

PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(21) Číslo dokumentu:

2001 - 4704

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **09.06.2000**
(32) Datum podání prioritní přihlášky: **02.07.1999**
(31) Číslo prioritní přihlášky: **1999/US9915131**
(33) Země priority: **US**
(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **12.06.2002**
(**Věstník č. 6/2002**)
(86) PCT číslo: **PCT/US00/15891**
(87) PCT číslo zveřejnění: **WO01/01940**

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl. ⁷:

A 61 K 7/16

(71) Přihlašovatel:

**THE PROCTER & GAMBLE COMPANY, Cincinnati,
OH, US;**

(72) Původce:

**Yue Jiang, West Chester, OH, US;
Crisanti Mark Matthew, Cincinnati, OH, US;
Majeti Satyanaryana, Cincinnati, OH, US;
Burgess Steven Carl, Sharonville, OH, US;
Li Li, West Chester, OH, US;
Mitra Sekhar, Guangzhou, PR, US;**

(74) Zástupce:

**PATENTSERVIS PRAHA a.s., Jivenská 1273, Praha 4,
14000;**

(54) Název přihlášky vynálezu:

**Prostředky obsahující organosiloxanové
pryskyřice vhodné pro dodávání látek
používaných v péči o ústní dutinu**

(57) Anotace:

Řešení popisuje prostředek určený k dodávání substanci (aktivních látek) ústní péče do ústní dutiny; tento prostředek obsahuje: a) organosiloxanovou pryskyřici; b) těkavý nosič schopný solubilizovat organosiloxanovou pryskyřici; c) modifikátor rheologické konsistence; a d) nejméně jednu substanci ústní péče. Řešení je také zaměřeno na prostředek, který obsahuje: a) organosiloxanovou pryskyřici; b) fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu; c) těkavý nosič schopný solubilizovat organosiloxanovou pryskyřici a fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu; d) modifikátor rheologické konsistence; a e) nejméně jednu aktivní látku (substanci) pro péči o ústní dutinu. Dále je popsán způsob použití těchto prostředků.

CZ 2001 - 4704 A3

Prostředky obsahující organosiloxanové pryskyřice vhodné pro dodávání látek používaných v péči o ústní dutinu.

Oblast techniky

Vynález se týká prostředků dodávajících na povrch zubů aktivní látky (substance), používané v oboru péče o ústní dutinu. Prostředek na povrchu, na který byl aplikován, vytvoří film a z něho pozvolna uvolňuje látku z oboru ústní péče, a to s prodlouženým terapeutickým, profylaktickým a/nebo kosmetickým účinkem. Konkrétněji řečeno, vynález se týká prostředků z oboru ústní péče, obsahujících organosiloxanové pryskyřice, dodávající substance do zubní skloviny. Mimo to se předpokládá, že prostředky podle vynálezu mají také pozvolné účinky i na ostatní povrchy dutiny ústní, jako jsou např. účinky na tkáně sliznic a dásní, stejně jako na povrch zubů.

Dosavadní stav techniky

Již dříve byly známy výrobky ústní péče, kterými lze do měkkých i tvrdých tkání ústní dutiny dodávat různé substance či aktivní látky. Příkladem takových výrobků pro péči o ústní dutinu jsou kartáčkové pomůcky ke vtírání zubních past dodávajících látky působící proti zubnímu kazu, jako jsou např. fluoridy nebo jiné antibakteriální látky, zamezující tvorbě plaku, a dále jsou to ústní vody obsahující látky osvěžující dech a/nebo baktericida. Mimo to byla vyvinuta bělicí činidla jako je peroxid, která lze aplikovat přímo na povrch zubů, t.j. na zubní sklovinu.

Bylo však zjištěno, že konvenční formy typických výrobků nepůsobí dostatečně k udržení aktivity na tvrdých i měkkých tkáních a po dobu, která by dostačovala k zesílení nebo prodloužení terapeutických, profylakčních a/nebo kosmetických účinků těchto aktivních látek. Tyto konvenční formy výrobků také nebyly schopny pozvolně dodávat látky aktivně působící na ústní dutinu bez opakované aplikace v poměrně krátkých intervalech, nebo bez speciálního zařízení nebo nádoby s náústkem.

Byly již činěny pokusy zesílit podstatné účinky bělicích, baktericidních a jiných aktivních komponent výrobků ústní péče. Viz např. USP 5 425 953 z 20. června 1995 autorů Sintova aj., v němž k přenosu bělicího činidla na zuby bylo použito polymeru

celulózy rozpustného ve vodě, vytvářejícího film; v USP 5 438 076, Friedman aj., bylo k dodání baktericidního farmakologického činidla použito prostředků s kapalným polymerem kyseliny methakrylové; a v Mezinárodní patentové přihlášce čís. PCT/CN97/00, zveřejněné dne 24. července 1997, autor Huang, se popisuje filmotvorný prostředek, obsahující celulózu a polyvinyl-acetal, kumaron-indenovou pryskyřici nebo šelak jako složku vytvářející film; tento prostředek dodává zubní sklovině bělící činidla.

Avšak výše uvedené systémy jsou ve vodě rozpustné, tj. snadno se rozpustí ve slinách, a to obvykle do 1 až 3 hodin po aplikaci. Jejich stupeň trvanlivosti je tudíž nízký, takže nemohou dlouhodobě dodávat aktivní ingredienci, obsaženou v prostředku. Mimo to rozpustnost ve vodě vylučuje použití prostředku s orálně aktivními látkami, které jsou ve filmech založených na vodě nestálé. Jedním příkladem těchto aktivních látek je natrium-perkarbonát, který je nestálý v prostředí vysokého pH ve filmu na bázi vody.

Ve snaze získat aplikovatelný prostředek s poměrně vysokým stupněm trvanlivosti bylo popsáno použití ochranných povlaků aplikovaných na zuby. Viz USP 5 401 528 z 18. března 1995, autor Schmidt, kde se na zuby aplikují ochranné povlaky polykondenzátů organicky modifikované kyseliny křemičité, které se potom polymerizují ošetřením na místě (in situ), aby byly zuby povlečeny k ochraně před ukládáním plaku. Tento systém není pravým systémem dodávání aktivní ingredience, postupně uvolňované; místo toho poskytuje bariéru, která zmírňuje škodlivý účinek bakterií, způsobujících plak.

Tento bariérový povlak sice poskytuje výhodu prodloužené trvanlivosti, avšak vyžaduje použití speciálního zařízení a složité aplikace; nemůže tudíž být používán doma a prováděn samoobslužně.

Lze tudíž nahlédnout, že ani jeden z předcházejících způsobů nemůže nabídnout kombinaci dlouhodobého dodávání substance ústní péče nebo aktivní ingredience a výhodné diskrétní samoobslužné aplikace doma.

Z předešlých úvah vysvítá potřeba vhodného systému dodávání různých substancí péče o ústní dutinu, v němž působení aktivních ingrediencí je zesíleno. Ani jeden z existujících způsobů neposkytuje všechny výhody a účinky tohoto vynálezu.

Podstata vynálezu

Vynález je zaměřen na prostředky pro dodávání substance ústní péče do dutiny ústní, přičemž tyto prostředky obsahují: (a) organosiloxanovou pryskyřici; (b) těkavý nosič schopný solubilizovat organosiloxanovou pryskyřici; (c) modifikátor rheologického stavu; a (d) nejméně jednu aktivní substanci ústní péče. Vynález je také zaměřen na prostředky, které obsahují: (a) organosiloxanovou pryskyřici; (b) fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu; (c) těkavý nosič schopný solubilizovat organosiloxanovou pryskyřici i fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu; (d) modifikátor rheologického stavu; a (e) nejméně jednu substanci ústní péče. Vynález je dále zaměřen na způsob použití těchto prostředků.

Tyto a jiné charakteristiky, aspekty a výhody vynálezu budou odborníkům zřejmé po přečtení následujícího popisu.

Podrobný popis vynálezu

I když specifikace shrnuté v nárocích podrobně a zřetelně vymezují nároky vynálezu, předpokládá se, že tento vynález bude lépe pochopen z následujícího popisu.

Všechna procenta a poměry v dalším uváděné jsou hmotnostní, míněno z celého prostředku, pokud to není uvedeno jinak.

Všechna měření uváděná ve vynálezu byla konána při 25 °C, pokud to není uvedeno jinak.

Všechna procenta, poměry a hladiny ingrediencí, uváděná ve vynálezu, jsou založena na skutečném množství ingredience, a nezahrnují rozpouštědla, plniva a jiné materiály, s nimiž by ingredience mohla být kombinována jako komerčně dostupný produkt, pokud to není uvedeno jinak.

Všechny publikace, patentové přihlášky a vydané patenty zmíněné v tomto textu jsou odkazem do vynálezu vtěleny jako celek. Citace jakéhokoliv odkazu není připuštěním platnosti jakéhokoliv tvrzení jako dosavadního stavu techniky oproti nárokovanému vynálezu.

Ve vynálezu uvedený termín „obsahující“ znamená, že je možno přidat i jiné kroky a jiné komponenty, které neovlivní konečný výsledek. Tento termín zahrnuje termíny „sestavující z...“ a „v podstatě sestávající z....“.

Organosiloxanové pryskyřice

Silikonové pryskyřice jsou vysoce zesítené polymerní siloxanové systémy. K zesítení dochází během výroby silikonových pryskyřic vnášením třífunkčních a čtyřfunkčních silanů do monofunkčních nebo difunkčních, nebo do obojích silanů. Jak je v oboru dobře známo, stupeň zesítení potřebný k vyrobení silikonové pryskyřice bude různý podle specifických silanových jednotek vnášených do silikonové pryskyřice. Všeobecně řečeno, za silikonové pryskyřice jsou považovány materiály s dostatečnou hladinou třífunkčních a čtyřfunkčních siloxanových monomerních jednotek, a tudíž s dostatečnou hladinou zesítení, při níž schnou na tuhý nebo tvrdý film. Ukazatelem hladiny zesítení příslušného silikonového materiálu je poměr atomů kyslíku a křemíku. Silikonové materiály s poměrem nejméně 1,1 atomu kyslíku k atomu křemíku jsou obecně silikonové pryskyřice uváděné v tomto vynálezu. Výhodným poměrem atomů kyslíku k atomům křemíku je poměr minimálně 1,2 : 1,0.

Silikonové materiály, a zejména silikonové pryskyřice se výhodně identifikují zkráceným názvoslovným systémem, známým odborníkům jako „nomenklatura MDTQ“. Podle tohoto systému se silikon popisuje podle přítomnosti různých siloxanových monomerních jednotek, které silikon tvoří. Stručně řečeno, symbol M označuje monofunkční jednotku $(\text{CH}_3)_3\text{SiO}_{0,5}$; D označuje difunkční jednotku $(\text{CH}_3)_2\text{SiO}$; T označuje třífunkční jednotku $(\text{CH}_3)\text{SiO}_{1,5}$ a Q označuje quadra- neboli tetra-funkční jednotku SiO_2 . Poznamenejme, že ve struktuře pryskyřice může být jako výsledek zpracování také malé množství, t.j. až 5% silanolové nebo alkoxy-funkcionality.

Odvozeniny symbolů jednotek, jako např. M', D', T' a Q', označují jiné substituenty než methyl, a při každém výskytu musí být specificky definovány. Typickými alternativními substituenty jsou skupiny jako vinyl, fenyl, amino, hydroxyl, atd. Úplný popis silikonových materiálů systémem MDTQ doplňují molární poměry různých jednotek, a to jako indexy symbolů, vyznačující celkový počet každého typu jednotky v silikonu, nebo jejich průměr, nebo specificky vyznačené poměry v kombinaci s molekulovou hmotností. Vyšší relativní molární množství T, Q, T' a nebo Q' ku D, D', M a nebo M' v silikonové pryskyřici ukazuje na vyšší hladiny zesítení. Avšak jak již bylo řečeno výše, celková hladina (úroveň) zesítení může být vyznačena také poměrem kyslíku ke křemíku.

Organosiloxanové pryskyřice jsou pevné při 25 °C a průměrná molekulová hmotnost pryskyřic činí 1 000 až 10 000. Pryskyřice jsou rozpustné v organických rozpouštědlech jako toluen, xylen, isoparafiny a cyklosiloxany nebo těkavé nosiče popsané dále, což naznačuje, že tyto pryskyřice nejsou dostatečně zesítěny, takže pryskyřice je nerozpustná v těkavém nosiči.

Výhodné silikonové pryskyřice pro použití podle vynálezu jsou pryskyřice MQ, MT, MTQ a MDTQ. Pryskyřice MQ jsou popsány v USP 5 330 747 z 19. července 1994, autor Krzysik. Výhodným silikonovým substituentem je tudíž methyl. Zvláště výhodné jsou pryskyřice MQ s poměrem M : Q v rozmezí 0,5 : 1,0 až 1,5 : 1,0. Organosiloxanové pryskyřice jako tyto jsou komerčně dostupné jako např. Wacker 803 a 804 u společnosti Wacker Silicones Corporation of Adrian, Michigan, US, a jako G.E. 1170-002 (SR 1000) u General Electric Company.

Hladina pryskyřice v prostředcích závisí na jejím stupni rozpustnosti ve formulacích, a zejména v použitých rozpouštědlech. Obecně řečeno, rozsah použití pryskyřice podle tohoto vynálezu činí 5 až 70%, výhodněji 15 až 45%, a nejvýhodněji 20 až 40% hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku.

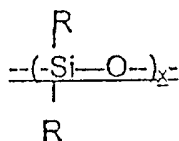
Fluidní polymery na bázi diorganopolysiloxanu

Vedle výše popsaných organosiloxanových pryskyřic prostředky tohoto vynálezu mohou dále obsahovat fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu, které se kombinují s organosiloxanovými pryskyřicemi. Tyto fluidní polymery na bázi diorganopolysiloxanu, použité podle tohoto vynálezu, mají široké rozpětí viskozit, a to od 10 do 10 000 000 centistokesů (cSt) při 25 °C. Některé polymery diorganopolysiloxanů použitelné podle tohoto vynálezu mají viskozitu větší než 10 000 000 centistokesů (cSt) při 25 °C, a proto je výrobci charakterizují specifickou zkouškou penetrace. Příkladem takové charakterizace jsou silikonové materiály SE 30 a SE 63 společnosti „GE“ se specifikacemi penetrace 500 - 1 500, resp. 250 - 600 (desetin milimetrů).

Mezi fluidní polymery na bázi diorganopolysiloxanů podle vynálezu patří polymery obsahující opakující se jednotky odpovídající vzorci $(R_2SiO)_n$, kde R je jednomocný radikál obsahující 1 až 6 atomů uhlíku, který se výhodně zvolí ze skupiny radikálů, kterou tvoří methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, t-butyl, amyl, hexyl, vinyl, allyl, cyklohexyl, aminoalkyl, fenyl, fluoroalkyl, a jejich směsi. Fluidní polymery diorganopolysiloxanu použité v tomto vynálezu obsahují jeden nebo

více těchto radikálů jako substituenty na hlavním řetězci siloxanového polymeru. Fluidní polymery diorganopolysiloxanu jsou zakončeny triorganosilyl - skupinami o vzorci (R'_3Si), kde R' je jednomocný radikál zvolený ze skupiny radikálů obsahujících 1 až 6 atomů uhlíku, hydroxylových skupin, alkoxylových skupin, a jejich směsí. Fluidní diorganopolysiloxanový polymer musí být kompatibilní v roztoku s organosiloxanovou pryskyřicí a těkavým nosičem. Termín „kompatibilní“ se týká vytvoření jednofázového roztoku, smísí - li se fluidní diorganopolysiloxanový polymer, organosiloxanová pryskyřice a těkavý nosič v poměrech, které předepisuje specifická formulace. Tak např. fluidní diorganopolysiloxanové polymery s nízkou viskozitou (asi 10 až 100 cSt) jsou zvláště použitelné, použije - li se ethanol jako hlavní těkavý nosič. Pro polymery s vyšší viskozitou, např. pro poly(dimethylsiloxan), zde označovaný jako PDMS neboli silikonový kaučuk s viskozitou nejméně 100 000 cSt, jsou výhodné jiné těkavé nosiče, než je ethanol.

Silikonový kaučuk odpovídá vzorci, kde R je methylskupina.



Fluidní diorganopolysiloxanové polymery jako jsou tyto, jsou k mání jako např. silikonový kaučuk SE 30 a silikonová kapalina SF96 u společnosti General Electric Company. Podobné materiály lze získat také u společnosti Dow Corning a Wacker Silicones.

Jiným fluidním polymerem na bázi diorganopolysiloxanu, výhodným pro použití podle vynálezu, je dimethikon-kopolyol, kterým se modifikuje podle přání vlastnost vytvářet film. Dimethikon-kopolyol lze dále charakterizovat jako polydimethylsiloxany modifikované polyalkylen-oxidem, které vyrábí Witco Corporation pod obchodním názvem „Silwet“. Podobné materiály lze získat od firem Dow Corning, Wacker Silicones a Goldschmidt Chemical Corporation, jakož i od jiných výrobců silikonů.

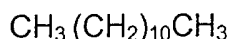
Ve výhodných provedeních tohoto vynálezu je poměr organosiloxanové pryskyřice k fluidnímu polymeru na bázi diorganopolysiloxanu v rozmezí 10 : 1 až 1 : 10, výhodněji v rozmezí 2 : 1 až 8 : 1, a nejvýhodněji v rozmezí 4 : 1 až 8 : 1.

Těkavé nosiče

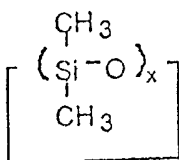
Podle vynálezu organosiloxanová pryskyřice a fluidní polymer na bázi diorganosiloxanu musejí být snadno přenositelné na povrchy ústní dutiny, jako jsou např. zubní sklovina. K dosažení tohoto přenosu je nutné, aby pryskyřice nebo výše uvedená kombinace pryskyřice a polymeru byly vpraveny do nosiče, a to zejména těkavého nosiče, který musí rychle vyprchat z povrchů ústní dutiny, a na aplikovaných površích musí zanechat film. Těkavý nosič musí solubilizovat organosiloxanovou pryskyřici, a také fluidní polymer na bázi diorganosiloxanu, je-li tento v prostředku obsažen.

Těkavý nosič obsahuje 10 až 90 %, výhodněji 15 až 80 %, a nejméně 20 až 70 % hmotnostního prostředku. Těkavý nosič podle tohoto vynálezu se zvolí ze skupiny látek, tvořené uhlovodíkovými oleji, těkavými silikony, neuhlovodíkovými rozpouštědly, a jejich směsí.

Uhlovodíkové oleje použitelné podle tohoto vynálezu jsou ty, které mají teplotu varu v rozpětí 60 až 260 °C, výhodněji které mají délku řetězce C₈ až C₂₀, a nejméně jsou to C₈₋₂₀-isoparafíny. Z těchto isoparafínů nejméně se vyberou ze skupiny látek, kterou tvoří isododekan, isohexadekan, isoeukosan, 2,2,4-trimethylpentan, 2,3-dimethylhexan, a jejich směsí. Nejméně je isododekan, který je k mání např. jako „Permethyl 99A“ od firmy Permethyl Corporation, a který odpovídá vzorci:



Výhodnými těkavými silikony jsou cyklomethikony s kruhovou strukturou o 3, 4 a 5 členech, které odpovídají vzorci:



kde x je 3 až 6. Takovými těkavými silikony jsou např. výrobky „244 Fluid“, „344 Fluid“, „245 Fluid“ a „345 Fluid“ společnosti Dow Corning Corporation.

Obecnými třídami neuhlovodíkových rozpouštědel použitelných podle tohoto vynálezu jsou estery, ketony, alkoholy, fluorované uhlovodíky a étery

fluoruhlovodíků, které mají teplotu varu v rozmezí 60 až 200 °C. Zvláště použitelná neuhlovodíková rozpouštědla nebo jejich směsi jsou ta, která jsou schopna solubilizovat pryskyřici a/nebo polymer na bázi diorganosiloxanu. Těmito rozpouštědly jsou (bez omezení pouze na tyto) ethanol, aceton, butanon, ethylacetát, propylacetát, amylacetát, ethylbutyrát, methyl(nonafluoroisobutyl)éter, methyl(nonafluorobutyl)éter, a jejich směsi. Tato neuhlovodíková rozpouštědla jsou snadno k dostání, jako např. ethylacetát a methyl(ethyl)keton dodává firma J. T. Baker, Phillipsburg, N. J., a HFE (směs methyl(nonafluoroisobutyl)éteru a methyl(nonafluorobutyl)éteru), který dodává společnost 3M Company.

Modifikátor rheologického stavu

Prostředky podle vynálezu dále obsahují modifikátor rheologického stavu, který brání usazování a separaci komponent nebo řídí usazování způsobem, který usnadňuje redisperzi a vlastnosti rheologického toku. Vhodnými modifikátory rheologie podle vynálezu jsou organicky modifikované hlíny, dioxid křemíku, polyethylen, a jejich směsi. Výhodné organofilní hlíny obsahují kvaternium-18-hektorit čili „Stearalkonium-hektorit“, jako je „Bentone 27“ a „38TM“ od firmy Rheox, disperzi organohlíny jako je „Bentone ISD gelTM“, nebo bentonitové organomodifikované hlíny, jako je „Bentone 34TM“ firmy Rheox nebo řada „Claystone SeriesTM“ od společnosti Southern Caly Products, a jejich směsi. Výhodný dioxid křemíku je kouřový dioxid křemíku, jako je řada „AerosilTM“ firmy Degussa, nebo řada „Cab-o-silTM“ společnosti Cabot Corporation, silikagely jako „SylodentTM“ nebo „SyloxTM“ firmy W.R.Grace & Co. nebo srážený dioxid křemíku, jako je „Zothix 265“ od firmy J.M.Huber Corporation.

Výhodný obsah modifikátoru rheologie v prostředku je v rozmezí 0,1 až 30%, výhodněji 0,5 až 10%, a nejméně 1 až 3% hmotnostních vytaženo na hmotnost prostředku.

Substance ústní péče

Substance ústní péče obsahuje aktivní část v množství, při kterém se po přímém použití projevý dobrý účinek očekávaný nositelem, aniž by došlo k poškození povrchu v ústní dutině, na který byla látka aplikována. Příklady ústních podmínek, na

kteře jsou tyto aktivní látky zaměřeny, jsou (bez omezení následujícím výčtem) vzhled a strukturní změny zubů, zbělení, vybělení skvrn, odstranění plaku, odstranění zubního kazu, předejití vzniku dutin a ošetření dutin, gumovité povlaky vzniklé zánětem nebo krvácením, poranění sliznic, rány, vředy, aftové vřidky, boláky, abscesy zubů, a pach úst, který je výsledkem výše citovaných podmínek a jiných příčin, jako je např. rozmnožování mikrobů.

Substance vhodné pro péči o ústní dutinu obsahují materiály, které jsou obvykle bezpečné pro ústní dutinu, a které způsobují změnu celkového vzhledu a nebo zdraví ústní dutiny. Množství této substance v prostředcích podle tohoto vynálezu obvykle bývá (pokud to není specifikováno jinak) v rozmezí 0,01 až 50%, výhodně 0,1 až 20%, výhodněji 0,5 až 10%, a nejméně 1 až 7% z celkové hmotnosti prostředku.

Prostředky ústní péče nebo substance podle tohoto vynálezu obsahují četné aktivní látky, které byly již dříve v oboru popsány. Následuje nevyčerpávající soupis aktivních látek pro péči o ústní dutinu, které se použijí v tomto vynálezu.

1. Látky aktivně bělicí zuby.

Aktivní substance ústní péče podle tohoto vynálezu obsahují látky aktivně bělicí zuby. Vhodné aktivní bělicí látky se vyberou ze skupiny látek, kterou tvoří peroxidy, chloritany kovů, perboráty, perkarbonáty, peroxykyseliny, persulfáty, a jejich kombinace. Vhodnými peroxidovými sloučeninami jsou peroxid vodíku, peroxid močoviny, kalcium-peroxid, karbamid-peroxid., a jejich směsi. Nejvýhodnější je peroxid karbamidu. Vhodnými chloritany kovů jsou kalcium-chloritan, baryum-chloritan, magnesium-chloritan, lithium-chloritan, natrium-chloritan, a kalium-chloritan. Přídavnými bělicími aktivními látkami jsou hypochlorit (chlornan) a dioxid chlóru. Výhodným chloritem je natrium-chloritan. výhodným perkarbonátem je natrium-perkarbonát. Výhodnými persulfáty jsou oxony.

2. Činidla proti zubnímu kameni

Činidla proti zubnímu kameni, známými a používanými ve výrobcích zubní péče, jsou fosfáty. Fosfáty zahrnují pyrofosfáty, polyfosfáty, polyfosfonáty, a jejich

směsi. Nejznámější ve výrobcích zubní péče jsou pyrofosfáty. Ionty pyrofosfátů a polyfosfátů, dodávané zubům, se uvolňují ze solí pyrofosfátů a polyfosfátů..

Pyrofosfátové soli použitelné v prostředcích podle tohoto vynálezu jsou dialkalické a tetraalkalické (alkalického kovu), a jejich směsi. Nejvýhodnější sloučeniny jsou dinatrium-dihydrogenpyrofosfát ($\text{Na}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$), tetranatrium-pyrofosfát ($\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$) a tetrakalium-pyrofosfát ($\text{K}_4\text{P}_2\text{O}_7$), a to ve své hydratované i nehydratované formě. Použit se může kterýkoli z výše uvedených pyrofosfátů, avšak přednost se dává tetranatrium-pyrofosfátu. Rovněž jsou výhodné např. natrium-polyfosfát a trietanolamin-polyfosfáty.

Pyrofosfátové soli jsou podrobněji popsány v publikaci Kirk & Othmer: „Encyclopedia of Chemical Technology“, 3. vyd., sv. 17, Wiley - Interscience Publishers (1982). Dalšími činidly proti zubnímu kameni jsou pyrofosfáty nebo polyfosfáty popsané v USP 4 590 066, vyd. 20. května 1986, Parran & Sakkab; polyakryláty a jiné polykarboxyláty popsané v USP 3 429 963, vyd. 25. února 1969, Sheldovskyho, a v USP 4 304 766, vyd. 8. prosince 1969, Changa, a USP 4 661 341, vyd. 28. dubna 1987, Benedict & Sunberg; polyepoxyjantarany popsané v USP 4 846 650, vyd. 11 července 1989, Benedict, Bush & Sunberg; ethylendiamintetraoctová kyselina popsaná v BP 490 384, vyd. 15. února 1937; nitriltriocetová kyselina a příbuzné sloučeniny popsané v USP 3 678 154, vyd. 18. července 1972, Widder & Briner; polyfosfonáty popsané v USP 3 737 533, vyd. 26. října 1976, Ploger, Schmidt - Dunker & Gloxhuber, a USP 4 877 603, vyd. 31. října 1989, Degenhardt & Kozikowski. Z fosfátů proti zubnímu kameni jsou to kalium- a natrium-pyrofosfáty, natrium-tripolyfosfát, difosfonáty jako ethan-1-hydroxy-1,1-difosfonát, 1-azacykloheptan-1,1-difosfonát, a lineární alkyl-difosfonáty, lineární karboxylové kyseliny, a citrát sodíku a zinku.

Činidla použitelná místo nebo v kombinaci s pyrofosfátovými solemi zahrnují takové známé materiály, jako jsou syntetické anionické polymery včetně polyakrylátů a kopolymerů maleinového anhydridu nebo kyseliny, a methyl (vinyl) éter (např. Gantrez), popisované např. v USP 4 627 977, autor Gaffar aj.; rovněž jsou to polyamino-propansulfonová kyselina (AMPS), trihydrát citrátu zinku, polyfosfáty (např. tripolyfosfát, hexametafosfát), difosfonáty (např. EHDP; AHP), polypeptidy (jako je polyasparagová a polyglutamová kyselina), a jejich směsi.



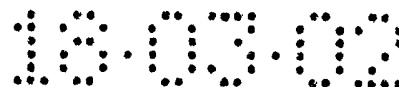
3. Zdroj iontů fluoridu

Zdroje fluoridových iontů jsou dobře známé a používané v prostředcích pro péči o ústní dutinu jako činidla proti zubnímu kazu. Fluoridové ionty jsou obsaženy v četných prostředcích ústní péče, a zejména v zubních pastách. Patenty popisující takové zubní pasty jsou: USP 3 689 637, vyd. 5. září 1972, Pader; USP 3 711 604, vyd. 16. ledna 1973, Colodney aj.; USP 3 911 104, vyd. 7. října 1975, Harrison; USP 4 040 858, vyd. 9. srpna 1977, Wason.

Aplikace fluoridových iontů na zubní sklovinu brání rozpadu zubů. Jako zdroje rozpustného fluoridu v instantních prostředcích lze použít široké palety materiálů skýtajících fluoridový iont. Příklady vhodných materiálů skýtajících fluoridový iont najdeme v USP 3 535 421, vyd. 20. října 1970, Briner aj.; USP 3 678 154, vyd. 18. července 1972, Widder aj.. Výhodnými zdroji fluoridového iontu pro použití podle vynálezu jsou fluorid sodný, fluorid draselný a fluorid amonný. Zvláště vhodný je fluorid sodný. Instatní prostředky poskytují výhodně 50 až 10 000 ppm, výhodněji 100 až 3 000 ppm fluoridového iontu v prostředcích, které přijdou do styku s povrchem zubů, byl-li použit systém dodávání (iontů) podle tohoto vynálezu.

4. Antimikrobiální činidla

V prostředcích ústní péče nebo substancích podle tohoto vynálezu jsou obsažena také antimikrobiální činidla. Těmito činidly jsou (bez omezení tímto výčtem): 5-chloro-2-(2,4-dichlorofenoxy)-fenol, obvykle označovaný jako triclosan a popsáný v „The Merck Index“, 11. vyd. (1989), str. 1529 (vstup čís. 9573) a v USP 3 506 720 a v Evropské pat. přihlášce čís. 0 251 591, Beecham Group, PLC, zveř. 7. ledna 1988; dále kyselina ftalová a její soli včetně solí popsáných v USP 4 994 262, z nichž výhodný je magnesium-monokalium-ftalát, chlorhexidin (Merck Index čís. 2090). alexidin (Merck Index čís. 222); hexetidin (Merck Index čís. 4624); sanguinarin (Merck Index čís. 8320); benzalkoniumchlorid (Merck Index čís. 1066); salicylanilid (Merck Index čís. 8299); domifenbromid (Merck Index čís. 3411); cetylpyridiniumchlorid (CPC) (Merck Index čís. 2024); tetradecyl-pyridiniumchlorid (TPC); N-tetradecyl-4-ethylpyridiniumchlorid (TDEPC); oktenidin; delmopinol; oktapinol a jiné deriváty piperidinu; preparáty nicinu; činidla s iontem zinečnato-cínatým; antibiotika jako augmentin, amoxicillin, tetracyklin, doxycyklin, minocyklin a



metronidazol; a analoga a soli výše uvedených; éterické oleje (silice) včetně thymolu, geraniolu, karvakrolu, citralu, hinokitiolu, eukalyptolu, katecholu (zejména 4-allyl-katechol) a jejich směsi; methylsalicylát; peroxid vodíku; soli kovů a chloritanu, a směsi všech z výše uvedených.

5. Protizánětlivá činidla

Do prostředků nebo substancí péče o ústní dutinu se přidávají také činidla působící proti zánětům. Tato činidla mohou obsahovat (bez omezení na vyjmenované) nesteroidální antizánětlivá činidla neboli NSAID, jako je ketorolac, flurbiprofen, ibuprofen, naproxen, indomethacin, aspirin, ketoprofen, piroxicam a kyselina meclofenamová. Použití NSAID, jako je např. „Ketorolac“, je nárokováno v USP 5 626 838, vyd. 6. května 1997. V patentu jsou popsány metody prevence a nebo ošetření primárního nebo opakovaného výskytu karcinomu šupinkových buněk ústní dutiny nebo hltanu topickým podáváním účinného množství NSAID do ústní dutiny nebo hltanu.

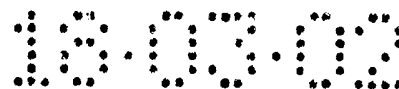
6. Výživné přísady

Výživné přísady zlepšují podmínky v ústní dutině a mohou se přidat do prostředků nebo substancí pro ústní péči podle tohoto vynálezu. Výživnými přísadami jsou minerály, vitaminy, ústní výživné doplňky, enterální (střevní) výživné přísady, a jejich směsi.

Minerály přidávané do prostředků podle tohoto vynálezu jsou vápník, fosfor, zinek, mangan, draslík, a jejich směsi. Tyto minerály jsou uvedeny v publikaci „Drug Facts and Comparisons“ (na volných listech informační služby o lécích), vyd. Wolters Kluwer Copany, St. Louis, Mo., 1997, str. 10 - 17.

Vitaminy je možno přidávat spolu s minerály nebo samostatně. Z vitaminů jsou to vitamin C a D, thiamin, ryboflavin, kalcium-pantothenát, niacin, kyselina listová, nikotinamid, pyridoxin, cyanokobalamin, p-aminobenzoová kyselina, bioflavonoidy, a jejich směsi. Tyto vitaminy jsou popsány v publikaci „Drug Facts and Comparisons“... (viz výše), 1997, str. 3 - 10.

Orálními výživnými přísadami jsou aminokyseliny, lipotropika, rybí tuk, a jejich směsi, které jsou uvedeny v publikaci „Drug Facts and Comparisons“... (viz výše),



1997, str. 54 - 54e. Použitelnými aminokyselinami jsou (bez omezení na tento výčet): L-tryptofan, L-lysin, methionin, threonin, levokarnitin čili L-karnitin, a jejich směsi. Lipotropika jsou (bez omezení na tento výčet): cholin, inositol, betain, kyselina linolová a linolenová, a jejich směsi. Rybí tuk obsahuje velké množství omega-3 (N-3) polynenasycených mastných kyselin, eicosapentaenovou kyselinu a docosahexaenovou kyselinu.

Střevními (enterálními) výživnými přísadami jsou (bez omezení na tento výčet): proteinové produkty, glukosové polymery, kukuřičný (klíčkový) olej, saflorový olej, triglyceridy se středním řetězcem. Jsou popsány v publikaci „Drug Facts and Comparisons“... (viz výše), 1997, str. 55 - 57.

7. Preparáty pro péči o ústa a krk

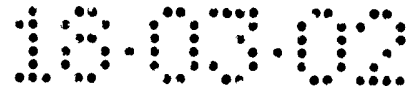
Další materiály použitelné v souvislosti s tímto vynálezem jsou běžně známé preparáty péče o ústa a krk. Tyto produkty jsou popsány v publikaci „Drug Facts and Comparisons“ (na volných listech Informační služby o lécích), vyd. Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo., 1997, str. 520b až 527. Tyto produkty zahrnují (avšak bez omezení na vyjmenované) antifungální, antibiotická a analgetická činidla.

8 Antioxidanty

Antioxidanty jsou obecně pokládány za užitečné v prostředcích, jaké jsou předmětem tohoto vynálezu. Antioxidanty jsou popsány v publikacích jako je „The Handbook of Antioxidants“, autoři Cadenas a Packer, vyd. Marcel Dekker Inc., 1996. Antioxidanty použitelné v prostředcích nebo substancích zubní péče podle tohoto vynálezu jsou (bez omezení na vyjmenované): vitamin E, kyselina askorbová, kyselina močová, karotenoidy, vitamin A, flavonoidy a polyfenoly, rostlinné antioxidanty, melatonin, aminoindoly, lipidní kyseliny, a jejich směsi.

9. H-2 antagonistické sloučeniny (H-2 antagonistika)

V prostředku ústní péče podle tohoto vynálezu se mohou použít antagonistické sloučeniny receptorů histaminu-2 (H-2 nebo H₂) (označované jako H-2 antagonistika). Pro použití podle vynálezu selektivní H-2 antagonistika jsou

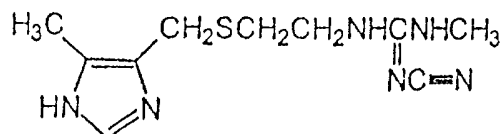


sloučeniny, které blokují H-2 receptory, nevyvíjejí však žádnou znatelnou aktivitu pro blokování receptorů histaminu-1 (H-1 neboli H1). Selektivní H-2 antagonistika stimulují stahování hladkých svalů různých orgánů, jako jsou např. vnitřnosti (střevo) a průdušky; tento efekt lze potlačit nízkou koncentrací mepyraminu - typického antihistaminického léku. Farmakologické receptory, vyskytující se v těchto histaminických odezvách citlivých na mepyramin, jsou definovány jako H-1 receptory (viz A. S. F. Ash a H. O. Schild, Brit. J. Pharmacol., Chemother., sv. 27 (1966), str. 427). Histamin také stimuluje vylučování kyseliny v žaludku (viz E. R. Loew a O. Chickering, Proc. Soc. Exp. Biol. Med., sv. 48 (1941), str. 65), zvyšuje tep srdce (viz U. Trendelenburg, J. Pharmacol., sv. 130 (1960), str. 450), a brání kontrakcím dělohy krysy (viz P. B. Dews a J. D. P. Graham, Brit. J. Pharmacol. Chemoter., sv. 1 (1946), str. 278); tyto účinky nemohou být antagonizovány mepyraminem a příbuznými léky. H-2 antagonistika užitečná v prostředcích nebo substancích ústní péče blokují receptory přicházející v úvahu v ne-H-1 (H-2) histaminových odezvách necitlivých na mepyramin, a neblokují receptory v histaminových odezvách citlivých na mepyramin.

Selektivní H-2 antagonistika jsou sloučeniny, u nichž bylo zjištěno, že jsou H-2 antagonistické, a to podle jejich chování při klasických předklinických screeningových testech na H-2 antagonistickou funkci. Selektivní H-2 antagonistika jsou definována jako sloučeniny, které mohou fungovat jako inhibitory schopné nebo neschopné realizovat efekty zprostředkované histaminem ve screeningových modelech specificky závislých na funkci H-2 receptoru, kterým však chybí význačná histaminová antagonistická aktivita v screeningových modelech, závislých na funkci H-1 receptoru. Specificky jde o sloučeniny, které definují a popisují J. W. Black, W. A. M. Duncan, C. J. Durant, C. R. Ganellin a E. M. Parsons (v článku „Definition and Antagonism of Histamine H₂-receptors“, Nature sv. 236 (21. dubna 1972), str. 385 - 390 (Black)), a to jako H-2 antagonistika, byla-li zkoumána, jak popisuje Black, testováním spontánního tepu pravé síně morčete při zkoušce in vitro, a sekrece žaludeční kyseliny krysy při zkoušce in vivo, kdy se však prokázal nedostatek značnější H-1 antagonistické aktivity ve srovnání s aktivitou H-2, což bylo stanoveno, jak popisuje Black, jak kontrakcí střev morčete při zkoušce in vitro, tak kontrakcí svalu žaludku krysy při zkoušce in vivo. Je výhodné, že H-2 antagonistika nevykazují žádnou znatelnější H-1 aktivitu bylo-li při výše zmíněných zkouškách H-1 použito rozumné (přiměřené) dávkování. Typickou rozumnou hladinou je nejnižší dávka, při

níž se při výše zmíněné zkoušce na H-2 dosáhne 90% inhibice (blokování) histaminu, a výhodněji 99% inhibice histaminu.

Selektivní H-2 antagonistika jsou sloučeniny splňující výše zmíněná kritéria a popsané v patentech USP 5 294 433 a USP 5 364 616 autorů Singer aj., vyd. 3/15/94 resp. 11/15/94, udělených firmě Procter & Gamble, podle nichž selektivní H-2 antagonistikum se vybere ze skupiny látek, kterou tvoří cimetidin, etintidin, ranitidin, ICIA' 5165, tiotidin, ORF-17578, lupitidin, donetidin, famotidin, roxatidin, pifatidin, lamtidin, BL-6548, BMY-25271, zaltidin, nizatidin, mifentidin, BMY-25368 (SKF-94482), BL-6341A, ICI-162846, ramixotidin, Wy-45727, SR-58042, BMY-25405, loxtidin, DA-4634, bisfentidin, sufotidin, ebrotidin, HE-30-256, D-16637, FRG-8813, FRG-8701, impromidin, L-643728, a HB-408. Nejvýhodnější je cimetidin (SKF-923334) tj. N-cyano-N'-methyl-N''-(2-(((5-methyl-1H-imidazol-4-yl)methyl)thio)ethyl)guanidin o vzorci:

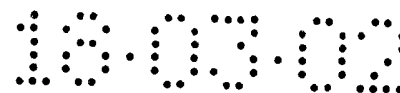


Cimetidin je také uveden v publikaci „Merck Index“, 11. vyd. (1989), str. 354 (vstup čís. 2279), a „Physicians Desk Reference“, 46. vyd. (1992), str. 2228.

Příbuzná výhodná H-2 antagonistika jsou buriamid a metlamid.

10. Analgeticky aktivní látky

Do prostředků nebo substancí ústní péče podle tohoto vynálezu se přidávají také léky proti bolestem a znečitlivující činidla. Tato činidla jsou (bez omezení tímto výčtem): stroncium-chlorid, kalium-nitrát, přírodní rostlinné látky jako je duběnka, Asarum, Cubebin, Galanga, scutellaria, Liangmianzhen, Baizhi, atd.



11. Protivirové aktivní látky

V prostředku podle vynálezu se jako protivirové aktivní látky použijí jakékoliv známé látky, které se běžně používají k potírání virálních infekcí. Tyto antivirální aktivní látky jsou uvedeny v publikaci „Drug Facts and Comparisons“ (na volných listech informační služby o lécích), vyd. Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo., 1997, str. 402(a) až 407(z), kterou zde uvádíme celou jako odkaz. Specifické příklady protivirových aktivních látek jsou uvedeny v USP 5 747 070, vyd. 5. května 1998, autor Satyanarayna Majeti, uvedeném zde jako odkaz ve svém celku. V tomto patentu se uvádí použití cínatých solí k potírání virů. Cínaté soli a jiné protivirové aktivní látky jsou podrobně popsány v publikaci Kirka a Othmera „Encyklopedia of Chemical Technology“, 3. vyd., sv. 23, Wiley-Interscience Publishers, 1982, str. 42 - 71, která je zde uvedena jako odkaz ve svém celku. Cínaté soli použitelné podle tohoto vynálezu jsou organické karboxyláty Sn a anorganické halidy Sn. Je možno použít také fluoridu cínatého, ten se však běžně používá pouze v kombinaci s jiným halidem Sn nebo s jedním nebo více karboxylátů Sn, nebo s jiným terapeutickým činidlem.

12 Jiné ingredience

Vedle výše uvedených materiálů v prostředku podle vynálezu je žádoucí přidávat do substance pro ústní péči i četné další komponenty. Přídavnými komponentami jsou (míněno bez omezení následujícím výčtem) příchuťové přísady, sladidla, xylitol, kaliva (opacifikační přísady), barviva, surfaktanty a chelatační přísady (chelanty) jako je ethylendiamintetraoctová kyselina. Vhodnými chuťovými přísadami jsou (míněno bez omezení následujícím výčtem): mátová silice, sassafrasová silice, hřebíčková silice, máta peprná, mentol, anetol, thymol, methylsalicylát, eukalyptol, kasiová silice, 1-methylacetát, šalvěj, eugenol, petrželová silice, oxanon, libavková silice, alfa-irison, mátový olej, majoránka, citronová silice, pomerančová silice, propenyl-guaethol, skořicová silice, a jejich směsi.

Do prostředku podle vynálezu se také přidávají pigmenty, k přesnějšímu označení míst, na která byl prostředek již aplikován, což umožňuje uživateli aplikovat prostředek důkladněji a rovnoměrněji. Avšak tyto pigmenty nesmějí maskovat skvrny, které bývají na povrchu zubů.

Tyto přídatné ingredience mohou být použity také místo sloučenin uvedených výše.

Příklady provedení vynálezu

Následující příklady dále popisují a demonstrují jednotlivá provedení v rozsahu vynálezu. Tyto příklady jsou uvedeny pouze pro objasnění a nejsou míněny jako omezení tohoto vynálezu, neboť jsou možné různé variace, které se neodklánějí od ducha a obsahu vynálezu.

Tabulka 1: Hydrofobní prostředky ústní péče

Komponenta	Př. 1	Př. 2	Př. 3	Př. 4	Př. 5	Př. 6
Organosiloxanová pryskyřice ¹	25	25	24,6	25	25	25
Silikonový kaučuk ²	12,5	4,2	3,5	2,5	1,8	-
Substance ústní péče ³	17	17	17	17	17	17
Těkavý nosič ⁴	44,5	52,8	53,9	54,5	55,2	57,0
Bentonitová hlínka ⁵	1	1	1	1	1	1
CELKEM	100	100	100	100	100	100

- 1 Např. pryskyřice MQ, dodává General Electric pod označením „1170-002“.
- 2 Např. dimetikonový kaučuk, dodává General Electric pod označením „SE 30“ nebo „SE 63“.
- 3 Např. natrium-perkarbonát jako suchý prášek.
- 4 Např. isododekan nebo směs 50/50 ethylacetátu a butanonu nebo směs ethylacetátu, propylacetátu a HFE. Procento každé jednotlivé složky rozpouštědla v systémech smíšeného rozpouštědla může kolísat od 0 do 100 %.
- 5 „Bentone 27“ od firmy Rheox.

Tabulka 2: Hydrofobní prostředek ústní péče

Komponenta	Př. 1	Př. 2	Př. 3	Př.4
Organosiloxanová pryskyřice ¹	33,43	33,43	35,14	33,43
Silikonový kaučuk ²	5,57	5,57	5,86	5,57
Substance ústní péče ³	19,00	12,00	19,00	19,00
Ethylacetát	8,00	8,50	8,00	8,00
Bentonitový gel ⁴	10,00	10,00	10,00	10,00
DC-200/350cst. ⁵	1,00	1,00	2,00	1,00
HFE-7100 ⁶	21,00	26,00	-	19,50
N-propylacetát	2,00	2,00	-	2,00
2-butanon	-	-	19,00	-
Aerosil 200 ⁷ (SiO ₂)	-	-	1,00	-
Chuťová přísada (aroma)	-	1,50	-	1,50
CELKEM	100	100	100	100

- 1 Např. pryskyřice MQ, dodává General Electric pod označením „1170-CO2“.
- 2 Např. dimetikonový kaučuk, dodává General Electric pod označením „SE 30“.
- 3 Např. natrium-perkarbonát jako suchý prášek.
- 4 Bentonitový gel „IPM“, dodává Rheox.
- 5 DC-200/350 je: dimethylpolysiloxan, dodává Dow Corning, CAS číslo „9016-00-6“.
- 6 HFE-7100 je směs methyl(nonafluoroisobutyl)éteru (CAS čís. 163702-08-7) a methyl(nonafluorobutyl)éteru (CAS čís. 163702-07-6), vyrábí firma 3M Co.
- 7 Aerosil 200 je dioxid křemíku (chemicky preparovaný), CAS čís. 112945-52-5, vyrábí Degussa AG.

Způsob přípravy

Prostředky podle tabulky 1 a 2 jsou nevodné. Substance ústní péče jsou dispergovány nebo rozpuštěny v roztoku, který obsahuje organosiloxanovou pryskyřici, fluidní diorganopolysiloxanový polymer, těkavý nosič a modifikátor konsistence (rheologické).

Hydrofobní prostředky podle tabulky 1 a 2 se vhodně připraví následovně. Tři sta (300) gramů roztoku organosiloxanové pryskyřice (např. 43,7% roztok pryskyřice MQ v isodekanu, nebo ve směsi 50/50 ethylacetátu a butanonu, nebo ve směsi

Tabulka 4: Prostředky ústní péče

Komponenta	Př. 1	Př. 2	Př. 3	Př. 4	Př. 5
Ethylacetát	24,50	27,75	22,00	19,96	21,10
2 - butanon	24,50	16,30	22,00	10,00	21,10
Isodekan	-	-	-	11,54	-
Limonen	-	-	-	5,00	-
Pryskyřice MQ	30,40	33,00	28,80	36,00	32,84
Silikonový kaučuk SE30	7,60	11,00	14,40	-	8,21
Silikonová kapalina 10cStk	-	-	-	9,00	-
Bentonitový gel ISD	10,00	8,00	10,50	-	11,75
Hlinka HY	-	-	-	3,00	-
Cab - o - sil	-	1,50	-	-	-
Oxychlorid bismutu	-	1,00	-	-	-
Dioxid titanu	-	-	-	2,00	-
Aromatický olej	-	0,15	-	-	-
Kalium - nitrát	-	-	-	-	5,00
Natrium - chlorit	3,00	-	-	-	-
Tripolyfosfát	-	-	-	2,50	-
Fluorid sodný	-	1,00	-	1,00	-
Chlorhexidin Glukonát	-	-	2,00	-	-
Natrium - sacharin	-	0,30	0,30	-	-
Celkem	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00

Tabulka 5: Prostředky ústní péče

Komponenta	Př. 1	Př. 2	Př. 3	Př. 4	Př. 5	Př. 6
Ethylacetát	26,00	22,00	35,00	28,00	25,77	23,00
2 - butanon	25,95	17,00	9,00	14,50	25,50	23,45
Isodekan	-	10,00	-	-	5,00	-

Limonen	-	4,00	-	-	-	-
Pryskyřice MQ	28,00	32,50	33,00	35,00	27,00	28,00
Silikonový kaučuk SE30	7,00	-	11,00	5,00	3,00	7,00
Silikonová kapalina 10cStk	-	6,50	-	-	-	-
Bentonitový gel ISD	10,00	-	8,00	10,00	10,00	-
Hlinka HY	-	2,00	-	-	-	7,00
Cab - o - sil M7D	-	-	1,50	-	-	-
Oxychlorid bismutu	-	5,00	-	-	-	10,00
Dioxid titanu	3,00	-	1,00	5,00	2,00	-
Aromatický olej	-	-	0,10	-	-	-
Polymethylseskvioxan	-	-	1,00	-	-	-
Polymethyl - methakrylát	3,00	1,00	-	-	0,50	-
Nylon 12	-	-	-	2,00	-	1,00
Silika (SiO ₂)	-	-	-	-	0,50	-
Žlut' FD & C čís.5 Al Lake	0,05	-	0,10	-	0,05	0,10
Oxid železa červený	-	-	-	0,50	0,03	-
Natrium - sacharin	-	-	0,30	-	0,50	0,30
Celkem	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00

Tabulka 6: Prostředky na bázi ethanolu

Komponenta	Př. 1	Př. 2	Př. 3	Př. 4	Př. 5	Př. 6
Ethanol	20,90	35,80	41,70	25,89	23,10	23,55
Ethylacetát	-	-	-	-	4,95	-
Ethylbutyrát	10,30	-	-	12,74	11,75	10,9
Isoamylacetát	-	-	-	-	-	2,65
Isodekan	-	13,00	-	-	-	-
Pryskyřice MQ	35,10	32,85	42,75	47,00	42,00	41,80
Silikon Visc - 100M	-	-	-	-	7,15	-
Silikonová kapalina 100cStk	7,80	-	-	9,65	-	8,55
Silikonová kapalina 10cStk	3,90	-	11,40	-	4,00	-
Silwet L - 7500	-	-	-	-	0,45	-

Bentone 27	1,50	-	2,00	1,85	1,35	1,97
Hlinka APA	-	2,00	-	-	-	-
Cab - o - sil	-	-	-	-	0,45	-
Natrium - perkarbonát	19,00	-	-	-	-	-
Peroxid karbamidu	-	15,00	-	-	-	-
Kalium - nitrát	-	-	-	-	5,00	-
Tripolyfosfát	-	-	-	-	-	2,50
Chlorhexedin Diglukonát	-	-	-	2,57	-	-
Dioxid titanu	1,50	-	2,00	-	-	1,50
Aromatický olej	-	-	0,05	-	-	-
Fluorid sodný	-	-	0,10	-	0,25	-
Natrium - sacharin	-	0,20	-	0,30	-	-
Celkem	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00	100,00

Způsob přípravy

Prostředky podle tabulek 3 až 6 se vhodně připraví následovně. Do nádoby vhodné pro minimalizaci ztrát rozpouštědla se vloží rozpouštědla. Přidají se modifikátory konsistence (rheologie) a míchá se až do úplné disperze. Přidá se silikonová pryskyřice a míchá se až do úplného rozpuštění. Přidá se silikonový kaučuk a/nebo silikonové kapaliny a míchá se až do úplného rozpuštění. Nyní se přidají některé soli, jako je natrium-perkarbonát a/nebo jiné aktivní látky ústní péče, ingredience zlepšující estetický vzhled, jako jsou opacifikátory, sladidla, barviva a chuťové přísady (aromata). Pokračuje se v míchání až do úplné homogenity. K podpoře smísení se zavede další stupeň stříhového (příčného) míchání. Balí se do vzduchotěsných obalů.

K usnadnění rozpouštění silikonu a výroby je možno alternativně připravit předsměsi silikonové pryskyřice a/nebo silikonového kaučuku, než se vše podrobí finálnímu kroku mísení. Pořadí přidávání komponent může být různé v závislosti na formulaci prostředku; tak např. přidávání modifikátorů konsistence (rheologie) se

může přesunout do pozdějšího kroku a tím udržet nižší viskozitu až do posledních kroků míchání.

Provedení popsaná a představovaná příklady uvedených tabulek mají mnohé výhody. Tak např. poskytují větší trvanlivost a lepší předávání substancí ústní péče, a to zejména na povrchy zubů. Také umožňují vhodné, diskrétní a snadné použití formy výrobků, která skýtá výhody značně odlišné, než jaké mohou poskytnout konvenční výrobky. Mimo to aktivní látky ústní péče, které by jinak v systému filmu na bázi vody projevovaly nestabilitu, mohou být vpraveny do prostředků podle vynálezu bez kompromisního snížení stability.

Způsob použití

K praktickému využití tohoto vynálezu uživateli stačí pouze aplikovat prostředek obsahující substanci nebo substance ústní péče, které jsou potřebné k dosažení požadovaného účinku, jakým je např. zbělení zubů, osvěžení dechu, prevence kažení zubů, uvolnění bolesti, ozdravení dásní, ošetření zubního kamene, atp. Aplikuje se na povrch zubů v požadovaném místě. Tyto prostředky lze také aplikovat na jiné povrchy ústní dutiny, jako jsou dásňové nebo slizniční tkáně, nebo na jakýkoliv jiný povrch ústní dutiny. Prostředek lze aplikovat kartáčkem, tužkovým aplikátorem, tamponovým aplikátorem a podobně, nebo pouze pomocí prstů.

Na povrchu s aplikovaným prostředkem se rychle vytvoří film obsahující substanci ústní péče. Předávání substance ústní péče po delší dobu je umožněno tím, že se tato substance uvolňuje z filmu po dlouhou dobu. Potom se zbylá substance ústní péče snadno odstraní otřením, kartáčkem nebo výplachem úst, a to po uplynutí určité požadované doby nebo během obvyklého normálního čištění zubů kartáčkem, nebo během jiné péče o ústní dutinu. Bez teoretického zdůvodňování předpokládáme, že film vydrží na místě 2 až 8 hodin bez ohledu na reaktivitu substance ústní péče. Je výhodné, aby prostředek po aplikaci v ústní dutině byl nanejvýš neznatelný.

Před aplikací prostředku podle tohoto vynálezu není nutné ústní dutinu nějak ošetřit. Tak např. uživatel může nebo nemusí zvolit zubní kartáček nebo výplach úst před aplikací prostředku. Povrchy ústní dutiny nemusí být před aplikací prostředku ani vysoušeny, ani nadměrně zvlhčovány slinami nebo vodou. Předpokládá se však, že adheze k povrchům zubní skloviny se zlepší, jsou-li zuby při aplikaci suché.

Rozumí se, že tento vynález se nevztahuje pouze na způsoby dodávání substance ústní péče do ústní dutiny člověka, ale že se vztahuje i na způsob dodávání substance ústní péče do huby zvířete, jako např. domácích mazlíčků nebo jiných zvířat, nebo zvířat držených v zajetí.

Rozumí se, že příklady a provedení popsaná v textu vynálezu jsou míněna pouze pro ilustrativní účely, a že zkušeného odborníka napadnou různé modifikace nebo změny ve smyslu vynálezu, aniž by se odchýlil od rozsahu tohoto vynálezu.

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Prostředek pro dodávání substance ústní péče do ústní dutiny, vyznačující se tím, že obsahuje:
 - a/ organosiloxanovou pryskyřici výhodně v množství od 5 % do 70 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku;
 - b/ těkavý nosič schopný solubilizovat organosiloxanovou pryskyřici, výhodně obsažený v množství 10 % až 90 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku;
 - c/ činidlo modifikující rheologickou konsistenci, obsažené výhodně v množství od 0,1 % do 30 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku; a
 - d/ nejméně jednu substanci pro ústní péči výhodně v množství od 0,1 % do 50 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku.
2. Prostředek podle nároku 1, vyznačující se tím, že organosiloxanová pryskyřice sestává z jednotek vybraných ze skupiny látek tvořené jednotkami „M“ $(\text{CH}_3)\text{SiO}_{0,5}$, jednotkami „D“ $(\text{CH}_3)\text{SiO}$, jednotkami „T“ $(\text{CH}_3)\text{SiO}_{1,5}$, jednotkami „Q“ SiO_2 , s jejich směsemi, při čemž výhodná siloxanová pryskyřice sestává z jednotek MQ, kdy poměr M : Q je v rozsahu od 0,5 : 1,0 do 1,5 : 1,0.
3. Prostředek podle nároku 1, vyznačující se tím, že těkavý nosič se zvolí ze skupiny sestávající z uhlovodíkových olejů, těkavých silikonů, neuhlíkových rozpouštědel, a jejich směsí, při čemž výhodný těkavý nosič se zvolí ze skupiny látek, které tvoří ethanol, isododekan, butanon, ethylacetát, propylacetát, methyl(nonafluoroisobutyl)éter, methyl(nonafluorobutyl)éter, a jejich směsi.
4. Prostředek podle nároku 1, vyznačující se tím, že substance ústní péče obsahuje nejméně jednu aktivní látku pro ústní péči, zvolenou ze skupiny látek, kterou tvoří aktivní látka bělicí zuby, činidlo proti zubnímu kameni, zdroj fluoridového iontu, antimikrobiální činidlo, protizánětlivé činidlo, jedna nebo více živin, produkty proti bolení v ústech a v krku, antioxidant, H-2

antagonistikum, analgetikum, protivirové činidlo, chuťové přísady, sladidla, xylitol, opacifikátory, barviva, surfaktanta, chelenty, pigmenty, a jejich směsi.

5. Prostředek podle nároku 4, vyznačující se tím, že substancí ústní péče je aktivní látka bělící zuby, zvolená ze skupiny látek, kterou tvoří peroxidy, chloritany kovů, perboráty, perkarbonáty, peroxykyseliny, persulfáty, a jejich směsi.
6. Prostředek podle nároku 1, vyznačující se tím, že modifikátor rheologické konsistence se zvolí ze skupiny látek, kterou tvoří organicky modifikované hlíny, dioxid křemíku, polyethylen, a jejich směsi.
7. Prostředek pro dodávání substance ústní péče do ústní dutiny, vyznačující se tím, že obsahuje:
 - a) organosiloxanovou pryskyřici výhodně v množství od 5 % do 70 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku;
 - b) fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu, výhodně v takovém množství, aby poměr organosiloxanové pryskyřice k fluidnímu polymeru na bázi diorganopolysiloxanu byl v rozmezí od 10 : 1 do 1 : 10;
 - c) těkavý nosič schopný solubilizovat organosiloxanovou pryskyřici a fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanovu, výhodně v množství od 10 % do 90 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku;
 - d) činidlo modifikující rheologickou konsistenci výhodně v množství od 0,1 % do 30 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku;
 - e) nejméně jednu substancí ústní péče, obsažené výhodně v množství od 0,01 % do 50 % hmotnostních, vztaženo na hmotnost prostředku.
8. Prostředek podle nároku 7, vyznačující se tím, že fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu sestává z opakujících se jednotek o vzorci $(R_2SiO)_n$, kde R se zvolí ze skupiny látek, kterou tvoří monovalentní radikály obsahující 1 až 6 atomů uhlíku nebo radikály obsahující polyalkylenoxidovou skupinu, nebo jejich směsi; výhodné R se zvolí ze skupiny, kterou tvoří methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, t-butyl, amyl, hexyl, vinyl, allyl, cyklohexyl, amino-alkyl, fenyl, fluoroalkyl, a jejich směsi.



9. Prostředek podle nároku 8, vyznačující se tím, že fluidní polymer na bázi diorganopolysiloxanu je zakončen triorganosilyl-skupinami o vzorci (R'_3Si) , kde R' je monovalentní radikál zvolený ze skupiny látek, kterou tvoří radikály s 1 až 6 atomy uhlíku, hydroxylové skupiny, alkoxy-skupiny, a jejich směsi.
10. Prostředek podle nároku 7, vyznačující se tím, že fluidním polymerem na bázi diorganopolysiloxanu je poly(dimethylsiloxan).
11. Prostředek podle nároku 7, vyznačující se tím, že fluidním polymerem na bázi diorganopolysiloxanu je polyalkylenoxidem modifikovaný poly(dimethylsiloxan).
12. Prostředek podle nároku 7, vyznačující se tím, že těkavý nosič se vybere ze skupiny látek, kterou tvoří uhlovodíkové oleje, těkavé silikony, neuhlovodíková rozpouštědla a jejich směsi, a že výhodný těkavý nosič se vybere ze skupiny látek, kterou tvoří ethanol, isododekan, butanon, ethylacetát, propylacetát, methyl(nonafluoroisobutyl)éter, methyl(nonafluorobutyl)éter, a jejich směsi.
13. Prostředek podle nároku 7, vyznačující se tím, že modifikátor rheologické konsistence se vybere ze skupiny látek, kterou tvoří organicky modifikované hlíny, siliky, polyethylen, a jejich směsi.
14. Prostředek podle kteréhokoliv z nároků 7 až 13, vyznačující se tím, že substance ústní péče obsahuje nejméně jednu aktivní látku ústní péče vybranou ze skupiny látek, kterou tvoří aktivní bělidlo zubů, činidlo proti zubnímu kameni, zdroj iontů fluoru, protimikrobiální činidlo, protizánětlivé činidlo, jedna nebo více živin, lék proti bolestem v ústech a krku, antioxidant, H-2 antagonistikum, aktivní analgetikum, protivirové činidlo, chuťové (aromatické) přísady, sladidla, xylitol, kaliva, barviva, surfaktanty, chelanty, pigmenty, a jejich směsi.
15. Prostředek podle nároku 14, vyznačující se tím, že aktivní bělidlo zubů se vybere ze skupiny látek, kterou tvoří peroxidy, chloritany kovů, perboráty, perkarbonáty, peroxykyseliny, persulfáty, a jejich směsi.
16. Způsob dodání substance ústní péče nejméně na jeden povrch ústní dutiny, vyznačující se tím, že sestává z následujících kroků: 1/ aplikace

prostředku podle kteréhokoliv z nároků 1 až 15 na povrch ústní dutiny;
2/ umožnění, aby prostředek na povrchu ústní dutiny vytvořil film.

17. Způsob podle nároku 16, vyznačující se tím, že prostředek obsahuje aktivní látku bělící zuby a že povrchem, na který se aplikuje prostředek, je zubní sklovina.