



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2004119405/15, 15.11.2002

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
15.11.2002

(30) Конвенционный приоритет:
28.11.2001 US 60/333,832

(43) Дата публикации заявки: 27.03.2005

(45) Опубликовано: 10.05.2006 Бюл. № 13

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: RU 2181280 C2, 20.04.2002. RU 2162319
C1, 27.01.2001. RU 2085184 C1, 27.07.1997.
WO 0168046 A, 20.09.2001. EP 0638307 B,
15.02.1995. WO 9822080 A, 28.05.1998.

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 28.06.2004

(86) Заявка РСТ:
US 02/36530 (15.11.2002)

(87) Публикация РСТ:
WO 03/045344 (05.06.2003)

Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(72) Автор(ы):

ЮЕ Дзианг (CN),
ЗУ Лонг (CN),
ЧЕН Ли (CN),
ЧЕНГ Йинг (CN),
КСУ Тао (CN),
ВЕЛЛЕР Эндрю Дамиан (US),
ВАНГ Йинг (US)

(73) Патентообладатель(и):

ДЗЕ ПРОКТЕР ЭНД ГЭМБЛ КОМПАНИ (US)

(54) КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ ЧИСТКИ ЗУБОВ (ВАРИАНТЫ), СВЯЗЫВАЮЩАЯ СИСТЕМА ДЛЯ ОДНОФАЗНОЙ КОМПОЗИЦИИ ДЛЯ ЧИСТКИ ЗУБОВ

(57) Реферат:

Изобретение относится к области стоматологии и касается средств для чистки зубов. Композиция для чистки зубов содержит в одной фазе один или более линейных полифосфатов со средней длиной цепи 4 или более, ионный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из источников фторид-ионов олова, цинка, меди и их смеси, где ионный активный ингредиент присутствует в виде твердой дисперсии в композиции и при солюбилизации доставляет эффективное количество ионного активного вещества.

Связующая система состоит из загустителя, содержащего полисахариды, карбомеры, полуксамеры, модифицированные целлюлозы и их смеси, и одного смачивающего вещества, где общее содержание воды в композиции средства для чистки зубов составляет менее 10%. Композиция средств для чистки зубов обеспечивает эффективную доставку активных веществ, а также обладает противогингивитным действием и против образования налета. 3 н. и 7 з.п. ф-лы, 5 табл.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: **2004119405/15, 15.11.2002**

(24) Effective date for property rights: **15.11.2002**

(30) Priority:
28.11.2001 US 60/333,832

(43) Application published: **27.03.2005**

(45) Date of publication: **10.05.2006 Bull. 13**

(85) Commencement of national phase: **28.06.2004**

(86) PCT application:
US 02/36530 (15.11.2002)

(87) PCT publication:
WO 03/045344 (05.06.2003)

Mail address:
**129010, Moskva, ul. B.Spasskaja, 25, str.3,
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i
Partnery", pat.pov. E.E.Nazinoj**

(72) Inventor(s):

**JuE Dziang (CN),
ZU Long (CN),
ChEN Li (CN),
ChENG Jing (CN),
KSU Tao (CN),
VELLER Ehndrju Damian (US),
VANG Jing (US)**

(73) Proprietor(s):

DZE PROKTER EhND GEhMBL KOMPANI (US)

(54) COMPOSITION FOR CLEANSING TEETH (VARIANTS), BINDING SYSTEM FOR MONOPHASE COMPOSITION FOR CLEANSING TEETH

(57) Abstract:

FIELD: medicine, stomatology.

SUBSTANCE: invention relates to agents used for cleansing teeth. The composition for cleansing teeth comprise in a single phase one or more linear polyphosphates with average chain length is 4 or more, ionic active component chosen from the group consisting of source of fluoride ions, tin, zinc, copper and their mixtures wherein ionic active component presents as a solid dispersion in the composition and delivers the effective amount of ionic binding

substance during the solubilization process. The binding system consists of a thickening agent comprising polysaccharides, carbomers, poloxamers, modified celluloses and their mixtures and one wetting substance wherein the total content of water in the agent composition for cleansing teeth provides effective delivery of active substances, and possesses anti-gingivitis effect against the deposit formation also.

EFFECT: improved and valuable properties of composition.

10 cl, 5 tbl, 20 ex

Область изобретения

Данное изобретение относится к композициям для чистки зубов, содержащим фазу с пониженным содержанием воды, содержащую полифосфат и ионные активные ингредиенты, включающие фторид-ионы и/или ионы металлов, таких как олово, цинк и ионы меди.

Предпосылки создания изобретения

Композиции данного изобретения представляют собой средства для чистки зубов, содержащие фазу, обеспечивающую эффективные количества полифосфатных и ионных активных веществ, таких как фторид-ионы и/или ионы металлов, таких как олово, цинк и ионы меди, причем данная фаза имеет низкое содержание воды, в которой компоненты стабильны, и также содержит связывающую систему, обеспечивающую достаточное желатинирование в условиях низкого содержания воды, неполярную систему смачивающих веществ.

В связи с тем что такие активные вещества ранее использовались в средствах для чистки зубов для улучшения гигиены полости рта, по ряду причин была подтверждена перспективность объединения этих активных веществ в единую стабильную фазу. Известно, что определенные полифосфаты, эффективные в качестве агентов против образования зубного камня, нестабильны в системах с высоким содержанием воды и также взаимодействуют с фторид-ионами в композициях для полости рта (оральных композициях) при температуре окружающей среды и продуцируют монофторфосфат-ионы, в дополнение к изменению pH композиции. Это взаимодействие снижает эффективность оральной композиции и ее способность обеспечивать поверхности полости рта стабильными фторид- и полифосфат-ионами.

Известно, что ионы металлов, таких как олово, медь и ионы цинка, являются эффективными антимикробными агентами. Указанные ионы металлов обеспечивают противогингивитное действие и действие против образования налета и также могут улучшать дыхание и снижать чувствительность. Однако также известно, что средства для чистки зубов, содержащие ионы металлов, обладают вяжущим действием. Олово и медь, как известно, вызывают окрашивание поверхности зубов.

Более ранние попытки создания композиций средств для чистки зубов, содержащих указанные активные вещества в эффективных количествах и эффективных формах, привели к появлению средства для чистки зубов в упаковке с двумя отделениями, в которых активные ингредиенты физически разделены до начала чистки зубов (см., например, WO98/22079, "Dentifrice Compositions Containing Polyphosphate and Fluoride"). Однако такие упаковки с двумя отделениями являются обычно значительно более дорогими, чем обычные ламинированные тубы, которые применялись много лет для хранения и распределения средств для чистки зубов. Данные упаковки могут быть также проблематичными с точки зрения простоты их использования потребителем и равномерного распределения приблизительно равных количеств каждой композиции во время каждого использования их потребителем. Таким образом, остается желательным создание однофазных композиций, которые могут быть упакованы в обычные ламинированные выдавливаемые тубы.

Другие попытки создания таких эффективных композиций средств для чистки зубов заключались в снижении содержания воды в композиции. Снижение содержания воды теоретически снижало бы или устраняло бы проблему стабильности, связанной с фторидом, полифосфатом и другими ионными активными веществами. Однако снижение содержания воды и необязательно замена части или всей удаленной воды смачивающим веществом создает проблемы в получении приемлемой реологии и густоты в композиции. Когда воду, которая является высокополярным растворителем, удаляют, обычные загустители, такие как карбоксиметилцеллюлоза ("КМЦ") имеют тенденцию к неадекватному гелеобразованию. Попытки снижения содержания воды в средствах для чистки зубов предпринимались в отношении средств для чистки зубов, описанных, например, в EP 0 638 307 B1; патенте США №4647451 и в патенте США №5670137.

Карагенан, полисахарид и природное производное морских водорослей был использован в композициях средств для чистки зубов в качестве замены более дешевых загустителей, таких как КМЦ. См., например, патент США №6187293BI, "Process for Making Toothpaste Using Low Levels of Carageenan" и 6162418, "Non-Stringy

5 Toothpaste". Однако относительно высокая стоимость карагенана и тиксотропные свойства карагенансодержащих зубных паст рассматривались как ограничивающие широкое распространение использования карагенана в средствах для чистки зубов.

Таким образом, остается желательным создание композиций средств для чистки зубов, обеспечивающих эффективную доставку неустойчивых в воде активных веществ и/или
10 активных веществ, которые являются реакционно-способными относительно друг друга в одной стабильной фазе. Ни одна из существующих разработок в данном уровне техники не обеспечивает всех преимуществ и положительных сторон данного изобретения.

Краткое изложение сущности изобретения

Данное изобретение относится к композициям средств для чистки зубов, содержащим в
15 одной фазе: (а) от примерно 0,1% до примерно 30% одного или более линейных полифосфатов, имеющих среднюю длину цепи примерно 4 или более; (b) ионный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из источника фторид-ионов, источника ионов олова, источника ионов цинка, источника ионов меди и их смесей, где ионный активный ингредиент присутствует в виде твердой дисперсии в композиции и при
20 солюбилизации обеспечивает доставку эффективного количества ионного активного вещества; (с) связывающую систему, состоящую из (i) от примерно 0,05% до примерно 3% загустителя, выбранного из группы, состоящей из полисахаридов, карбомеров, полоксамеров, модифицированных целлюлоз и их смесей; и (ii) от примерно 0,1% до примерно 70% по крайней мере одного смачивающего вещества; где общее содержание
25 воды в композиции средства для чистки зубов составляет менее чем примерно 10%.

Данное изобретение также относится к способам стабилизации композиций средств для чистки зубов за счет обеспечения данной связывающей системы. Указанные и другие особенности, аспекты и преимущества данного изобретения станут очевидными для специалистов в данной области после прочтения данного описания.

Детальное описание изобретения

Хотя данное описание заканчивается формулой изобретения, четко указывающей и определяющей изобретение, считается, что данное изобретение станет более понятно из
30 следующего описания предпочтительных вариантов воплощения.

Все используемые здесь процентные соотношения даны по массе композиции средства
35 для чистки зубов, если не указано иначе. Соотношения, используемые здесь, являются молярными относительно всей композиции, если не указано иначе. Все измерения произведены при 25°C, если не указано иначе.

Все публикации, патентные заявки и выданные патенты, упоминаемые здесь, таким образом, включены полностью в качестве ссылок. Цитирование любого ссылочного
40 материала не является допущением того, что любое определение не следует рассматривать в качестве уровня техники для заявленного изобретения.

В данном тексте термин "содержащий" означает, что могут быть добавлены другие стадии и другие компоненты, которые не повлияют на конечный результат. Этот термин включает в себя термины "состоящий из" и "состоящий по существу из".

45 В данном тексте термин "эффективное количество" означает количество соединения или композиции, достаточное для значительного индуцирования положительного результата, особенно благоприятного эффекта в отношении гигиены полости рта, но достаточно низкого, чтобы избежать серьезных побочных эффектов, т.е. для обеспечения разумного соотношения риск-польза, в пределах обоснованного мнения специалиста.

50 Композиция средства для чистки зубов данного изобретения может быть в форме зубной пасты или средства для чистки зубов. Термин "средство для чистки зубов", как здесь используется, подразумевает препараты в виде паст или гелей, если не указано иначе. Композиция средства для чистки зубов может быть в любой желаемой форме, такой как с

глубокими полосами, поверхностными полосами, многослойная, включать пасту, окруженную гелем, или любые их комбинации.

Композиция средства для чистки зубов является продуктом, который при обычном пути введения, намеренно не проглатывается для целей системного введения конкретных терапевтических агентов, но остается в полости рта в течение времени, достаточного для контакта по существу всех поверхностей зубов и/или тканей полости рта для целей активности оральной полости.

Термин "водный носитель", используемый здесь, означает любые безопасные и эффективные материалы для использования в композициях данного изобретения. Такие материалы включают загустители, смачивающие вещества, ионные активные ингредиенты, буферные агенты, агенты против зубного камня, абразивные полирующие материалы, источники перекиси, бикарбонатные соли щелочного металла, поверхностно-активные вещества (ПАВ), диоксид титана, окрашивающие агенты, системы отдушки, подсластители, антимикробные агенты, агенты на растительной основе, агенты, десенсибилизирующие агенты, снижающие окрашивание, и их смеси.

Данные композиции включают в себя существенные компоненты, а также необязательные компоненты. Существенные и необязательные компоненты композиций данного изобретения описаны в следующих параграфах.

Источник полифосфатов

Данное изобретение включает в себя источник полифосфатов. Полифосфаты, как известно, помогают замедлить образование конкремента. Однако также известно, что полифосфаты со средней длиной цепи более примерно 4, кроме изменения pH композиции, также взаимодействуют с фторид-ионами в композициях для полости рта при температуре окружающей среды и образуют монофторфосфат-ионы. Это взаимодействие снижает эффективность композиции для полости рта и ее способность обеспечивать поверхности полости рта стабильными фторид-ионами и полифосфатами. Также известно, что для получения стабильного полифосфата, необходимо контролировать общее содержание воды и значение pH композиции для чистки зубов с целью уменьшения гидролиза полифосфатов.

Как правило, считается, что полифосфат состоит из двух или более фосфатных молекул, в основном имеющих линейную конфигурацию, хотя могут присутствовать некоторые циклические производные. Несмотря на то, что пирофосфаты являются полифосфатами, требуемыми полифосфатами являются те, которые имеют около четырех или более фосфатных молекул. Требуемые неорганические полифосфатные соли, среди прочих, включают тетраполифосфат и гексаметафосфат. Полифосфаты, которые больше тетраполифосфатов, обычно встречаются в виде аморфных стекловидных материалов. Предпочтительными в данном изобретении являются линейные "стекловидные" полифосфаты, имеющие формулу:



где X является ионом натрия или калия и n в среднем составляет от примерно 6 до примерно 125, наиболее предпочтительно от примерно 11 до примерно 50.

Предпочтительными являются полифосфаты, производимые фирмой FMC Corporation и имеющие торговые названия, такие как Sodaphos (n), Hexaphos (n13) и Glass H (n).

Данные полифосфаты могут быть использованы отдельно или в комбинации друг с другом.

Источники фосфатов более детально описаны в Kirk & Othmer, "Encyclopedia of Chemical Technology", четвертое издание, том 18, Wiley-Interscience Publishers (1996). Эффективное количество источника полифосфатов обычно составляет от примерно 0,1% до примерно 30%, предпочтительно от примерно 1% до примерно 26%, более предпочтительно от примерно 4% до примерно 20% и наиболее предпочтительно от примерно 5% до примерно 13%, от массы всей композиции средства для чистки зубов.

Водные носители

При получении композиций по изобретению желательно добавлять к ним один или более водных носителей. Данные материалы хорошо известны в данной области техники и легко

могут быть выбраны специалистом в данной области, основываясь на физических и эстетических свойствах, желательных для получаемой композиции. Водные носители обычно включают от примерно 40% до примерно 99%, предпочтительно от примерно 70% до примерно 98% и более предпочтительно от примерно 90% до примерно 95%, от массы всей композиции средства для чистки зубов.

Общее содержание воды

Вода, применяемая для изготовления коммерчески подходящих композиций для полости рта, должна быть предпочтительно с низким содержанием ионов и свободной от органических примесей. В композиции средства для чистки зубов вода в основном составляет менее чем примерно 10% и предпочтительно от примерно 0% до примерно 6% от массы данной композиции. Полифосфаты и активные вещества, такие как фторид и олово, нерастворимы в данных композициях со столь низким уровнем содержания воды. Однако указанные ингредиенты могут быть растворены в данных композициях в других низкополярных растворителях, образующих неионные молекулярные структуры. Кроме того, активные вещества остаются стабильными в композициях при хранении. Фторид-ионы и ионы олова, если они присутствуют, будут высвобождаться из их солевых форм или форм неионных растворов только при контактировании со слюной и/или водой во время чистки зубов. Таким образом, нет необходимости физически отделять полифосфат-содержащую часть композиции от ее ионной части, содержащей активные вещества, например, за счет использования упаковки с двумя отделениями. Кроме того, фторид-ион из ряда источников может быть эффективно использован в настоящей композиции; не существует предпочтения в использовании монофторфосфата натрия в качестве источника фторид-ионов, являющегося наиболее совместимым с полифосфатами в композиции, как это было ранее описано в патенте США №6190644, "Dentifrice Compositions Containing Polyphosphate and Sodium Monofluorophosphate".

Содержание воды включает в себя свободную добавляемую воду и ту, которую вводят с другими материалами, такими как сорбит, диоксид кремния, растворы ПАВ и/или растворы красителей.

Связывающая система

Композиции средства для чистки зубов содержат систему связывания, состоящую из загустителя, выбранного из группы, состоящей из полисахаридов, карбомеров, полуксамеров, модифицированных целлюлоз и их смесей, и, по крайней мере, одного смачивающего вещества. Загуститель составляет от примерно 0,05% до примерно 3% и предпочтительно от примерно 0,1% до 1,5% от массы композиции. Данные связывающие системы обеспечивают желаемую консистенцию и желатинирование композиции с низким содержанием воды. Ранее было известно, что гелеобразующие материалы, обеспечивающие желаемую реологию при взаимодействии с водой и смачивающим веществом, дают в основном менее удовлетворительные результаты по реологии, если вода не присутствует и не активирует их гелеобразующие связующие свойства. Вероятно, этот факт особенно справедлив в отношении глицерина как смачивающего вещества. Связывающая система может, кроме того, содержать дополнительные неорганические загустители.

А. Загуститель

Полисахариды, подходящие для использования в данном изобретении, включают карагены, геллановую смолу, смолу рожкового дерева, ксантановую смолу и их смеси. Карагенан является полисахаридом, полученным из морских водорослей, и известен для использования в качестве связующего вещества или загустителя в зубных пастах, см., например, патенты США №6187293 В1 и 6162418. Существует несколько типов карагенана, которые могут различаться по водорослевому источнику и/или по степени и положению сульфатирования. Предпочтительными для применения в данном изобретении являются каппа-карагены, модифицированные каппа-карагены, иота-карагены, модифицированные иота-карагены и их смеси. Лямбда-карагенан также, вероятно, подходит для использования здесь, но в основном менее предпочтителен. Температура

гелеобразования для карагенана, имеющего каппа-производное в качестве основного ингредиента, равна от примерно 30°C до примерно 70°C, более предпочтительно от примерно 40°C до примерно 65°C, наиболее предпочтительно от примерно 45°C до примерно 60°C. Температура гелеобразования для карагенана, имеющего иота-
5 производное в качестве основного ингредиента, равна от примерно 10°C до примерно 50 °C, более предпочтительно от примерно 20°C до примерно 45°C, наиболее предпочтительно от примерно 25°C до примерно 40°C.

Карагенаны, подходящие для применения в изобретении, включают карагенаны, коммерчески доступные от фирмы FMC Company под серийным наименованием "Viscarin",
10 включая, но не ограничиваясь этим, Viscarin TP 329, Viscarin TP 388 и Viscarin TP 389.

Содержание воды для композиций, в которых связующая система имеет каппа-карагенан в качестве первичного загустителя, составляет от примерно 0% до примерно 10% (мас./мас.), предпочтительно от примерно 0,1% до примерно 6% (мас./мас.) и более
15 предпочтительно от примерно 0,3% до примерно 5,5%. Содержание воды для композиций, в которых связующая система имеет иота-карагенан в качестве первичного загустителя, составляет от примерно 0% до примерно 15% (мас./мас.), предпочтительно от примерно 0,1% до примерно 10% (мас./мас.) и более предпочтительно от примерно 0,3% до примерно 8%.

Влияние соли на каппа- и иота-карагенан различно. Для каппа-карагенана ионы натрия и калия предпочтительны, так как они значительно не влияют на вязкость матрикса с
20 низким содержанием воды. А для иота-карагенана и натрий, и калий могут значительно влиять на вязкость матрикса с низким содержанием воды, таким образом, добавление данных ингредиентов в матрикс с низким содержанием воды должно производиться после того, как иота-карагенан достаточно желатинизируется.

Геллановая смола является другим подходящим для использования здесь полисахаридом. Данный полисахарид аэробно ферментируется *pseudomonas elodea*. Он может также образовывать приемлемый матрикс с низким содержанием воды, если он присутствует на уровне от примерно 0,1% до примерно 3%, предпочтительно от примерно
30 0,4% до примерно 1,8% (мас./мас.). Предпочтительная температура гелеобразования выше чем 40°C. Для улучшения тиксотропных и псевдопластичных свойств матрикса средств для чистки зубов предпочтительна комбинация геллановой смолы и карагенана. При взаимодействии геллановой смолы и карагенана при температурах выше чем 40°C данные вещества образуют поперечно-сшитую структуру. На этой стадии другие реагенты, такие
35 как вода, диоксид кремния и другие органические растворители, будут иммобилизованы. Динамика гелеобразования может контролироваться температурой.

Смола рожкового дерева и ксантановая смола также являются подходящими для использования здесь полисахаридами. Смола рожкового дерева или ксантановая смола в качестве загустителей могут образовывать стабильный и приемлемый матрикс средства
40 для чистки зубов при содержании воды ниже чем 10% в композиции, но, вероятно, они не так эффективны, как карагенан. Смешивание смолы рожкового дерева и ксантановой смолы, вероятно, приводит к образованию более вязких структур, чем если бы каждая смола была добавлена отдельно. Доведение pH и ионной силы, вероятно, слегка влияет на вязкость системы. Предпочтительная температура гелеобразования равна от примерно
45 30 °C до примерно 80°C, более предпочтительно от примерно 40°C до примерно 70°C и наиболее предпочтительно от примерно 45°C до примерно 60°C в течение 15 минут.

Полоксамеры также подходят для использования здесь в качестве загустителей в матриксе с малым содержанием воды. Полоксамер представляет собой синтетический блок-сополимер этиленоксида и пропиленоксида. Он доступен в виде различных типов.
50 Здесь предпочтительным является полоксамер 407. Он может быть частично растворен в воде. Если температура выше чем 65°C, он может растворяться в глицерине. Полоксамер 407 доступен, например, от фирмы BASF CORPORATION, New Jersey, USA.

Карбомеры также подходят в качестве загустителей в матриксе с низким содержанием

воды, особенно в безводном матриксе. Обычно уровень карбомера в композиции составляет от примерно 0,1% до примерно 2%, более предпочтительно от примерно 0,2% до примерно 1,5% и наиболее предпочтительно от примерно 0,3% до примерно 1,2%.

Предпочтительная температура гелеобразования равна от примерно 15°C до примерно 40 °C. В системе с высоким содержанием воды (например, выше чем 10%) карбомер может быть растворен в кислом водном растворе и стать вязким при pH, равном примерно 8,0. Но поведение карбомера в матриксе с низким содержанием воды другое. Он может также образовывать гель при pH, равном примерно 3,0, когда смачивающим веществом является глицерин или ПЭГ. Ионное влияние также существенно для карбомера, особенно влияние ионов олова. Если матрикс содержит олово, то предпочтительным способом является добавление сначала карбомера к смачивающему веществу с последующим его разворачиванием. Подходящие для использования здесь карбомеры включают коммерчески доступные от фирмы Goodrich Company под серийным торговым наименованием Carbopol. Особенно подходящим для использования в матриксе представленных композиций с низким содержанием воды является Carbopol 956. Особенно предпочтительна комбинация карагенана и Carbopol 956.

Модифицированные целлюлозы, такие как гидроксиэтилцеллюлоза, особенно в сочетании с карагенаном, также являются хорошими загустителями в матриксе с низким содержанием воды. Данные вещества могут помочь карагенану противостоять влиянию кислоты, щелочи, условиям повышенного содержания соли и биodeградации. В связи с тем что содержание воды в данных композициях ограничено, модифицированная гидроксиэтилцеллюлоза с гидрофобной цепью (C₁₂-C₂₀) предпочтительна для повышения растворимости и гидратации данного загустителя в других низкополярных растворителях, таких как глицерин, пропиленгликоль и ПЭГ.

В. Смачивающее вещество

Смачивающее вещество служит для предохранения композиций зубных паст от затвердевания при воздействии воздуха, и определенные смачивающие вещества могут также придавать композициям зубных паст желаемый сладкий вкус. Подходящие для использования в изобретении смачивающие вещества включают глицерин, сорбит, полиэтиленгликоль, пропиленгликоль, ксилит и другие пищевые многоатомные спирты. Предпочтительными являются глицерин, полиэтиленгликоль, полипропиленгликоль и их смеси, особенно их смеси. Смачивающее вещество составляет обычно от примерно 0,1% до 70%, предпочтительно от примерно 1% до примерно 60% и более предпочтительно от примерно 15% до 55%, от массы композиции.

Смачивающее вещество имеет значительное влияние на вязкость матрикса с низким содержанием воды. Например, при использовании в композиции полисахарида в качестве загустителя вязкость матрикса повышается, когда повышается уровень глицерина или полиэтиленгликоля. Наоборот, вязкость матрикса понижается, когда в композиции повышается уровень пропиленгликоля.

С. Неорганические загустители

Связующая система может дополнительно содержать дополнительные неорганические загустители, такие как коллоидный алюмосиликат магния или тонко измельченный диоксид кремния для дополнительного улучшения текстуры. Дополнительные неорганические загустители, если они присутствуют, могут быть использованы в количестве от примерно 0,1% до примерно 15%, более предпочтительно от примерно 0,1% до примерно 5%, от массы композиции средства для чистки зубов.

Ионный активный ингредиент

Композиции средства для чистки зубов данного изобретения предпочтительно содержат эффективное количество ионного активного ингредиента, выбранного из группы, состоящей из источника фторид-ионов, источника ионов олова, источника ионов цинка, источника ионов меди и их смесей.

А. Источник фторид-ионов

Представленный здесь источник фторид-ионов является растворимым фторидным

источником, способным обеспечивать свободные фторид-ионы. Растворимые источники фторид-ионов включают фторид натрия, фторид олова, фторид индия, фторид цинка и монофторфосфат натрия. Фторид натрия и фторид олова являются предпочтительными растворимыми источниками фторид-иона. Как было указано выше, в существующих описаниях средств для чистки зубов, содержащих полифосфат, имеющий длину цепи примерно 4 или более, указывалось на то, что монофторфосфат натрия является предпочтительным источником фторид-ионов. Это связано с тем, что было установлено, что монофторфосфат натрия более стабилен, чем другие источники фторида в присутствии полифосфата, имеющего среднюю длину цепи примерно 4 или более, так же как и в композициях средств для чистки зубов, содержащих относительно высокий уровень воды. Norris и др. в патенте США №2946725, выданном 26 июля 1960 г., и Widder и др. в патенте США №3678154, выданном 18 июля 1972 г., описывают как указанные источники фторид-ионов, так и другие источники.

Источник фторид-ионов в данных композициях предпочтительно присутствует в виде твердой дисперсии в композиции во время хранения до непосредственного использования потребителем при чистке зубов. Уровень воды в данных композициях слишком низок, чтобы позволить источнику фторид-ионов раствориться в композиции во время хранения. Таким образом, не существует очевидного взаимодействия между фторид-ионом и полифосфатом или диоксидом кремния в период хранения, что обеспечивает стабильность композиции в период хранения. При контактировании композиции со слюной и/или водой во время чистки зубов источник фторид-ионов диспергируется и активные ионы доставляются в полость рта.

Композиции по изобретению могут содержать растворимый источник фторид-ионов, способный обеспечивать от примерно 50 ч/млн до примерно 3500 ч/млн, и предпочтительно от примерно 500 ч/млн до примерно 3000 ч/млн свободных фторид-ионов. Для доставки желаемого количества фторид-ионов источник фторид-ионов может присутствовать в общей композиции средства для чистки зубов в количестве от примерно 0,1% до примерно 5%, предпочтительно от примерно 0,2% до примерно 1% и более предпочтительно от примерно 0,3 до примерно 0,6%, от массы всей композиции средства для чистки зубов.

В. Источник ионов металлов

Данное изобретение может включать источник ионов металлов, который обеспечивает ионы олова, ионы цинка, ионы меди или их смеси. Источник ионов металлов может быть растворимым или труднорастворимым соединением олова, цинка или меди с неорганическими или органическими противоионами. Примеры включают фторид, хлорид, хлорфторид, ацетат, гексафторцирконат, сульфат, тартрат, глюконат, цитрат, малат, глицинат, пирофосфат, метафосфат, оксалат, фосфат, карбонатные соли и оксиды олова, цинка и меди.

Ионы олова, цинка и меди, как было установлено, способствуют уменьшению гингивита, налета, чувствительности и улучшению дыхания. Эффективность указанных ионов металлов в данных композициях не снижается за счет полифосфата.

Ионы олова, цинка и меди поступают из источника(ов) ионов металлов, находящихся в эффективном количестве в композиции средства для чистки зубов. Эффективное количество определяется значением от по крайней мере около 1000 ч/млн иона металла, предпочтительно примерно 2000 ч/млн, до примерно 15000 ч/млн. Более предпочтительно ионы металлов присутствуют в количестве от примерно 3000 ч/млн до примерно 13000 ч/млн и даже более предпочтительно от примерно 4000 ч/млн до примерно 10000 ч/млн. Это общее количество ионов металлов (олова, цинка, меди и их смесей), которое присутствует в композициях для доставки к поверхности зубов.

Источники ионов металлов в данных композициях предпочтительно не полностью ионизированы в композиции во время хранения, до непосредственного использования композиции потребителем для чистки зубов. Уровень воды в данных композициях слишком низок, чтобы позволить источнику ионов металлов раствориться в композиции во время хранения. Но определенные соли, такие как хлорид олова и фторид олова, могут быть

солюбилизированы в глицерине или пропиленгликоле. Оба смачивающих вещества могут обеспечить особую защиту стабильности для таких солей олова и также могут обеспечить лучший профиль вкуса, чем водные растворы олова. При контактировании композиции со слюной и/или водой во время чистки зубов источник ионов олова полностью ионизируется и активные ионы доставляются в полость рта.

Средства для чистки зубов, содержащие соли олова, особенно фторид олова и хлорид олова, описаны Majeti и др. в патенте США №5004597. Другие описания средств для чистки зубов, содержащих соль олова, представлены в патенте США №5578293.

Предпочтительными солями олова являются фторид олова и дигидрат хлорида олова.

Другие подходящие соли олова включают ацетат олова, тартрат олова и цитрат натрия олова. Примеры подходящих источников ионов цинка представлены оксидом цинка, сульфатом цинка, хлоридом цинка, цитратом цинка, лактатом цинка, глюконатом цинка, малатом цинка, тартратом цинка, карбонатом цинка, фосфатом цинка и другими солями, перечисленными в патенте США №4022880. Примеры подходящих источников ионов меди перечислены в патенте США №5534243.

Комбинированный(е) источник(и) ионов металлов будет присутствовать в количестве от примерно 0,25% до примерно 11% от массы конечной композиции. Предпочтительно источники ионов металлов присутствуют в количестве от примерно 0,4 до примерно 7%, более предпочтительно от примерно 0,45% до примерно 5%.

Буферирующий агент

Композиции по изобретению могут содержать буферирующий агент. Буферирующие агенты, как использовано здесь, относятся к агентам, которые могут использоваться для доводки значения pH композиций до интервала от примерно 3,0 до примерно 10. Фаза средства для чистки зубов, содержащая олово, обычно имеет pH суспензии от примерно 3,0 до примерно 5,5, предпочтительно от примерно 3,25 до примерно 5 и более предпочтительно от примерно 3,4 до примерно 4,5. Фаза средства для чистки зубов, содержащая полифосфат, обычно имеет pH суспензии от примерно 4,0 до примерно 10, предпочтительно от примерно 4,5 до примерно 8 и более предпочтительно от примерно 5,0 до примерно 7,0. Средство для чистки зубов, содержащее олово и полифосфат в одной фазе, обычно имеет pH от примерно 4,0 до примерно 7, предпочтительно от примерно 4,5 до примерно 6 и более предпочтительно от примерно 5 до примерно 5,5.

Буферирующие агенты включают гидроксиды щелочных металлов, гидроксид аммония, органические аммонийные соединения, карбонаты, сесквикарбонаты, бораты, силикаты, фосфаты, имидазол и их смеси. Специфические буферирующие агенты включают монофосфат натрия, трифосфат натрия, бензоат натрия, бензойную кислоту, гидроксид натрия, гидроксид калия, карбонаты щелочных металлов, натрия карбонат, имидазол, пиррофосфаты, лимонную кислоту и натрия цитрат. Буферирующие агенты используются в количестве от примерно 0,1% до примерно 30%, предпочтительно от примерно 0,1% до примерно 10% и более предпочтительно от примерно 0,3% до примерно 3%, от массы данной композиции. Когда в композиции присутствует олово, предпочтительными буферами являются гидроксид натрия, гидроксид калия и гидроксид аммония.

Агенты против конкремента

Необязательные агенты, которые используются вместо полифосфата или в комбинации с ним, включают материалы с известной эффективностью в отношении снижения минерального отложения фосфата кальция, связанного с образованием конкремента. Указанные агенты включают пиррофосфаты, триполифосфаты, синтетические анионные полимеры [включающие полиакрилаты и сополимеры малеинового ангидрида или кислоты и метилвинилового эфира (например, Gantrez), как описано, например, Gaffar и др. в патенте США №4627977; так же как и, например, полиаминопропансульфоновую кислоту (AMPS)], тригидрат цитрата цинка, дифосфонаты (например, EHDP; AHP), полипептиды (такие как полиаспарагиновая и полиглутаминовая кислоты) и их смеси.

Абразивные полирующие материалы

Абразивный полирующий материал может быть также включен в композиции зубных

паст. Абразивным полирующим материалом, предлагаемым к использованию в композициях данного изобретения, может быть любой материал, который не сильно истирает дентин. Обычные абразивные полирующие материалы содержат диоксиды кремния, включая гели и преципитаты; оксиды алюминия; фосфаты, включая ортофосфаты, полиметафосфаты и пирофосфаты; и их смеси. Специфические примеры включают дигидрат ортофосфата кальция, пирофосфат кальция, фосфат трикальция, полиметафосфат кальция, нерастворимый полиметафосфат натрия, гидратированный оксид алюминия, пирофосфат бета-кальция, карбонат кальция и смолистые абразивные материалы, такие как продукты частичной конденсации мочевины и формальдегида, и прочие, такие как описаны Cooley и др. в патенте США №3070510, выданном 25 декабря, 1962 г. Также могут быть использованы смеси абразивных материалов. В случае, если композиция средств для чистки зубов или определенная ее фаза содержит полифосфат, имеющий среднюю длину цепи около 4 или более, кальцийсодержащие абразивы и оксид алюминия не являются предпочтительными. Наиболее предпочтительным абразивом является диоксид кремния.

Зубные абразивы различных типов на основе диоксида кремния являются предпочтительными благодаря их уникальным свойствам исключительной очищающей и полирующей способности в отношении зубов без чрезмерного истирания зубной эмали или дентина. Полирующие абразивы на основе диоксида кремния, представленные здесь, так же как и другие абразивы, в основном имеют средний размер частиц, варьирующий от примерно 0,1 до примерно 30 микрон и предпочтительно от примерно 5 до примерно 15 микрон. Абразив может быть осажденным диоксидом кремния или гелями диоксида кремния, такими как ксерогели диоксида кремния, описанные Pader и др. в патенте США №3538230, выданном 2 марта 1970 г., и DiGiulio в патенте США №3862307, выданном 21 января 1975 г. Предпочтительными являются ксерогели диоксида кремния, имеющиеся на рынке под торговым названием "Syloid" W.R. Grace & Company, Davison Chemical Division. Также предпочтительными являются материалы из осажденного диоксида кремния, такие как выпущенные в продажу J.M. Huber Corporation под торговым названием "Zeodent", особенно диоксид кремния, имеющий обозначение "Zeodent 119". Типы зубных абразивов на основе диоксида кремния, применяемые в зубных пастах по изобретению, описаны более детально Wason в патенте США №4340583, выданном 29 июля 1982 г.

Абразивы на основе диоксида кремния также описаны Rice в патентах США №5589160; 5603920; 5651958; 5658553 и 5716601. Абразивы в композициях зубных паст, описанных здесь, в основном присутствуют в количестве от примерно 6% до примерно 70% от массы композиции. Предпочтительно зубные пасты содержат от примерно 10% до примерно 50% абразива от массы композиции средства для чистки зубов.

Источник пероксидов

Данное изобретение может содержать в композиции источник пероксидов. Источник пероксидов выбирают из группы, состоящей из пероксида водорода, пероксида кальция, пероксида мочевины и их смесей. Предпочтительным источником пероксидов является пероксид кальция. Следующие количества представляют количество пероксидного сырья, несмотря на то, что источник пероксидов может содержать ингредиенты, отличные от пероксидного сырья. Данная композиция может содержать от примерно 0,01% до примерно 10%, предпочтительно от примерно 0,1% до примерно 5%, более предпочтительно от примерно 0,2% до примерно 3% и наиболее предпочтительно от примерно 0,3% до примерно 0,8% источника пероксидов, от массы композиции средства для чистки зубов.

Бикарбонатная соль щелочного металла

Данное изобретение может также содержать бикарбонатную соль щелочного металла. Бикарбонатные соли щелочных металлов растворимы в воде и, если они не стабилизированы, имеют тенденцию к высвобождению в водной среде диоксида углерода. Бикарбонат натрия, также известный как пищевая сода, является предпочтительной бикарбонатной солью щелочных металлов. Бикарбонатные соли щелочных металлов действуют так же, как буферирующие агенты. Данная композиция может содержать от

примерно 0,5% до примерно 50%, предпочтительно от примерно 0,5% до примерно 30%, более предпочтительно от примерно 2% до примерно 20% и наиболее предпочтительно от примерно 5% до примерно 18%, бикарбонатной соли щелочных металлов от массы композиции средства для чистки зубов.

5 Дополнительные водные носители

Данные композиции могут также содержать поверхностно-активные вещества (ПАВ), также обычно относимые к пенообразующим агентам. Подходящими ПАВ являются те, которые достаточно стабильны и вспениваются в широком диапазоне значений pH. ПАВ может быть анионным, неионным, амфотерным, цвиттерионным, катионным или их смесью. Анионные ПАВ, используемые здесь, содержат водорастворимые соли алкилсульфатов, имеющих от 8 до 20 атомов углерода в алкильном радикале (например, алкилсульфат натрия), и водорастворимые соли сульфонированных моноглицеридов жирных кислот, имеющих от 8 до 20 атомов углерода. Лаурилсульфат натрия и сульфонаты кокомоноглицерида натрия являются примерами анионных ПАВ данного типа. Другими 15 подходящими анионными ПАВ являются саркозинаты, такие как лауроилсаркозинат натрия, таураты, лаурилсульфоацетат натрия, лауроилизотионат натрия, лауреткарбоксилат натрия и додецилбензолсульфонат натрия. Также могут применяться смеси анионогенных ПАВ. Многие подходящие анионные ПАВ описаны Agricola и др. в патенте США №3959458, выданном 25 мая 1976 г. Неионные ПАВ, которые могут быть использованы в композициях 20 данного изобретения, могут быть широко определены как соединения, получаемые конденсацией алкиленоксидных групп (гидрофильных по природе) с органическим гидрофобным соединением, которое может быть по своей природе алифатическим или алкилароматическим. Примеры подходящих неионных ПАВ включают полуксамеры (продаваемые под торговым названием Pluronic), полиоксиэтилен, сложные эфиры 25 полиоксиэтиленсорбита (продаваемого под торговым названием Tweens), гидрогенизированное касторовое масло Polyoxyl 40, этоксилаты жирных спиртов, полиэтиленоксидные конденсаты алкилфенолов, продукты, полученные конденсацией этиленоксида с продуктом реакции пропиленоксида и этилендиамина, этиленоксидные конденсаты алифатических спиртов, оксиды третичных аминов с длинной цепью, оксиды 30 третичных фосфинов с длинной цепью, диалкилсульфоксиды с длинной цепью и смеси данных материалов. Амфотерные ПАВ, применяемые в данном изобретении, в широком смысле могут быть охарактеризованы как производные алифатических вторичных и третичных аминов, в которых алифатический радикал может быть прямым или разветвленным и в которых один из алифатических заместителей содержит от примерно 8 35 до примерно 18 атомов углерода и один из них содержит анионную водосолюбилизирующую группу, например карбоксилат, сульфонат, сульфат, фосфат или фосфонат. Другими подходящими амфотерными ПАВ являются бетаины, особенно кокамидопропил бетаин. Могут также применяться смеси амфотерных ПАВ. Многие из данных подходящих неионных и амфотерных ПАВ описаны Gieske и др. в патенте США 40 №4051234, выданном 27 сентября 1977 г. Данная композиция обычно содержит один или более ПАВ, каждый на уровне от примерно 0,25% до примерно 12%, предпочтительно от примерно 0,5% до примерно 8% и наиболее предпочтительно от примерно 1% до примерно 6%, от массы композиции.

К данной композиции может быть также добавлен диоксид титана. Диоксид титана 45 представляет собой белый порошок, который придает непрозрачность композициям. Диоксид титана составляет в основном от примерно 0,25% до примерно 5% от массы композиции.

К данной композиции могут быть также добавлены окрашивающие агенты. Окрашивающий агент может быть в виде водного раствора, предпочтительное содержание 50 окрашивающего агента в водном растворе составляет 1%. Растворы красителей в основном составляют от примерно 0,01% до примерно 5% от массы композиции.

К композициям может быть также добавлена система ароматизирующих веществ. Подходящие ароматизирующие компоненты включают винтергриновое масло, масло мяты

перечной, масло мяты курчавой, гвоздичное масло, ментол, анетол, метилсалицилат, эвкалиптол, кассию, 1-ментилацетат, шалфей, эвгенол, масло петрушки, оксанон, альфа-иризон, душицу, лимон, апельсин, пропенилгвазтол, циннамон, ванилин, этилванилин, гелиотропин, 4-цис-гептенал, диацетил, метил-пара-трет-бутилфенилацетат и их смеси.

5 Часть системы ароматизирующих веществ могут быть также охладители.

Предпочтительными охладителями в данных композициях являются параментанкарбоксамидные агенты, такие как N-этил-п-ментан-3-карбоксамид (известный на рынке как "WS-3") и их смеси. Система ароматизирующих веществ в основном используется в композициях в количестве от примерно 0,001% до примерно 5% от массы

10 композиции.

К композициям могут быть также добавлены подсластители. Данные подсластители включают сахарин, декстрозу, сахаразу, лактозу, ксилит, мальтозу, левулозу, аспартам, цикламат натрия, D-триптофан, дигидрохальконы, ацесульфам и их смеси. Различные окрашивающие агенты могут быть также включены в данное изобретение. Подсластители и

15 окрашивающие агенты в основном применяются в зубных пастах в количестве от примерно 0,005% до примерно 5% от массы композиции.

Данное изобретение может также содержать другие агенты, такие как антимикробные агенты. В состав таких агентов включены водонерастворимые некатионные антимикробные агенты, такие как галогенированные дифениловые эфиры, фенольные соединения,

20 включая фенол и его гомологи, моно- и полиалкил- и ароматичные галогенфенолы, резорцин и его производные, бисфенольные соединения и галогенированные

салициланилиды, эфиры бензойной кислоты и галогенированные карбанилиды, полифенолы и агенты растительного происхождения. Водорастворимые антимикробные агенты включают, среди прочих, четвертичные аммониевые соли и бис-бигуанидные соли.

25 Триклозан монофосфат является предпочтительным дополнительным водорастворимым антимикробным агентом. Четвертичные аммониевые агенты включают те, в которых один или два заместителя у четвертичного атома азота имеют длину углеродной цепи (обычно алкильная группы) от примерно 8 до примерно 20, обычно от примерно 10 до примерно 18 атомов углерода, при этом оставшиеся заместители (обычно алкильная или бензильная

30 группы) имеют меньшее число атомов углерода, то есть от примерно 1 до примерно 7 атомов углерода, обычно метильную или этильную группы. Примерами типичных четвертичных аммониевых антибактериальных агентов являются

додецилтриметиламмонийбромид, тетрадецилпиридинийхлорид, домифенбромид, N-тетрадецил-4-этилпиридинийхлорид, додецилдиметил(2-феноксиэтил)аммонийбромид,

35 бензилдиметилстеариламмонийхлорид, цетилпиридинийхлорид, кватернизованный 5-амино-1,3-бис(2-этилгексил)-5-метил- гексагидропиримидин, бензалконийхлорид,

бензэтонийхлорид и метилбензэтонийхлорид. Другие соединения представляют собой бис [4-(R-амино)-l-пиридиний]алканы, как описано Bailey в патенте США №4206215, выданном 3 июня 1980 г. Могут быть также включены другие антимикробные агенты, такие как

40 бисглицинат меди, глицинат меди, цитрат цинка и лактат цинка. Также применяются энзимы, включающие эндогликозидазу, папаин, декстраназу, мутаназу и их смеси. Такие агенты описаны у Norris и др. в патенте США №2946725, выданном 26 июля 1960 г., и Gieske и др. в патенте США №4051234, выданном 27 сентября 1977 г. Специфические антимикробные агенты включают хлоргексидин, триклозан, триклозан монофосфат и

45 ароматные масла, такие как тимол. Триклозан является предпочтительным антимикробным агентом для включения в композиции по изобретению. Триклозан и другие агенты этого типа описаны Parran, Jr. и др. в патенте США №5015466, выданном 14 мая 1991 г., и Nabi и др. в патенте США №4894220, выданном 16 января 1990 г. Водонерастворимые антимикробные агенты, водорастворимые агенты и энзимы могут присутствовать или в

50 первой, или во второй композиции средства для чистки зубов. Четвертичные аммониевые агенты, соли олова и замещенные гуанидины предпочтительно присутствуют во второй композиции средства для чистки зубов. Данные агенты могут присутствовать в количестве от примерно 0,01% до примерно 1,5% от массы композиции средства для чистки зубов.

Агент растительного происхождения, включающий, но не ограничивающийся этим, экстракт золотой юкки, экстракт жимолости и их смеси, может также присутствовать в композициях в количестве от примерно 0,01% до примерно 0,05%. Такие агенты растительного происхождения, вероятно, обеспечивают антибактериальную

5 эффективность. Полифенолы могут быть дополнительно включены в количестве от примерно 0,01% до примерно 2%. Предпочтительным полифенолом является полифенол из чая.

Эффективное количество десенсибилизирующего агента может быть также включено в данные композиции. Десенсибилизирующие агенты включают агенты, выбранные из солей щелочных металлов с хлоридом, с нитратсульфатом, или ацетата металла II группы или

10 алюминия или полимеризуемого мономера для закупорки сосудов, щелочного металла или нитрата аммония, оксилата аммония, лимонной кислоты и цитрата натрия.

Предпочтительными солями являются нитрат калия, цитрат калия и их смеси. Данные десенсибилизирующие агенты описаны, например, в патенте США №5718885.

15 К композициям, которые содержат олово, может быть также добавлен агент, снижающий окрашивание (обесцвечивающий агент), такой как Plasdone S-630 или алюминий гидрат. Plasdone представляет собой поливинилпирролидон (ПВП), который может быть синтезирован полимеризацией винилпирролидона. Коммерчески данный агент получали в виде серии продуктов, имеющих средние молекулярные массы в интервале значений от

20 10000 до 700000. В данном случае низкие и средние молекулярные массы (от примерно 10000 до примерно 100000) предпочтительны. Для эффективного удаления окрашивания предпочтительный уровень ПВП составляет от примерно 0,5% до примерно 10%, более предпочтительно от примерно 1,0% до примерно 7,0% и даже более предпочтительно от примерно 1,5% до примерно 5,0%.

25 Композиции средств для чистки зубов могут быть пастой, гелем или любой их конфигурацией или комбинацией. Другое воплощение данного изобретения включает двухфазные или многофазные композиции, содержащие данные композиции с низким содержанием воды в виде одной фазы и по крайней мере одну другую отдельную фазу, содержащую дополнительные компоненты средств для чистки зубов для дополнительного

30 повышения стабильности, характеристик и/или эстетических свойств продукта для чистки зубов. Например, двухфазная композиция может содержать первую фазу, содержащую данную композицию с низким содержанием воды с полифосфатом и ионным активным веществом(ами), и отдельную вторую фазу, содержащую дополнительные активные агенты, такие как отбеливающие агенты, предпочтительно источник пероксидов, или

35 кондиционирующий агент поверхности зубов для обеспечения улучшенного очищения, чистоты, отбеливания, обесцвечивания и полезных ощущений в полости рта.

Примерами зубных кондиционирующих агентов являются полисилоксаны и модифицированные полисилоксаны, включающие диорганополисилоксаны, такие как полидиметилсилоксан (ПДМС); алкил- и алкоксидиметикон сополиолы, такие как C12-C20

40 алкилдиметикон сополиолы; и аминоксилконы. Данные силоксановые полимеры описаны, например, в патентах США №5759523; 6024891; 6123950; 6019962; 6139823, все переданы The Procter & Gamble Company.

Распределителем (дозатором) композиций средств для чистки зубов может быть туба, насос или любой другой контейнер, подходящий для распределения зубной пасты. В

45 двухфазной композиции для полости рта каждая композиция для полости рта будет содержаться в физически отделенном отсеке распределителя и распределяться параллельно.

Способы применения

При применении данного изобретения потребитель должен только нанести описанную

50 здесь композицию средства для чистки зубов на поверхность зубов человека или животного, на желаемые области для получения желаемого эффекта, например отбеливания, освежения дыхания, предотвращения кариеса, облегчения боли, улучшения здоровья десен, контроля зубного камня и т.д. Композиции могут быть также применены к

другим поверхностям полости рта, таким как десневая или слизистая ткани, хотя, вероятно, наилучший эффект достигается, когда композицию средств для чистки зубов наносят на зубы. Композиция средств для чистки зубов может непосредственно либо опосредованно контактировать с поверхностью зуба и/или полости рта, однако предпочтительно применять непосредственно. Композиция средства для чистки зубов может быть нанесена любыми способами, но предпочтительно наносить с помощью щетки или полосканием суспензией средства для чистки зубов.

Примеры и способы получения

Следующие примеры дополнительно описывают и демонстрируют воплощения в объеме данного изобретения. Данные примеры даются лишь с целью иллюстрации и не должны быть истолкованы как ограничение данного изобретения, так как многие их вариации возможны без отклонения от духа и объема данного изобретения.

Примеры 1-11

Ингредиент	Пр.1	Пр.2	Пр.3	Пр.4	Пр.5	Пр.6
Полифосфат Glass H	7,000	7,000	7,000	13,000	14,030	7,000
Фторид натрия	0,243	0,321	0,243	-	0,240	0,243
Фторид олова	-	-	-	0,454	-	-
Дигидрат лактата цинка	-	-	-	2,500	-	-
Дигидрат цитрата цинка	-	-	-	-	2,00	-
Глюконат натрия	-	-	-	0,652	0,650	-
Глицерин	58,005	55,577	57,725	38,519	38,400	57,737
ПЭГ-300	5,000	5,000	5,000	7,000	7,000	5,000
Пропиленгликоль	-	-	-	7,000	7,000	-
Карагенан	0,500	1,050	0,900	0,600	0,600	-
Ксантановая смола	0,400	-	-	0,350	0,350	0,200
Полоксамер 407	-	-	-	-	-	1,000
Карбомер 956	-	-	-	-	-	0,300
Абразив на основе диоксида кремния	20,000	20,000	20,000	25,000	25,000	20,000
Лаурилсульфат натрия (27,9% ЛСН раствор)	6,000	-	6,000	2,500	2,500	5,000
Триклозан	-	-	0,28	-	-	-
Лаурилсульфат натрия, в порошке	-	1,400	-	-	-	-
Бетаин	1,500	-	1,500	-	-	-
Ароматизатор	1,100	1,000	1,100	0,800	0,600	0,900
Окрашивающий агент	0,002	0,002	0,002	0,025	0,030	0,300
Сахарин натрия	0,250	0,250	0,250	0,500	0,500	0,370
Вода	-	5,300	-	-	-	1,250
Тринатрия фосфат	-	3,000	-	1,100	-	-
Гидроксид натрия	-	-	-	-	-	0,500

Ингредиент	Пр.7	Пр.8	Пр.9	Пр.10	Пр.11
Полифосфат натрия	7,000	7,000	7,000	7,000	7,000
Карагенан (Viscarin TP 329)	0,800	1,200	1,200	1,200	0,800
Карбомер (Carbopol 956)	0,300	-	-	-	0,300
Глицерин	52,298	51,328	51,094	58,094	58,194
ПЭГ-300	5,000	5,000	5,000	5,000	5,000
Фторид натрия	0,321	0,321	0,321	0,321	0,321
Голубой краситель	0,002	0,002	0,030	0,030	0,030
Сахарин натрия	0,250	0,250	0,250	0,250	0,250
Лаурилсульфат натрия (27,9% раствор)	7,000	7,000	7,000	5,000	5,000
Абразив на основе диоксида кремния	20,000	20,000	20,000	20,000	20,000
Ароматизатор	1,100	1,100	1,100	1,100	1,100
Вода	5,000	5,000	5,000	1,405	1,405
NaOH 50% (мас./мас.) раствор	0,929	1,649	1,405	0,600	0,600
Тетракалия пирофосфат	-	0,150	0,600	-	-

Композиции примеров 1-3 удобно получать, как описано ниже. Диспергируют активное вещество(а), подсластитель(и) и связующее вещество(а) в смачивающем агенте(ах). Нагревают до температуры в интервале от 40°C до 60°C и выдерживают при этой

температуре в течение примерно 15-20 минут. После желатинирования связующих веществ охлаждают сосуд до примерно 40°C перед добавлением диоксида кремния.

Гомогенизируют смесь и затем вакуумируют сосуд. Далее добавляют ароматизатор и раствор ЛСН, затем хорошо перемешивают. Добавляют полифосфат в сосуд и перемешивают до гомогенности.

Композиции примеров 4-11 удобно получать, как описано ниже. Диспергируют загустители (такие как карагеноан, ксантановая смола, полоксамер или карбопол) в смачивающем веществе(ах). Вакуумируют и гомогенизируют, дважды переворачивая смесь. Добавляют воду (если присутствует) и вакуумируют с перемешиванием в течение 15 минут для гидратирования связующего вещества и его раскручивания (желатинирования). Диспергируют активное вещество(а) и подсластитель(и) в жидкостях и перемешивают в течение 5 минут. Добавляют буфер, перемешивают в течение 5 минут. Гомогенизируют, дважды переворачивая смесь, и снова вакуумируют и затем добавляют диоксид кремния; перемешивают в течение 10 минут. Добавляют раствор ЛСН и ароматизатор, затем перемешивают в течение 2 минут. Снова вакуумируют. Добавляют полифосфат натрия в сосуд и перемешивают до гомогенности.

Примеры 12-20

Ингредиент	Пр.12	Пр.13	Пр.14
Фторид натрия, USP	0,243	-	-
Фторид олова	-	0,454	0,454
Хлорид олова, FCC(дигидрат)	1,430	0,776	0,776
Карагеноан	0,400	0,400	0,300
Ксантановая смола	0,200	0,200	0,150
Глицерин, USP	38,120	38,564	31,019
Пропиленгликоль, USP	9,000	9,000	9,000
Полиэтиленгликоль 300, (ПЭГ)	9,000	9,000	9,000
Полифосфат натрия, FCC (Glass H)	13,000	13,000	20,000
Абразив на основе диоксида кремния	23,825	23,825	25,000
Диоксид кремния Zeodent 165	1,000	1,000	1,000
Лаурилсульфат натрия(ЛСН)	1,680	1,680	1,200
Раствор гидроксида натрия, FCC(50%)	0,600	0,600	0,600
Сахарин натрия, USP	0,400	0,400	0,400
Ароматизатор	1,100	1,100	1,100
Краситель FD&C Голубой #1	0,002	0,001	0,001

Ингредиент	Пр.15	Пр.16	Пр.17
Фторид олова	0,454	0,454	0,454
Хлорид олова, FCC(дигидрат)	0,776	0,776	0,776
Полифосфат натрия, FCC (Glass H)	20,000	20,000	20,000
Карагеноан (Viscarin TP 388)	0,300	0,300	0,100
Ксантановая смола	0,150	0,150	0,100
Глицерин, USP	31,019	29,519	31,269
Пропиленгликоль, USP	9,000	9,000	9,000
Полиэтиленгликоль 300, (ПЭГ)	9,000	9,000	9,000
Диоксид кремния Zeodent 119	-	12,500	12,500
Диоксид кремния 109	25,000	12,500	12,500
Диоксид кремния Zeodent 165	1,000	1,000	1,000
Лаурилсульфат натрия(ЛСН)	1,200	1,200	1,200
Раствор гидроксида натрия, FCC(50%)	0,600	0,600	0,600
Сахарин натрия, USP	0,400	0,400	0,400
Ароматизатор	1,100	1,100	1,100
Краситель FD&C Голубой #1	0,001	0,001	0,001
Plasdone S-630	-	1,500	-

Ингредиент	Пр.18	Пр.19	Пр.20
Фторид олова	0,454	0,454	0,454
Хлорид олова, FCC(дигидрат)	0,776	0,776	0,380

Карагенан (Viscarin TP 389)	0,300	-	-
Карагенан (Viscarin TP 3531)	-	0,900	0,700
Ксантановая смола	0,150	-	-
Карбопол 956	-	-	0,500
Глицерин, USP	29,519	20,468	20,764
Пропиленгликоль, USP	9,000	-	-
Полиэтиленгликоль 300, (ПЭГ)	9,000	30,000	30,000
Полифосфат натрия, FCC (Glass H)	20,000	20,000	20,000
Абразив на основе диоксида кремния	25,000	25,000	25,000
Диоксид кремния Zeodent 165	1,000	-	-
Лаурилсульфат натрия(ЛСН)	1,200	0,500	0,500
Раствор гидроксида натрия, FCC(50%)	0,600	0,600	0,600
Сахарин натрия, USP	0,400	0,500	0,500
Ароматизатор	1,100	0,800	0,800
Краситель FD&C Голубой #1	0,001	0,002	0,002
Plasdone S-630	1,500	-	-

Примеры 12-20 удобно получать, как описано ниже. Диспергируют активное вещество(а), подсластитель(и) и связующее вещество(а) в жидкостях. Нагревают смесь до температуры примерно 40°C-60°C. Выдерживают при этой температуре в течение примерно 15-20 минут для того, чтобы связующее вещество гидратировалось и желатинировалось (раскрутилось). Охлаждают смесь до примерно 40°C перед добавлением диоксида кремния. После гомогенизации и вакуумирования смеси добавляют буфер и ароматизатор. Затем добавляют полифосфат. Перемешивают до гомогенности.

Примеры 13-16 также можно получить, как описано ниже. Диспергируют активное вещество(а), подсластитель(и) и связующее вещество(а) в жидкостях. Хорошо перемешивают и добавляют буфер. Перемешивают в течение 15 минут для того, чтобы связующее вещество гидратировалось и желатинировалось (раскрутилось). Добавляют диоксид кремния. После гомогенизации и вакуумирования смеси добавляют ЛСН и ароматизатор. Затем добавляют полифосфат. Перемешивают до гомогенности.

Примеры 17-18 также можно получить, как описано ниже. Диспергируют связующее вещество(а) в смачивающем веществе(ах) и перемешивают в течение 10 минут. Затем добавляют буфер и перемешивают в течение 15 минут для того, чтобы связующее вещество гидратировалось и желатинировалось (раскрутилось). Диспергируют соли, то есть активное вещество(а) и подсластитель(и) в жидкостях. Перемешивают их до гомогенности. Добавляют диоксид кремния. После гомогенизации и вакуумирования смеси добавляют твердый ЛСН и ароматизатор. Затем добавляют полифосфат. Перемешивают до гомогенности.

Пример 19 также можно получить, как описано ниже. Смешивают глицерин, ПЭГ, краситель, активное вещество(а) и перемешивают в течение 10 минут. Вакуумируют, затем добавляют подсластитель и связующее вещество(а). Гомогенизируют смесь, дважды переворачивая смесь, и вакуумируют. Затем добавляют раствор NaOH и перемешивают в течение по крайней мере 3 минут. Вакуумируют и затем добавляют абразив на основе диоксида кремния и перемешивают в течение по крайней мере 8 минут. Вакуумируют и затем перемешивают в течение 10 минут. Добавляют порошок ЛСН и ароматизатор и перемешивают в течение по крайней мере 2 минут. Затем вакуумируют и гомогенизируют, дважды переворачивая смесь. Добавляют полифосфат и перемешивают в течение по крайней мере 5 минут до гомогенности.

Пример 20 также можно получить, как описано ниже. Смешивают глицерин, ПЭГ и краситель и перемешивают смесь в течение 5 минут. Добавляют связующее вещество(а). Гомогенизируют смесь, перевернув смесь один раз, и вакуумируют. Перемешивают в течение 5 минут. Добавляют раствор NaOH. Вакуумируют и перемешивают в течение в течение 10 минут. Добавляют активное вещество(а). Гомогенизируют, перевернув 1 раз, и вакуумируют. Добавляют абразив на основе диоксида кремния, перемешивают в течение по крайней мере 8 минут. Добавляют порошок ЛСН и ароматизатор и перемешивают в течение по крайней мере 2 минут. Затем вакуумируют и гомогенизируют, дважды

переворачивая смесь. Добавляют полифосфат и перемешивают в течение по крайней мере 5 минут до гомогенности.

Композиции данного изобретения проявляют хорошую вязкость и стабильность. Вязкость по Брукфилду данных композиций составляет от примерно 30 до примерно 90 ВКУ после достижения матриком равновесия. Таблица 1 показывает зависимость

Таблица 1								
Зависимость профиля вязкости от времени при комнатной температуре и 40°C								
Время старения в днях	0	1	2	6	7	8	40	48
Вязкость (ВКУ) при комнатной температуре	2	6	10	8,6	14	17	48	46
Вязкость (ВКУ) при 40°C	2	33,8	74	86	84	88	71,4	72,6

Кроме того, таблицы 2-5 демонстрируют свойства стабильности композиций данного изобретения. Температура 40°C относится к 4-месячному ускоренному тесту на стабильность, а температура 60°C относится к 3,5-месячному ускоренному тесту на стабильность.

Зависимость значения pH композиции примера 12 от времени показана в таблице 2. Можно видеть, что pH более 5 сохраняется при 40°C, что показывает, что композиция является среднекислой и безопасна для использования потребителем.

Таблица 2						
Зависимость стабильности pH от времени						
Дни	0	41	60	80	105	120
pH при 40°C	5,54	5,43	5,34	5,24	5,34	5,49
pH при 60°C	5,54	5,4	5,3	5,02	4,98	-

Зависимость стабильности растворимого олова композиции примера 12 от времени показана в таблице 3. Можно видеть, что уровень растворимого олова остается выше 65%. Это процентное соотношение соответствует уровню олова выше чем 1200 ч/млн, что показывает, что эффективное количество ионов олова будет доступно ко времени использования потребителем.

Таблица 3							
Зависимость стабильности растворимого олова от времени							
Дни	0	41	60	80	105	120	135
Растворимое олово при 40°C (%)	100	84,70	84,11	75,18	76,52	78,33	66,76
Растворимое олово при 60°C (%)	100	83,53	82,94	73,48	74,82	-	-

Зависимость деградации полифосфата композиции примера 12 от времени показана в таблице 4. Можно увидеть, что деградация полифосфатов составляет менее 4,21% после 4,5 месяцев хранения при 60°C. Это показывает, что полифосфат стабилен в данном матриксе (минимально приемлемый предел при этой же температуре составляет приблизительно 26000 ч/млн).

Таблица 4							
Зависимость стабильности полифосфатов от времени							
Дни	0	41	60	80	105	120	135
Орто при 40°C (%)	1,20	1,34	1,41	1,53	1,55	1,59	2,37
Орто при 60°C (%)	1,20	1,46	1,54	2,50	2,75	0,00	4,21

Зависимость стабильности растворимого фторида композиции примера 12 от времени показана в таблице 5. Можно увидеть, что уровень растворимого фторида выше 65%. Данное процентное соотношение соответствует уровню фторидов выше 190 ч/млн. Это показывает, что эффективное количество фторид-ионов будет доступным ко времени использования потребителем.

Таблица 5

Зависимость стабильности растворимых фторидов от времени							
Время (дни)	0	41	60	80	105	120	135
Растворимые фториды при 40°C (%)	100	97,14	93,06	88,57	89,80	91,84	90,61
Растворимые фториды при 60°C (%)	100	89,80	88,57	82,86	79,59	0,00	78,78

5 Понятно, что примеры и воплощения, описанные здесь, приведены лишь с целью иллюстрации и что различные модификации и изменения в вышеуказанном свете могут быть предложены специалисту в данной области без отклонения от объема данного изобретения.

10

Формула изобретения

1. Композиция для чистки зубов, содержащая в одной фазе:

a. от 0,1 до 30% одного или более линейных полифосфатов со средней длиной цепи 4 или более;

15 b. ионный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из источника фторид-ионов, источника ионов олова, источника ионов цинка, источника ионов меди, и их смесей, где ионный активный ингредиент при солюбилизации доставляет эффективное количество ионного активного вещества;

c. связующую систему, состоящую из (i) 0,05-3% загустителя, выбранного из группы, состоящей из полисахаридов, карбомеров, поллоксамеров, модифицированных целлюлоз, и их смесей; и (ii) от 0,1 до 70% по крайней мере одного смачивающего вещества;

20 d. менее чем 10% общей воды,

где ионный активный ингредиент присутствует в виде твердой дисперсии в композиции.

2. Композиция по п.1, где полисахарид выбирают из группы, состоящей из карагенана, геллановой смолы, смолы рожкового дерева, ксантановой смолы и их смесей.

25 3. Композиция по п.2, где загуститель содержит смесь карагенана и карбомера.

4. Композиция по п.2, где загуститель содержит смесь поллоксамера, карбомера и ксантановой смолы.

5. Композиция по п.1, где смачивающее вещество выбирают из группы, состоящей из глицерина, полиэтиленгликоля, полипропиленгликоля и их смесей.

30 6. Композиция по п.1, где полифосфат выбирают из группы, состоящей из линейных «стекловидных» полифосфатов, имеющих формулу $\text{XO}(\text{XPO}_3)_n\text{X}$, где X является ионом натрия или калия и n варьирует от 6 до 50.

7. Композиция по п.6, где полифосфат имеет среднюю длину цепи примерно 21.

35 8. Композиция по п.1, дополнительно содержащая водные носители, которые являются материалами, выбранными из групп, состоящих из дополнительных неорганических загустителей, буферирующих агентов, агентов против конкремента, абразивных полирующих материалов, источников пероксида, бикарбонатных солей щелочных металлов, поверхностно-активных веществ, диоксида титана, окрашивающих агентов, систем ароматизаторов, подсластителей, антимикробных агентов, агентов из растительного сырья, десенсибилизирующих агентов, агентов, снижающих окрашивание, и их смесей.

45 9. Связывающая система для однофазной композиции для чистки зубов, содержащей ионные активные ингредиенты, состоящая из (i) от 0,05 до 3% загустителя, выбранного из группы, состоящей из полисахаридов, карбомеров, поллоксамеров, модифицированных целлюлоз и их смесей; и (ii) от 0,1 до 70% по крайней мере одного смачивающего вещества, где ионные ингредиенты присутствуют в виде твердых дисперсий в композиции, и где композиция для чистки зубов имеет общее содержание воды менее чем 10%.

10. Композиция для чистки зубов, содержащая первую и вторую фазы, где первая фаза содержит композицию, имеющую общее содержание воды менее чем 10%, и содержащую

50 a. от 0,1 до 30% одного или более линейных полифосфатов со средней длиной цепи 4 или более;

b. ионный активный ингредиент, выбранный из источника фторид-ионов, источника ионов олова, источника ионов цинка, источника ионов меди, и их смесей, где ионный

активный ингредиент при солюбилизации доставляет эффективное количество ионного активного вещества;

с. связывающую систему, состоящую из (i) 0,05-3% загустителя, выбранного из полисахаридов, карбомеров, поллоксамеров, модифицированных целлюлоз, и их смесей, и

5 (ii) от 0,1 до 70% по крайней мере одного смачивающего вещества,

где вторая фаза содержит композицию, содержащую активное вещество для ухода за полостью рта, выбранное из отбеливающего агента, осветляющего агента, кондиционирующего агента для поверхности зубов, и их смесей, и где ионный активный ингредиент в первой фазе присутствует в виде твердой дисперсии в композиции.

10

15

20

25

30

35

40

45

50