

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号
特表2024-540663
(P2024-540663A)

(43)公表日 令和6年10月31日(2024.10.31)

(51)国際特許分類		F I		テーマコード (参考)	
A 6 1 K	8/21 (2006.01)	A 6 1 K	8/21	4 C 0 8 3	
A 6 1 K	8/34 (2006.01)	A 6 1 K	8/34		
A 6 1 K	8/86 (2006.01)	A 6 1 K	8/86		
A 6 1 K	8/27 (2006.01)	A 6 1 K	8/27		
A 6 1 K	8/81 (2006.01)	A 6 1 K	8/81		
		審査請求	未請求	予備審査請求	未請求 (全19頁) 最終頁に続く
(21)出願番号	特願2024-531463(P2024-531463)			(71)出願人	315010950
(86)(22)出願日	令和4年11月23日(2022.11.23)				ヘイリオン ユーケー アイピー リミテ
(85)翻訳文提出日	令和6年7月19日(2024.7.19)				ッド
(86)国際出願番号	PCT/EP2022/083049				イギリス サリー ケーティー 1 3 0 エ
(87)国際公開番号	WO2023/094489				ヌワイ ウェイブリッジ ザ ハイツ ビル
(87)国際公開日	令和5年6月1日(2023.6.1)				ディング 5 ファースト フロア
(31)優先権主張番号	2117188.9			(74)代理人	110002572
(32)優先日	令和3年11月29日(2021.11.29)				弁理士法人平木国際特許事務所
(33)優先権主張国・地域又は機関	英国(GB)			(72)発明者	マートック, アルワ
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA				イギリス国 ケーティー 1 3 0 エヌワイ
	,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(				サリー ウェイブリッジ, ザ ハイツ 5
	AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A			(72)発明者	メンスオ, ジュニア
	T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR				イギリス国 ケーティー 1 3 0 エヌワイ
	,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,				サリー ウェイブリッジ, ザ ハイツ 5
	最終頁に続く			(72)発明者	ループール, ニマ
					最終頁に続く

(54)【発明の名称】 非水性歯磨剤組成物

(57)【要約】
フッ化第一スズ及び少なくとも1種の亜鉛塩を含む安定な単相非水性歯磨剤組成物。好ましくは、歯磨剤組成物は歯磨きペースト配合物を含む。
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

- a) 少なくとも1種の溶媒、
- b) フッ化第一スズ、
- c) 少なくとも1種の亜鉛塩、
- d) 支持ポリマー、
- e) 少なくとも1種の界面活性剤、及び
- f) カラギーナン

を含む、単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 2】

少なくとも1種の溶媒がグリセリン、ポリエチレングリコール(PEG)、又はそれらの混合物を含む、請求項1に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 3】

少なくとも1種の溶媒がグリセリン30～70重量%及びポリエチレングリコール(PEG)10～30重量%を含む、請求項1に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 4】

少なくとも1種の亜鉛塩が塩化亜鉛である、請求項1から3のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 5】

少なくとも1種の亜鉛塩が組成物の0.05重量%～1重量%を占める、請求項1から4のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 6】

支持ポリマーがポリアクリル酸(PAA)である、請求項1から5のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 7】

PAAがcarbopolホモポリマー、好ましくはCarbopol 974Pである、請求項6に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 8】

支持ポリマーが組成物の0.1～1.5重量%を占める、請求項1から7のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 9】

PEGが1mol当たり380～420グラムのモル質量を有する、請求項2から7のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 10】

カラギーナンが組成物の0.1～1重量%を占める、請求項1から9のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 11】

少なくとも1種の界面活性剤がSLS及びコカミドプロピルベタインを含む群から選択される、請求項1から10のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 12】

SLSとコカミドプロピルベタインとの両方を含む、請求項9に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項 13】

歯磨剤が、

- a) 52～55重量%のグリセリン、
- b) 18～22重量%のPEG400、
- c) フッ化第一スズ、
- d) 0.2～0.4重量%の塩化亜鉛、
- e) 0.6～0.8重量%の高分子量PAAポリマー、
- f) 1.0～2.4重量%の重量比3:1の界面活性剤ラウリル硫酸ナトリウム及びココアミド

10

20

30

40

50

プロピルペタイン、並びに

g) 0.1～0.4重量%のカラギーナン

を含む、請求項1から12のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項14】

追加のフッ化物供給源を更に含む、請求項1から13のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項15】

防汚剤を含む、請求項1から14のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項16】

歯科用シリカ、増稠性シリカ、香料、着色料、保存料、pH調整剤、レオロジー調整剤、及び研磨剤から選択される1種以上の追加の成分を含む、請求項1から15のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物。

【請求項17】

歯ブラシと組み合わせて歯を洗浄するための、請求項1から16のいずれか一項に記載の単相非水性歯磨剤組成物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は少なくとも1種の亜鉛塩及びフッ化第一スズを含む単相非水性歯磨剤組成物に関する。特に、本発明は塩化亜鉛及びフッ化第一スズを含む単相非水性歯磨剤組成物に関する。

【背景技術】

【0002】

本発明はフッ化第一スズ及び少なくとも1種の亜鉛塩を含む安定な非水性歯磨剤に関する。

【0003】

フッ化第一スズは口腔ケア用途での使用でよく知られている。これは歯肉炎、プラーク形成、及び過敏に対する保護に役立つことが実証されている。

【0004】

亜鉛は口腔内の悪臭の低減、プラーク形成の低減、及び歯石形成の抑制のため、一般に口腔衛生製品に配合される。

【0005】

この2種の活性物質は異なる化学及び物理特性を有し、これにより単相の歯磨剤組成物に共に配合することは非常に困難である。

【0006】

以前はこれらの活性物質を単一の歯磨きペーストに組み合わせるには、使用時に一緒に絞り出される異なる配合物を使用することが通常は必要とされた。例えば、縞模様の歯磨きペーストが一般的に使用されている。これにより、各活性成分に対して異なるペーストを最適化することができる。そしてこれらは使用前にブラシ上で短時間組み合わせられるだけである。この方法では、組み合わせられた活性物質を含有する単一の歯磨剤が可能となるが、別々の配合物の製造、並びにより複雑なチューブ、格納、及びノズル構成の使用を含む関連コストがないわけではない。

【発明の概要】

【0007】

本発明の目的は、フッ化第一スズと亜鉛塩の両方に対して使用環境まで安定した保存を提供する単相歯磨剤組成物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

【0008】

一態様において、本発明は少なくとも1種の溶媒、フッ化第一スズ、少なくとも1種の亜鉛塩、支持ポリマー、少なくとも1種の界面活性剤、及びカラギーナンを含む単相非水

10

20

30

40

50

性歯磨剤組成物を提供する。

【0009】

本発明の更なる一態様において、少なくとも1種の溶媒はグリセロール、ポリエチレングリコール(PEG)、又はそれらの混合物を含む。

【0010】

本発明の更なる一態様において、少なくとも1種の溶媒はグリセロール30～70重量%及びポリエチレングリコール(PEG)10～30重量%を含む。

【0011】

本発明の更なる一態様において、少なくとも1種の亜鉛塩は塩化亜鉛を含む。

【0012】

本発明の更なる一態様において、少なくとも1種の亜鉛塩は組成物の0.05重量%～1重量%を占める。

【0013】

本発明の更なる一態様において、支持ポリマーはポリアクリル酸(PAA)である。

【0014】

本発明の更なる一態様において、PAAは高分子量PAAポリマーである。

【0015】

本発明の更なる一態様において、支持ポリマーは組成物の0.1～1.5重量%を占める。

【0016】

本発明の更なる一態様において、PEGは1mol当たり380～420グラムのモル質量を有する。

【0017】

本発明の更なる一態様において、カラギーナンは組成物の0.1～1重量%を占める。

【0018】

本発明の更なる一態様において、少なくとも1種の界面活性剤はラウリル硫酸ナトリウム(SLS)及びココミドプロピルベタインを含む群から選択される。

【0019】

本発明の更なる一態様において、組成物はSLS及びココミドプロピルベタインの両方を含む。

【0020】

本発明の更なる一態様において、単相非水性歯磨剤は、

a)52～55重量%のグリセロール、

b)18～22重量%のPEG400、

c)フッ化第一スズ、

d)0.2～0.4重量%の塩化亜鉛、

e)0.6～0.8重量%の高分子量PAAポリマー、

f)1.0～2.4重量%の重量比3:1の界面活性剤ラウリル硫酸ナトリウム及びココアミドプロピルベタイン、並びに

g)0.1～0.4重量%のカラギーナン

を含む。

【0021】

本発明の更なる一態様において、組成物は追加のフッ化物供給源を更に含む。

【0022】

本発明の更なる一態様において、組成物は防汚剤を含む。

【0023】

本発明の更なる一態様において、組成物は歯科用シリカ、増稠性シリカ、香料、着色料、保存料、pH調整剤、レオロジー調整剤、及び研磨剤から選択される1種以上の追加の成分を含む。

【0024】

本発明はまた、歯ブラシと組み合わせて歯を洗浄するための、先行する請求項のいずれ

10

20

30

40

50

かに記載の組成物の使用を含む。

【発明を実施するための形態】

【0025】

本明細書において使用する場合、「歯磨剤」という用語は、個人の口腔の全て又は一部の洗浄又は処置における使用のためのペースト、クリーム、又はゲルの形態のあらゆる半固形調合物を含む。

【0026】

本明細書において使用する場合、「口腔」という用語は、歯肉縁及び/又は歯周ポケットに至るまでの歯を含む全ての歯周領域を含む個人の歯及び歯茎を意味する。

【0027】

本明細書において使用する場合、「非水性」という用語は、無水又は実質的に水を含まないことを意味する。非水性組成物の個々の構成成分は、組成物全体が実質的に水を含まないままである限り、限られた量の水を含有してもよい。本開示の目的では、「非水性」及び「無水」という用語は交換可能であり、同じ意味を有する。

【0028】

本明細書において使用する場合、「単相」という用語は組成物が均質であり、共に配置された2種以上の異なる組成物を含む組成物ではないことを意味する。

【0029】

本発明の組成物は、フッ化第一スズを含む。フッ化第一スズは口腔ケア用途での使用でよく知られている。これは歯肉炎、プラーク形成、及び過敏に対する保護に役立つことが実証されている。

【0030】

フッ化第一スズは水に非常に敏感であり、口内の水の存在下で酸化して分解し、第二スズイオン(Sn^{4+})を形成する。これらの不溶性の塩がフッ化第一スズにその過敏性の利益をもたらすものと考えられている。この塩が、露出した象牙質細管上に保護バリアを形成する。

【0031】

したがって、フッ化第一スズの効能を最大にするために、口腔に到達する前にフッ化第一スズを無水環境に保つ必要がある。

【0032】

市販の歯磨剤中のフッ化第一スズのレベルは規制によって高度に管理されており、世界の様々な地域で異なる。本発明の配合物は、広範囲の様々なレベルのフッ化第一スズに対して安定である。

【0033】

好適には、組成物は0.05重量%~0.5重量%のフッ化第一スズ、例えば0.186重量%(450ppmのフッ化物に相当)、0.382重量%(927ppmのフッ化物に相当)、又は0.454重量%(1150ppmのフッ化物に相当)を含む。

【0034】

本発明の配合物は、最大4重量%のフッ化第一スズを含有することができる。

【0035】

当業者であれば、様々な管轄区域におけるフッ化物レベルの要件がわかるであろう。

【0036】

本発明の非水性歯磨剤組成物は、必要に応じて追加のフッ化物供給源も含んでよい。追加のフッ化物の更なる非限定的な例としては、フッ化ナトリウム、モノフルオロリン酸ナトリウム、フッ化カリウム、フッ化アンモニウム、ビス-(ヒドロキシエチル)アミノ-プロピル-N-ヒドロキシエチルオクタデシルアミン-ジヒドロフルオリド、及びそれらの混合物が挙げられる。

【0037】

好ましくは、フッ化第一スズによって提供される量を超える、配合物で必要とされる任意の追加のフッ化物は、フッ化ナトリウム(NaF)により供給される。

10

20

30

40

50

【0038】

イオン性塩の形態の亜鉛も、口腔衛生製品での使用でよく知られている。これを口腔衛生組成物に添加してプラーク形成を低減し、臭いの原因となる揮発性分子との化学結合により悪臭(口臭)を低減し、歯石形成を抑制する。亜鉛は抗菌性ももたらす。

【0039】

亜鉛塩は経口摂取による毒性が低いため、口腔衛生製品での使用に好都合である。

【0040】

当業者であれば、歯磨剤組成物に使用される様々な形態の亜鉛がわかるであろう。口腔衛生製品に一般的に使用される亜鉛塩の非限定的な例としては、塩化亜鉛、酸化亜鉛、クエン酸亜鉛、硫酸亜鉛、及びグルコン酸亜鉛が挙げられる。

【0041】

塩であるため、これらの生成物は通常、水系配合物で使用される。その理由は、塩のような電荷をもったイオン性構成成分に対して安定な非水性配合物を得ることが非常に難しいからである。

【0042】

本発明の非水性歯磨剤配合物は、0.05～5重量%の亜鉛塩、好ましくは0.1～2.5重量%、最も好ましくは0.2～1.0重量%の亜鉛塩を含んでよい。

【0043】

本発明における亜鉛塩は単一の亜鉛塩を含んでもよく、又は2種以上の異なる亜鉛塩の混合物を含んでもよい。

【0044】

特に好ましい一実施形態において、亜鉛塩は塩化亜鉛を含む。そして好ましくは、塩化亜鉛は0.1重量%～0.5重量%、より好ましくは0.2重量%～0.4重量%存在する。

【0045】

しかしながら、亜鉛塩には欠点もある。これらは効能に必要なレベルでは渋味を与えること、並びに界面活性剤と干渉し、歯磨きペーストの泡立ち及び洗浄力を低下させることが公知である。これらは、無水歯磨剤に配合するのが非常に難しくもある。これらの電荷をもったイオン性の性質により、非水性配合物で不安定となる。

【0046】

本出願人らは、上記の口腔衛生の利益に有効なレベルのフッ化第一スズ及び亜鉛塩の両方に対して安定な無水歯磨剤組成物を意外にも見出した。歯磨剤は消費者に許容される感覚受容性(味及び泡立ち)ももたらす。

【0047】

本出願人らは研究作業中に、いくつかの様々な公知の無水歯磨剤基部(フッ化第一スズの安定性に好適であることが公知である)に単に亜鉛塩を添加しても、受容できない結果となったことを見出した。非常に低いレベルの亜鉛塩を用いても、これらの組成物に添加すると深刻なシネシス及び/又はレオロジーの問題を引き起こした。その結果、外観的な魅力が乏しい又は粘度が乏しいペーストとなるか、あるいは第一スズの受容できない損失を経時的に引き起こす完全に不安定な配合物となる。

【0048】

本出願人らは当初これらの問題を解決することができなかった。公知のゲル化ポリマーと溶媒混合物の組合せを単に入れ替える試みがなされた。いくつかの様々な安定化剤、増稠剤、及び添加剤も試したが成功しなかった。

【0049】

本発明の非水性歯磨剤組成物は、任意の非水性/無水溶媒を含んでよい。

【0050】

少なくとも1種の溶媒と組み合わせて少量のカラギーナンを添加すると、亜鉛及び第一スズイオンを口腔に送達するのに好適な、必要とされる安定且つ有効な無水歯磨剤がもたらされたことが、最終的に意外なことに見出された。

【0051】

特に、カラギーナンを伴ったグリセリンとPEGの溶媒の組合せにより、亜鉛及び第一スズイオンを口腔に送達するのに好適な、必要とされる安定且つ有効な無水歯磨剤がもたらされたことが見出された。

【0052】

本発明の非水性歯磨剤組成物は、主溶媒としてグリセリンを含んでよい。本発明の非水性歯磨剤組成物は、30～70重量%のグリセリンを含有してよい。

【0053】

グリセリンはグリセロール及びグリセリンとしても知られる。これらの用語は本明細書において交換可能に使用することができる。

【0054】

市販のグリセリンはグリセリンを伴っている水を0.1～2.0重量%含有し得ることが周知である。典型的にこの量はグリセリンの0.5重量%未満、例えば0.1～0.5重量%である。この少量の水はグリセリンと結合しており、したがって他の成分には利用できない。当業者であれば、グリセリンを含有する組成物は非水性であると依然として考えるであろう。

【0055】

いずれの場合でも溶媒は可能な限り無水であるべきである。

【0056】

本発明の特に好ましい一実施形態において、単相非水性歯磨剤組成物は52～55重量%のグリセリンを含む。

【0057】

本発明の単相非水性歯磨剤組成物の溶媒はポリエチレングリコール(PEG)も含んでよい。

【0058】

本発明の単相非水性歯磨剤は、10～30重量%のPEGを含んでよい。

【0059】

PEGは、様々な化学及び物理特性を有する様々な鎖長(FW)で得ることができる。本発明の組成物に好適には、ポリエチレングリコールはPEG300、PEG400、及びそれらの混合物から選択されてよい。

【0060】

一実施形態において、ポリエチレングリコールはPEG400を含む。そして別の好ましい実施形態において、PEG400は本発明の非水性歯磨剤組成物の重量の18～22%を占める。

【0061】

本発明の単相非水性歯磨剤の少なくとも1種の溶媒は、グリセリンとポリエチレングリコールの混合物を含んでもよい。好ましくは、2種の溶媒は、重量で1:1～4:1、より好ましくは2:1～3:1、最も好ましくは2.3:1～2.7:1の比(グリセリン:PEG)で存在する。

【0062】

本発明で使用するのに好適な他の追加の溶媒としては、ソルビトール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、又はそれらの混合物が挙げられる。

【0063】

本発明による非水性歯磨剤組成物は、溶媒及び活性物質を固化するための支持(又はゲル化)ポリマーを含む。

【0064】

当業者であれば、歯磨剤に使用するための多くの様々な種類の支持ポリマーがわかるだろう。2つの非限定的な例としては、メチルビニルエーテルと無水マレイン酸のコポリマー、例えばGantrez(登録商標)、及びしばしばカルボマーと呼ばれるポリアクリル酸ホモポリマーが挙げられる。

【0065】

本発明に好適には、支持(又はゲル化)ポリマーはカルボキシビニルポリマー、例えばカ

10

20

30

40

50

ルボマーを含む。

【0066】

カルボマーは、アクリル酸の合成高分子量架橋ポリマーを含む。アクリル酸の繰り返し単位で形成されたポリマー鎖は、例えばアリルスクロース(allyl sucrose)と架橋して、一形態でCarbopol(商標)934として市販されているカルボマーを提供するか;ペンタエリスリトールのエーテルと架橋して、一形態でCarbopol(商標)974として市販されているカルボマーを提供するか;又はジビニルグリコールと架橋して、一形態でNoveon(商標)AA-1として市販されているものを提供することができる。Carbopol(商標)ポリマーは、B.F. Goodrich Companyにより製造されている。

【0067】

一実施形態において、カルボキシビニルポリマーはCarbopol(商標)974を含む。

【0068】

カルボキシビニルポリマーは非水性組成物の約0.1~約7.5重量%の範囲で存在してよい。一実施形態において、カルボキシビニルポリマーは組成物の約0.3~約1.0重量%の量で存在する。

【0069】

本発明の安定な単相非水性歯磨剤配合物は、カラギーナンを含むことを要する。

【0070】

カラギーナンはヤハズツノマタ(Irish Moss)として一般的に知られる紅藻からの抽出物である。この食用海藻はイギリス諸島原産であり、ここで数百年間伝統的な料理に使用されてきた。主に増稠剤及びゲル化剤として食品業界でも広く使用されている。

【0071】

カラギーナンは15~40%のエステル-スルフェート成分を含み、これによりアニオン性多糖である。これらはそのスルフェート含有量に基づいて3つの異なるクラスに主に分類することができる。カップ-カラギーナンは二糖当たり1つの硫酸基、イオタ-カラギーナンは2つ、ラムダ-カラギーナンは3つを有する。

【0072】

本発明の単相非水性歯磨剤組成物は、いずれかの形態のカラギーナンを、個別に又は2つ以上の形態の混合物として、利用することができる。好ましくは本発明の非水性単相歯磨剤組成物はイオタ-カラギーナンを含み、より好ましくは本発明の非水性単相歯磨剤組成物のカラギーナン成分はイオタカラギーナン形態のみを含む。

【0073】

本発明の単相無水組成物は、安定な歯磨剤組成物の形成を可能にするために、0.05~2重量%のカラギーナンを含む。

【0074】

好ましくは、カラギーナンは単相非水性歯磨剤組成物の0.1~1重量%、より好ましくは0.2~0.5重量%を占める。

【0075】

カラギーナンに追加して他のゲル化安定剤も使用してよいが、カラギーナンの代替としてではない。使用してもよい増稠性ガムの他の非限定的な例としては、例えば限定するものではないがキサンタンガム、レシチン、グアーガム、ジェランガム、ローカストビーンガム(イナゴマメガム)、及びアラビアガム(アカシアガム)が挙げられる。

【0076】

本発明による単相非水性歯磨剤組成物は、少なくとも1種の界面活性剤を含む。少なくとも1種の界面活性剤は、単一の界面活性剤を含んでもよい。あるいは、少なくとも1種の界面活性剤は、第1の界面活性剤と第2の界面活性剤の混合物を含んでもよい。あるいは、少なくとも1種の界面活性剤は、第1の界面活性剤、第2の界面活性剤、及び第3の界面活性剤、及び/又は更なる界面活性剤の混合物を含んでもよい。

【0077】

本発明による組成物に使用するのに好適な界面活性剤は、ベタインとして知られる化合

10

20

30

40

50

物のクラスに属する。構造的に、ベタイン化合物は、メチレン部分によって分離された、アニオン性官能基（例えばカルボキシレート官能基）及びカチオン性官能基（例えば第四級窒素官能基）を含む。ベタイン化合物としては、n-アルキルベタイン、例えばセチルベタイン及びベヘニルベタイン、並びにn-アルキルアミドベタイン、例えばココアミドプロピルベタインが挙げられる。

【0078】

一実施形態において、ベタインは商品名Tego Betain(登録商標)で市販されているココアミドプロピルベタインである。

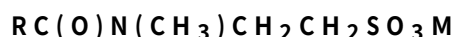
【0079】

好適には、ベタインは単相非水性組成物の約0.05～約4重量%、例えば約0.2～約2.0重量%、より好ましくは非水性組成物の約0.3～約0.6重量%の範囲の量で存在する。

10

【0080】

本発明による単相非水性歯磨剤組成物に使用するための別の界面活性剤は、タウレート系界面活性剤から選択される。本発明において有用なタウレート界面活性剤は、N-メチルタウリンの脂肪酸アミドの塩である。これらは構造式：



(式中、RC(O)-は脂肪酸基を表し、Mはナトリウム、カリウム、アンモニウム、又はトリエタノールアミンを表す)

に一般に適合する。ヤシ油、パーム油、及びトール油由来のものを含む、10～20の炭素鎖長を有する脂肪酸が使用される。一実施形態において、脂肪酸はココナツ由来である。

20

一実施形態において、ナトリウム塩が使用される。

【0081】

一実施形態において、タウレートはココイルメチルタウリンナトリウムである。このタウレート界面活性剤はCrodaからAdinol(登録商標)CTの商標で販売されている。

【0082】

タウレート界面活性剤は、無水歯磨剤組成物の約0.1～約10%の量で存在してよい。一実施形態において、タウレート界面活性剤は非水性組成物の約0.1～約5重量%の量で存在する。一実施形態において、タウレート界面活性剤は非水性組成物の約0.5～約2.0重量%の量で存在する。

【0083】

30

本発明に好適な別のクラスの界面活性剤は、以下の構造式：



(R¹は脂肪アルコール部分を表し、Mはナトリウム、カリウム、アンモニウム、又はトリエタノールアミンを表す。)

のアルキルスルフェート界面活性剤である。ヤシ油、パーム油、及びトール油由来のものを含む約10～約20の炭素鎖長を有する脂肪アルコール。一実施形態において、脂肪アルコールはラウリルアルコールである。一実施形態において、ナトリウム塩が使用される。

【0084】

一実施形態において、アルキルスルフェートはラウリル硫酸ナトリウムである。

【0085】

40

アルキルスルフェート界面活性剤は非水性組成物の約0.1～約10%の量で存在してよい。一実施形態において、アルキルスルフェート界面活性剤は非水性歯磨剤組成物の約0.1～約5重量%の量で存在してもよい。

【0086】

一実施形態において、アルキルスルフェート界面活性剤は、非水性組成物の約0.5～約2.0重量%の量で存在する。

【0087】

ある特定の実施形態において、少なくとも1種の界面活性剤は、C₁₀₋₂₀アルキルスルフェート界面活性剤である第1の界面活性剤及びベタインからなる第2の界面活性剤を含む。好ましくは、第1の界面活性剤はラウリル硫酸ナトリウム(SLS)であり、第2の界面

50

活性剤はコカミドプロピルベタインである。

【0088】

好ましくは、SLSとコカミドプロピルベタインの比は重量で2:1～4:1である。最も好ましくは、SLS対コカミドプロピルベタインの比は約3:1である。

【0089】

特に好ましい一実施形態において、SLSは非水性歯磨剤組成物の1.0～1.4重量%を占め、コカミドプロピルベタインは非水性歯磨剤組成物の0.3～0.5重量%を占める。

【0090】

本発明の例示的な単相非水性歯磨剤は、表1に記載される組成物を含むことができる。

【0091】

【表1】

表1

成分	機能	% w/w
グリセリン	配合溶媒	30-70 %
ポリエチレングリコール	配合溶媒	10-30 %
少なくとも1種の界面活性剤	界面活性剤	0.1-5 %
亜鉛塩	活性物質	>0.05%
フッ化第一スズ	活性物質	>0.05%
支持ポリマー	安定化剤	0.2-2.0 %
カラギーナン	安定化剤	0.1-1.0 %
任意選択の成分	複数の機能	0.1-25 %

【0092】

任意選択の成分

本発明の単相非水性組成物は歯磨剤配合物に従来使用されている1種以上の口腔ケア活性剤も追加的に(任意選択で)含有してよい。

【0093】

当業者であれば、歯磨剤配合物に添加して有益な特性をもたらす又は調整することができる非常に多くの追加の成分がわかるだろう。

【0094】

このような薬剤としては、非限定的な例として、減感剤、歯石防止剤、侵食防止剤、pH調整成分、レオロジー調節試薬、抗菌剤、プラーク防止剤、ホワイトニング剤、口腔悪臭剤、又はこれらの混合物を挙げることができる。

【0095】

非水性組成物に、歯科的に許容される研磨剤を任意選択で添加してもよい。有利には、歯科的に許容される研磨剤の存在又は非存在、及びそのような研磨剤の量を用いて、本発明の非水性組成物を用いて作製された歯磨剤組成物の研磨性(abrasivity)を選択的に制御してよい。更なる例としては、所望の量の歯科的に許容される研磨剤を添加して、非水性組成物全体の研磨性を向上させてよい。

【0096】

非水性組成物に使用するのに好適な研磨剤としては、例えば非晶質シリカ、ゲル化シリカ、沈降シリカ、若しくはヒュームドシリカ、オルトリン酸亜鉛、炭酸水素ナトリウム(重曹)、プラスチック粒子、アルミナ、アルミナ水和物、炭酸カルシウム、ピロリン酸カルシウム、不溶性メタリン酸塩、又はそれらの混合物が挙げられる。

【0097】

シリカ研磨剤は、天然非晶質シリカ、例えば珪藻土;又は合成非晶質シリカ、例えば沈降シリカであってよい。例としては、シリカ研磨剤としてはHuber、Degussa、Ineos

、及びRhodiaからそれぞれZeodent、Sident、Sorbosil、又はTixosilの商品名で販売されているものが挙げられる。

【0098】

好適には、シリカ研磨剤は全組成物の最大25重量%、例えば全組成物の2~20重量%、例えば5~15重量%の量で存在する。

【0099】

一般に、本発明の非水性組成物中で使用するのに好適な研磨剤の量は、当技術分野で周知の技術に従って許容されるレベルの洗浄及び研磨を提供するように経験又は実験により決定される。好適には、研磨剤は非水性組成物の約0~約60重量%、典型的には約5~約30重量%の量で存在する。

【0100】

ポリリン酸塩は歯石形成を遅らせるのに役立つことが知られており、本発明での使用に好適な歯石防止剤の例である。ポリリン酸塩は主に直鎖配列で配置された2個以上のリン酸基からなると一般に理解されるが、いくつかの環状誘導体が存在することがある。本発明で使用するポリリン酸塩としては、ピロリン酸塩、3個以上のポリリン酸基を有するポリリン酸塩、例えばトリポリリン酸ナトリウム(STP)、並びに4個以上のポリリン酸基を有するポリリン酸塩、例えば特にテトラポリリン酸塩及びヘキサメタリン酸塩が挙げられる。

【0101】

例えばWO 02/15809(Block)に記載されている細管ブロック剤(tubule blocking agent)又は神経減感剤及びそれらの混合物を含む減感剤が本発明による組成物に含まれてもよい。そのような更なる任意選択の減感剤としてはストロンチウム塩、例えば塩化ストロンチウム、酢酸ストロンチウム、若しくは硝酸ストロンチウム、又はカリウム塩、例えばクエン酸カリウム、塩化カリウム、炭酸水素カリウム、グルコン酸カリウム、及び特に硝酸カリウムが挙げられる。減感剤は生体活性ガラスも含んでよい。

【0102】

本発明の組成物は侵食防止剤、例えばWO 04/054529(Procter & Gamble)に記載されている高分子ミネラル表面活性剤を更に含んでよい。

【0103】

本発明の組成物は、香味剤、甘味剤、不透明化又は着色剤、及び保存料等の、口腔保健衛生組成物の技術分野でこのような目的のために従来使用されているものから選択される追加の配合剤を含有してよい。

【0104】

一般に、任意選択の薬剤はわずかな量又は配合物全体のわずかな割合で使用してよい。例としては、そのような構成成分は通常、非水性組成物の約0.001~約5重量%で存在する。そのような構成成分の合計は組成物の0.1~25重量%の範囲であってよい。

【0105】

歯磨剤組成物は、典型的に、口腔への適用に好適な粘度を有する。粘度は作製される歯磨剤組成物の種類及びその最終的な使用により異なる。当業者であれば、本明細書で提供される教示から、口腔での使用に好適な粘度を有する組成物を容易に調製することができる。

【0106】

好適には、本発明による組成物は無機増稠剤、例えば増稠性シリカを更に含んでよい。好適には、増稠剤は、増稠性シリカ、例えばSident 22S又はSyloid 244FPとして市販されている、例えばコロイド状含水シリカである。

【0107】

一実施形態において、増稠性シリカは非水性組成物の約0~約15重量%、好適には約5.0~約15.0重量%の範囲で存在する。

【0108】

本発明による組成物は、適切な相対量の成分を任意の好都合な順序で混ぜることによっ

10

20

30

40

50

て調製してよい。

【0109】

本発明による単相非水性歯磨剤組成物は弱酸性、中性、又は弱アルカリ性であってよく、すなわち6.0～7.5の範囲、例えばpH6.1～7.4、6.2～7.3、又は6.2～7.2の範囲のスラリーpHを有する。一実施形態において、組成物は約6.2のpHを有する。更なる一実施形態において、組成物は約7.0のpHを有する。言及されたpHは、歯磨剤組成物と水との重量比1:3で歯磨剤組成物を水でスラリー化したときに測定されるものである。好適には、歯磨剤組成物1部と蒸留水3部の重量比で歯磨剤組成物を水でスラリー化することによりスラリーを調製する。pHは標準的なpHメーターを用いて決定する。

【0110】

表2には本発明の非水性歯磨剤組成物の好ましい一般的な配合が記載されている。

【0111】

【表2】

表2

成分	機能	% w/w
グリセリン	配合溶媒	52-55 %
ポリエチレングリコール400	配合溶媒	18-22 %
SLS:ベタイン(3:1)	界面活性剤	1-3 %
シリカ	増稠剤/研磨剤	10-25 %
STP	歯石防止剤	3-8 %
フッ化第一スズ	活性物質	0.1-1 %
塩化亜鉛	活性物質	0.1-1 %
カルボマーホモポリマー	安定化剤	0.4-1.5 %
カラギーナン	安定化剤	0.1-0.5 %
任意選択の成分	複数の機能	1-10 %

【0112】

本発明の非水性歯磨剤組成物は長期間にわたって安定である。組成物は全て40℃及び相対湿度75%の条件下で3か月間安定であった。安定とは、配合物に目に見える分解又はストレスの徴候がなく、活性物質のレベルが維持されていることを意味する。

【0113】

本発明の非水性歯磨剤組成物の特定の一例を表3に示す。

【0114】

10

20

30

40

50

【表 3】

表 3

成分	機能	% w/w
グリセリン	配合溶媒	53.715 %
PEG (Macrogol 400)	配合溶媒	20.00 %
二酸化ケイ素(Sident 225)	増稠剤	8.00 %
含水シリカ(Zeodent 124)	増稠剤	7.50 %
STP	歯石防止剤	5.0 %
ラウリル硫酸ナトリウム(SLS)	界面活性剤	1.10 %
二酸化チタン	不透明化剤	1.0 %
カルボマーホモポリマー(Carbopol 971)	安定化剤/ポリマー	0.70 %
カラギーナン	安定化剤	0.25 %
NaF	活性物質	0.0721 %
フッ化第一スズ	活性物質	0.454 %
コカミドプロピルベタイン	界面活性剤	0.36 %
塩化亜鉛	活性物質	0.3 %
着色料	着色料	0.003 %
甘味料	甘味料	0.35 %
香料	香料	1.20 %

10

20

30

40

50

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/083049

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER					
INV.	A61K8/19	A61K8/20	A61K8/27	A61K8/34	A61K8/44
	A61K8/46	A61K8/73	A61K8/81	A61Q11/00	
ADD.					
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC					
B. FIELDS SEARCHED					
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)					
A61K A61Q					
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched					
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)					
EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data					
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT					
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages				Relevant to claim No.
X	US 2003/124067 A1 (YUE JIANG [CN] ET AL) 3 July 2003 (2003-07-03)				1-3, 8-11, 14-17
Y	example 4 paragraphs [0003], [0028] paragraph [0058] paragraph [0040] -----				1-17
X	WO 2007/076001 A2 (PROCTER & GAMBLE [US]; GLANDORF WILLIAM MICHAEL [US]; WANG XIAOLI [CN]) 5 July 2007 (2007-07-05)				1-3, 8-11, 14-17
Y	example IG ----- -/--				1-17
☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.					
* Special categories of cited documents :					
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance			"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention		
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date			"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone		
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)			"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art		
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means			"&" document member of the same patent family		
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed					
Date of the actual completion of the international search			Date of mailing of the international search report		
15 March 2023			31/03/2023		
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016			Authorized officer Krattinger, B		

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/083049

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 2003/206874 A1 (DOYLE MATTHEW JOSEPH [US] ET AL) 6 November 2003 (2003-11-06)	1-3, 8-11, 15-17
Y	examples 3D, 3E paragraph [0009] paragraph [0118] -----	1-17
X	US 2021/000721 A1 (STRAND ROSS [SG] ET AL) 7 January 2021 (2021-01-07)	1-3, 8-11, 15-17
Y	example 6 paragraph [0013] paragraph [0067] -----	1-17
X	WO 2008/041055 A1 (PROCTER & GAMBLE [US]; GLANDORF WILLIAM MICHAEL [US] ET AL.) 10 April 2008 (2008-04-10)	1-3, 8-11, 15-17
Y	examples IIA, IIB, IID page 2, line 18 - page 3, line 8 -----	1-17
X	US 2016/324738 A1 (BAIG ARIF ALI [US] ET AL) 10 November 2016 (2016-11-10)	1-3, 8-11, 15-17
Y	paragraph [0107] examples 5A, 5B, 5D paragraphs [0003], [0017] -----	1-17
Y	US 2018/078475 A1 (HODGKINSON JOHN [GB]) 22 March 2018 (2018-03-22) claims 1-4; examples 2-3, study 3 -----	1-17
Y	WO 2018/114825 A1 (GLAXOSMITHKLINE CONSUMER HEALTHCARE UK IP LTD [GB]) 28 June 2018 (2018-06-28) claim 1 example 9 -----	1-17
X	US 2011/104080 A1 (SALLOUM DAVID SALLOUM [US] ET AL) 5 May 2011 (2011-05-05) examples A, B -----	1-3, 8-11, 15-17
X	DATABASE GNPD [Online] MINTEL; 19 February 2021 (2021-02-19), anonymous: "Fluoride Toothpaste", XP093031512, Database accession no. 8502307	1, 5, 8, 10, 11, 14-17
Y	paragraph [ingredients] -----	1-17
	----- -/--	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2022/083049

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X, P	DATABASE GNPD [Online] MINTEL; 17 March 2022 (2022-03-17), anonymous: "Sensitivity & Breathe Fluoride Toothpaste", XP093031529, Database accession no. 9461308 paragraph [ingredients] -----	1-17

2

10

20

30

40

50

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2022/083049

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 2003124067 A1	03-07-2003	AT 469633 T	15-06-2010
		AU 2002346395 A1	10-06-2003
		CA 2468606 A1	05-06-2003
		CN 1592605 A	09-03-2005
		EP 1448159 A2	25-08-2004
		ES 2346856 T3	21-10-2010
		HK 1074790 A1	25-11-2005
		JP 4800576 B2	26-10-2011
		JP 2005510538 A	21-04-2005
		MX PA04005066 A	19-08-2004
		PL 209407 B1	31-08-2011
		RU 2275946 C2	10-05-2006
		US 2003124067 A1	03-07-2003
		WO 03045344 A2	05-06-2003
WO 2007076001 A2	05-07-2007	AU 2006331526 A1	05-07-2007
		BR PI0620220 A2	01-11-2011
		CA 2634758 A1	05-07-2007
		CN 101330900 A	24-12-2008
		EP 1962787 A2	03-09-2008
		JP 2009520829 A	28-05-2009
		KR 20080070757 A	30-07-2008
		WO 2007076001 A2	05-07-2007
US 2003206874 A1	06-11-2003	NONE	
US 2021000721 A1	07-01-2021	AU 2018415260 A1	10-09-2020
		BR 112020017909 A2	22-12-2020
		CA 3095057 A1	03-10-2019
		CN 111989083 A	24-11-2020
		EP 3773452 A1	17-02-2021
		JP 7058342 B2	21-04-2022
		JP 2021516246 A	01-07-2021
		US 2019298634 A1	03-10-2019
		US 2020146957 A1	14-05-2020
		US 2021000721 A1	07-01-2021
WO 2008041055 A1	10-04-2008	WO 2019183887 A1	03-10-2019
		AU 2006349144 A1	10-04-2008
		BR PI0622151 A2	08-07-2014
		CA 2663913 A1	10-04-2008
		CN 101511327 A	19-08-2009
		EP 2068814 A1	17-06-2009
		JP 2010505760 A	25-02-2010
		RU 2009111321 A	10-11-2010
US 2016324738 A1	10-11-2016	WO 2008041055 A1	10-04-2008
US 2016324738 A1	10-11-2016	US 2016324738 A1	10-11-2016
		US 2016324741 A1	10-11-2016
US 2018078475 A1	22-03-2018		
		AU 2012293696 A1	27-02-2014
		BR 112014002403 A2	17-01-2017
		CA 2842519 A1	14-02-2013
		EP 2741826 A2	18-06-2014
		ES 2668668 T3	21-05-2018
		JP 6339937 B2	06-06-2018
		JP 2014521707 A	28-08-2014
		PL 2741826 T3	31-08-2018

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2022/083049

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		RU 2742133 C1	02-02-2021
		RU 2014101248 A	20-09-2015
		US 2014186274 A1	03-07-2014
		US 2018078475 A1	22-03-2018
		US 2020188264 A1	18-06-2020
		US 2021220242 A1	22-07-2021
		WO 2013020960 A2	14-02-2013
		ZA 201400330 B	30-03-2022

WO 2018114825 A1	28-06-2018	EP 3558217 A1	30-10-2019
		JP 7152402 B2	12-10-2022
		JP 2020502191 A	23-01-2020
		US 2019314647 A1	17-10-2019
		WO 2018114825 A1	28-06-2018

US 2011104080 A1	05-05-2011	AU 2010315380 A1	31-05-2012
		BR 112012010455 A2	08-03-2016
		CN 102596158 A	18-07-2012
		EP 2496205 A2	12-09-2012
		US 2011104080 A1	05-05-2011
		WO 2011056759 A2	12-05-2011

フロントページの続き

(51)国際特許分類	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 8/46 (2006.01)	A 6 1 K 8/46	
A 6 1 K 8/44 (2006.01)	A 6 1 K 8/44	
A 6 1 K 8/73 (2006.01)	A 6 1 K 8/73	
A 6 1 Q 11/00 (2006.01)	A 6 1 Q 11/00	

MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,N
E,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,
CV,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,I
T,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,
MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,
SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

イギリス国 ケーティー 1 3 0 エヌワイ サリー ウェイブリッジ, ザ ハイツ 5

(72)発明者 ウェブスター, コリンヌ

イギリス国 ケーティー 1 3 0 エヌワイ サリー ウェイブリッジ, ザ ハイツ 5

F ターム (参考) 4C083 AB171 AB172 AB211 AB212 AB242 AB331 AB471 AB472 AC121 AC122
AC711 AC712 AC781 AC782 AD041 AD042 AD091 AD092 AD351 AD352 BB21
BB41 BB44 BB48 CC41 DD22 DD28 EE01