

PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

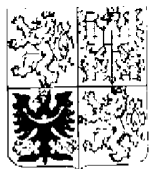
zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(21) Číslo dokumentu:

3450-97

(19)

ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **19. 04. 96**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **02.05.95**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **95/434149**

(33) Země priority: **US**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **18. 03. 98**
(Věstník č. 3/98)

(86) PCT číslo: **PCT/US96/05499**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO 96/34594**

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl.⁶:

A 61 K 7/16

(71) Přihlašovatel:

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

(72) Původce:

Rice David Earl, Cincinnati, OH, US;

(74) Zástupce:

PATENTSERVIS PRAHA a.s., Jivenská 1273,
Praha 4, 14021;

90:10 až 40:60; a B) 0,1% hmotnostních
až 99% hmotnostních orálně přijatelné-
ho nosiče na čištění zubů.

(54) Název přihlášky vynálezu:

Prostředky na čištění zubů

(57) Anotace:

Orální prostředky, jako jsou ústní gely a zubní pasty, obsahující nové brusivo. prostředek na čištění zubů, který obsahuje: A) vysrážený brusný prostředek oxidu křemičitého obsahující: a) vysrážený oxid křemičitý, který sestává z částic, které mají: i) střední velikost částice 5 až 11 mikronu (stand. odchylka 9); ii) Einlehnnerovou tvrdost 0,8 až 2,5 pro obrušování mosazného síta a 5 až 8 pro obrušování polyesterového síta; iii) olejovou absorpci 95 ml/100 g až 135 ml/100 g; a iv) radioaktivní obrušování zubů 25 až 80; a b) vysrážený oxid křemičitý, který sestává z částic, které mají: i) střední velikost částice 5 až 11 mikronů (stand. odchylka 9); ii) Einlehnnerovou tvrdost 3 až 8 pro obrušování mosazného síta a 8 až 11 pro obrušování polyesterového síta; iii) olejovou absorpci 70 ml/100 g až do 95 ml/100 g; a iv) radioaktivní obrušování zubů 80 až 200; přičemž přinejmenším 70 % hmotnostních uvedených částic má průměr menší než 25 mikronů a jejich čisticí poměr je 90 až 135 a radioaktivní obrušování zubů je 60 až 100 s čisticím poměrem/radioaktivní obrušovací poměr 1,25 až 1,75 a poměr oxidu křemičitého v a) ku oxidu křemičitému v b) je

CZ 3450-97 A3

Prostředky na čištění zubu

Oblast techniky

Předkládaný vynález se týká prostředku na čištění zubů, jako jsou zubní pasty, které mají vylepšené orální čištění.

Dosavadní stav techniky

Synteticky vyráběné vysrážené oxidy křemičité hrají důležitou roli jako složka v mnoha dnešních prostředcích pro zubní pasty. Kromě jejich čistící schopnosti jsou také relativně bezpečné, nejedovaté a slučitelné s dalšími složkami zubních past, včetně glycerinu, sorbitolu (nebo xylitolu), zahusťovadel, detergentu, barviv a vonných látek a, nepovinně, složkami, které obsahují fluorid.

Syntetické vysrážené oxidy křemičité se připravují smícháním roztoku alkalického křemičitanu s kyselinami, mícháním a odfiltráváním vysráženého oxidu křemičitého. Výsledná sráženina je pak promyta, vysušena a rozmělněna na žádanou velikost. Při přípravě syntetických vysrážených oxidu křemičitého je třeba získat oxidy křemičité, které mají maximální čistící účinek s minimálním poškozováním orální tkáně. V této oblasti je neustále prováděn výzkum, aby se získaly vysrážené oxidy křemičité, které splňují tyto podmínky.

Příklady vysrážených oxidu křemičitého jsou v U.S. patentu 4,122,161, Wason, 24. 10. 1978, U.S. patentu 4,992,251 a 5,035,879, Alderft a kol., 12. 2. 1991 a 30. 7. 1991, U.S. patentu 5,056,496 Newton a kol, 24. 3. 1992 a U.S. patentu 5,275,515, Wason a kol, 18. 1. 1994.

V jiné problematice byly také popsány různé kombinace oxidu křemičitého. Kombinace oxidu křemičitého zahrnující prostředky s různou velikostí částic a různými specifickými povrchy jsou

posány v U.S. patentu 3,577,521, Karlheinz Scheller a kol., 4. 5. 1971 a U.S. patentu 4,618,488, Mayeama a kol., 21. 10. 1986. Podobně, U.S. patent, Reinhardt a kol., 5. 5. 1992, popisuje spojení zahušťovacích a leštících oxidu křemičitých, které tvoří prostředky, které mají hodnoty absorpce oleje přinejmenším 200. Další příklady kombinací oxidu křemičitých zahrnují U.S. patent 5,124,143, Muhlemann, 23. 6. 1992 a U.S. patent 4,632,826, Ploger a kol, 30. 12. 1986.

Navzdory mnoha vynálezům, které se týkají prostředku pro orální čištění a jejich aktivity proti plaku, stále existuje potřeba dalších prostředků, které mají zlepšené čistící účinky s minimálním obrušováním. Autoři předkládaného vynálezu zjistili, že brusné prostředky obsahující oxidy křemičité, které mají částice o různé tvrdosti, poskytují zlepšené čištění zubu s minimálním obrušováním.

Předmětem předkládaného vynálezu tak je poskytnutí vysrážených prostředků oxidu křemičitého, které vykazují zlepšené čistící účinky bez zvýšeného obrušování zubu nebo skloviny. Dalším předmětem předkládaného vynálezu je poskytnutí účinného způsobu pro prevenci nebo odstranění skvrn na zubech. Dalším předmětem předkládaného vynálezu je poskytnutí účinného způsobu prevence nebo odstraňování plaku. Tyto a další předměty budou snadno jasné z popisu, který následuje.

Podstata vynálezu

Shrnutí vynálezu

Předkládaný vynález se týká prostředku na čištění zubu, které obsahuje:

 a) vysrážený brusný prostředek oxidu křemičitého

07.01.98

a) vysrážený oxid křemičitý, který sestává z částic, které mají:

i) střední velikost částice 5 až 11 mikronu (stand. odchylka ≤ 9);

ii) Einlehnerovu tvrdost 0,8 až 2,5 pro obrušování mosazného síta a 5 až 8 pro obrušování polyesterového síta;

iii) olejovou absorpci 95 ml/100 g až 135 ml/100 g;

a

iv) radioaktivní obrušování zubu 25 až do 80;

a

b) vysrážený oxid křemičitý, který sestává z částic, které mají:

i) střední velikost částice 5 až 11 mikronu (stand. odchylka ≤ 9);

ii) Einlehnerovu tvrdost 3 až 8 pro obrušování mosazného síta a 8 až 11 pro obrušování polyesterového síta;

iii) olejovou absorpci 70 ml/100 g až do 90 ml/100 g; a

iv) radioaktivní obrušování zubu 80 až 200;

přídemž přinejmenším 70 hmotnostních uvedených částic má průměr menší než 25 mikronu a jejich čistící poměr je 90 až 135 a radioaktivní obrušování zubu je 60 až 100 s čistícím poměrem / radioaktivnímu obrušovacímu poměru 1,25 až 1,75 a poměr oxidu křemičitého v a) ku oxidu křemičitému v b) je 90 : 10 až 40 : 60;

a

B) 0,1 hmotnostních až 99 hmotnostních orálně přijatelného nosiče na čištění zubu.

Všechna množství a poměry jsou hmotnostní, vztažené na celkový prostředek, pokud není uvedeno jinak. Hodnoty PCR a RDA jsou bez jednotek. Dále, všechna měření jsou prováděna při 25 °C pokud není uvedeno jinak.

pH prostředku popsaných v předkládaném vynálezu je 4 až 9,5, s tím, že preferované pH je 6,5 až 9,0 a nejpreferovanější pH je 7,9 až 8,5, při měření v 5% hmotnostních vodné suspenzi.

Podrobný popis vynálezu

"Bezpečné a účinné množství" tak, jak se používá v předkládaném vynálezu, označuje účinné množství, které snižuje skvrny a/nebo plak/gingivitidu bez poškození tkání a struktur v ústní dutině.

Termín "orálně přijatelný nosič na čištění zubu" tak, jak se používá v předkládaném vynálezu, označuje nosič, který umožňuje použití předkládaných prostředku v ústní dutině bezpečným a účinným způsobem.

Nezbytné, stejně jako nepovinné složky prostředku podle předkládaného vynálezu jsou popsány v následujících částech.

Brusná složka

Vysrážené oxidy křemičité použité pro tvorbu prostředku oxidu křemičitého podle předkládaného vynálezu lze charakterizovat buď jako nízko strukturní nebo středně strukturní oxidy křemičité podle definic uvedených v J. Soc. Cosmet. Chem. 29, 497 až 521 (srpen 1978) a Pigment Handbook: svazek 1, Properties and Economics, druhé vydání, editor Peter A. Lewis, John Wiley & Sons, Inc., 1988, str. 139 až 159 a tedy, s výjimkou charakterizovány jako syntetické hydratované amorfní oxidy křemičité, také známé jako křemeny nebo SiO₂. Dále lze tyto oxidy křemičité charakterizovat tím, že mají BET povrch 50 m²/g až 250 m²/g.

Tyto prostředky jsou dále charakterizovány tím, že mají střední průměrnou velikost částic 5 mikronů až 11 mikronů, s tím, že přinejméním 70% hmotnostních v rozdělení velikosti částic je menších než 20 mikronů. Průměrná velikost částic (střední hodnota nebo D₅₀) se měří zařízením Microtrac II,

Leeds and Northrup. Konkrétně je laserový paprsek pouštěn skrz průhlednou celu, která obsahuje proud pohybujících se částic suspendovaných v kapalině. Světelné paprsky, které se dotknou částic, jsou vychýleny v úhlech, které jsou nepřímo úměrné jejich velikosti. Fotodetektor měří množství světla v několika předdefinovaných úhlech. Elektrické signály úměrné k měřeným hodnotám průtoku světla se pak zpracují mikropočítačovým systémem, čímž se získá multikanálový histogram rozdělení velikosti částic.

Vysrážené oxidy křemičité používané do prostředku podle předkládaného vynálezu jsou dále děleny pomocí jejich hodnot Einlechnerovy tvrdosti, hodnot radioaktivního obrousování zubu (Radioactive Dentin Abrasion - RDA) a hodnot olejové absorpce.

Hodnoty Einlechnerovy tvrdosti se měří pomocí přístroje Einlechner At-1000 Abrader, pro měření měkkosti oxidu křemičitých, následujícím způsobem: Fourdrinierovo drátěné síto se zváží a vystaví působení 10 - hmotnostních vodné suspenze oxidu křemičitého na určitou dobu. Množství obroušení se pak stanoví v miligramech ztráty hmotnosti Fourdrinierova drátěného síta na 100 000 otáček. Mosazné Einlechnerovy (Brass Einlechner - BE) a polyesterové Einlechnerovy (Polyester Einlechner - PE) výsledky se vyjadřují v miligramech.

Hodnoty RDA se stanovují způsobem uvedeným v Hoeffern, Journal of Dental Research, červenec - srpen 1976, str. 563 až 573, a popsáným v U.S. patentech 4,340,583, 4,420,312 a 4,421,527, Wason, které jsou zde uvedeny jako reference.

Prostředky vysrážené oxidu křemičitého podle předkládaného vynálezu lze charakterizovat tím, že mají hodnoty olejové absorpce nižší než 100 ml / 100 g. Hodnoty olejové absorpce se měří pomocí ASTM vyfíracího způsobu D281. Povrch se stanovuje BET dusíkovým absorpčním způsobem podle Brunaur a kol., J. Am. Chem. Soc., 60, 309 (1938). Pro měření lesku se jemně práškový materiál stlačí na plochu s hladkým povrchem, které lze hodnotit pomocí Technidyne Brightimeter 3 5/8C. Tento

přístroj má dvojpaprskový optický systém, ve kterém je vzorek osvětlován v úhlu 45° a odražené světlo je vidět v úhlu 0° . To vyhovuje TAPPI testovacímu způsobu T452 a T646 a ASTM Standard D981. Serie filtru směruje odražené světlo žádaných vlnových délek do fotobuňky, ve které je převáděno na výstupní napětí. Tento signál je zesilován a pak zpracováván vnitřním mikropočítačem pro zobrazení a tisk.

Srážení oxidu křemičitých podle předkládaného vynálezu se provádí podle obecných způsobu popsanych, například, v U.S. patentech 3,893,840, vydanem 8. 7. 1975, Wason, 3,988,162, vydanem 26. 10. 1976, Wason, 4,067,746, vydanem 10. 1. 1978, Wason a 4,340,583, vydanem 29. 7. 1982, Wason, které jsou zde všecimny uvedeny jako reference.

V jednom kroku způsobu, se první vysrážená suspenze oxidu křemičitého připravuje, za ruzných reakčních parametru srážení, tak, že vznikají vysrážené oxidy křemičité, které mají hodnoty BE 0,8 mg až 2,5 mg a hodnoty PE 5 mg až do 8 mg a RDA 25 až 80 a olejovou absorpci 95 ml / 100 g až 135 ml / 100 g. Reakční parametry, které ovlivňují charakteristiky výsledného oxidu křemičitého zahrnují: rychlost, kterou se přidávají ruzné reaktanty, koncentraci ruzných reaktantu, pH reakce, reakční teplotu nebo rychlost jakou jsou přidávány elektrolyty.

V dalším kroku způsobu srážení se podobným způsobem připravuje druhá suspenze vysráženého oxidu křemičitého za ruzných reakčních podmínek, že vznikají vysrážené oxidy křemičité, které mají hodnoty BE 3 mg až 8 mg a hodnoty PE 6 mg až 11 mg a RDA 81 až 200 a olejovou absorpci 70 ml / 100 g až do 91 ml / 100 g.

Nakonec pro obě suspenze vysráženého oxidu křemičitého spojeny a jejich pH upraveno na 5,0. Spojená suspenze je prefiltrována a pak promyta vodou, aby se odstranily soli z filtračního kolače. Filtrační kolač se vysuší, s výhodou, právnym sušením rozprašováním, aby vznikl vysrážený oxid

křemičitý obsahující 3 % hmotnostní až 10 % hmotnostních vlhkostí. Směs vysráženého oxidu křemičitého se mele tak, aby měla velikost částic, při které 70 % hmotnostních rozdělení velikosti částic bylo pod 20 mikronu. Alternativně lze oba oxidy křemičité spojit před jejich zahrnutím do prostředku na čištění zubu.

Kromě nezbytných složek, které již byly popsány, prostředky na čištění zubu podle předkládaného vynálezu obsahují různé nepovinné složky na čištění zubu, z nichž některé jsou popsány dále. Nepovinné složky zahrnují, například, ale nejsou tímto výčtem nijak omezeny, pojiva, příchutě, sladidla, přídavné látky působící proti plaku, brusiva a barviva. Tyto a další nepovinné složky jsou dále popsány v U.S. patentu 5,004,597, 2. 4. 1991, Majeti, U.S. patentu 4,885,155, 5. 12. 1989, Parran, Jr., a kol, U.S. patntu 3,959,458, 25. 5. 1976, Agricola a kol. a U.S. patentu 3,937,807, 10. 2. 1976, Haefele, které jsou zde všechny uvedeny jako reference.

Čistící poměr (Pellicle Cleaning Ratio - PCR) prostředku oxidu křemičitého podle předkládaného vynálezu, který je mírou čistící charakteristiky prostředku na čištění zubu, je 90 až 135 a, s výhodou, 100 až 130, pro spojený vysrážený oxid křemičitý podle předkládaného vynálezu. Radioaktivní chruchování zubu (Radioactive Dentin Abrasion - RDA) oxidu křemičitých podle předkládaného vynálezu, které je mírou brusivosti spojeného vysráženého oxidu křemičitého, při jeho použití do prostředku na čištění zubu, je 60 až 10, s výhodou 6 až 8.

Podmínky PCR se stanovují mírně modifikovanou verzí PCR testu popsaného v "In Vitro Removal of Stain With Dentifrice", G. K. Slackey, L. A. Burkhard a E. R. Schemerhorn, J. Dental Research, 61, 1236 až 1239, 1982. Čištění se provádí in vitro na modifikovaném PCR testu. Tento test je stejný jako ten popsaný Slackeyem a kol. s následujícími úpravami: (i) Před aplikací skvrnitě vrstvy se na novězi úlomky aplikuje čirý

umělý film, (2) spíše se používá zahřívání roztoku než radiační ohřívání během aplikace filmu, (3) počet štětín kartáče je omezen na 200 štětín a (4) koncentrace suspenze je 1 díl prostředku na čištění zubu na 3 díly vody.

Vysrážené prostředky oxidu křemičitého podle předkládaného vynálezu při použití do prostředku na čištění zubů zlepši poměr PCR / RDA. Poměr PCR / RDA se používá pro stanovení relativního poměru čistících a obrušovacích charakteristik prostředku na čištění zubu. Komerčně dostupné prostředky na čištění zubu obecně mají poměr PCR / RDA v rozsahu 0,5 až do 1,0. Vysrážené oxidy křemičité použité v prostředcích podle předkládaného vynálezu poskytují prostředkům na čištění zubů poměry PCR ku RDA větší než 1, obvykle 1,25 až 1,75, ale výhodněji 1,6 až 1,75.

Brusivo je, ve formě vysrážených silikagelových prostředku podle předkládaného vynálezu, při použití do prostředku popsaných v předkládaném vynálezu, přítomno v množství 6 hmotnostních až 70 hmotnostních, s výhodou 15 hmotnostních až 35 hmotnostních, pokud je prostředek na čištění zubu zubní pasta. Větší množství, až 95 hmotnostních, se používá i, pokud je prostředek na čištění zubů zubní prášek.

Farmaceuticky přijatelný nosič

Další nezbytnou složkou předkládaného vynálezu je orálně přijatelný nosič na čištění zubu. Nosič složek prostředku podle předkládaného vynálezu je jakékoliv vehikulum na čištění zubů vhodné pro použití v ústní dutině. Takové nosiče zahrnují obvykle složky zubních past, zubních prášku, profylaktických past, bonbónu, pryskyřic a podobně a podrobněji jsou posány dále. Preferované systémy jsou zubní pasty.

Nepovinné složky

Tenzidy

Jednou z preferovaných složek předkládaného vynálezu je tenzid, s výhodou vybraný ze skupiny sestávající ze sarkosinátových tenzidů, isethionátových tenzidů a taurátových tenzidů. Preferovány jsou pro použití v předkládaném vynálezu amonné soli nebo soli alkalických kovů těchto tenzidů. Neipreferovanější jsou v předkládaném vynálezu sodné a draselné soli lauroylsarkosinátu, myristoylsarkosinátu, palmitoylsarkosinátu, stearoylsarkosinátu a oleoylsarkosinátu.

Tyto tenzidy jsou v prostředcích podle předkládaného vynálezu přítomny v množstvích 0,1 hmotnostních až 2,5 % hmotnostních, s výhodou 0,3 % hmotnostních až 2,5 % hmotnostních a nejvýhodněji 0,5 % hmotnostních až 2,0 % hmotnostních celkového prostředku.

Spolu se sarkosinátovým tenzidem lze v prostředcích podle předkládaného vynálezu, nepovinně, použít jiné vhodné slučitelné tenzidy. Vhodné nepovinné tenzidy jsou podrobněji popsány v U.S. patentu 3,959,458, 25. 5. 1976, Agricola a kol., U.S. patentu 3,973,807, 10. 2. 1976, Haefele a U.S. patentu 4,051,234, 27. 9. 1988, Gieske a kol. Tyto patenty jsou zde uvedeny jako reference.

Preferované aniontové tenzidy použitelné v předkládaném vynálezu jsou ve vodě rozpustné soli alkylsulfátu, které mají 10 až 18 atomů uhlíku v alkylem zbytku a ve vodě rozpustné soli sulfonovaných monoglyceridů mastných kyselin, které mají 10 až 18 atomů uhlíku. Příklady anionických tenzidů tohoto typu jsou laurylsulfát sodný a kokosové monoglyceridsulfonáty sodné. Také lze použít směsi aniontových tenzidů.

Preferované kationtové tenzidy použitelné v předkládaném vynálezu jsou deriváty alifatických kvarterních amoniových sloučenin, které mají jeden dlouhý alkylový řetězec obsahující 10 až 18 atomů uhlíku, jako je lauryl trimethylamoniumchlorid, octylpyridiniumchlorid, octyltrimethylamoniumbromid, diisobu-

tylfenoxyethyl-dimethylbenzylamoniumchlorid, kokosový alkyl-trimethylamoniumdusitan, cetylpyridiniumfluorid atd. Preferované sloučeniny jsou kvarterní amoniumfluoridy popsané v U.S. patentu 3,535,421, 20. 10. 1970, Briner a kol., který je zde uveden jako reference, přičemž kvarterní amoniumfluoridy mají detergentní vlastnosti. Určité kationtové tenzidy také působí v prostředcích popsáných v předkládaném vynálezu jako protibakteriální látky. Kationtové tenzidy, jako je chlorhexadin, ačkoliv jsou vhodné pro použití v předkládaném vynálezu, nejsou preferovány, protože mají tendenci zanechávat skvrny na tvrdých tkáních v ústní dutině. Odborníci o této skutečnosti vědí a používají kationtové tenzidy pouze s tím, že pamatují na toto omezení.

Preferované neionogenní tenzidy, které lze použít do prostředku podle předkládaného vynálezu, lze definovat jako sloučeniny, které vznikají kondenzací alkylenoxidových skupin (hydrofilní povahy) s organickou hydrofobní sloučeninou, která je alifatické nebo aromatické povahy. Příklady vhodných neionogenních tenzidu zahrnují Pluronic, polyethylenoxidové kondenzáty alkylfenolu, produkty odvozené z kondenzace ethylenoxidu s reakčním produktem propylenoxidu a ethylendiaminu, ethylenoxidové kondenzáty alifatických alkoholů, terciární aminoxidy a dlouhým řetězcem, terciární fosfinoxidy a dlouhým řetězcem, dialkylsulfoxidy a dlouhým řetězcem a směsí takových materiálů.

Preferované zwitteriontové syntetické tenzidy použitelné v předkládaném vynálezu lze popsat jako deriváty alifatických kvarterních amoniových, fosfoniových a sulfoniových sloučenin, ve kterých alifatické zbytky jsou přímé nebo rozvětvené a jeden z alifatických substituentů obsahuje 8 až 18 atomů uhlíku a jeden obsahuje aniontovou skupinu, která pomáhá rozpustnosti ve vodě, např. karboxyl, sulfonát, sulfát, fosfát nebo fosfonát.

Preferované betainové tenzidy jsou popsány v U.S. patentu 5,180,577, Polefka a kol., vydaném 19. 1. 1993. Typické alkyldimethylbetainy zahrnují decylbetain nebo 2-(N-decyl-N,N-dimethylamonio)acetát, kokobetain nebo 2-(N-koko-N,N-dimethylamonio)acetát, myristylbetain, palmitylbetain, laurylbetain, cetylbetain, stearylbetain, atd. Příklady amidobetainu jsou kokoamidoethylbetain, kokoamidopropylbetain, lauramidopropylbetain a podobně. S výhodou se vybírají betainy kokoamido-
propylbetain a, ještě výhodněji, lauramidopropylbetain.

Chelatační činidla

Další nepovinná složka je chelatační činidlo vybrané ze skupiny sestávající z kyseliny vinné a jejích farmaceuticky přijatelných solí, kyseliny citrónové a citrátu alkalických kovů a jejich směsí. Chelatační činidla dokáží komplexovat vápník, který se nalézá v buněčných stěnách bakterií. Chelatační činidla také odstraňují plak odstraněním vápníku z vápníkových mostků, které pomáhají udržovat tuto biomasu kompaktní. Ale při použití chelatačního činidla, které má příliš vysokou afinitu k vápníku, dochází k demineralizaci zubu, což je v rozporu s cíli předkládaného vynálezu.

Preferované citráty alkalických kovů jsou citrát sodný a citrát draselný, přičemž citrát sodný je nejpreferovanější. Také je preferována směs kyselina citrónová / citrát alkalického kovu. V předkládaném vynálezu jsou preferovány soli alkalických kovů kyseliny vinné. Nejpreferovanější jsou pro použití v předkládaném vynálezu vinan sodný, vinan draselný, vinan sodnodraselný, hydrogenvinan sodný a hydrogenvinan draselný. Množství chelatačního činidla vhodného pro použití v předkládaném vynálezu je 0,1 hmotnostních až 2,7 hmotnostních, s výhodou 0,5 hmotnostních až 2,5 hmotnostních a, ještě výhodněji, 1,0 hmotnostních až 2,5 hmotnostních. Sůl kyseliny vinné jako chelatační činidlo lze

použít samostatně nebo ve směsi s jinými nepovinnými chelatačními činidly.

Lze použít i dlejší nepovinná chelatační činidla. S výhodou mají tato chelatační činidla komplexační konstantu vápníku 10^4 až 10^5 , což poskytuje zlepšené čištění s omezením plaku a tvorby zubního kamene.

Další skupinou činidel vhodných pro použití jako chelatační činidla v předkládaném vynálezu jsou rozpustné difosforečnany. Soli difosforečnanu použité v předkládaném vynálezu jsou jakékoliv soli difosforečnanu s alkalickými kovy. Konkrétní soli zahrnují difosforečnan alkalického kovu, dihydrogen-difosforečnan alkalického kovu, hydrogendifosforečnan alkalického kovu a jejich směsi, přičemž alkalický kov je, s výhodou, sodík nebo draslík. Soli jsou použitelné jak v hydratované, tak v nehydratované formě. Účinné množství difosforečnanové soli použitelné v předkládaných prostředcích obecně postačuje k tomu, aby poskytlo přinejmenším 1,0 hmotnostních difosforečnanového iontu, s výhodou 1,5 hmotnostních až 6 hmotnostních a ještě výhodněji 3,5 hmotnostních až 6 hmotnostních těchto iontu. Je třeba uvést, že tak je do prostředku dodáno množství difosforečnanových iontu (tj. teoretické množství při vhodném pH) a že po ustavení konečného pH finálního produktu, mohou být přítomny i jiné formy difosforečnanu než je PO_4^{3-} (např. HPO_4^{2-}).

Difosforečnanové soli jsou podrobněji popsány v Kirk & Othmer, Encyclopedia of Chemical Technology, druhé vydání, svazek 10, Interscience Publishers (1968), která je zde uvedena jako reference.

Další možnou skupinou chelatačních činidel vhodných pro použití v předkládaném vynálezu jsou aniontové polymerní polykarboxyláty. Takové materiály jsou v dané problematice dobře známy a lze je použít ve formě volných kyselin nebo jejich solí, s výhodou, plně neutralizovaných ve vodě rozpustných aniontových solí nebo solí alkalických kovu (např.

draselných a, s výhodou, sodných). Preferovány jsou 1 : 4 až 4 : 1 kopolymery anhydridu kyseliny maleinové nebo kyseliny maleinové s dalším polymerovatelným ethylenicky nenasyceným monomerem, s výhodou s methylvinyletherem (methoxyethylenem), které mají molekulovou hmotnost 30 000 až 1 000 000. Tyto kopolymery jsou dostupné například jako Gantrez AN 139 (molekulová hmotnost 500 000), AN 119 (molekulová hmotnost 250 000) a, s výhodou, S-97 Pharmaceuticla Grade (molekulová hmotnost 70 000) od GAF Chemicals Corporation.

Jiné polymerní polykarboxyláty zahrnují ty, které jsou 1 : 1 kopolymery anhydridu kyseliny maleinové s ethylakrylátem, hydroxyethylmethakrylátem, N-vinyl-2-pyrrolidonem nebo ethylenem, přičemž kopolymer s ethylenem je dostupný například jako Monsanto EMA č. 1103, molekulová hmotnost 10 000, a EMA Grade 61, a 1 : 1 kopolymery kyseliny akrylové s methyl nebo hydroxyethylmethakrylátem, methyl nebo ethylakrylátem, isobutylvinyletherem nebo N-vinyl-2-pyrrolidonem.

Další polymerní polykarboxyláty jsou popsány v U.S. patentu 4,136,477, d. d. 1979, Gaffar, a U.S. patentu 4,183,914, 15. 1. 1980, Gaffar a kol., které jsou zde oba uvedeny jako reference, a popisují kopolymery anhydridu kyseliny maleinové se styrenem, isobutylenem nebo ethylvinyletherem, polyakrylové, polyitakonové a polymaleinové kyseliny a sulfakrylové oligomery o molekulové hmotnosti 1000, dostupné jako Unioyax NB-2.

Do prostředku na čištění zubu lze také přidat příchutě. Vhodné příchutě zahrnují olej z vřesu, mentolový olej, mátový olej, sasafrasový olej a hřebíčkový olej. Sladidla, která lze použít, zahrnují aspartam, acylsulfam, sacharin, dextrosu, levulose a cyklamát sodný. Příchutě a sladidla se do prostředku na čištění zubu obecně používají v množství 0,005 - hmotnostních až 10 hmotnostních.

Je běžné, že v prostředcích na čištění zubu a dalších orálních prostředcích je přítomna ve vodě rozpustná fluoridová

sloučenina v takovém množství, které postačuje k tomu, aby v prostředku při 25 °C byla koncentrace fluoridového iontu 0,0025 % hmotnostních až 5,0 % hmotnostních, s výhodou 0,005 % hmotnostních až 2,0 % hmotnostních, která má přídavný účinek proti vzniku zubního kazu. Jako zdroj rozpustného fluoridu v předkládaných prostředcích je možno použít širokou škálu materiálu, které obsahují fluoridový ion. Příklady vhodných materiálu, které obsahují fluoridový ion lze nalézt v U.S. patentu č. 3,535,421, 20. 10. 1970, Briner a kol., a U.S. patentu č. 3,878,154, 18. 7. 1972, Widder a kol., které jsou zde oba uvedeny jako reference. Reprezentativní zdroje fluoridového iontu zahrnují fluorid cínatý, fluorid sodný, fluorid draselný, monofluorfosforečnan sodný a mnoho dalších. Fluorid cínatý a fluorid sodný jsou zejména preferovány, stejně jako jejich směs.

V zubních pastách podle předkládaného vynálezu je také přítomna voda. Voda používaná v přípravách komerčně vhodných zubních past by, s výhodou, měla být deionizovaná a zbavena organických nečistot. Voda obecně tvoří 10 % hmotnostních až 50 % hmotnostních, s výhodou 20 % hmotnostních až 40 % hmotnostních prostředku pro zubní pasty podle předkládaného vynálezu. Tato množství vody zahrnují volnou vodu, která je přidávána navíc, kromě té, která je přidávána s jinými materiály, jako se sorbitolem.

Při výrobě zubních past je nezbytné přidat nějaké zahušťovadlo, aby se získala žádaná konzistence. Preferovaná zahušťovadla jsou karboxyvinylové polymery, karrageenan, hydroxyethylcelulóza a ve vodě rozpustné soli celulozových etheru, jako je sodná sůl karboxymethylcelulósy a sodná sůl karboxymethylhydroxyethylcelulósy. Také lze použít přírodní pryskyřice, jako je karaya, xanthanová pryskyřice, arabská guma a tragakatanová pryskyřice. Lze použít zahušťovadla v množství 0,1 % hmotnostních až 5,0 % hmotnostních celkového prostředku.

Také je žádoucí použít nějaké zvlhčovaadlo, aby se zabránilo tvrdnutí zubní pasty. Vhodná zvlhčovaadla jsou glycerin, sorbitol a další polyhydroxyalkoholy v množství 15 - hmotnostních až 70 - hmotnostních.

Také je žádoucí zahrnout do prostředku podle předkládaného vynálezu další cínaté soli jako je difosforečnan cínatý a dusičnan cínatý a protibakteriální látky jako jsou kvarterní amoniové soli, jako je cetylpyridiniumchlorid a tetradecylpyridiniumchlorid, bisbiguanidinové soli, bisglycinát měďnatý, neionogenní protibakteriální soli a příchutěvé oleje. Taková činidla jsou popsána v U.S. patentu č. 2,946,725, 26. 6. 1960, Norris a kol., a U.S. patentu č. 4,051,234, 27. 9. 1977, Gieske a kol, který je zde uveden jako reference. Další nepovinné složky zahrnují pufrы, hydrogenuhlíčitany, peroxidy, dusičnany, jako je dusičnan sodný a dusičnan draselný. Tato činidla, pokud jsou přítomna, jsou v množstvích 0,01 - hmotnostních až 30 - hmotnostních.

Další použitelné nosiče zahrnují dvoufázové prostředky na čištění zubů, jako jsou ty, které jsou popsány v U.S. patentech 5,213,790, vydaném 23. 5. 1993, 5,145,666, vydaném 8. 9. 1992 a 5,281,410, vydaném 25. 1. 1994, všechny Lukacovic a kol. a v U.S. patentech 4,849,231 a 4,528,180, Schaeffer, jejichž objevy jsou zde uvedeny jako reference.

Vhodné složky bonbónu a čvykaček jsou popsány v U.S. patentu č. 4,063,955, 11. 4. 1978, Grabenstetter a kol., který je zde uveden jako reference.

Příklady provedení vynálezu

Následující příklady dále popisuje a demonstrují preferovaná provedení v rámci předkládaného vynálezu. Příklady jsou uvedeny pouze pro ilustraci a nelze je pokládat za omezení předkládaného vynálezu ve všech jeho možných variacích, které jsou možná namyšleny mimo jeho rámec.

Příklad 1

Prostředek na čištění zubu podle předkládaného vynálezu obsahující následující složky.

Složka	% hmotnostní
Asorbitor 70 roztok	24,200
K voda	24,757
Glycerin	7,000
Karboxymethylcelulosa	0,500
PEG 6	4,000
Fluorid sodný	0,243
Sacharin sodný	0,130
Dihydrogenfosforečnan sodný	0,415
Fosforečnan sodný	0,395
Vinan sodný	1,000
TiO	0,500
Oxid křemičitý	35,000
Lauroylsarkosinát sodný	
(95 aktivní složky)	1,060
Příchuť	0,800

Podáno firmou Aqualon Company

Složka vysraženého oxidu křemičitého má následující vlastnosti: APS střední hodnota = 8,5 mikronu, olejová absorpce = 103 ml / 100 g, BE = 1,6, PE = 7, PCR = 106, RLA = 67.

Teplota pláště míchací nádrže je 65 °C až 71 °C. Do míchací nádrže se přidalo zvlhčovací a voda a začalo míchání. Když teplota dosáhla 50 °C, byly přidány fluorid, sladidlo, pufr, chelatační činidlo, barvivo a oxid titaničitý. K brusivu bylo přidáno zahušťovací a výsledná směs byla přidána za silného míchání do míchací nádrže. Pak byl přidán tenzid a míchání pokračovalo. Nádrž byla ochlazená na 50 °C a byla přidána příchuť. Míchání se pokračovalo po dobu 5 minut. Výsledný prostředek má pH 7.

Příklad 2

Prostředek na čištění zubu podle předkládaného vynálezu obsahující následující složky.

Složka	% hmotnostní
Scrbitol 70 roztok	29,810
RO voda	24,757
Glycerin	7,000
Karboxymethylcelulosa	0,750
PEG 6	4,000
Fluorid sodný	0,243
Sacharin sodný	0,130
Dihydrogenfosforečnan sodný	0,415
Fosforečnan sodný	0,395
TiO	0,500
Oxid křemičitý	30,000
Lauroylsarkosinát sodný	1,200
Příchut'	0,800

ledáno firmou Aqualon Company

Složka vysráženého oxidu křemičitého má následující vlastnosti: AFS střední hodnota = 8,5 mikronu, olejová absorpce = 103 ml / 100 g, BE = 1,6, PE = 7, PCR = 106, RDA = 67.

Příklad 3

Pryskyřičný prostředek podle předkládaného vynálezu obsahující následující složky.

Složka	% hmotnostní
Pryskyřičná báze	30,000
30 dílů esterger	
45 dílů coumeronová pryskyřice	
15 dílů suchý latex	
Oxid křemičitý	10,000
Slad	40,000

07.01.98

Kukuřičný sirup	18,175
Lauroylsarkosinát sodný	0,075
Titan sodný	0,250
Břichut'	1,500

Složka vysráženého oxidu křemičitého má následující vlastnosti: APS střední hodnota = 8,5 mikronu, olejová absorpce = 101 ml / 100 g, BE = 1,6, PE = 7,2.

Průmyslová využitelnost

Prostředky podle předkládaného vynálezu jsou průmyslově využitelné při výrobě prostředku na čištění zubu.

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Prostředek na čištění zubů, v y z n a č u j í c í s e
t í m, že obsahuje:

A) vysrážený brusný prostředek oxidu křemičitého obsahující:

a) vysrážený oxid křemičitý, který sestává z částic, které mají:

i) střední velikost částice 5 až 11 mikronu (stand. odchylka < 9);

ii) Einlechnerovu tvrdost 0,8 až 2,5 pro obrušování mosazného síta a 5 až 8 pro obrušování polyesterového síta;

iii) olejovou absorpci 95 ml/100 g až 135 ml/100 g;

a

iv) radioaktivní obrušování zubu 25 až do 80;

a

b) vysrážený oxid křemičitý, který sestává z částic, které mají:

i) střední velikost částice 5 až 11 mikronu (stand. odchylka < 9);

ii) Einhlerovu tvrdost 3 až 8 pro obrušování mosazného síta a 8 až 11 pro obrušování polyesterového síta;

iii) olejovou absorpci 70 ml/100 g až do 95 ml/100 g; a

iv) radioaktivní obrušování zubu 80 až 200;

příčemž přinejmenším 70 % hmotnostních uvedených částic má průměr menší než 25 mikronů a jejich čistící poměr je 90 až 100 a radioaktivní obrušování zubu je 60 až 100 a čistící poměr / radioaktivní obrušovací poměr 1,25 až 1,75 a poměr oxidu křemičitého v a) ku oxidu křemičitému v b) je 90 : 10 až 40 : 60;

a

B) 0,1 hmotnostních až 99 hmotnostních granulů při otáčení v síce na čištění zubu.

2. Prostředek na čištění zubů podle nároku 1, v y z n a ě u j í c í s e t í m, že dále obsahuje zdroj fluoridového iontu, přičemž tento zdroj fluoridového iontu je vybrán ze skupiny sestávající z fluoridu sodného, fluoridu cínatého, monofluorofosforečnanu sodného, fluoridu draselného a jejich směsí.

3. Prostředek na čištění zubu podle kteréhokoliv z předchozích nároku, v y z n a ě u j í c í s e t í m, že dále obsahuje tenzid vybraný ze skupiny sestávající ze sarkosinátových tenzidů, isethionátových tenzidů a taurátových tenzidů.

4. Prostředek na čištění zubu podle kteréhokoliv z předchozích nároku, v y z n a ě u j í c í s e t í m, že dále obsahuje 0,1 hmotnostních až 2,5 hmotnostních chelatačního činidla vybraného ze skupiny sestávající z kyseliny vinné a jejich farmaceuticky přijatelných solí, kyseliny citrónové a citrátu alkalických kovů a jejich směsí.

5. Prostředek na čištění zubu podle kteréhokoliv z předchozích nároku, v y z n a ě u j í c í s e t í m, že má přinejménom 1 a tenzid je vybrán ze skupiny sestávající z laurylsarkosinátu sodného, decylsarkosinátu sodného, myristylsarkosinátu sodného, stearylsarkosinátu sodného, palmitylsarkosinátu sodného, oleoylsarkosinátu sodného a jejich směsí.

6. Prostředek na čištění zubu podle kteréhokoliv z předchozích nároku, v y z n a ě u j í c í s e t í m, že dále obsahuje 15 hmotnostních až 70 hmotnostních zvlhčovačů vybraného ze skupiny sestávající z glycerinu, sorbitolu, propylen glykolu a jejich směsí.

7. Prostředek na čištění zubu podle kteréhokoliv z předchozích nároku, v y z n a ě u j í c í s e t í m, že tenzid ze směsi laurylsarkosinátu sodného a kokoamidopropyl betainu a chelatační činidlo je směs kyseliny vinné a vinanu sodného.

6. Prostředek na čištění zubu podle kteréhokoliv z předchozích nároku, v y z n a č u j í c í s e t í m, že je ve formě zubní pasty, zubního prášku, profylaktické pasty, bonbónu, pryskyřice nebo ústního gelu.