

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第5179150号
(P5179150)

(45) 発行日 平成25年4月10日(2013.4.10)

(24) 登録日 平成25年1月18日(2013.1.18)

(51) Int.Cl.

A 6 1 K 6/08 (2006.01)

F 1

A 6 1 K 6/08

Z

請求項の数 20 (全 9 頁)

(21) 出願番号 特願2007-300720 (P2007-300720)
 (22) 出願日 平成19年11月20日(2007.11.20)
 (65) 公開番号 特開2008-127391 (P2008-127391A)
 (43) 公開日 平成20年6月5日(2008.6.5)
 審査請求日 平成22年10月25日(2010.10.25)
 (31) 優先権主張番号 11/603952
 (32) 優先日 平成18年11月22日(2006.11.22)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 505251989
 サイエンティフィック ファーマシューテ
 イカルズ インコーポレイティッド
 SCIENTIFIC PHARMACE
 UTICALS, INC.
 アメリカ合衆国 91768-3916
 カリフォルニア州 ポモナ プロデューサ
 ー ウェイ 3221
 3221 Producer Way P
 omona, CA 91768-391
 6 USA
 (74) 代理人 100065215
 弁理士 三枝 英二
 (74) 代理人 100099988
 弁理士 斎藤 健治

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 新規な知覚鈍麻およびフッ素処理歯科用バーニッシュ

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

水添ウッドロジンまたは水添ガムロジンと、少なくとも1つの $C_2 \sim C_4$ 脂肪族アルコールまたは少なくとも1つの $C_2 \sim C_4$ 脂肪族アルコールと少なくとも1つの $C_5 \sim C_7$ 炭化水素との混合物を含む溶媒とを含む、知覚過敏の予防もしくは軽減および/またはう蝕発生の減少もしくは予防のための歯科用バーニッシュ。

【請求項 2】

前記ロジンが、部分水添または高度水添された、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 3】

前記水添ロジンが、部分的に重合されている、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

10

【請求項 4】

前記水添ロジンが、部分的にまたは完全に中和されている、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 5】

前記溶媒が、アルコールと $C_5 \sim C_7$ 炭化水素との共沸混合物または共沸様混合物を含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 6】

前記溶媒が、エチルアルコールもしくはイソプロピルアルコールと、 n -ヘキサン、その異性体もしくはこれらの混合物との共沸混合物または共沸様混合物を含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

20

【請求項 7】

前記溶媒が、エチルアルコールまたはイソプロピルアルコールまたはこれらの混合物を含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 8】

フッ化ナトリウム、フッ化カリウム、モノフルオロリン酸ナトリウム、フッ化第一スズ、ヘキサフルオロケイ酸亜鉛、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウムおよびヘキサフルオロケイ酸カリウムからなる群から選択されるフッ化物塩 0.1 重量% ~ 10 重量%を含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 9】

前記ロジン成分が、25 重量% ~ 85 重量%の濃度で存在する、請求項 1 に記載のバーニッシュ。 10

【請求項 10】

前記溶媒が、大気圧で 100 未満の沸点を有する、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 11】

着色剤またはオペーク剤をさらに含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 12】

甘味料およびフレーバーなどの感覚増強剤をさらに含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 13】

無機充填剤および / または有機充填剤をさらに含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。 20

【請求項 14】

前記無機充填剤がシリカである、請求項 13 に記載のバーニッシュ。

【請求項 15】

1 重量% ~ 25 重量%の別のタイプの天然樹脂または合成樹脂をさらに含む、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 16】

前記天然樹脂が、コロホニー、コーパルおよび / またはクマロンタイプのロジンである、請求項 15 に記載のバーニッシュ。

【請求項 17】

前記合成樹脂がポリアミドを含む、請求項 15 に記載のバーニッシュ。 30

【請求項 18】

前記ポリアミドが、脂肪族ジアミンと脂肪酸との反応生成物である、請求項 17 に記載のバーニッシュ。

【請求項 19】

前記ロジンが、50% ~ 100% 水添されている、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【請求項 20】

前記ロジンが、75% ~ 100% 水添されている、請求項 1 に記載のバーニッシュ。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、歯科用バーニッシュに関し、より詳細には揮発性溶媒中の水添ロジンの溶液を含む、知覚鈍麻および歯のフッ素処理バーニッシュに関する。 40

【背景技術】

【0002】

最も古いタイプの歯科用バーニッシュは、エチルエーテル中、塩素化炭化水素中および、後にはアルコール中に、化石化した植物由来材料であるコーパルタイプのロジンの溶液を含んでいた。このようなバーニッシュは、アマルガムまたはリン酸タイプの修復材の装着前に、ほとんど例外なく露出した象牙質のコーティングとして使用されていた。それらは、新規な樹脂をベースとした修復材の下における使用には適さなかった。なぜなら、コーパルは重合過程の阻害剤として作用し、修復材料の硬化と結果的に修復材の質に悪影響 50

を及ぼすためである。材料の不完全な硬化はまた、術後の不快感を生じる可能性もあり、さらに歯髄に重大な損傷を及ぼしかねない。コーパルバーニッシュは、新規な修復材の辺縁漏洩を防ぐ点において一般に優れているが、歯のフッ素処理といった便宜を提供しなかったため、二次う蝕に対する望ましい追加的な保護手段を提供しなかった。

【 0 0 0 3 】

コーパルタイプの樹脂をベースとしたバーニッシュに、合成ポリマー、主としてポリアミドタイプのポリマーをベースとしたバーニッシュが続いた。このようなバーニッシュの例は、特許文献 1 に記載されている。合成バーニッシュは、樹脂をベースとした修復材料の重合過程を阻害しなかった。したがって、このようなバーニッシュは、すべての公知のタイプの修復材の下で使用するのに適切であった。それらは低比重および低粘度であるため、懸濁液中にフッ化物塩を保持することができなかった。したがって、それらの役割は象牙質細管を閉鎖することに限られ、潜在的に傷を受けやすい歯の表面をフッ素処理するといった便宜をもたらさなかった。

10

【 0 0 0 4 】

歯科用バーニッシュのより新しいタイプは、フィルム形成剤（天然または合成樹脂）に加え、治療剤を含む配合物を包含することで、歯の化学的性質に望ましい変化をもたらし、知覚過敏を軽減し、歯科材料との接触に起因する組織への刺激または損傷を防止する。

【特許文献 1】米国特許第 4, 396, 378 号

【特許文献 2】米国特許第 2, 407, 248 号

【特許文献 3】米国特許第 4, 308, 062 号

【特許文献 4】米国特許第 4, 748, 198 号

【特許文献 5】米国特許第 5, 213, 615 号

【特許文献 6】米国特許第 5, 330, 746 号

【特許文献 7】米国特許第 5, 558, 701 号

【特許文献 8】米国特許第 5, 708, 052 号

【特許文献 9】米国特許出願公開第 2006/0004120 号

【特許文献 10】米国特許出願公開第 2007/0105975 号

【特許文献 11】DE 19722596

【特許文献 12】特開 2001-288025

【特許文献 13】米国特許第 2, 630, 397 号

【特許文献 14】米国特許第 2, 788, 287 号

【特許文献 15】米国特許第 3, 081, 227 号

【特許文献 16】米国特許第 3, 087, 904 号

【特許文献 17】米国特許第 3, 266, 147 号

【特許文献 18】米国特許第 3, 469, 317 号

【特許文献 19】米国特許第 3, 868, 447 号

【特許文献 20】米国特許第 4, 240, 832 号

【特許文献 21】米国特許第 4, 396, 378 号

【非特許文献 1】Encyclopedia of Polymeric Science and Technology, Vol. 10, 1969, pp. 597-615.

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【 0 0 0 5 】

現在の歯科用バーニッシュにおける治療添加剤で最も一般的なものは、フッ化物塩、特にフッ化ナトリウムである。最も一般的なフッ化物を含む歯科用バーニッシュは、フィルム形成剤としてコロホニータイプのロジンを、媒質/溶媒としてエチルアルコールを、そして主なもしくは唯一の治療剤としてフッ化ナトリウムを含むものである。コロホニーは、木に由来する天然物であるため、その特性はロットごとに異なることが多い。その違いには、バーニッシュの性能や見た目の美しさに関連した性質が含まれる場合が多く、口腔組織を刺激する可能性にも影響を与え得る。望ましいバーニッシュの稠度は、塗膜を適切

50

な膜厚に仕上げ、取扱いを容易にし、とりわけ配合物中のフッ化物塩と他の分散した構成成分が沈降するのを防ぐために重要である。このようなパーニッシュの公知の不都合な点には、遅い硬化をもたらす遅い溶媒の放出、見た目の悪さ、および不快な味が含まれる。

【課題を解決するための手段】

【0006】

発明の要約

一実施形態によれば、知覚過敏を予防もしくは軽減し、う蝕発生を減少させるための歯科用パーニッシュを提供する。このパーニッシュは、フィルム形成樹脂および溶媒を含み、この溶媒は、1つまたは複数の $C_2 \sim C_4$ 脂肪族アルコール、あるいは1つまたは複数の $C_5 \sim C_7$ 炭化水素、あるいはこれらの混合物を含むことが好ましい。このフィルム形成樹脂は、水添ロジン、部分的に重合された水添ロジン、中和されたまたは部分的に中和された水添ロジン、あるいはこれらの組合せを含む。一実施形態では、溶媒は、この溶媒の、好ましくはエチルアルコールおよびn-ヘキサンの共沸混合物または共沸様混合物を含む。

10

【発明を実施するための最良の形態】

【0007】

好ましい実施形態の詳細な説明

本明細書において開示されるのは、従来技術のパーニッシュの利点および機能を保持する一方で、それらの問題とされる特性、特に見た目、味および生体適合性（口腔組織への刺激の減少または欠如）を好ましくはさらに高める、新規なタイプの歯科用パーニッシュである。

20

【0008】

植物由来の生成物であるロジンは有機酸を含み、そのカルボキシル基が口腔組織への刺激をもたらし得る。また、コロホニータイプなどの未変性ロジンは、まれに皮膚過敏性をもたらし得ることが見いだされた。特に歯科用途において、未変性ロジンを使用する他のマイナスの側面としては、その不快な味、見た目が悪い色、低く、一定でないことが多い軟化点、不溶性不純物の存在、および遅い溶媒の放出が挙げられる。このような欠点は、劣ったまたは妥協した最終製品の性能および使用者の許容性の一因となっている。

【0009】

本明細書において開示される歯科用パーニッシュは、重合されていない水添ロジン、または重合された水添ロジンを使用する。ロジンの中和または部分的中和は任意選択であるが、ある種のロジンにとっては望ましい。

30

【0010】

部分的にまたは完全に中和されたものを含めた水添ロジンおよびそれらのポリマーは、目に見える不純物なしで、均一で明るい色の商業用形態で入手可能であり、硬化後は歯の上で事実上目に見えないパーニッシュの配合を可能にする。好ましい実施形態によるパーニッシュに用いられる水添ロジンは、本来存在した不飽和結合の50%~100%が水添によって除去されたものであり、この割合には、約50%~74%（部分水添とも称される）および75%~100%（高度水添とも称される）が含まれる。好ましいパーニッシュは、少なくとも約20重量%のロジンを含み、これには約30%、約35%、約40%、約45%、約50%、約55%、約60%、約65%、約70%および約75%が含まれ、ならびにこれらの列挙した百分率の間の百分率も含まれ、ならびに例えば約30~70%といった列挙した百分率で両端を挟まれた範囲も含まれる。一実施形態では、樹脂混合物には、これらに限定されないが、コロホニー、クマロン、コーパル、およびポリアミド樹脂が含まれる1つまたは複数の他の天然樹脂または人工樹脂が挙げられる。このような他の樹脂は、約1~20%で存在することが好ましく、これには約5%、約10%および約15%が含まれ、これにはこれらの列挙した百分率の間の百分率が含まれ、ならびに列挙した百分率に両端を挟まれた範囲が含まれる。好ましいポリアミドには、脂肪族ジアミンを含めたジアミンと脂肪酸との反応生成物であるものが挙げられる。

40

【0011】

50

特定の好ましい実施形態では、最良のまたは最良に近い稠度を特徴とするバーニッシュ中のこのようなフィルム形成剤の濃度は非常に高く、50～75重量%の範囲であり、これによって都合のよい稠度をもたらす、それは速い溶媒の放出によってさらに促進される。バーニッシュの良好な機械的特性によって、従来のコロホニータイプの配合物と比較した場合、フッ化物の放出時間の延長を可能にし、したがって歯のフッ素処理剤および知覚鈍麻剤としての有効性を向上させる。

【0012】

特定の好ましい実施形態では、バーニッシュの溶媒成分は、1つ以上のアルコールおよび/あるいは1つ以上の炭化水素を含む。いくつかの実施形態では、この溶媒は、共沸比率のまたは共沸比率に近いアルコールと炭化水素との混合物を含み、それだけに限らないが、760 mmHgで58.7の沸点を有する、エチルアルコール(21重量%)とn-ヘキサン(79重量%)との混合物; 760 mmHgで62.7の沸点を有する、イソプロピルアルコール(23重量%)とn-ヘキサン(77重量%)との混合物; および760 mmHgで78.3の沸点を有する純粋なエチルアルコールが挙げられる。このような混合物中の水添ロジンの溶液は、硬化が早く、刺激が少ないまたは刺激がないバーニッシュを可能にする。上記で述べた相対的重さは、共沸混合物にのみ関し、バーニッシュ配合物中のアルコールおよび/または炭化水素の絶対量もしくは相対量を制限することは意図していない。バーニッシュ配合物には、個々の溶媒(例えば、エチルアルコールのみ)またはアルコールの混合物、個々の炭化水素またはこれらの混合物、あるいはアルコールと炭化水素との混合物が挙げられ得る。

【0013】

好ましいアルコールには、C₃アルコールを含めたC₂～C₄アルコールが挙げられ、前記アルコールは線状、枝分かれおよび/または環状でもよい。好ましいアルコールには、エチルアルコール、プロピルアルコール(その異性体、n-プロピルアルコールおよびイソプロピルアルコールを含む)、ブチルアルコール(その異性体、すなわちn-ブチルアルコール、sec-ブチルアルコール、iso-ブチルアルコール、およびt-ブチルアルコールを含む)、およびこれらのブレンドが挙げられる。C₂～C₄の範囲外のアルコールの使用も意図している。好ましい炭化水素には、C₆炭化水素化合物を含めたC₅～C₇炭化水素が挙げられ、前記炭化水素は、線状、枝分かれおよび/または環状でもよく、アルカンおよび/またはアルケンでもよい。炭化水素成分は、単一の炭化水素または2つ以上の炭化水素のブレンドを含み得る。特定の好ましい炭化水素としては、イソペンタン、n-ペンタン、n-ヘキサン、イソヘキサン、シクロヘキセン、シクロヘキサン、メチルシクロペンタン、n-ヘプタン、メチルシクロヘキサン、2,5-ジメチルヘキサン、シクロヘキセン、メチルシクロヘキセン、1-ヘプテン、およびこれらの混合物が挙げられる。C₅～C₇の範囲外の炭化水素の使用も意図している。

【0014】

好ましい実施形態では、バーニッシュは、少なくとも約15重量%の溶媒を含み、これには約18%、約19%、約20%、約21%、約22%、約23%、約24%、約25%、約30%、および約35%が含まれ、ならびにこれらの列挙した百分率の間の百分率、ならびに列挙した百分率で両端を挟まれた範囲も含まれる。好ましい実施形態では、このバーニッシュは、少なくとも約4重量%のアルコール成分を含み、これには約5%、約6%、約7%、約8%、約9%、約10%、約11%、約12%、約13%、および約14%が含まれ、ならびにこれらの列挙した百分率の間の百分率、ならびに列挙した百分率で両端を挟まれた範囲も含まれる。好ましい実施形態では、このバーニッシュは、少なくとも約10重量%の炭化水素成分を含み、これには約11%、約12%、約13%、約14%、約15%、約16%、約17%、約18%、約19%、および約20%が含まれ、ならびにこれらの列挙した百分率の間の百分率、ならびに列挙した百分率で両端を挟まれた範囲も含まれる。本発明の特定の実施形態では、列挙した好ましい濃度よりも高い濃度および低い濃度で存在する成分が含まれ得る。

【0015】

好ましいフッ素処理剤には、フッ化ナトリウム、フッ化第一スズ、モノフルオロリン酸ナトリウム、ヘキサフルオロケイ酸亜鉛、およびヘキサフルオロケイ酸ナトリウムが挙げられる。フッ素処理剤が存在する場合は、約 0.1 ~ 10 重量%のフッ素処理剤が存在することが好ましく、これには少なくとも約 1%、約 2%、約 2.5%、約 3%、約 3.5%、約 4%、約 4.5%、約 5%、約 5.5%、および約 6%が含まれ、ならびにこれらの列挙した濃度の間の百分率、ならびに約 2.5% ~ 6% および約 3 ~ 5% などの、列挙した百分率で両端を挟まれた範囲も含まれる。

【0016】

このバーニッシュ配合物は、下記の 1 つまたは複数を必要に応じて含む：キシリトール、ソルビトール、アスパルテーム、サッカリンナトリウム、およびこれらの混合物などの甘味料；これらだけに限らないが、ペパーミント、スイカ、ウインターグリーン、スペアミント、チェリー、クエン酸、オレンジ、イチゴ、バニラ、ココナッツ、バブルガムフレーバー、およびこれらの混合物を含めた香味料；着色剤；ならびに有機および/もしくは無機の充填剤または増粘剤。甘味料が存在する場合は、その濃度は約 0.5 ~ 3 重量%であることが好ましく、これには約 1 重量%、1.5 重量%、2 重量%、および 2.5 重量%、またはバーニッシュの口当たりのよさを向上させるのに十分な他の量が含まれる。香味料が存在する場合は、それらが約 1 ~ 4 重量%で存在することが好ましく、これには約 2% および約 2.5% およびその間の値を含めた、約 1.5 ~ 3% が含まれる。シリカなどの充填剤または増粘剤が存在する場合は、約 2 ~ 10 重量%で存在することが好ましく、これには約 3 ~ 6 重量%が含まれる。

【0017】

本明細書に記載するバーニッシュは、当業者によく理解されているように、適切なアプリケーション、好ましくはブラシを用いて歯に塗布され得る。歯をシールするためにバーニッシュを使用する方法には、バーニッシュを歯に塗布し、溶媒を蒸発させて、処理される表面に接着するフィルムを残す方法が含まれる。

【0018】

本発明を実施例中でさらに説明する。これは単に例示目的のためであり、特許請求の範囲に記載された範囲の制限を意図するものではない。特に断りのない限り、下記および本明細書の全ての場所に記載された百分率は重量による。

【実施例】

【0019】

実施例 1

バーニッシュ配合物は、

【0020】

【表 1】

高度水添ウッドロジン	29.8%
N-ヘキサン	23.5%
シリカ	19.3%
ポリアミド樹脂（エチレンジアミンと脂肪酸との縮合生成物）	11.3%
エチルアルコール	6.3%
フッ化ナトリウム	4.3%
スイカフレーバー	3.0%
キシリトール	2.2%
サッカリンナトリウム	0.3%

からなった。

【0021】

この配合物は、懸濁液中でフッ化ナトリウムおよびキシリトールを保持する適切な稠度を示した。遠心処理または高めの温度での長時間の保管によって沈殿させた後、穏やかに攪拌することによって均一な懸濁液が容易に回復した。37 での硬化時間は、約 6 分であった。色および透光性は良好であると判断された。

実施例 2

バーニッシュ配合物は、

【0022】

【表 2】

部分的に中和した高度水添ウッドロジン	70.4%
ヘキサシラン（異性体の混合物）	11.8%
フッ化ナトリウム	4.9%
シリカ	3.7%
チェリーフレーバー	3.1%
エチルアルコール	3.1%
キシリトール	2.7%
サッカリンナトリウム	0.3%

10

からなった。

20

【0023】

この配合物は、懸濁液中でフッ化ナトリウムおよびキシリトールを保持する適切な稠度を示した。遠心処理または高温での長時間の保管によって沈殿させた後、穏やかに攪拌することによって均一な懸濁液が容易に回復した。37 での硬化時間は、約 5 分であった。色および透光性は良好であると判断された。

実施例 3

バーニッシュ配合物は、

【0024】

【表 3】

部分的に中和した高度水添ウッドロジン	67.6%
エチルアルコール	18.5%
シリカ	5.3%
フッ化ナトリウム	4.7%
キシリトール	2.6%
バブルガムフレーバー	1.3%

30

からなった。

【0025】

40

この配合物は、懸濁液中でフッ化ナトリウムおよびキシリトールを保持する適切な稠度を示した。遠心処理または高温での長時間の保管によって沈殿させた後、穏やかに攪拌することによって均一な懸濁液が容易に回復した。37 での硬化時間は、約 8 分であった。色および透光性は良好であると判断された。

実施例 4

バーニッシュ配合物は、

【0026】

【表 4】

高度水添ウッドロジン	34.4%
N - ヘキサン	26.5%
シリカ	22.4%
イソプロピルアルコール	7.9%
フッ化ナトリウム	4.5%
キシリトール	2.5%
バブルガムフレーバー	1.3%
サッカリンナトリウム	0.50%

10

からなった。

【 0 0 2 7 】

この配合物は、懸濁液中でフッ化ナトリウムおよびキシリトールを保持する適切な稠度を示した。遠心処理または高温での長時間の保管によって沈殿させた後、穏やかに攪拌することによって均一な懸濁液が容易に回復した。37 での硬化時間は、約 9 分であった。色および透光性は良好であると判断された。

実施例 5

バーニッシュ配合物は、

20

【 0 0 2 8 】

【表 5】

シリカ	31.3%
部分水添ガムロジン	27.7%
ヘキサン	23.55%
エチルアルコール	8.5%
フッ化ナトリウム	4.0%
チェリーフレーバー	2.54%
キシリトール	2.2%
サッカリンナトリウム	0.21%

30

からなった。

【 0 0 2 9 】

この配合物は、懸濁液中でフッ化ナトリウムおよびキシリトールを保持する適切な稠度を示した。遠心処理または高温での長時間の保管によって沈殿させた後、穏やかに攪拌することによって均一な懸濁液が容易に回復した。37 での硬化時間は、約 5 分であった。色および透光性は良好であると判断された。

40

フロントページの続き

(74)代理人 100108084

弁理士 中野 睦子

(74)代理人 100115484

弁理士 林 雅仁

(72)発明者 オールウスキ エー . ジャン

アメリカ合衆国 9 1 0 0 1 カリフォルニア州 アルタデナ ルービン 1 3 0 4

(72)発明者 バトラー ヴィ . デイヴィッド

アメリカ合衆国 9 1 7 9 1 カリフォルニア州 ウェスト コヴィナ エス . アルパイン 1
5 1 6

(72)発明者 マッキンレー ケー . リンゼイ

アメリカ合衆国 9 0 6 3 8 カリフォルニア州 ラ ミラダ プランタナ ドライブ 1 4 3 0
2

審査官 辰己 雅夫

(56)参考文献 特開 2 0 0 6 - 0 1 6 3 9 6 (J P , A)

特開 2 0 0 2 - 2 2 0 3 1 3 (J P , A)

特開平 0 2 - 0 1 7 1 0 8 (J P , A)

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

A 6 1 K 6 / 0 0 - 6 / 1 0