        | 1,00     |

- 1) Például MQ gyanta, kapható mint 1170-002 a General Electric-től.
- 2) Például dimetikon gumi, kapható mint SE30, a General Electric-től.
- 3) Például nátrium-perkarbonát, mint száraz por.
- 4) Bentone gél IPM, kapható a Rheox cégtől.
- 5) DC-200/350: dimetil-polisziloxán, CAS# 9016-00-6, a Dow Corning cégtől.
- 6) Lehet anionos, kationos, vagy semleges.

**Előállítási eljárás**

A 3. táblázat szerinti vegyületeket a fentiek szerint állíthatjuk elő, azzal az eltéréssel, hogy hordozót nem adunk hozzá, és a felületaktív anyagot és az ízanyagot az után adjuk hozzá, miután a gyantát és a szilikon-gumit kevertük, amíg teljesen feloldódtak.

Valamennyi itt ismertetett szájápoló anyag a fent leírtak szerint állítható elő.

## 4. táblázat

Fehéritő készítmények

| Komponens             | 1. példa | 2. példa | 3. példa | 4. példa | 5. példa | 6. példa |
|-----------------------|----------|----------|----------|----------|----------|----------|
| Etil-acetát           | 18,00    | 14,85    | 22,25    | 20,88    | 18,96    | 18,00    |
| 2-Butanon             | 18,00    | 13,00    | 13,10    | 20,88    | 10,00    | 18,00    |
| Izododekán            | --       | 10,00    | --       | --       | 11,54    | --       |
| Limonén               | --       | 4,35     | --       | --       | 5,00     | --       |
| MQ gyanta             | 28,00    | 32,50    | 26,50    | 27,33    | 36,00    | 31,50    |
| SE 30 szilikongumi    | 7,00     | --       | 8,80     | 13,67    | --       | --       |
| Silicona Visc-100M    | --       | --       | --       | --       | --       | 3,50     |
| Silicona Fluid 10 cSt | --       | 6,50     | --       | --       | 9,00     | --       |
| Bentone Gel ISD       | 10,00    | --       | 6,40     | 9,95     | --       | 10,00    |
| Clayton HY            | --       | 2,45     | --       | --       | 3,00     | --       |
| Cab-o-Sil             | --       | --       | 1,50     | --       | --       | --       |
| Nátrium-perkarbonát   | 19,00    | --       | 19,00    | 7,00     | --       | 19,00    |
| Karbamid-peroxid      | --       | 15,0     | --       | --       | 5,00     | --       |
| Bizmut-oxiklorid      | --       | 1,15     | --       | --       | --       | --       |
| Titán-dioxid          | --       | --       | 1,00     | --       | 1,50     | --       |
| Aromaolaj             | --       | --       | 0,15     | --       | --       | --       |
| Nátrium-fluorid       | --       | --       | 1,00     | --       | --       | --       |
| Nátrium-szacharin     | --       | 0,20     | 0,30     | 0,30     | --       | --       |
| Összesen              | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   |

## 5. táblázat

Szájápoló készítmények

| Komponens             | 1. példa | 2. példa | 3. példa | 4. példa | 5. példa |
|-----------------------|----------|----------|----------|----------|----------|
| Etil-acetát           | 24,50    | 27,75    | 22,00    | 19,96    | 21,10    |
| 2-Butanon             | 24,50    | 16,30    | 22,00    | 10,00    | 21,10    |
| Izododekán            | --       | --       | --       | 11,54    | --       |
| Limonén               | --       | --       | --       | 5,00     | --       |
| MQ gyanta             | 30,40    | 33,00    | 28,80    | 36,00    | 32,84    |
| SE 30 szilikongumi    | 7,60     | 11,00    | 14,40    | --       | 8,21     |
| Silicone fluid 10 cSt | --       | --       | --       | 9,00     | --       |
| Bentone Gel ISD       | 10,00    | 8,00     | 10,50    | --       | 11,75    |
| Claytone HY           | --       | --       | --       | 3,00     | --       |
| Cab-o-Sil             | --       | 1,50     | --       | --       | --       |
| Bizmut-oxiklorid      | --       | 1,00     | --       | --       | --       |
| Titán-dioxid          | --       | --       | --       | 2,00     | --       |
| Aromaolaj             | --       | 0,15     | --       | --       | --       |
| Kálium-nitrát         | --       | --       | --       | --       | 5,00     |
| Nátrium-klorit        | 3,00     | --       | --       | --       | --       |
| Tripolifoszfát        | --       | --       | --       | 2,50     | --       |
| Nátrium-fluorid       | --       | 1,00     | --       | 1,00     | --       |
| Klórhexidin-glükonát  | --       | --       | 2,00     | --       | --       |
| Nátrium-szacharin     | --       | 0,30     | 0,30     | --       | --       |
| Összesen              | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   |

## 6. táblázat

## Szájápoló készítmények

| Komponens                  | 1. példa | 2. példa | 3. példa | 4. példa | 5. példa | 6. példa |
|----------------------------|----------|----------|----------|----------|----------|----------|
| Etil-acetát                | 26,00    | 22,00    | 35,00    | 28,00    | 25,77    | 23,00    |
| 2-Butanon                  | 25,95    | 17,00    | 9,00     | 14,50    | 25,50    | 23,45    |
| Izododekán                 | --       | 10,00    | --       | --       | 5,00     | --       |
| Limonén                    | --       | 4,00     | --       | --       | --       | --       |
| MQ gyanta                  | 28,00    | 32,50    | 33,00    | 35,00    | 27,00    | 28,00    |
| SE 30 szilikongumi         | 7,00     | --       | 11,00    | 5,00     | 3,00     | 7,00     |
| Silicone fluid 10 cSt      | --       | 6,50     | --       | --       | --       | --       |
| Bentone Gel ISD            | 10,00    | --       | 8,00     | 10,00    | 10,00    | --       |
| Clayton HY                 | --       | 2,00     | --       | --       | --       | 7,00     |
| Cab-o-Sil M7D              | --       | --       | 1,50     | --       | --       | --       |
| Bizmut-oxiklorid           | --       | 5,00     | --       | --       | --       | 10,00    |
| Titán-dioxid               | 3,00     | --       | 1,00     | 5,00     | 2,00     | --       |
| Aromaolaj                  | --       | --       | 0,10     | --       | 0,15     | 0,15     |
| Polimetilszil-szeszquioxán | --       | --       | 1,00     | --       | --       | --       |
| Polimetilmetakrilát        | 3,00     | 1,00     | --       | --       | 0,50     | --       |
| Nylon 12                   | --       | --       | --       | 2,00     | --       | 1,00     |
| Szilícium-dioxid           | --       | --       | --       | --       | 0,50     | --       |
| FD&C Yellow # 5 Al Lake    | 0,05     | --       | 0,10     | --       | 0,05     | 0,10     |
| Vasoxid, vörös             | --       | --       | --       | 0,50     | 0,03     | --       |
| Nátrium-szacharin          | --       | --       | 0,30     | --       | 0,50     | 0,30     |
| Összesen                   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   |

## 7. táblázat

Etanol-alapú készítmények

| Komponens                   | 1. példa | 2. példa | 3. példa | 4. példa | 5. példa | 6. példa |
|-----------------------------|----------|----------|----------|----------|----------|----------|
| Etanol                      | 20,90    | 35,80    | 41,70    | 25,89    | 23,10    | 23,55    |
| Etil-acetát                 | --       | --       | --       | --       | 4,95     | --       |
| Etil-butirát                | 10,30    | --       | --       | 12,74    | 11,75    | 10,9     |
| Izoamil-acetát              | --       | --       | --       | --       | --       | 2,65     |
| Izododekán                  | --       | 13,00    | --       | --       | --       | --       |
| MQ gyanta                   | 35,10    | 32,85    | 42,75    | 47,00    | 42,00    | 41,80    |
| Silicone Visc-100 M         | --       | --       | --       | --       | 7,15     | --       |
| Silicone Fluid<br>100 cSt   | 7,80     | --       | --       | 9,65     | --       | 8,55     |
| Silicone Fluid<br>10 cSt    | 3,90     | --       | 11,40    | --       | 4,00     | --       |
| Silwet L-7500               | --       | --       | --       | --       | --       | 6,58     |
| Bentone 27                  | 1,50     | --       | 2,00     | 1,85     | 1,35     | 1,97     |
| Claytone APA                | --       | 2,00     | --       | --       | --       | --       |
| Cab-o-Sil                   | --       | --       | --       | --       | 0,45     | --       |
| Nátrium-perkar-<br>bonát    | 19,00    | --       | --       | --       | --       | --       |
| Karbamid-peroxid            | --       | 15,00    | --       | --       | --       | --       |
| Kálium-nitrát               | --       | --       | --       | --       | 5,00     | --       |
| Tripolifoszfát              | --       | --       | --       | --       | --       | 2,50     |
| Klórhexidin-di-<br>glükonát | --       | --       | --       | 2,57     | --       | --       |
| Titán-dioxid                | 1,50     | --       | 2,00     | --       | --       | 1,50     |
| Aromaolaj                   | --       | --       | 0,05     | --       | --       | --       |
| Nátrium-fluorid             | --       | --       | 0,10     | --       | 0,25     | --       |
| Nátrium-szacharin           | --       | 0,20     | --       | 0,30     | --       | --       |
| Összesen                    | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   | 100,00   |

### **A készítmények előállítási eljárása**

A 4-7. táblázatok szerinti készítményeket célszerűen a következőképpen állítjuk elő. Az oldószereket egy tartályba adagoljuk, amely alkalmas arra, hogy az oldószer vesztesége minimális legyen, hozzáadjuk a reológiai módosítókat, és keverjük, amíg jól diszpergálódtak. Ezután az elegyhez adjuk a szilikongyantát és keverjük, amíg tökéletesen feloldódik, majd hozzáadjuk a szilikongumit és/vagy szilikon-folyadékokat, és keverjük, amíg tökéletesen feloldódnak. Ekkor az elegyhez adunk egy sót, így nátrium-perkarbonátot és/vagy más szájápoló hatóanyagokat, esztétikai komponenseket, így opálosító szereket, édesítőket, színezékeket és ízanyagokat. Az elegyet keverjük, míg homogén lesz. További nagy nyíróerőt használhatunk a keveredés elősegítésére. A terméket légmentesen záró tartályokba csomagoljuk.

Alternatív, elkészíthetjük a szilikongyanta és/vagy szilikongumi előkeverékeit, mielőtt ezeket a végső keverési műveletben bekevernénk, hogy a szilikon oldódását és a gyártást megkönnyítsük. A készítmény összetételétől függően változhat a komponensek bevitelének sorrendje, valamint a reológiai módosító(k) hozzáadása is történhet egy későbbi műveletben, ami lehetővé teszi, hogy a viszkozitást alacsonyabb értéken tartsuk a keverési művelet későbbi szakaszáig.

### **A hátszalag és a szájápoló készítmény előállítási eljárása**

Miután elkészítettük a készítményt valamely fent leírt módszer szerint, a készítményt egy darab hátszalag-anyagra (például rizspapírra) kiöntjük. Ezután az együttest körülbelül 10-60 percig szárítjuk, hogy a hordozó adott esetben jelenlévő illó kom-

ponensét eltávolítsuk. Ekkor a hátszalag anyagán tapadó film képződik. A tapadó film vastagsága szabályozható annak a készítménynek a mennyiségével, amit akkor használunk, amikor a készítményt a hátszalagra kiöntjük. Ezután a hátszalagot a kívánt alakra és méretre vágjuk.

#### **Alkalmazási módszerek**

A találmány gyakorlatában a hátszalagot a viselő illeszti fel a kívánt szájfelületre. A szalagnak a szájfelület felé néző oldala be van vonva egy szájapoló készítménnyel, ami előnyösen igen viszkózus állapotban van.

A hátszalag könnyen illeszkedik a szájfelülethez a felvitel alatt, azt könnyedén a felület ellenébe nyomva. A hátszalag a szájüregben hagyható, ha lényegileg vízoldható, vagy lefejthető, ha vízben lényegileg oldhatatlan. Miután a szalag in-situ feloldódott, vagy miután a felhasználó azt lefejtette, a szájapoló készítmény mint vékony film a szájfelületeken marad.

A találmány gyakorlatában a felhasználónak csak fel kell vinnie a hátszalagot, ami be lett vonva a találmány szerinti készítménnyel, ez tartalmazza a szájapoló anyagot vagy anyagokat, ami szükséges a kívánt hatás eléréséhez, ez lehet például fehérités, lehelet frissítés, szuvasodás megelőzése, fájdalomcsökkentés, ínykezelés, fogkő elleni kezelés, stb., a fogfelületekhez a kívánt területeken. A készítmények felvihetők a szájüreg más felületeire is, így az íny vagy nyálkahártya szöveteire, vagy a szájüreg bármely más felületére.

Lehetséges a szájapoló anyag elnyújtott kiadagolása, ha a szájapoló anyag hosszabb időn át szabadul fel. Ezután, a visszama-

radó szájápoló anyag könnyen eltávolítható dörzsöléssel, keféléssel vagy a szájfelület öblítésével, miután a kívánt időtartam le-telt, vagy a fogak kefélésének normális folyamán vagy más szájápo-ló műveletekkel. Elméleti megkötöttség nélkül úgy gondoljuk, hogy a filmet körülbelül 2 - körülbelül 8 órán át hagyjuk fent, tekin-tet nélkül a szájápoló anyag reaktivitására. A készítmények elő-nyösen csaknem észrevehetetlenek, ha a szájüregbe felhordjuk.

A szájüreget nem szükséges előkészíteni, mielőtt a találmány szerinti rendszert használjuk. Így például a felhasználó megvá-laszthatja, hogy megkeféli a fogait vagy kiöblíti a száját, mie-lőtt a rendszert használja. A szájüreg felületeit nem kell tel-jesen megszáritani vagy nem kell túlságosan benedvesíteni nyál-lal vagy vízzel, mielőtt a rendszert használják. Azt gondoljuk azonban, hogy jobb lesz a tapadás a fogzománc felületeihez, ha fogak szárazak, amikor a rendszert felhordják.

Meg kell jegyeznünk, hogy a jelen találmány nem csak szá-jápoló anyag kiadagolására vonatkozik emberek szájüregéhez, hanem olyan eljárásokra is, amikor a szájápoló anyagot egy állat, pél-dául egy házi kedvenc vagy más háziállat, vagy fogságban tartott állat szájüregéhez alkalmazzuk.

Meg kell jegyeznünk továbbá, hogy az itt leírt példák és ki-vitelezések csupán szemléltető jellegűek, és a szakember tudni fogja, hogy ezeken számos módosítás vagy változtatás végezhető, anélkül, hogy a találmány tárgyától eltérnénk.

### Szabadalmi igénypontok

1. Adagoló rendszer szájápoló anyag adagolására a száj-üregbe, amely tartalmaz:

- (a) egy eltávolítható hátszalagot, amely elég flexibilis ahhoz, hogy könnyen illeszkedjék a szájfelülethez, amikor az adagoló rendszert ennek ellenében elhelyezzük; és
- (b) egy szájápoló készítményt, felhordva a hátszalagra, oly módon, hogy ha az adagoló rendszert a szájfelületre helyezzük, a szájápoló készítmény érintkezik a szájfelülettel; a szájápoló készítmény tartalmaz:

- (i) egy organosziloxán gyantát;
- (ii) egy reológiai módosítót; és
- (iii) legalább egy szájápoló anyagot;

ahol a szájápoló készítmény a szájfelületen marad, miután a hátszalagot eltávolítottuk.

2. Az 1. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél az organosziloxán gyanta a készítményben körülbelül 5 % - körülbelül 70 % mennyiségben van jelen.

3. A 2. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelyben az organosziloxán gyanta  $(\text{CH}_3)_3\text{SiO}_{0,5}$  „M” egységeket,  $(\text{CH}_3)_2\text{SiO}$  „D” egységeket,  $(\text{CH}_3)\text{SiO}_{1,5}$  „T” egységeket,  $\text{SiO}_2$  „Q” egységeket tartalmaz, és ezek keverékeit.

4. Az 1. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a szájápoló anyag magába foglal legalább egy szájápoló hatóanyagot, így fogfehérítő hatóanyagot, fogkő elleni anyagot, fluoridion forrást, mikrobaellenes szert, gyulladásgátló szert, egy vagy több tápanyagot, száj- és torok-terméket, antioxidánst, egy  $\text{H}_2$  antagonistát, fájdalomcsillapító szert, vírus elleni szert,

ízanyagot, édesítő szert, xilitet, opálosítókat, színezékeket, felületaktív anyagokat, kelátképzőket, pigmenteket, vagy ezek keverékeit.

5. A 4. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a szájápoló anyag körülbelül 0,01 % - körülbelül 50 %-a a szájápoló készítménynek.

6. Az 5. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a szájápoló anyag egy fogfehérítő hatóanyag, így a peroxidok, fém-kloritok, perborátok, perkarbonátok, peroxisavak, perszulfátok vagy ezek keverékei csoportjából választva.

7. Az 1. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a reológiai módosító a szervesen módosított gyanták, szilícium-dioxidok, polietilén vagy ezek keverékei csoportjából van kiválasztva.

8. A 7. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a reológiai módosító a szájápoló készítményben körülbelül 0,1 % - körülbelül 30 % mennyiségben van jelen.

9. Adagoló rendszer, szájápoló anyag adagolására a szájüregbe, amely tartalmaz:

- (a) egy eltávolítható hátszalagot, amely elég flexibilis ahhoz, hogy könnyen illeszkedjék a szájfelülethez, amikor az adagoló rendszert ennek ellenében elhelyezzük; és
- (b) egy szájápoló készítményt, felhordva a hátszalagra, oly módon, hogy ha az adagoló rendszert a szájfelületre helyezzük, a szájápoló készítmény érintkezik a szájfelülettel; a szájápoló készítmény tartalmaz:
  - (i) egy organosziloxán gyantát;
  - (ii) egy folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimert;
  - (iii) egy reológiai módosítót; és

(iv) legalább egy szájápoló anyagot;

ahol a szájápoló készítmény a szájfelületen marad, miután a hátszalagot eltávolítottuk.

10. A 9. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a szájápoló készítmény tartalmaz még egy hordozót is, amely az organosziloxán gyantát és a folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimert képes szolubilizálni.

11. A 10. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimer  $(R_2SiO)_n$  általános képletű ismétlődő egységeket tartalmaz, a képletben R 1-6 szénatomot tartalmazó egyértékű szénhidrogéncsoport.

12. A 11. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a folyékony organopolisziloxán polimer poli(dimetil-sziloxán).

13. A 9. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél az organosziloxán gyanta és a folyékony diorganopolisziloxán-alapú polimer aránya körülbelül 10:1 - körülbelül 1:10.

14. A 10. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a hordozó a szénhidrogén olajok, illékony szilikonok, nem-szénhidrogén oldószerek vagy keverékeik csoportjából van választva.

15. A 9. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a szájápoló anyag legalább egy szájápoló hatóanyagot, így egy fogfehérítő anyagot, fogkő elleni szert, fluoridion forrást, mikróbaellenes anyagot, gyulladásgátló szert, egy vagy több tápanyagot, száj- és torok-terméket, egy antioxidánst, H2 antagonistát, fájdalomcsillapítót, vírus elleni szert, ízanyagokat, édesítőszereket, xilitet, opálosító anyagokat, színezékeket, felületaktív anyagokat, kelátképzőket, pigmenteket tartalmaz, vagy ezek keverékeit.

16. A 15. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a szájápoló hatóanyag a szájápoló hatóanyag a szájápoló készítménynek körülbelül 0,01 - körülbelül 50 %-a.

17. A 16. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a szájápoló hatóanyag egy fogfehérítő hatóanyag, a peroxidok, fém-kloritok, perborátok, perkarbonátok, peroxisavak, perszulfátok vagy keverékeik csoportjából választva.

18. A 9. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a reológiai módosító a szervesen módosított agyagok, szilícium-dioxidok, polietilén vagy keverékeik csoportjából van választva.

19. A 18. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a reológiai módosító a szájápoló készítményben körülbelül 0,1 % - körülbelül 30 % mennyiségben van jelen.

20. Az 1., 9. vagy 10. igénypontok bármelyike szerinti adagoló rendszer, amelynél a hátszalag lényegileg vízben oldhatatlan.

21. A 20. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a hátszalag egy polimer fólia, kisebb mint körülbelül 0,1 mm nominális vastagsággal, és a polietilén, etil-vinil-acetát, poliészterek, etil-vinil-alkohol, pullulan fólia és kombinációik csoportjából választva.

22. A 21. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a hátszalag lefejtési ereje kevesebb mint 50 g.

23. Az 1., 9. vagy 10. igénypontok bármelyike szerinti adagoló rendszer, amelynél a hátszalag lényegileg vízzoldható.

24. A 23. igénypont szerinti adagoló rendszer, amelynél a hátszalag rizspapír, pullulan papír, agarfólia, keményítő papír, természetes gumi vagy ezek keveréke.

25. Eljárás szájápoló anyag kiadagolására a szájüreg legalább egy felületére, azzal jellemezve, hogy a következő művele-

teket végezzük: (1) az adagoló rendszer hátszalagját, bevonva az 1., 9. vagy 10. igénypontok bármelyike szerinti szájápoló készítménnyel, felvisszük a szájúreg felületére (felületeire); (2) a hátszalagot eltávolítjuk a szájúreg felületéről (felületeiről), amikor is a hátszalag eltávolítása után a szájápoló készítmény a szájúreg felületén (felületein) marad.

26. A 25. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy fogfehérítő hatóanyagot tartalmazó szájápoló készítményt alkalmazunk, és a szájúreg felülete, amelyre a készítményt felvisszük, a fogak zománca.

27. Eljárás szájápoló anyag kiadagolására a szájúreg legalább egy felületére, azzal jellemezve, hogy a következő műveleteket végezzük: (1) az adagoló rendszer hátszalagját, bevonva az 1., 9. vagy 10. igénypontok bármelyike szerinti szájápoló készítménnyel, felvisszük a szájúreg egy felületére (felületeire); (2) a hátszalagot hagyjuk in situ feloldódni, amikor is a szájápoló készítmény a szájúreg felületén (felületein) marad, miután a hátszalag feloldódott.

28. A 27. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy fogfehérítő hatóanyagot tartalmazó szájápoló készítményt alkalmazunk, és a szájúreg felülete, amelyre a készítményt felvisszük, a fogak zománca.

A meghatalmazott:

3 oldal ábr  
U

MSZ



KÖZZÉTÉTELI  
PÉLDÁNY

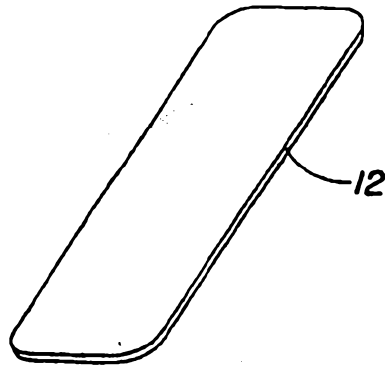


Fig. 1

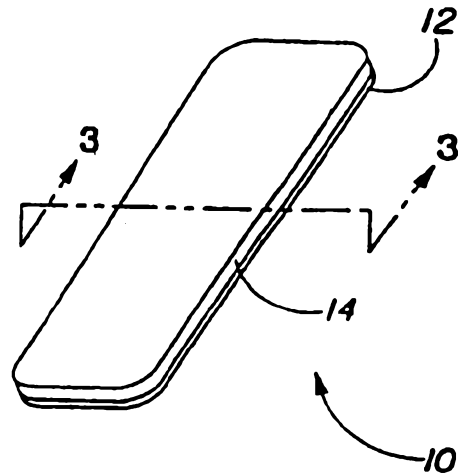


Fig. 2

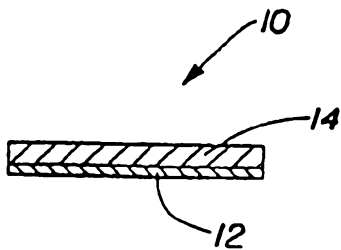


Fig. 3

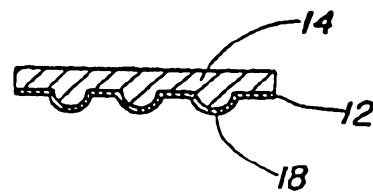


Fig. 4

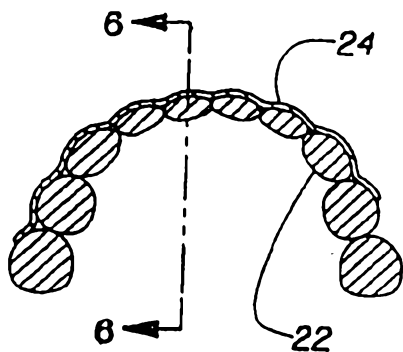


Fig. 5

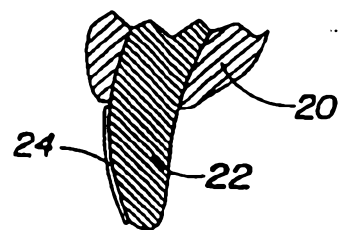


Fig. 6

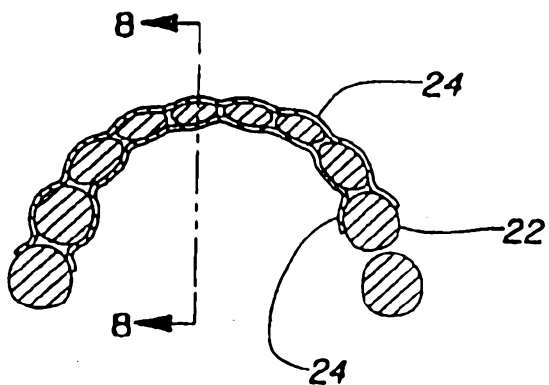


Fig. 7

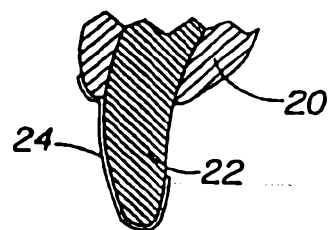


Fig. 8

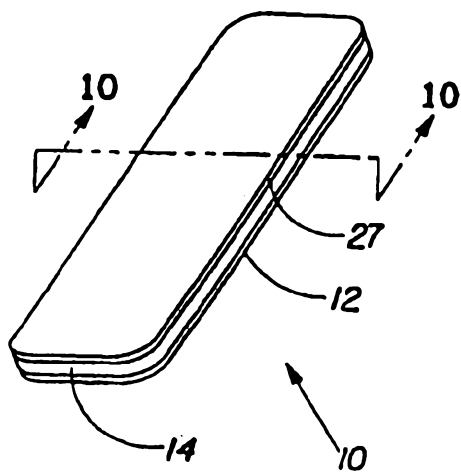


Fig. 9

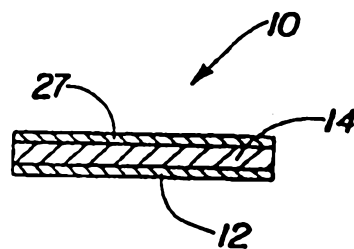


Fig. 10

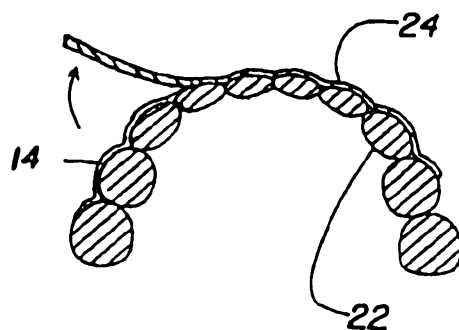


Fig. 11