

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2015129837, 20.12.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
20.12.2012 US 61/740,391

(43) Дата публикации заявки: 26.01.2017 Бюл. № 03

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 20.07.2015(86) Заявка РСТ:  
US 2013/077330 (20.12.2013)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2014/100775 (26.06.2014)Адрес для переписки:  
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО  
"Союзпатент"(71) Заявитель(и):  
БХУШАН Раджив (US),  
ДЖИН Джерри (US),  
ГОСВАМИ Амит (US)(72) Автор(ы):  
БХУШАН Раджив (US),  
ДЖИН Джерри (US),  
ГОСВАМИ Амит (US)

## (54) ПЕРОРАЛЬНЫЕ КОМПОЗИЦИИ ПРОТИВ ЗУБНОГО НАЛЕТА И БЛЯШЕК

## (57) Формула изобретения

1. Пероральная композиция против зубного налета/бляшек, содержащая хелатирующий агент или его соли; усилитель транспорта; носитель или основу, приемлемые для применения в полости рта, и один или более вспомогательных ингредиентов, в которой хелатирующий агент и усилитель транспорта присутствуют в соотношении, эффективном для достижения значительного противодействия образованию зубного налета/бляшек у индивида, применяющего эту пероральную композицию, и в которой доля хелатирующего агента составляет от около 0,1% (масса/масса) до около 40% (масса/масса), а доля усилителя транспорта составляет от около 0,1% (масса/масса) до около 80% (масса/масса), соответственно.

2. Композиция по п. 1, в которой усилителем транспорта является метилсульфонилметан (MSM).

3. Композиция по п. 1, в которой усилителем транспорта является DMSO.

4. Композиция по п. 2, в которой соотношение хелатирующего агента и метилсульфонилметана составляет от около 1:100 до около 100:1.

5. Композиция по п. 1, представленная формой, выбираемой из зубной пасты, геля для чистки зубов, зубного порошка, полоскания для полости рта, применяемого до чистки зубов, полоскания для полости рта, применяемого после чистки зубов, препарата, отверждающего зубы, антикалькулезной композиции, жевательной резинки, леденцов или любой иной формы, пригодной для применения на поверхностях полости рта, зубов

A  
2015129837 AR U  
2015129837 A

или десен.

6. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент выбирают из этилендиаминтетрауксусной кислоты (EDTA), этиленгликольтетрауксусной кислоты (EGTA), циклогександиаминтетрауксусной кислоты (CDTA), гидроксиэтилэтилендиаминтриуксусной кислоты (HEDTA), диэтилентриаминпентауксусной кислоты (DPTA), димеркаптопропансульфоновой кислоты (DMPS), димеркаптоянтарной кислоты (DMSA), аминотриметиленфосфоновой кислоты (ATPA), лимонной кислоты, уксусной кислоты, их приемлемых солей и комбинаций этих веществ.

7. Композиция по п. 6, в которой соль этилендиаминтетрауксусной кислоты (EDTA) выбирают из  $(\text{NH}_4)_2\text{-EDTA}$ ,  $\text{Na}_2\text{-EDTA}$ ,  $\text{K}_2\text{-EDTA}$ ,  $(\text{NH}_4)_3\text{-EDTA}$ ,  $\text{Na}_3\text{-EDTA}$ ,  $\text{K}_3\text{-EDTA}$ ,  $\text{Na}_4\text{-EDTA}$ ,  $\text{K}_4\text{-EDTA}$ ,  $\text{CaNa}_2\text{-EDTA}$  и их комбинаций.

8. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент выбирают из фосфатов, пирофосфатов, триполифосфатов и гексаметаfosфатов.

9. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является хелатирующим антибиотиком - хлорохином или тетрациклином.

10. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является азотсодержащим хелатирующим агентом, включающим два или более хелатирующих атомов азота в аминогруппе или в ароматическом кольце, - диамином или 2,2'-бипиридином.

11. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является полиамином, выбранным из цикламина (1,4,7,11-тетраазациклотетрадекана),  $\text{N}-(\text{C}_1\text{-}\text{C}_{30})\text{-алкил}$ -замещенных цикламов (например, гексадецциклама, тетраметилгексадецилцилама), диэтилентриамина (DETA), спермина, диэтилнорспермина (DENSPM), диэтилгомоспермина (DEHOP), дефероксамина ( $\text{N}'\text{-}\{5\text{-[ацетил(гидрокси)амино]пентил}\}\text{-N}\text{-[5}\text{-}\{4\text{-[(5-аминопентил)(гидрокси)амино]-4-оксобутаноил}\text{]амино}]\text{-пентил}\}-\text{N}$ -гидроксисукцинамида или  $\text{N}'\text{-[5\text{-[ацетил-гидрокси-амино]пентил}\]-N}\text{-[5\text{-[3\text{-[5-аминопентил-гидрокси-карбамоил]пропаноиламино]пентил}\]-N-гидрокси-бутандиамида}$ ), десферриоксамина В, десфероксамина В, DFO-В, DFOA, DFB, десферала, деферипона, пиридоксалъизоникотиноилгидразона (РН), салицилальдегид-изоникотиноилгидразона (SIH), этан-1,2-бис( $\text{N}$ -1-амино-3-этилбутил-3-тиола).

12. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является конъюгатом EDTA и 4-аминохинолина, выбранным из  $\{[2\text{-}(бис\text{-этоксикарбонилметил\text{-амино})\text{-этил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино\text{-этилкарбамоил}})\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([2\text{-}(бис\text{-этоксикарбонилметил\text{-амино})\text{-пропил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино}})\text{-этилкарбамоил}\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([3\text{-}(бис\text{-этоксикарбонилметил\text{-амино})\text{-пропил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино\text{-этилкарбамоил}})\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([4\text{-}(бис\text{-этоксикарбонилметил\text{-амино})\text{-бутил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино\text{-этилкарбамоил}})\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([2\text{-}(бис\text{-этоксиметил\text{-амино})\text{-этил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино}})\text{-этилкарбамоил}\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([2\text{-}(бис\text{-этоксиметил\text{-амино})\text{-пропил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино\text{-этилкарбамоил}})\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([3\text{-}(бис\text{-этоксиметил\text{-амино})\text{-пропил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино}})\text{-этилкарбамоил}\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([4\text{-}(бис\text{-этоксиметил\text{-амино})\text{-бутил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино\text{-этилкарбамоил}})\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([2\text{-}(бис\text{-этоксиметил\text{-амино})\text{-пропил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино\text{-этилкарбамоил}})\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}, ([4\text{-}(бис\text{-этоксиметил\text{-амино})\text{-бутил}]\text{-}\{[2\text{-}(7\text{-хлорхинолин\text{-4-иламино\text{-этилкарбамоил}})\text{-метил}\text{-амино}\}\text{-уксусной кислоты этилового эфира}$ .

13. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является четырехзамещенной натриевой солью иминодиянтарной кислоты.

14. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является солью полиаспарагиновой кислоты.

15. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является четырехзамещенной натриевой солью L-глутаминовой-N,N-диуксусной кислоты.

16. Композиция по п. 1, в которой хелатирующий агент является природным хелатирующим агентом, выбранным из лимонной кислоты, фитиновой кислоты, молочной кислоты, уксусной кислоты, их солей и куркумина.

17. Композиция по п. 1, в которой вспомогательные компоненты включают один или более полирующих агентов; загустителей; поверхностно-активных веществ; увлажняющих агентов; растворителей; подсластителей; агентов, отверждающих зубы; агентов, противодействующих образованию зубного камня; антикалькулезных агентов; ароматизаторов и антибактериальных агентов.

18. Композиция по п. 17, в которой полирующий агент выбирают из одного или более следующих веществ: тонко измельченной двуокиси кремния, карбоната кальция, трехзамещенного фосфата кальция, двухзамещенного фосфата кальция и нерастворимого метаfosфата натрия.

19. Композиция по п. 17, в которой поверхностно-активное вещество выбирают из одного или более следующих веществ: лаурилсульфата натрия, N-кокоил,N-метилтаурата натрия, N-лаурилкарбозина-натрия или других совместимых детергентов для зубов.

20. Композиция по п. 17, в которой загуститель выбирают из одного или более природных или синтетических агентов: каррагенана, гидроксиметилцеллюлозы, загустителей на основе кремния или коллоидной двуокиси кремния.

21. Композиция по п. 17, в которой подсластитель выбирают из одного или более следующих веществ: сахарина, аспартами, цикламата, сукралозы, препаратов медовой травы (стевии), маннита, сорбита, ксилита и сходных гликолов.

22. Композиция по п. 17, в которой антикалькулезный агент выбирают из одного или более азациклоалкан-дифосфоновых соединений, азациклогептандифосфоновой кислоты и ее солей, синтетических анионных полимерных поликарбоксилатов, сополимеров малеиновой кислоты или малеинового ангидрида с винилметиловым эфиром и их солей.

23. Композиция по п. 17, в которой агент, отверждающий зубы, выбирают из растворимых фторидов щелочных металлов, фторида натрия, фторида калия; фторида меди, фторидов олова, фторсиликата аммония; фторцирконата натрия; фторцирконата аммония; монофторфосфата натрия; фторфосфатов алюминия (моно-, ди- и три); фторированного пирофосфата натрия-кальция, монофторфосфата натрия и их смесей.

24. Композиция по п. 17, в которой агент, противодействующий образованию зубного камня, выбирают из полифосфатов, триполифосфатов щелочных металлов, пирофосфатов щелочных металлов и пирофосфата натрия.

25. Композиция по п. 17, в которой антибактериальный агент выбирают из 2',4,4'-трихлор-2-гидрокси-дифенилового эфира (Triclosan®), диоксида хлора, хлоргексидина, некатионных дифениловых эфиров, 2,2'-дигидрокси-5,5'-дibrom-дифенилового эфира, галогенированных и гидроксизамещенных дифениловых эфиров.

26. Композиция по п. 17, в которой ароматизирующий агент является фенольным соединением, выбираемым из эвкалиптола, тимола, метилсалцилата, ментола, хлортимола, фенола, масла грушанки («винтергринового»), масла мяты кудрявой, масла мяты перечной и сходных эфирных масел, а также их галогенированных форм и других производных.

27. Способ для лечения зубов с целью подавить развитие на них налета/бляшек,ключающий нанесение на зубы композиции по п. 1 в количестве, обеспечивающем подавление образования зубного налета/бляшек, при этом измеряют значительное уменьшение зубного налета/бляшек.

28. Способ по п. 27, в котором указанная композиция представляет собой зубную

пасту или зубной порошок и ее использование включает чистку зубов щеткой с использованием этой композиции по меньшей мере один раз в день на протяжении по меньшей мере трех суток.

29. Способ по п. 27, в котором указанная композиция представляет собой средство для полоскания полости рта, которое используют до либо после чистки зубов, и ее использование включает полоскание рта с использованием этой композиции по меньшей мере два раза в день на протяжении четырех или более суток.

30. Способ по п. 27, в котором указанная композиция представлена леденцами или таблетками и ее использование включает их прием по меньшей мере два раза в день на протяжении одной недели или более.

31. Способ по п. 27, в котором указанная композиция представляет собой жевательную резинку и ее использование включает употребление этой композиции по меньшей мере два раза в день на протяжении одной недели или более.