



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ**

**(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ**(21), (22) Заявка: **2006107979/15, 13.08.2004**(24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
**13.08.2004**(30) Конвенционный приоритет:  
**15.08.2003 US 10/641,961**(43) Дата публикации заявки: **27.07.2006**(45) Опубликовано: **27.11.2009** Бюл. № 33(56) Список документов, цитированных в отчете о  
поиске: **US 4971782 A, 20.11.1990. WO 0168045 A1,  
20.09.2001. WO 9107184 A1, 30.05.1991.**(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную  
фазу: **15.03.2006**(86) Заявка РСТ:  
**US 2004/026217 (13.08.2004)**(87) Публикация РСТ:  
**WO 2005/018591 (03.03.2005)**

Адрес для переписки:  
**129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной, рег. № 517**

(72) Автор(ы):

**ФЭЙ Линь (US),  
ЧОПРА Суман К. (US),  
МАНДАДИ Пракасаро (US),  
ПЭЙТЕЛ Нита (US),  
ШАСТРИ Рамачандра (US),  
МИРАДЖКАР Йеллоджи-Рао К. (US),  
ПРЕНСАЙП Майкл (US)**

(73) Патентообладатель(и):

**КОЛГЕЙТ-ПАЛМОЛИВ КОМПАНИ (US)****(54) НЕВОДНАЯ ЖИДКАЯ КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ ОТБЕЛИВАНИЯ ЗУБОВ**

(57) Реферат:

Изобретение относится к медицине и касается стабильной неводной жидкой композиции для отбеливания зубов, состоящей из безводного пероксидного соединения, диспергированного в орально приемлемой смеси безводного гидрофильного полимера и усиливающего адгезию средства (энхансера адгезии), причем эта композиция при местном

нанесении на поверхность зубов образует адгезивный (плотно прилегающий) слой, содержащий соединение пероксида, которое затем высвобождается из вышеуказанного слоя, осуществляя отбеливание зубов. Изобретение обеспечивает источник пероксида, который, по существу, устойчив к разложению при хранении. 2 н. и 11 з.п. ф-лы, 4 табл.



FEDERAL SERVICE  
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,  
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.  
**A61K 8/23** (2006.01)  
**A61Q 11/02** (2006.01)

**(12) ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: **2006107979/15, 13.08.2004**

(24) Effective date for property rights:  
**13.08.2004**

(30) Priority:  
**15.08.2003 US 10/641,961**

(43) Application published: **27.07.2006**

(45) Date of publication: **27.11.2009 Bull. 33**

(85) Commencement of national phase: **15.03.2006**

(86) PCT application:  
**US 2004/026217 (13.08.2004)**

(87) PCT publication:  
**WO 2005/018591 (03.03.2005)**

Mail address:  
**129090, Moskva, ul. B.Spasskaja, 25, str.3, OOO  
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",  
pat.pov. E.E.Nazinoj, reg. № 517**

(72) Inventor(s):

**FEhJ Lin' (US),  
ChOPRA Suman K. (US),  
MANDADI Prakasarao (US),  
PEhJTEL Nita (US),  
ShASTRI Ramachandra (US),  
MIRADZhKAR Jellodzhi-Rao K. (US),  
PRENSAJP Majkl (US)**

(73) Proprietor(s):

**KOLGEJT-PALMOLIV KOMPANI (US)**

**(54) NONAQUEOUS LIQUID COMPOSITION FOR DENTAL BLEACHING**

(57) Abstract:

FIELD: medicine.

SUBSTANCE: invention refers to medicine and concerns a stable nonaqueous liquid composition for dental bleaching containing anhydrous peroxide compound dispersed in perorally acceptable mixture of anhydrous hydrophilic polymer and adhesion enhancing agent (adhesion enhancer). When applied

locally on surface of teeth, said composition forms an adhesive (adherent) layer containing peroxide compound then released from said layer ensuring dental bleaching.

EFFECT: invention ensures a source of peroxide which is essentially decay-resistant in storage.

13 cl, 2 ex, 4 tbl

## 1. Область техники

Данное изобретение относится к устойчивой неводной жидкой композиции для отбеливания зубов.

## 2. Предшествующий уровень техники

5 Желательно, чтобы зубы человека выглядели блестящими или “белыми”. Общество придает большое значение “белизне” зубов своих представителей. Лица, имеющие белые зубы, могут чувствовать себя более уверенными и удовлетворенными и могут даже иметь большее признание в обществе.

10 Зуб состоит из внутреннего слоя, дентина, и наружного твердого слоя эмали, который является защитным слоем зуба. Эмалевый слой зуба непрозрачно белый от природы или слегка не совсем белого цвета. Именно эмалевый слой может покрываться пятнами (окрашиваться) или изменять цвет. Эмалевый слой зуба состоит из кристаллов минерального вещества - гидроксиапатита, которые создают в  
15 некоторой степени пористую поверхность. Эти гидроксиапатитные кристаллы представляют собой микроскопические гексагональные стержни или призмы, которые составляют поверхность эмали. Как следствие этого, поверхность эмалевого слоя имеет микроскопические (свободные) области или поры между призмами. Считают,  
20 что именно пористая природа эмалевого слоя позволяет проникать в эмаль окрашивающим веществам и изменяющим цвет веществам и изменять цвет зубов. Эти остающиеся вещества могут заполнить микроскопические свободные области и, в конечном счете, изменить цвет зуба.

25 Большое количество веществ, с которыми ежедневно сталкивается человек или с которыми вступает в соприкосновение, могут “окрашивать (вызывать появление пятен)” или снижать “белизну” его зубов. В частности, пищевые продукты, табачные изделия и жидкости, которые потребляет каждый человек, имеют тенденцию окрашивать его зубы. Указанные продукты или вещества имеют склонность  
30 накапливаться в эмалевом слое зуба и образовывать мембранную пленку на зубах. Эти окрашивающие или изменяющие цвет вещества могут затем проникать внутрь эмалевого слоя. Эта проблема возникает постепенно на протяжении многих лет и проявляется в заметном изменении цвета эмали зубов человека. При условии, что зубы с измененным цветом все еще здоровы и не представляют никакого риска или  
35 проблемы для здоровья, продукт или вещество, которое могло бы отбелить изменившие цвет зубы, был бы полезен.

40 Кроме того, важно, чтобы продукт, отбеливающий зубы, который должен быть использован в домашних условиях или индивидуально потребителем, был безопасным и удобным в обращении, был устойчивым и сохранял свою эффективность отбеливания во время его хранения на полках магазина, торгующего в розницу, а также на протяжении всего периода использования его потребителем.

45 Продукты и вещества для отбеливания зубов, которые в настоящее время имеются в распоряжении, включают ряд различных компонентов, однако основным активным компонентом их является пероксидное средство, введенное в композицию в виде водной жидкости, раствора, пасты или геля. Эти продукты при хранении теряют свою отбеливающую эффективность с течением времени, поскольку пероксидные соединения в водных растворах относительно неустойчивы. Эта склонность к  
50 неустойчивости пероксида ограничивала полезность водных жидких отбеливающих продуктов для отбеливания зубов. Поэтому было бы крайне желательно разработать стабильную пероксидсодержащую отбеливающую жидкость, способную осуществлять реальное отбеливание.

### Краткое изложение существа изобретения

В соответствии с одним аспектом данного изобретения предлагается устойчивая неводная композиция для отбеливания зубов, состоящая из безводной жидкой суспензии безводного пероксидного отбеливающего средства в безводном жидком гидрофильном полимере, причем эта суспензия при нанесении на зубы является достаточно вязкой для того, чтобы образовать адгезивный (плотно прилегающий) сплошной слой пероксидсодержащей композиции на поверхности зубной эмали.

Безводный жидкий гидрофильный полимер согласно данному изобретению обеспечивает стабильный носитель, который предотвращает разложение пероксидного отбеливающего средства во время хранения и до использования. После нанесения на поверхность зубов слюна, находящаяся на поверхности зубной эмали, на которую нанесена композиция, может либо растворять, либо дезинтегрировать пероксидсодержащий слой, приводя к быстрому разложению пероксида, что, в свою очередь, обеспечивает отбеливающее действие.

Неводная жидкая отбеливающая композиция по данному изобретению представляет собой портативный [переносной] оральный отбеливатель для ухода за зубами, который может быть удобно нанесен на поверхность зубной эмали. После нанесения на поверхность зубов нанесенная неводная жидкая отбеливающая композиция образует адгезивный (плотно прилегающий) слой пероксидсодержащей суспензии, который обладает способностью высвободить пероксидное отбеливающее средство на протяжении длительного периода времени, например от около 5 до около 30 минут. Нанесенный слой адгезирует к зубной поверхности, благодаря чему высвобождаемый источник пероксида затем отбеливает зубы, на которые нанесена композиция. Поддержание композиции в неводном состоянии обеспечивает источник пероксида, который, по существу, устойчив к разложению при хранении.

### Описание предпочтительных вариантов осуществления

Используемый в настоящем описании термин "гидрофильный" полимер относится к органическому полимеру, который имеет растворимость в воде, по меньшей мере, около одного грамма на 100 граммов воды при 25°C. Используемый здесь термин "гидрофобный" полимер или "нерастворимый в воде" полимер относится к органическому полимеру, который имеет растворимость в воде меньше чем около одного грамма на 100 граммов воды при 25°C. Используемый здесь термин "неводный" означает присутствие в композиции по данному изобретению воды меньше чем 10 мас. %.

Композиция по данному изобретению представляет собой вязкую суспензию, которая сохраняет свою консистенцию во время хранения, давая возможность нанести продукт на поверхность зубов мягкой кисточкой-аппликатором или допуская нанесение из слоя покрытия на полоске.

### Неводный гидрофильный жидкий полимер

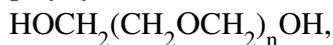
В соответствии с данным изобретением полимер, используемый в качестве наполнителя (носителя) для пероксида, представляет собой жидкий гидрофильный полимер, выбранный из водорастворимых и диспергируемых в воде органических полимеров. Можно использовать и смесь полимеров, и для улучшения адгезионных свойств жидкой композиции для отбеливания зубов вместе с гидрофильным полимером в ее состав может быть включен гидрофобный полимер при содержании от около 1,0 до 50%.

Неводные гидрофильные полимеры, используемые в практике настоящего

изобретения, предпочтительно обеспечивают вязкость композиции в диапазоне от около 10000 сантипуаз до 600000 сантипуаз.

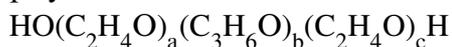
Примеры неводных жидких гидрофильных полимерных наполнителей, подходящих для использования в практике настоящего изобретения, включают

полиэтиленгликоли, неионогенные полимеры этиленоксида, имеющие общую формулу:



где  $n$  означает среднее число оксиэтиленовых групп. Полиэтиленгликоли, доступные от Dow Chemical, обозначены (сопутствующим) числом, например, 200, 300, 400, 600, 2000, которое означает приблизительную среднюю молекулярную массу полимера. Полиэтиленгликоли 200, 300, 400 и 600 представляют собой прозрачные вязкие жидкости при комнатной температуре, и они являются предпочтительными для использования в практике настоящего изобретения.

Второй предпочтительный неводный жидкий гидрофильный полимер, используемый для получения композиции по данному изобретению, включает в себя водорастворимый, неионогенный блоксополимер этиленоксида и пропиленоксида формулы:



Блоксополимер предпочтительно выбирают (в отношении  $a$ ,  $b$  и  $c$ ) так, чтобы этиленоксидная составляющая составляла от около 65 до около 75 мас.% от массы вышеуказанной молекулы сополимера и чтобы указанный сополимер имел среднюю молекулярную массу от около 2000 до около 15000, причем сополимер присутствует в жидкой композиции для отбеливания зубов в такой концентрации, чтобы композиция представляла собой жидкость при комнатной температуре (23°C).

Особенно желательный блоксополимер для использования в практике настоящего изобретения коммерчески доступен от BASF под названием Pluraflo L1220, и этот блоксополимер имеет среднюю молекулярную массу около 9800. Гидрофильный поли(этиленоксид)ный блок составляет в среднем 65 мас.% от массы полимера.

Как правило, неводные жидкие гидрофильные полимерные наполнители, используемые в композициях по данному изобретению, присутствуют в количестве от около 5 до 85 мас.%. Предпочтительно, жидкие полимеры присутствуют в количестве от около 55 до около 70 мас.%.

#### Средства, усиливающие адгезию

Усиливающие адгезию средства используют в композициях по данному изобретению для улучшения адгезионных свойств безводных гидрофильных полимеров, и указанные средства включают неорганические вещества, а также органические природные и синтетические полимеры. Неорганические вещества включают соединения аморфного кремнезема, которые функционируют в качестве загустителей, соединения коллоидного кремнезема, доступные под торговыми марками, такие как белая сажа Cab-o-sil, производимая Cabot Corporation и поставляемая Lenape Chemical, bound Brook, NJ; Zeodent 165 от J.M. Huber Chemicals Division, Havre de Grace, MD 21078; и Sylox 15, также известный как Sylodent 15, доступный от Davison Chemical Division of W.R. Grace Corporation, Baltimore, MD 21203.

Предпочтительное соединение аморфной белой сажи доступно в порошкообразной форме от Degussa Company под торговым названием "Аэросил". В продаже имеются различные типы "Аэросилов" в зависимости от вариаций в способе получения. Аэросил 200 представляет собой гидрофильную белую сажу, имеющую площадь поверхности около 200 квадратных метров на грамм, средний размер частиц около 10-

12 нанометров и уплотненную кажущуюся плотность около 50 г/л, и является предпочтительным для использования в практике настоящего изобретения.

Органические полимеры, используемые в качестве усиливающих адгезию средств, используемые в практике настоящего изобретения, включают гидрофильные полимеры, как, например, карбомеры (Carbomers), такие как карбоксиметиленовые полимеры типа полимеров акриловой кислоты и сополимеров акриловой кислоты. Карбоксиполиметилден представляет собой слабокислый виниловый полимер с активными карбоксильными группами. Предпочтительным карбоксиполиметилденом, используемым в практике настоящего изобретения, является сополимер акриловой кислоты, сшитый (с образованием сетчатой структуры) посредством от приблизительно 0,75% до приблизительно 1,5% полиаллилсахарозы, который продается под торговым названием Carborol 934, 974 комп. В.Ф. Goodrich.

В качестве усиливающих адгезию средств в практике настоящего изобретения также используют гидрофобные органические материалы, которые включают такие гидрофобные материалы, как, например, воски, такие как пчелиный воск, минеральное масло, пластигель (смесь минерального масла и полиэтилена), петролатум, белый вазелин, версагель (смесь вазелинового масла, гидрированного сополимера бутен/этилен/стирол), полимеры и сополимеры акрилата и винилацетата, полиэтиленовые воски, кремнийорганические (силиконовые) полимеры, такие как деметикон, кремнийорганические эластомеры, органосилоксановые смолы (полиорганосилоксаны), ненаполненные силиконовые каучуки и сополимеры поливинилпирролидон/винилацетата.

Кроме того, для регулирования вязкости жидких композиций по данному изобретению могут быть использованы небольшие количества безводного растворителя, такого как этанол, а также увлажнители, такие как глицерин, и эти вышеуказанные добавки присутствуют в неводных жидких отбеливающих композициях по данному изобретению в количествах от около 0,1 до около 25 мас.% и предпочтительно от около 0,3 до около 20 мас.%.

#### Безводное отбеливающее средство

Безводные отбеливающие средства, используемые в практике настоящего изобретения, включают безводные пероксидсодержащие соединения, такие как пероксид мочевины, перкарбонат натрия, перборат натрия и комплексы PVP- $H_2O_2$  (в дальнейшем "PVP- $H_2O_2$ "). Комплексы PVP- $H_2O_2$ , как линейные, так и поперечно-сшитые, известны в данной области техники, раскрыты в патентах США 3376110 и 3480557 и были использованы в композициях для лечения обыкновенных [юношеских] угрей (патент США 5122370). Комплексы PVP- $H_2O_2$  раскрыты в патенте США 5122370. PVP- $H_2O_2$  устойчив в безводной среде. При воздействии водных сред, таких как, например, в ротовой полости, отбеливающее средство диссоциирует на отдельные составляющие (полимер PVP и  $H_2O_2$ ).

Комплекс PVP- $H_2O_2$ , в общем, состоит из около 80 мас.% поливинилпирролидона и 20 мас.% воды.

Безводное отбеливающее средство присутствует в жидких отбеливающих композициях по данному изобретению при концентрации от около 1 до около 50 мас.% и предпочтительно от около 10 до около 25 мас.%.

#### Поверхностно-активное вещество

Неионогенные поверхностно-активные вещества, которые являются совместимыми с пероксидными соединениями, служат в качестве солюбилизующих,

диспергирующих, эмульгирующих и увлажняющих средств и являются особенно эффективными для солубилизации ароматизатора при включении его в жидкую отбеливающую композицию. Особенно полезным неионогенным  
5 поверхностно-активным веществом является водорастворимый полиоксиэтилированный сложный моноэфир сорбита и (C10-C18)-жирной кислоты, имеющийся на рынке под торговой маркой Твин. Поверхностно-активные вещества типа Твин представляют собой смеси сложных эфиров (C10-C18)-жирных кислот и сорбита (и ангидридов сорбита), состоящие преимущественно из сложного  
10 моноэфира, конденсированного с около 10-30, предпочтительно около 20, молями этиленоксида. Жирная кислота (алифатическая углеводородсодержащая монокарбоновая кислота) может быть насыщенной или ненасыщенной, например лауриновой, пальмитиновой, стеариновой, олеиновой кислотой. Полисорбат 20 (например, Твин 20) является особенно предпочтительным и его обычно называют  
15 полиоксиэтилен(20)сорбитанмонолаурат. Неионогенное поверхностно-активное вещество составляет от около 0 до 50 мас.% и предпочтительно от 0,5 до 40 мас.% от общей массы жидкой композиции.

#### Ароматизатор

20 Неводная жидкая отбеливающая композиция по данному изобретению может дополнительно содержать ароматизирующее средство. Ароматизаторы, которые используют в практике настоящего изобретения, включают эфирные масла, а также различные ароматизирующие альдегиды, сложные эфиры, спирты и подобные  
25 вещества. Примеры эфирных масел включают масла из кудрявой мяты, перечной мяты, винтергреновое масло, сассафрасовое масло, масло из гвоздики, шалфейное масло, эвкалиптовое масло, масло из листьев майорана, коричное масло, лимонное масло, лаймовое масло, масло грейпфрута и апельсиновое масло. Также используют такие химические вещества, как ментол, карвон и анетол. Из вышеуказанных обычно  
30 наиболее используемыми являются масла из перечной мяты, кудрявой мяты и винтергреновое масло. Ароматизатор входит в состав отбеливающей жидкой композиции по данному изобретению в концентрации от около 0,1 до около 2 мас.% и предпочтительно от около 0,1 до около 0,5 мас.%.

35 Как дополнение к ароматизирующему средству также используют подслащивающее вещество. Подходящие подслащивающие средства являются водорастворимыми и включают натрий-сахарин, цикламат натрия, ксилит, перилларгин, D-триптофан, аспартам, дигидрохалконы и т.п. при концентрациях от около 0,01 до около 1 мас.%. Предпочтительным является натрий-сахарин.

40 Неводную жидкую отбеливающую композицию по данному изобретению получают в форме текучей вязкой жидкой суспензии, содержащей отбеливающее средство, и наносят, как таковую, на зубы пользователей мягкой кисточкой-аппликатором. При нанесении пользователем на зубы остается слой вязкой жидкой суспензии. Контакт со слюной вызывает медленное высвобождение  $H_2O_2$  из безводного отбеливающего  
45 соединения в месте нанесения слоя суспензии на зубы, обеспечивая пролонгированную отбеливающую обработку затронутых участков поверхности зубов.

50 Слой жидкой суспензии, содержащей пероксид, не содержит никаких ингредиентов, придающих ему недопустимый вкус или текстуру, делающих его неприятным для пользователя и сильно адгезирующим к эмали зуба. Суспензия является достаточно вязкой и обладает достаточной адгезией (сцеплением) для того, чтобы оставаться на зубах в течение некоторого периода времени, например от около 5 до около 30 минут, для осуществления отбеливающего эффекта и чтобы оказать сопротивление силам,

обычно создаваемым губами и языком. Пока слой нанесенной жидкой отбеливающей композиции находится на месте, пользователю следует воздержаться от жевания. Отбеливающую композицию можно удалить, как и когда требуется, по желанию, используя обычные гигиенические процедуры ухода за полостью рта, например, очистку щеточкой или полоскание спиртосодержащим зубным эликсиром. Находясь в месте (действия), слой композиции высвобождает содержащиеся в нем средства с медленной, относительно постоянной скоростью и в концентрации, достаточно эффективной для того, чтобы осуществить удаление (окрашенных) пятен с зубов.

#### Активаторы пероксида

Активаторы разложения пероксида, такие как бикарбонат натрия, карбонат натрия, глюконат марганца, могут быть включены в состав жидкой гелеобразной отбеливающей композиции по данному изобретению. Активатор относительно неактивен в отношении пероксидного отбеливающего средства, когда присутствует в находящейся на хранении неводной жидкой композиции вследствие отсутствия воды в ее составе. Активатор функционирует, взаимодействуя с пероксидом с высвобождением кислорода в том случае, когда жидкая отбеливающая композиция, нанесенная на зубы, вступает в контакт со слюной, находящейся в полости рта. Активатор пероксида присутствует в неводной жидкой композиции по данному изобретению в концентрации от около 0 до около 10 мас.% и предпочтительно от около 1 до около 5 мас.%.

Другие компоненты, которые могут быть включены в состав жидкой отбеливающей композиции по данному изобретению, включают любое из веществ, обычно используемых в рецептурах средств для ухода за полостью рта. Такие вещества включают антимикробные средства, например триклозан, хлоргексидин, медь-, цинк- и двухвалентные оловосодержащие соли, такие как цитрат цинка, сульфат цинка, глицинат цинка, цитрат цинка-натрия и пирофосфат олова(II), экстракт сангвинарина, метронидазол, соединения четвертичного аммония, такие как хлорид цетилпиридиния; бис-гуаниды, такие как диглюконат хлоргексидина, гексетидин, октенидин, алексидин; и галогенированные бисфенольные соединения, такие как 2,2'-метиленбис-(4-хлор-6-бромфенол); противовоспалительные средства, такие как ибупрофен, флурбипрофен, аспирин, индометацин и т.д.; противокариозные средства, такие как натрий-, кальций-, магний- и двухвалентное оловосодержащий фторид, аминфториды, динатриймонофторфосфат и триметафосфат натрия; буферы для защиты от зубного налета (бляшек), такие как мочевины, лактат кальция, глицерофосфат кальция и полиакрилаты стронция; витамины, такие как витамин С; растительные экстракты; десенсибилизирующие средства, например цитрат калия, хлорид калия, тартрат калия, бикарбонат калия, оксалат калия, нитрат калия и соли стронция; средства, эффективные против зубного камня, такие как пирофосфатные соли, включая моно-, ди-, три- и тетрапирофосфатные и триполифосфатные соли щелочного металла и аммония; биомолекулы, например бактериоцины, антитела, ферменты, такие как папаин, глюкоамилаза; опалесцирующие средства, пигменты, красители и (фтор-ион)-обеспечивающие соли, имеющие противокариозную активность, такие как фторид натрия, фторид калия, фторид олова, такой как фторид двухвалентного олова.

#### Получение композиции

Неводные жидкие отбеливающие композиции по данному изобретению получают путем добавления и смешивания компонентов композиции в подходящем сосуде, таком как резервуар из нержавеющей стали, снабженный смесителем. Для получения

жидкой отбеливающей композиции компоненты добавляют в смеситель преимущественно в следующем порядке: гидрофильный полимер, отбеливающее средство - безводное пероксидное соединение, энхансер (усилитель) адгезии, активатор пероксида и какой-нибудь желательный ароматизатор или подслащивающее вещество.

Настоящее изобретение иллюстрируется нижеследующими примерами, которые не следует рассматривать как его ограничение.

#### Пример 1

Получали ряд жидких отбеливающих композиций для нанесения в виде покрытия, используя компоненты, перечисленные в Таблице I ниже.

Таблица I							
мас.%							
Композиция	A	B	C	D	E	F	G
Компонент							
PEG 400	71,20	33,50	51,50	21,50	12,50	37,00	-
Блоксополимер полиэтилен/полипропилен*	-	-	-	50,00	60,00	35,00	54,5
Аморфный кремнезем**	3,00	1,50	3,00	1,50	0,50	3,00	~
Перкарбонат натрия	24,00	24,00	24,0	25,00	25,00	24,00	24,00
Сополимер винилацетата	0,50	-	-	-	-	-	-
Безводный этиловый спирт	0,50	~	-	0,50	0,50	-	-
Полиоксиэтиленсорбитан***	-	40,00	-	-	-	-	-
Диметикон (350 cst)	-	-	-	-	-	-	20,00
Сополимер PVP/VA	-	-	20,00	-	-	-	-
Петролатум	-	-	-	-	-	-	-
Na сахарин	0,80	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00	1,00
Ароматизатор	-		0,50	0,50	0,50	-	0,5
* Pluraflo L-1220							
** Аэросил 200							
*** Полисорбат 60							

#### Стабильность

Устойчивость при хранении неводной жидкой отбеливающей композиции, представленной в Таблице I, определяли, упаковывая композицию в герметизированные пластмассовые бутылочки и подвергая заполненные бутылочки воздействию 120°F (~48°C). После 4-недельного воздействия 120°F определяли процент выделившегося пероксида водорода из жидкой отбеливающей композиции, используя иодометрическое титрование. Результаты выделения пероксида свидетельствовали о том, что неводные жидкие отбеливающие композиции являются эффективными отбеливающими композициями даже после 4-недельного хранения при повышенной температуре 120°F.

Эффективность отбеливания жидких композиций определяли, используя сдвоенную пару проточных ячеек (кювет), предназначенную для размещения, суммарно, восьми блоков бычьей эмали (четыре в каждой ячейке). Получали блоки бычьей эмали с только что нанесенными на них окрашенными пятнами, используя установленный протокол окрашивания пятнами (Indiana University, Indianapolis, IN). Начальные значения L\*, a\* и b\* были соотнесены (согласованы) по возможности как можно точнее до эксперимента с использованием колориметра (Minolta CR-321) исходя из начальных значений L\*, a\* и b\* (CIELAB). Эти начальные значения составляли обычно от L\*=25,00, a\*=3,00 и b\*=5,00 до L\*=35,00, a\*=5,00 и b\*=7,00. Значения L, a, b измеряли четыре раза в незначительно отличающихся местах на поверхности блоков

бычьей эмали.

Для имитирования (моделирования) слюны рта человека получали буферный раствор искусственной слюны, поддерживаемый при 37°C, содержащий такие же соли и в такой концентрации, которые обычно присутствуют в слюне человека.

Блоки бычьей эмали помещали в проточные ячейки и, используя кисточку, на них равномерно наносили жидкие композиции, при этом количество нанесенного продукта определяли, используя разницу массы контейнера. Поток среды (слюны) через зубы составлял 0,6 мл/мин в течение 30 мин. Средние начальные и конечные показания колориметра использовали для вычисления  $\Delta E$  согласно уравнению  $\Delta E = ((L_f - L_i)^2 + (b_f - b_i)^2 + (a_f - a_i)^2)^{1/2}$ . Конечное сообщаемое  $\Delta E$  представляло собой среднее по всем наблюдениям после исключения значений, резко отличающихся от остальных, используя критерий Стьюдента (95% доверительный уровень). Результаты представлены в Таблице II ниже. Для сравнения методику тестирования эффективности отбеливания Примера I повторяли за исключением того, что дополнительно проводили оценку эффективности отбеливания коммерчески доступной водной композиции для отбеливания зубов, наносимой в виде покрытия на внешнюю поверхность зубов, обозначенной как композиция X, содержащей 6,75 мас.% пероксида водорода. Результаты этих оценочных испытаний представлены в Таблице II ниже.

Состав жидкого геля	$\Delta E$
A	17
B	17
C	17
D	34
E	20
F	26
G	26
X	5,3
Y	5,3

Результаты, приведенные в Таблице II, показывают, что эффективность отбеливания ( $\Delta E$ ) композиций по данному изобретению (композиции A-G) существенно выше, чем сравнительных коммерчески доступных жидких композиций для отбеливания зубов X и Y.

#### Пример II

Получали ряд безводных жидких отбеливающих гелеобразных композиций, обозначенных "Композиции I-O", с либо PVP/H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>, либо перкарбонатом натрия, либо комбинации двух безводных пероксидных соединений вводили в безводный жидкий наполнитель, в котором сополимер поливинилпирролидон/винилацетат (PVP/VA) или белая сажа представляли собой модификатор реологии. В Таблице III ниже перечислены компоненты этих композиций.

Композиция	I (мас.%)	J (мас.%)	K (мас.%)	L (мас.%)	M (мас.%)	N (мас.%)	O (мас.%)
Компоненты							
Na перкарбонат	-	-	-	-	2	24	24
PVP-пероксид водорода	30	30	20	10	30	-	-
PEG 600	62,9	-	73	85	64	70,9	72

PEG 400	-	62,5	-	-	-	-	-
Белая сажа	5	5	5	3	3	5	3
NaHCO <sub>3</sub>	2	2	1	-	-	-	-
NaCO <sub>3</sub>	-	-	-	1	-	-	-
Полимер PVP/VA	0,1	0,5	1	1	1	0,1	1
Суммарно	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00

#### Получение композиций I-M

Полиэтиленгликоли (PEG) добавляли к PVP/H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> при осторожном смешивании, получая суспензию. Затем смесь нагревали до около 70°C при непрерывном перемешивании до тех пор, пока PVP/H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> не растворялся полностью в смеси PEG. Затем добавляли полимер PVP/VA к наполнителю PEG с последующим добавлением белой сажи. Смесь гомогенизировали до тех пор, пока не образовывалась гомогенная смесь (приблизительно 10 минут). Твердый активатор (NaHCO<sub>3</sub>) добавляли к смеси на последней стадии и смесь перемешивали, чтобы равномерно распределить активатор.

#### Получение композиций N-O

Полимер PVP/VA растворяли в наполнителе PEG при перемешивании. Добавляли белую сажу с последующим смешиванием до тех пор, пока смесь не становилась визуально однородной. Затем к смеси добавляли перкарбонат натрия и перемешивали с получением гомогенной композиции.

Эффективность отбеливания жидких отбеливающих гелеобразных составов I и J определяли, используя бычьи зубы, следуя методике Примера 1.

Таблица IV Эффективность отбеливания	
Состав жидкого геля	ΔE
I	20
J	20

#### Формула изобретения

1. Стабильная неводная жидкая композиция для отбеливания зубов, подходящая для нанесения на поверхность зубов, содержащая жидкую суспензию, содержащую:

а) PVP-H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> (поливинилпирролидон-H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>), диспергированное в орально приемлемом безводном гидрофильном жидком полимере, где жидкий полимер присутствует в композиции в количестве от около 5 до около 85 мас.%;

б) усиливающее адгезию средство, представляющее собой сополимер поливинилпирролидон/винилацетат или сополимер винилацетата;

с) меньше 10 мас.% воды.

2. Композиция по п.1, где концентрация PVP/H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> составляет от около 4 мас.% до около 50 мас.%.

3. Композиция по п.1, где жидкий полимер представляет собой полиэтиленгликоль.

4. Композиция по п.1, где жидкий полимер представляет собой блоксополимер полиэтиленоксид/полипропиленоксид.

5. Композиция по п.1, дополнительно содержащая тонкоизмельченную окись кремния.

6. Композиция по п.1, где усиливающее адгезию средство присутствует в количестве от около 0,1 до около 4 мас.%.

7. Композиция по п.1, дополнительно содержащая активатор пероксида.

8. Композиция по п.7, где активатор пероксида представляет собой  $\text{NaHCO}_3$ .

9. Композиция по п.7, где активатор пероксида представляет собой  $\text{Na}_2\text{CO}_3$ .

5 10. Композиция по п.7, где активатор пероксида представляет собой глюконат марганца.

11. Композиция по п.7, где активатор пероксида присутствует в концентрации от около 0 до около 10 мас. %.

12. Способ отбеливания поверхности зубов, включающий:

- 10 а) получение неводной жидкой композиции для отбеливания зубов по п.1;  
б) контактирование композиции с поверхностью зубов, подлежащих отбеливанию;  
с) удерживание композиции в контакте с поверхностью зубов в течение нескольких минут в день и  
д) повторение стадий б) и с) в течение нескольких дней.

15 13. Способ по п.12, в котором композиция для отбеливания зубов дополнительно содержит активатор пероксида.

20

25

30

35

40

45

50