(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号

特許第4568182号
(P4568182)

(45)発行日　平成22年10月27日(2010.10.27)　(24)登録日　平成22年8月13日(2010.8.13)

(51)Int.Cl.			F I	
A61K	6/08	(2006.01)	A61K	6/08
A61K	6/02	(2006.01)	A61K	6/02
A61K	6/027	(2006.01)	A61K	6/027
A61K	6/087	(2006.01)	A61K	6/087
A61K	8/97	(2006.01)	A61K	8/97

請求項の数 14　外国語出願　(全 9 頁)　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2005-194368 (P2005-194368)
(22)出願日　平成17年7月1日 (2005.7.1)
(65)公開番号　特開2006-16396 (P2006-16396A)
(43)公開日　平成18年1月19日 (2006.1.19)
審査請求日　平成18年5月26日 (2006.5.26)
(31)優先権主張番号　10/884390
(32)優先日　平成16年7月2日 (2004.7.2)
(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　ファーマシューティカルズ　インコーポレイティッド
ＳＣＩＥＮＴＩＦＩＣ　ＰＨＡＲＭＡＣＥＵＴＩＣＡＬＳ，　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　Ｐｏｍｏｎａ，　ＣＡ　９１７６８－３９１６　ＵＳＡ
(74)代理人　100065215
弁理士　三枝　英二
(74)代理人　100076510
弁理士　掛樋　悠路

最終頁に続く

(54)【発明の名称】う蝕予防用の知覚鈍麻およびフッ素化処理歯科用バーニッシュ

(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

知覚過敏（tooth sensitivity）の予防または軽減および／または、う蝕の発生率低下のための歯科用バーニッシュであって、

グリセロール又はペンタエリスリトールによってエステル化されているエステル化ロジンおよび

少なくとも１つのＣ$_2$～Ｃ$_4$脂肪族アルコールと少なくとも１つのＣ$_5$～Ｃ$_7$炭化水素を含む溶媒を含み、

上記エステル化ロジンの含有量が２０～７５重量％である、歯科用バーニッシュ。

【請求項２】

前記エステル化ロジンが、修飾されていないまたは部分的に重合したロジン或いは他のロジン誘導体との混合物で存在する請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項３】

前記溶媒がエチルアルコールと、ｎ－ヘキサンまたはその異性体或いはそれらの混合物との共沸または共沸様混合物である請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項４】

前記溶媒がイソプロピルまたはプロピルアルコールと、ｎ－ヘキサンまたはその異性体或いはそれらの混合物との共沸または共沸様混合物である請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項５】

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一群から選択されたフッ化物塩を０．１～１０重量％含む請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項６】

前記溶媒が大気圧下で１００℃よりも低い沸点を持つ請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項７】

さらに着色剤を含む請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項８】

さらに甘味料やフレーバーのような感覚増強剤を含む請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項９】

さらに無機および／または有機充填材を含む請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項１０】

前記無機充填材がシリカである請求項９に記載のバーニッシュ。

【請求項１１】

さらに１～２０重量％の他の天然または合成樹脂を含む請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項１２】

前記ロジンがさらにコロホニウム、コーパルおよび／またはクマロン樹脂を含む請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項１３】

前記樹脂がポリアミドを含む請求項１に記載のバーニッシュ。

【請求項１４】

前記ポリアミドが脂肪族ジアミンと脂肪酸の反応生成物である請求項１３に記載のバーニッシュ。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

発明の分野

本発明は歯科用バーニッシュ、より詳細には歯をシール（seal）するために使用される樹脂と溶媒を含むバーニッシュに関する。

【背景技術】

【０００２】

発明の背景

最も古いタイプの歯科用バーニッシュは、化石化した植物由来の採掘材料であるコーパル樹脂を塩素化炭化水素中、後にアルコール中に含む溶液を含んでいた。これらのバーニッシュは、殆ど例外なくアマルガムタイプの修復材の装着前にキャビティ壁上のコーティング材として使用されていた。それらは、新規の樹脂を基にした修復材下での使用には適さなかった。なぜなら、コーパル樹脂は重合過程の阻害剤として働き、修復材料の硬化と結果的に修復材の質に悪影響を及ぼすからである。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、さらに生活歯の場合は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通常優れているが、歯のフッ素化処理といった便宜を与えていなかったため、歯組織の二次う蝕に対して重要で追加的な保護手段を備えていなかった。

【０００３】

コーパル樹脂を基にしたバーニッシュに、脂肪族ジアミンと長鎖カルボン酸の反応生成物として代表されるポリアミド系ポリマーに主として基づい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米国特許第４３９６３７８号に記載されている。合成バーニッシュは通常、樹脂を基にした修復材料の重合過程を阻害しないため、アマルガム下と同様にポリマー修復材下の使用にも適していた。それらは、軽稠度、低粘度性のために、懸

濁液中にフッ化物塩を保持することができなかった。従って、それらの役割は象牙質細管をシール（seal）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化処理するといった便宜をもたらさなかった。

【０００４】

もうひとつのタイプの歯科用バーニッシュは、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、歯の化学的性質に有益な変化をもたらし、知覚過敏（tooth sensitivity）を軽減し、さらに傷を受けやすい口腔組織を歯科材料との接触に起因する潜在的に有害な副作用から保護する。

【０００５】

現在の歯科用バーニッシュに使用され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。最もよく知られる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ウム樹脂を、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。コロホニウムは生きた木に由来する天然樹脂であるため、その特性は樹脂のロットごとにしばしば異なる。その違いには、そのような樹脂を用いて作られた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多くの場合に含まれる。望ましいバーニッシュのコンシステンシーは塗膜を適切な膜厚に仕上げ、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。これらバーニッシュの他の不都合な点には、溶媒の放出が遅いことに起因した遅い硬化と不快な味が含まれる。

【特許文献１】米国特許第２，６３０，３９７号
【特許文献２】米国特許第２，７８８，２８７号
【特許文献３】米国特許第３，０８１，２２７号
【特許文献４】米国特許第４，３９６，３７８号
【特許文献５】米国特許第３，０８７，９０４号
【特許文献６】米国特許第３，２６６，１４７号
【特許文献７】米国特許第３，４６９，３１７号
【特許文献８】米国特許第３，８６８，４４７号
【特許文献９】米国特許第４，２４０，８３２号
【特許文献１０】米国特許第４，３０８，０６２号
【特許文献１１】米国特許第５，２１３，６１５号
【特許文献１２】米国特許第５，３３０，７４６号
【特許文献１３】米国特許第５，５５８，７０１号

【発明の開示】

【課題を解決するための手段】

【０００６】

発明の要旨

一実施形態に従って、知覚過敏（tooth sensitivity）の予防または軽減および／またはう蝕発生率を減少させるための歯科用バーニッシュを提供する。ここで該バーニッシュは、フィルム形成をする樹脂または樹脂混合物と、少なくとも一つのC_2～C_4脂肪族アルコールと少なくとも一つのC_5～C_7の炭化水素を好ましく含む溶媒を含む。該樹脂混合物は天然ロジン、酸修飾されたロジン、部分的に重合したロジンとこれらの組み合わせを含むことが好ましい。好ましくは、少なくとも一つのロジンがエステル化されたロジンである。一つの好適な実施形態においては、該ロジンが一つ以上の例えばグリセロールやペンタエリスリトールといった多価アルコールによってエステル化されている。一実施形態において、該溶媒が共沸または共沸様の、エチルアルコールとｎ－ヘキサンを含むがこれに限定されない溶媒の混合物を含む。

【０００７】

好ましい実施形態の詳細説明

本発明の主題は、先行技術材料の全ての利点と機能を保持する一方で、それらの問題点を完全に解消する新しいタイプの歯科用バーニッシュである。

【０００８】
ここに開示される配合物中の樹脂／フィルム形成成分中には、ロジンと多価アルコールとのエステル（グリセロールやペンタエリスリトールとのものを含む）がある。植物由来の天然生産物であるロジンは多くの歯科用製品、特にテンポラリーセメントや充填修復材料によく用いられる成分である。エステル化によるロジンの化学的加工の結果、望ましい一貫した特徴のある生産物が得られる。このようなエステルのうちの幾つかが、C_2～C_4アルコールに溶解し、そしてそれらのC_5～C_7炭化水素との混合物には更に良く溶解するということは予想外の発見であった。
【０００９】
一実施形態において、該溶媒成分はアルコールと炭化水素の混合物を含む共沸または共沸様混合物である。このような混合物中のロジンエステル溶液は、結果的に速硬性且つ刺激性の無いバーニッシュとなる。下表中に示されているアルコールと炭化水素の混合物はバーニッシュの配合に適した共沸または共沸様混合物に含まれる。該表中に与えられた相対重量は与えられた沸点における共沸混合物にのみ関連し、バーニッシュ配合物中のアルコールと炭化水素の絶対または相対量を制限することを意図するのではない。バーニッシュ配合物は下記の溶媒と溶媒の組み合わせ、並びに共沸または共沸様混合物でない他の溶媒を使用した溶媒混合物を含んでもよい。一つの好ましい実施形態において、バーニッシュに用いられる溶媒混合物は約１００℃よりも低い沸点を持つ。
【００１０】

【表１】

アルコール／炭化水素の共沸混合物の例

アルコール	炭化水素 共溶媒	百分率（w/w） アルコール	共沸点(℃)
イソプロピルアルコール	イソペンタン	5	27.8
	ｎ－ペンタン	6	35.5
	ｎ－ヘキサン	23	62.7
	シクロヘキセン	37	70.5
	シクロヘキサン	33	68.6
	ｎ－ヘプタン	50.5	76.4
	メチルシクロヘキサン	47.5	77.4
	２，５－ジメチルヘキサン	62	79.0
ｎ－プロピルアルコール	ｎ－ヘキサン	4	65.6
	シクロヘキサン	20	74.3
	ｎ－ヘプタン	38	84.8
エチルアルコール	ｎ－ペンタン	5	34.3
	ｎ－ヘキサン	21	58.7
	シクロヘキサン	30	64.9
	ｎ－ヘプタン	49	70.9
ｎ－ブチルアルコール	シクロヘキセン	5	82.0
	シクロヘキサン	4	79.8
	メチルシクロヘキサン	21	96.4
	１－ヘプテン	13	90.0
	ｎ－ヘプタン	18	94.4
イソブチルアルコール	ｎ－ヘキサン	2.5	68.3
	シクロヘキセン	14.2	80.5
	シクロヘキサン	14	78.1
	メチルシクロヘキサン	30	93.2
	ｎ－ヘプタン	27	90.8
ｓｅｃ－ブチルアルコール	ｎ－ヘキサン	8	67.2
	シクロヘキセン	18	76.0
	シクロヘキサン	21	78.7
	ｎ－ヘプタン	38	89.0

【００１１】

コロホニウムと異なり、エステル化されたロジンは非常に望ましい淡色で存在し、歯に装着後、実質的に目に見えないバーニッシュを作ることを可能にする。これは特定の臨床応用において非常に望ましい特徴である。

【００１２】

ロジンエステル、特にグリセロールとペンタエリスリトールをエステル化用のアルコールとして使用したものは、完成した配合物中での重量で２０％～７５％濃度において、望ましい粘性溶液を配合することができる。このような配合物は溶媒の速放性に、被覆剤としての優れた機械的特性を兼ね備えた特徴を有する。このようなフィルムからのフッ化物

の放出（または浸出）は非常に優れており、先行技術のコロホニウムバーニッシュのものに格段に勝ることもまた発見された。

【００１３】

好適な実施形態において、該バーニッシュは溶媒系にフィルム形成性樹脂または樹脂混合物を含む。好ましいフィルム形成性樹脂には天然ロジン、酸修飾ロジン、部分的に重合したロジンとこれらの組み合わせが含まれる。該ロジンの一部もしくは全体がアルコール、好ましくはグリセロールやペンタエリスリトールおよび／またはアルキレングリコールのような多価アルコールによってエステル化されていてもよい。バーニッシュが少なくとも約２０重量%のロジンを含むことが望ましく、これは約３０%、約３５%、約４０%、約４５%、約５０%、約５５%、約６０%、約６５%、約７０%および約７５%を含み、またこれら列挙した百分率の間の値、並びに例えば約３０～７０%といった列挙した百分率で両端を挟まれた範囲を含む。一実施形態において、該樹脂混合物は、コロホニウム、クマロン、コーパル、そしてポリアミド樹脂を含むがこれらに限定されない一つ以上の他の天然または合成樹脂を含む。このような他の樹脂は、約１～２０%存在することが望ましく、これは約５%、約１０%および約１５%を含み、これら列挙した百分率の間の値、並びに列挙した百分率に両端を挟まれた範囲を含む。好ましいポリアミドには脂肪族ジアミンと脂肪酸の反応生成物であるものが含まれる。

【００１４】

好ましい溶媒系はアルコールと炭化水素を含む。一つの好適な実施形態において、該溶媒系は共沸また共沸様のこれらの成分の混合物を含む。溶媒系に使用する好ましいアルコールにはC_2～C_4アルコールが含まれ、これはC_3アルコールを含み、ここで前記アルコールは直鎖、枝分かれおよび／または環状のいずれでもよい。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と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、イソブチルアルコール、そしてｔ－ブチルアルコールを含む）、そしてこれらの混合物が含まれる。

【００１５】

好ましい炭化水素にはC_6炭化水素化合物を含むC_5～C_7炭化水素が含まれ、ここで前記炭化水素は直鎖、枝分かれ、および／または環状のいずれでもよく、さらにアルカンおよび／またはアルケンでもよい。該炭化水素成分は、単一の炭化水素または二つ以上の炭化水素の混合物を含んでもよい。特に好ましい炭化水素には、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－ヘプテンとこれらの混合物が含まれる。該溶媒混合物はC_5～C_7範囲外の炭化水素を含んでもよい。

【００１６】

一つの好適な実施形態において、該バーニッシュは少なくとも約１５重量%の溶媒を含み、これは約１８%、約１９%、約２０%、約２１%、約２２%、約２３%、約２４%、約２５%、約３０%および約３５%を含み、またこれら列挙した百分率の間の値、並びに列挙した百分率で両端を挟まれた範囲を含む。一つの好適な実施形態において、該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、これは約５%、約６%、約７%、約８%、約９%、約１０%、約１１%、約１２%、約１３%および約１４%を含み、またこれら列挙した百分率の間の値、並びに列挙した百分率に両端を挟まれた範囲を含む。一つの好適な実施形態において、該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、これは約１１%、約１２%、約１３%、約１４%、約１５%、約１６%、約１７%、約１８%、約１９%および約２０%を含み、またこれら列挙された百分率の間の値、並びに列挙された百分率に両端を挟まれた範囲を含む。本発明の特定の実施形態は、列挙した濃度のよりも大きいまたは小さい濃度で存在する成分を含み得る。

【００１７】

該バーニッシュ配合物は必要に応じてフッ素化剤を含む。好ましいフッ素化剤にはフッ

化ナトリウム、フッ化スズ、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、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウムが含まれる。フッ素化剤が存在する場合は、約０．１～１０重量％であることが望ましく、これは少なくとも約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％を含み、またこれらの列挙した百分率の間の値、並びに例えば約２．５％～６％や約３～５％のように列挙した百分率に両端を挟まれた範囲を含む。

【００１８】

該バーニッシュ配合物は必要に応じて次のものを一つ以上含む：甘味料、例えばキシリトール、ソルビトール、アスパルテーム、サッカリンナトリウムそしてこれらの混合物；矯味矯臭剤（flavorings）、例えばペパーミントオイル、チェリー、クエン酸、オレンジ、ストロベリー、バニラ、ココナッツ、バブルガムフレーバーそしてこれらの混合物；着色剤；そして有機および／または無機の充填材または増粘剤。甘味料が存在する場合は約０．５～３重量％存在することが望ましく、これは重量で、約１％、１．５％、２％および２．５％、またはバーニッシュの口当たりのよさを改善するのに十分な他の量を含む。矯味矯臭剤が存在する場合、それらは約１～４重量％存在することが好ましく、これは約１．５～３％を含み、さらにこれは約２％、２．５％とこれらの間の値を含む。シリカなどの充填材や増粘剤が存在する場合は、約２～５％存在することが好ましく、これは約３～４重量％を含む。

【００１９】

ここに記載されるバーニッシュは当業者に良く知られているように、適切なアプリケーターを用いて歯に塗布されてもよい。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、歯にバーニッシュを塗り溶媒を蒸発させて歯をシールするフィルムを後に残す方法が含まれる。

【実施例】

【００２０】

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、本特許請求の範囲に明示された範囲の制限を意図するのではない。別段の指示をした場合を除き、以下及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。

【００２１】

本発明のセメントの配合物と特性の例

実施例１

該バーニッシュ配合物は以下からなる：

ペンタエリスリトールロジンエステル	６８％
シリカ	３．５％
キリシトール	２．７％
バブルガムフレーバー	３．０％
フッ化ナトリウム	４．２％
エチルアルコール	５．８％
ｎ－ヘキサン	１２．８％

該配合物は懸濁液中にフッ化ナトリウムとキシリトールを保持する充分な能力を示した。３７℃下での硬化時間は約５分であった。硬化したバーニッシュからのフッ素の浸出性は実証された。

【００２２】

実施例２

該バーニッシュ配合物は以下からなる：

グリセロールロジンエステル	６０％
ポリアミド（エチレンジアミンと脂肪酸の縮合生成物）	５％
シリカ	４％
アスパルテーム	０．５％

ペパーミントオイル　２％
フッ化ナトリウム　４．５％
エチルアルコール　５．４％
ｎ－ヘキサン　１８．６％
この配合物の特性および性能は実施例１のものと実質的に類似していた。

【００２３】
実施例３
該バーニッシュ配合物は以下からなる：
グリセロールロジンエステル　６８％
部分的に重合したロジン　６％
サッカリンナトリウム混合物　０．６％
キシリトール　１．４％
チェリーフレーバー　２％
フッ化スズ　３．０％
イソプロピルアルコール　５％
ｎ－ヘキサン(８５％)と　１４％
２－メチルペンタン(１５％)の混合物
この配合物の特性および性能は実施例１のものと実質的に類似していた。しかし、硬化時間は約２５％長かった。

【００２４】
実施例４
該バーニッシュ配合物は以下からなる：
グリセロールロジンエステル　３０％
ペンタエリスリトールロジン　３０％
コーパル樹脂　５％
キシリトール　２．５％
ワイルドチェリーフレーバー　２．５％
モノフルオロリン酸ナトリウム　５％
エチルアルコール　１２．５％
ｎ－ヘプタン　１２．５％
この配合物の特性および性能は実施例１のものと概して類似していた。しかし、硬化時間は約３０％遅かった。

【００２５】
実施例５
該バーニッシュ配合物は以下からなる：
グリセロールロジンエステル　６４％
シリカ　３．２％
キシリトール　２．３％
ワイルドチェリーフレーバー　１．５％
フッ化ナトリウム　３．８％
イソプロピルアルコール　８．３％
シクロヘキサン　１６．６％
この配合物の特性及び性能は実施例１のものと概して類似していた。３７℃での硬化時間は約２０分であった。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I
A61Q 11/00 (2006.01) A61Q 11/00
A61P 1/02 (2006.01) A61P 1/02

(74)代理人 100099988
弁理士 斎藤 健治
(73)特許権者 506067903
スリーエム イノベーティブ プロパティーズ カンパニー
アメリカ合衆国 ミネソタ州、セント・ポール，ピー．オー．ボックス ３３４２７，スリーエム・センター
(74)代理人 100065215
弁理士 三枝 英二
(74)代理人 100099988
弁理士 斎藤 健治
(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 ９１００１ カリフォルニア州 アルタ デナ ルビオ １３０４
(72)発明者 バトラー ヴィ． デイヴィッド
アメリカ合衆国 ９１７９１ カリフォルニア州 ウェスト コヴィナ エス． アルパイン １５１６
(72)発明者 マッキンリー ケイ． リンゼイ
アメリカ合衆国 ９１７６８ カリフォルニア州 ポモナ プロデューサー ウェイ ３２２１

審査官 鶴見 秀紀

(56)参考文献 特開昭６２－２７７９５３（ＪＰ，Ａ）
特開平０５－０８５９１４（ＪＰ，Ａ）
特開昭６３－０４４５０６（ＪＰ，Ａ）
特開平０４－０６６５２３（ＪＰ，Ａ）
特許第２７２６８７０（ＪＰ，Ｂ２）

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
Ａ６１Ｋ ６／０８
Ａ６１Ｋ ６／０２
Ａ６１Ｋ ６／０２７
Ａ６１Ｋ ６／０８７
Ａ６１Ｋ ８／９７
Ａ６１Ｐ １／０２
Ａ６１Ｑ １１／００