

(12)

PATENTSCHRIFT

(21) Anmeldenummer: 477/87

(51) Int.Cl.⁵ : A61K 7/26

(22) Anmeldetag: 3. 3.1987

(42) Beginn der Patentdauer: 15.10.1989

(45) Ausgabetag: 25. 4.1990

(30) Priorität:

10. 3.1986 US 837989 beansprucht.

(56) Entgegenhaltungen:

GB-PS1311060 US-PS4138477 US-PS4022880

(73) Patentinhaber:

COLGATE-PALMOLIVE COMPANY
10022 NEW YORK (US).

(54) FESTES MUNDPFLEGEMITTEL GEGEN ZAHNSTEIN UND MUNDGERUCH

(57) Es wird eine nichtkariogene, sich langsam auflösende, feste, gegen Zahnstein und Mundgeruch anhaltend wirkende Zusammensetzung mit verbessertem Geschmack beschrieben, sowie ein Verfahren, das über längere Zeit Mundgeruch und Zahnsteinbildung verringert. Die Zusammensetzung enthält eine Zink liefernde Zinkverbindung, ein Jononketon-Terpenderivat und Aromastoff, vorzugsweise Minze, als wesentliche Bestandteile in einem zuckerfreien Träger.

AT 390 371 B

Die Erfindung betrifft neue feste Mundpflegemittel, die in einem zuckerfreien Träger eine Zink liefernde Zinkverbindung, ein Jononketon-Terpenderivat und vorzugsweise einen Minzaromastoff als aktive Bestandteile zum Verhindern von Zahnstein und Mundgeruch enthalten.

5 Bekannt sind desodorierende und Karies hemmende Pastillen, und zwar sowohl mit Zucker als cariogenem als auch mit Polyol als nichtcariogenem Träger, die aktive Bestandteile inklusive Kupfergluconat, Vitamin B-6, antibakteriellen Substanzen, Peroxydiphosphaten und einer Tranexamsäure/Carvon-Kombination passend zusammengestellt enthalten, wie es in US-PS 2 894 876 (Kupfergluconat auf einer Zuckerbasis),
 10 US-PS 3 228 844 (Vitamin B-6 in einer Sucrose- oder Polyethylenglycolbasis), US-PS 3 556 811 (antibakterielle Substanz in einer harten Bonbonbasis), US-PS 4 041 149 (Peroxydiphosphat in einer Zucker- oder Sorbitbasis), und US-PS 4 465 662 (Kombination von Tranexamsäure und Carvon in einer Glucose- oder Stärke/Gummiarabicum-Basis) beschrieben ist.

US-PS 4 169 885 offenbart eine gefüllte Kapsel oder Tablette, deren wasserlösliche oder candy-(bonbon)-artige Außenschale eine gegen Plaque- und/oder Zahnstein aktive Substanz enthält, beispielsweise ein Fluorid, Fluorsilikat, Phosphatsalz, eine Zinkverbindung oder antimikrobielle Substanz.

15 Aus GB-PS 1 311 060 und der entsprechenden kanadischen Patentschrift 987 597 sind Tabletten zum Desodorieren des Mundes bekannt, die Jonon als den einzigen aktiven, desodorierenden Bestandteil enthalten. Das Jonon liegt jedoch in einem Zuckerträger, der cariogen ist, vor.

Gemäß US-PS 4 138 477, 4 325 939 und 4 469 674 sind Zinkverbindungen enthaltende Mundpflegemittel in Form von Zahnpasten, Mundwasser sowie als Tabletten oder Pastillen bekannt.

20 Man kennt zahlreiche Mundpflegemittel oder besonders Mittel gegen Parodontose mit einem Gehalt an Zinksalzen, wie Zinkchlorid, Zinkjodid, Zinkfluorid, Zinkphenolsulfonat und dergleichen, als antiseptisch wirkende Verbindungen. Zinkchlorid wurde in Mundpflegemitteln meist wegen seiner adstringierenden Wirkungen verwendet. Zinkphenolsulfonat wurde in Zahnpasten als Agens gegen Plaque und Zahnstein eingesetzt sowie zur Hemmung des bei der Fermentation und Zersetzung in der Mundhöhle entstehenden Geruchs. Mundpflegemittel,
 25 in denen diese löslichen Zinksalze eingesetzt wurden, zeigten den Nachteil, daß sie im Mund einen unangenehmen adstringierenden Geschmack hinterlassen und/oder ihre Wirkung gegen Zahnstein und Plaque sowie als Geruchshemmer kurzfristig ist.

In den US-PS 4 100 269 und 4 144 323 wurde vorgeschlagen, schwer lösliche Zinksalze, wie Zinkcitrat, in Zahnpflegemitteln anzuwenden, um die Zahnstein und Plaque verhindernde Wirkung der Zinkionen aufgrund der langsamen Auflösung der Zinksalze im Speichel zu verlängern.

30 In US-PS 4 138 477 ist das Reaktionsprodukt einer Zinkverbindung und eines Polymeren beschrieben als eine Verbindung, die wirksam gegen Mundgeruch ist. Diese Wirksamkeit kann einige Stunden dauern, im allgemeinen jedoch nicht über Nacht.

Aus DE-PS 2 229 466 ist die Anwendung eines Zinkkomplexes eines speziellen Diketons bekannt, um Zahnstein und Zahnverfärbung zu bekämpfen. Daß Zinkverbindungen desodorierende sowie andere für die Mundhygiene erwünschte Eigenschaften besitzen, ist also bekannt.

Kombinationen einer Zinkverbindung mit einem anderen aktiven Bestandteil in gegen Zahnstein wirkenden Zahnpasten und Mundwassern sind ebenfalls bekannt, und zwar nach US-PS 4 022 880 mit einer antibakteriell wirkenden Verbindung; nach US-PS 4 082 841 mit einem Enzym; und nach US-PS 4 289 754, 4 289 755 und
 40 4 469 674 mit einer Fluoridverbindung.

In US-PS 4 469 674 ist ein Mundpflegemittel in Form einer Pastille geoffenbart, die Zinksalicylat, Zinklactat oder Zinkgluconat in Kombination mit einem ionischen Fluoridsalz in einem Zuckerträger aufweist.

Ein nichtcariogenes festes Mundpflegemittel gegen Zahnstein und Mundgeruch, das eine Kombination einer Zinkverbindung, eines Jononketon-Terpenderivats und eines Minzaromas in einem zuckerfreien Träger enthält, ist
 45 jedoch nicht bekannt.

Die Hauptaufgabe der Erfindung besteht darin, ein festes, dosiert vorliegendes Produkt zu schaffen, das den Zahnstein verringert, die Atemluft lang anhaltend frisch macht und über verbesserte Geschmackseigenschaften verfügt.

Eine weitere Aufgabe der Erfindung ist die Maximierung der Wirkung der aktiven Bestandteile durch Anwendung einer festen dosierten Form eines Mundpflegemittels, beispielsweise einer sich langsam lösenden
 50 Lutschtablette oder Pastille.

Noch eine weitere Aufgabe der Erfindung besteht darin, eine feste, zahnsteinverhindernde und den Mund desodorierende Zusammensetzung verfügbar zu machen, die bei der Bekämpfung des Mundgeruchs und Verringerung der Zahnsteinbildung über einen längeren Zeitraum synergistisch wirksam ist.

55 Aufgabe der Erfindung ist ferner, ein zweckmäßiges, festes, dosiertes Produkt als Lutschtablette oder Pastille mit verlängerter Geruchs- und Zahnsteinentfernung zu schaffen.

Zur Lösung dieser und anderer Aufgaben der Erfindung wird ein festes, Zahnstein und Mundgeruch verhinderndes Produkt vorgeschlagen, das eine nicht toxische Zinkverbindung, die 0,05 bis 1% Zink, vorzugsweise 0,12 bis 0,25 Gew.% Zink(ionen), liefert, und 0,1 bis 2, vorzugsweise 0,25 bis 0,5 Gew.% eines aromatischen Minzöls, das ein Jononketon-Terpenderivat aufweist, in einem nichtcariogenen Träger enthält.
 60

Insbesondere wird gemäß Erfindung eine sich langsam lösende Lutschtablette oder Pastille vorgeschlagen, die eine Zinkverbindung enthält, die 0,05 bis 1,0 Zinkionen, 0,001 bis 0,1% eines Jononketon-Terpens und

vorzugsweise einen Minzaromastoff in einem zuckerfreien Träger aufweist.

Frühere Versuche entsprechend US-SN 723 786 haben gezeigt, daß man durch Anwendung der Kombination von Zinkchlorid, Alpha-Jonon und Minzaromastoffen Mundspülmittel erhalten kann, die Mundgeruch wirksam verringern. Die Anwendung eines Mundspülmittels erfordert jedoch die Benutzung eines Ausgußbeckens. Die kurze Anwendungsdauer macht höhere Konzentrationen an Aktivbestandteilen notwendig, was negative Geschmackeffekte zur Folge hat. Zahnpasten mit Zink haben Zahnstein signifikant verringert, können jedoch bedauerlicherweise ernstliche Geschmacksprobleme aufwerfen.

Gegenstand der Erfindung ist eine feste dosierte Form, welche die folgenden aktiven Bestandteile umfaßt: Eine nicht-toxische, zur Lieferung von 0,5 bis 1% Zink befähigte Zinkverbindung, ein Jononketon-Terpenderivat und vorzugsweise einen Minzaromastoff. Die feste dosierte Form hat den zweifachen Vorteil, daß sie überall und bequemer anzuwenden ist und daß sie mit einer längeren Kontaktzeit angewendet wird, um die Wirksamkeit der Aktivbestandteile zu maximieren. Dies gestattet den Einsatz geringerer Konzentrationen aktiver Bestandteile, was einen verbesserten Geschmack, einen weniger trockenen Mund sowie sogar eine größere Wirkung zur Folge hat. Das Produkt gewährleistet sowohl effektive Verringerung der Zahnsteinbildung als auch lang anhaltende Atemdesodorierung. Die sich langsam lösende Tablette oder Pastille ermöglicht längere Kontaktzeit im Mund und dadurch deren Aktivitätsmaximierung.

Die neue Tablette oder Pastille der Erfindung besitzt den doppelten Vorteil, daß sie überall anwendbar ist und eine längere Kontaktzeit zur Maximierung der Aktivität der Aktivbestandteile ermöglicht. Das Ergebnis ist verbesserter Geschmack, geringere Zahnsteinbildung und lang andauernde Geruchsbefreiung des Atems.

Die Zink liefernde, gemäß Erfindung in Kombination mit Jonon anwendbare Zinkverbindung kann jede physiologisch verträgliche Zinkverbindung sein, einschließlich der wasserlöslichen und in Wasser schwer löslichen organischen und anorganischen Zinksalze, die mindestens etwa 0,01 mg Zinkionen je ml Wasser liefern. Die wasserlöslichen Zinksalze (mindestens 1% löslich) sind bevorzugt, besonders die Zinkhalogenide und Zinkacetat. Unter den schwer löslichen Zinksalzen ist Zinkcitrat bevorzugt. Beispiele für geeignete Zinksalze, die angewandt werden können, sind:

Zinkstearat	Zinkfluorid
Zinkacetat	Zinkformiat
Zinkammoniumsulfat	Zinkiodid
Zinkbromid	Zinknitrat
Zinkchlorid	Zinkphenolsulfonat
Zinkchromat	Zinksalicylat
Zinkcitrat	Zinksulfat
Zinkdithionat	Zinkgluconat
Zinkfluosilikat	Zinksuccinat
Zinktartrat	Zinkglycerophosphat.

Weitere Zinksalze mit einer Löslichkeit von mindestens etwa 0,01 mg Zinkionen je ml Wasser sind in US-PS 4 138 477 geoffenbart, deren Kenntnis hier vorausgesetzt wird.

Die Zinkverbindung ist in dem festen Mundpflegemittel in Mengen vorhanden, die 0,05 bis 1, vorzugsweise 0,12 bis 0,25 Gew.% Zink liefern.

Die Löslichkeit des Zinksalzes und damit Lieferung von Zinkionen kann ein Faktor sein bei der Wirkung gegen Geruchsbildung. Die Wirkung wird jedoch synergistisch verbessert, wenn ein Jononketon-Terpenderivat anwesend ist.

Zusätzlich dazu, daß Zink in Ionenform aus wasserlöslichen und schwer löslichen Zinkverbindungen verfügbar wird, kann es zu einem Festkörpertransfer von Zink in die Mundhöhle kommen. Daher kann gemäß Erfindung eine im wesentlichen wasserunlösliche Verbindung, wie Zinkoxid, eingesetzt werden.

Ein anderer wesentlicher Bestandteil gemäß Erfindung ist ein Jononketon-Terpenderivat, das eine ketonische Carbonylgruppe enthält. Die Formel des Jonongrundkörpers ist $(\text{CH}_3)_3\text{C}_6\text{H}_6\text{CH}=\text{CHCOCH}_3$. Es kommt als

Alpha-Jonon (Kp 120 °C) und β -Jonon (Kp 135 °) vor, die beide farblose Flüssigkeiten und im Wasser geringfügig löslich sind. Andere Jononvarianten, wie Gamma-Jonon, Dihydrojonon und Alpha-Methyljonon, können ebenfalls verwendet werden. Außerdem soll der Ausdruck "Jononketon-Terpenderivat", wie er in der Beschreibung verwendet wird, isomere Jononformen umfassen, z. B. Iron. Es wird zweckmäßig in den festen Mundpflegemitteln in Mengen von 0,0005 bis 1, vorzugsweise 0,001 bis 1 und am meisten bevorzugt von 0,001 bis 0,1 % angewandt. Alpha-Jonon ist bevorzugt. Jonon kann zweckmäßig als eine einem aromatisierenden Öl, wie dem Pfefferminzöl, zugesetzte Komponente eingebaut werden.

In GB-PS 1 311 060 wurde die Theorie aufgestellt, daß die Verbesserung schlechten Mundgeruchs mittels Jonon entweder auf seiner Fähigkeit beruht, Geruchsrezeptoren oder Geruchsrezeptorstellen in dem Geruchsepithel zu blockieren oder darauf, die Geruchsschwellen zu erniedrigen bzw. Geruchseingänge zu verkleinern, möglicherweise eine Kombination von beidem. Was auch die Ursache dieses Effekts ist, er ist jedenfalls nicht anhaltend. Bei Bestimmung des Atemgeruchs nach einer Nachtschlafzeitspanne wurde, wenn überhaupt, nur eine geringe Geruchsverringering festgestellt. Wenn andererseits Jonon in Kombination mit einem Salz vorliegt, das

Zinkionen liefert, kommt es über einen längeren Zeitraum, d. h. über Nacht und bis zu 12 Stunden, zu einer synergistischen Wirkung bei der Bekämpfung des Mundgeruchs.

Zur Ergänzung des Jononbestandteils der Erfindung können beliebige geeignete aromatisierende oder süßende Substanzen verwendet werden. Es wird bevorzugt, das Jononketon-Terpenderivat als Additiv zu aromatisierenden Minzölen zuzugeben. Die Anwesenheit des aromatisierenden Öls verbessert den Geschmack des Zink/Jonon-enthaltenden Produkts. Beispiele für geeignete aromatisierende oder aromatische Öle umfassen die Öle von grüner Minze, Pfefferminz, Wintergrün, Sassafras, Gewürznelke, Salbei, Eucalyptus, Majoran, Zimt, Zitrone und Orange sowie Methylsalicylat. Am meisten bevorzugt sind Minzöle wie Pfefferminzöl. Geeignete Süßungsmittel umfassen Sorbit, Natriumcyclamat, Saccharin, Acetosulfam, N-1-Alpha-aspartyl-1-phenylanilinmethylester (Aspartam), Xylit, Chalconmaterialien. Die aromatisierenden und süßenden Substanzen können zusammen 0,25 bis 2,5 Gew.% oder mehr der Zusammensetzungen gemäß Erfindung ausmachen. In einer typischen Modifikation enthält ein aromatisierendes Öl, wie beispielsweise Pfefferminzöl, 50 bis 75 % Pfefferminz und als Rest grüne Minze, Anethol, Menthol und/oder Carvon, wobei 0,5 bis 3 % Jonon zugegeben werden. Ähnliche Modifikationen mit hohem Minzgehalt können mit anderen aromatisierenden Ölen hergestellt werden.

Wäßrige Lösungen und Dispersionen von Vergleichssubstanzen, Placebos und verschiedenen Zink/Jonon-Materialien können in einem in vitro wie in einem in vivo System getestet werden. Bei dem in vitro Test wird der gesamte menschliche Speichel mit L-Cystein als Substrat 3 Stunden über Nacht bei 37 °C in einem luftdichten Behälter inkubiert. Nach der Inkubation wird die flüchtige Schwefelverbindung, die sich im Luftraum gebildet hat (VSC, die Hauptursache des unangenehmen Mundgeruchs), nach einer instrumentellen GC-Flammenfotometrischen Technik bestimmt. Da Mundgeruch auf die Anwesenheit von VSC's, wie Schwefelwasserstoff, Methylmercaptan und in geringerem Ausmaß auf Dimethylsulfid, zurückzuführen ist, welche sich bei den in der Mundhöhle stattfindenden Zersetzungsprozessen bilden, liefert der in vitro Test Ergebnisse, die sensorischen in vivo Untersuchungen entsprechen.

Mit an 12 Personen durchgeführten in vivo Tests wurde festgestellt, daß die Testtablettchen, die Zinksalz, Jonon und Aromastoff enthielten, im allgemeinen vorteilhaft für die Mundpflege waren, wirksam Gerüche von Speiseresten, wie Knoblauch oder Zwiebeln, entfernten und anhaltende Wirkungen auf den Geruch der Atemluft zeigten. Mehrere auf diesem Gebiet erfahrene Fachleute kamen nach ausgedehnten Geruchsbewertungen der Atemluft zu der Meinung, daß die Testtablettchen Mundgeruch wirksam und verlängert verringern.

Obleich man besonders gute Ergebnisse erzielt, was die Bekämpfung oder Inhibierung von Mundgeruch betrifft, wenn man die wäßrigen Lösungen oder Dispersionen des Zinksalz-Jonon enthaltenden Materials einfach verwendet, werden gemäß dem breiteren Aspekt der Erfindung Zinksalz und Jononmaterial in feste Mundpflegemittel, wie langsam lösliche Tabletten oder Pastillen, eingebaut, die einen nicht-kariogenen, zuckerfreien Träger enthalten.

Medium oder Träger einer Tablette oder Pastille sind ein nichtkariogener, fester, wasserlöslicher, mehrwertiger Alkohol (Polyol), wie Mannit, Xylit, Sorbit, Maltit, ein hydriertes Stärkehydrolysat, Lycasin, hydrierte Glucose, hydrierte Disaccharide, hydrierte Polysaccharide; sowie Natriumbicarbonat als Hauptbestandteil, und zwar in einer Menge von 90 bis 98 Gew.% der Gesamtzusammensetzung. Feste Salze, wie Natriumbicarbonat, Natriumchlorid, Kaliumbicarbonat oder Kaliumchlorid, können den Polyolträger ganz oder teilweise ersetzen.

Zur Tablettierung übliche Gleitmittel können in geringen Mengen von 0,1 bis 5 Gew.% in die Tabletten- oder Pastillenformulierung eingebaut werden, um die Herstellung der Tabletten und/oder Pastillen zu erleichtern. Geeignete Gleitmittel sind beispielsweise vegetabilische Öle, wie Kokosnußöl, Magnesiumstearat, Aluminiumstearat, Talkum, Stärke und Carbowax.

Pastillenformulierungen enthalten etwa 2 % Gum als Sperrsubstanz, um eine glänzende Oberfläche zu gewährleisten, im Gegensatz zu einer Tablette, die ein glattes Aussehen hat. Geeignete nicht kariogene Gumen umfassen Kappakarageenan, Carboxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Gantrez (Poly(vinylmethylether) maleinsäureanhydrid) und dergleichen.

Die Pastille oder Tablette kann gegebenenfalls mit einem Überzugsmaterial beschichtet sein, beispielsweise mit Wachsen, Schellack, Carboxymethylcellulose, Polyethylen/Maleinsäureanhydrid-Copolymerem oder Kappakarageenan, um die Zeit zur Auflösung der Tablette oder Pastille im Mund noch weiter zu verlängern. Die nicht beschichtete Tablette oder Pastille löst sich langsam und liefert mit anhaltender Freisetzungsrates während etwa 3 bis 5 Minuten die aktiven Bestandteile. Das feste dosierte Mundpflegemittel der Erfindung gewährt demzufolge eine längere Kontaktzeit mit den Aktivbestandteilen im Mund als eine Zahnpasta, ein Zahnpulver oder Mundspülmittel, das mit dem Mund nur etwa 30 bis 90 Sekunden während des Bürstens oder Spülens in Kontakt ist.

In den festen Träger des Zahnpflegemittels können beliebige geeignete oder verträgliche oberflächenaktive oder reinigende Substanzen eingebaut werden. Solche kompatiblen Materialien sind erwünscht, um zusätzliche reinigende, schäumende und antibakterielle Eigenschaften zu verleihen, was von dem speziellen Typ des oberflächenaktiven Materials abhängt. Sie werden in entsprechender Weise ausgewählt. Diese reinigenden Substanzen sind gewöhnlich wasserlösliche organische Verbindungen und können anionisch, nicht-ionisch oder kationisch sein. Geeignete reinigende Materialien, Tenside, sind bekannt und umfassen beispielsweise die wasserlöslichen Salze von Monoglyceridmonosulfaten höherer Fettsäuren (z. B. das Natriumsalz von Kokosnußsäuremonoglyceridmonosulfat), höheren Alkylsulfaten (z. B. Natriumlaurylsulfat), Alkylarylsulfonaten

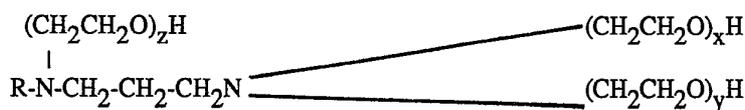
(z. B. Natriumdodecylbenzolsulfonat), Methylkokoylaurat, höheren Fettsäureestern von 1-2-Dihydroxypropansulfonat und dergleichen.

Weitere geeignete Tenside sind beispielsweise die im wesentlichen gesättigten (höher)aliphatischen Acylamide von (nieder)aliphatischen Aminocarbonsäureverbindungen, beispielsweise denen mit 12 bis 16 Kohlenstoffatomen im Acylrest. Der Aminosäureteil leitet sich im allgemeinen von den (nieder)aliphatischen gesättigten Monoaminocarbonsäuren mit etwa 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, im allgemeinen den Monocarbonsäureverbindungen ab. Geeignete Verbindungen sind die Fettsäureamide von Glycin, Sarcosin, Alanin, 3-Aminopropansäure und Valin mit etwa 12 bis 16 Kohlenstoffatomen im Acylteil. Zur Erzielung optimaler Wirkungen ist jedoch die Anwendung der N-Lauroylmyristoyl- und Palmitoylsarcosidverbindungen bevorzugt.

Die Amidverbindungen können in Form der freien Säure oder vorzugsweise als die wasserlöslichen Salze derselben verwendet werden, z. B. die Alkali-, Ammonium-, Amin- und Alkylolaminsalze. Spezielle Beispiele hierfür sind die Natrium- und Kalium N-Lauroyl-, Myristoyl- und Palmitoylsarcoside, Ammonium- und Ethanolamin-N-Lauroylsarcosid, N-Lauroylsarcosin, und Natrium-N-Lauroylglycin sowie Alanin. Der Einfachheit halber bedeuten beschreibungsgemäß "Aminocarbonsäure", "Sarcosid" und dergleichen derartige Verbindungen mit einer freien Carboxylgruppe oder deren wasserlösliche Carboxylatsalze.

Andere besonders geeignete oberflächenaktive Materialien sind beispielsweise nicht-ionische Tenside, wie die Kondensationsprodukte von Sorbitanmonostearat mit etwa 20 Molen Ethylenoxid, Sorbitandiisostearat mit 40 Molen Polyethylenglykol, Kondensationsprodukte von Ethylenoxid mit Propylenglycol (Pluronic) und Castorölester (z. B. Cremopher EL); sowie amphotere Substanzen, z. B. quartäre Imidazolderivate, die unter dem Handelsnamen MIRANOL erhältlich sind, wie MIRANOL C2M. Die Anwendung der nicht-ionischen Tenside, insbesondere der Kondensationsprodukte von Sorbitanmonostearat oder Diisostearat mit 20 bis 40 Molen Ethylenoxid oder Polyethylenglycol, ist bevorzugt.

Ebenfalls angewandt werden können kationische oberflächenaktive Germizide und antibakterielle Verbindungen, beispielsweise Diisobutylphenoxyethoxyethylmethylbenzylammoniumchlorid, tertiäre Amine mit einer Fettalkylgruppe (mit 12 bis 18 Kohlenstoffatomen) und 2(Poly)oxyethylengruppen am Stickstoff (wobei meist insgesamt 20 bis 50 Ethanoxygruppen je Molekül enthalten sind) sowie die Salze derselben mit Säuren, und Verbindungen der Formel



worin R eine Fettalkylgruppe darstellt, die meist 12 bis 18 Kohlenstoffatome aufweist, x, y und z zusammen 3 oder mehr bedeuten, sowie die Salze derselben mit mineralischen oder organischen Säuren.

Die verschiedenen Tenside können in jeder geeigneten Menge eingesetzt werden, die im allgemeinen von 0,05 bis 5 Gew.%, vorzugsweise 0,5 bis 2 Gew.%, der festen Zahnpflegemittelzusammensetzung reicht.

Antibakterielle Substanzen können ebenfalls in den festen Trägern der Erfindung verwendet werden. Typische antibakterielle Substanzen umfassen:

- N¹-(4-Chlorbenzyl)-N⁵-(2,4-dichlorbenzyl)biguanid;
- p-Chlorphenylbiguanid;
- 4-Chlorbenzhydrylbiguanid;
- 4-Chlorbenzhydrylguanidylharnstoff;
- N-3-Lauroxypropyl-N-p-chlorbenzylbiguanid;
- 1-6-Di-p-chlorphenylbiguanidhexan;
- 1-(Lauryldimethylammonium)-8-(p-chlorbenzylmethylammonium)octandichlorid;
- 5,6-Dichlor-2-guanidinobenzimidazol;
- N¹-p-Chlorphenyl-N⁵-laurylguanid;
- 5-Amino-1,3-bis-(2-ethylhexyl)-3-methylhexahydropyrimidin und deren nicht-toxische Säureadditionssalze.

Den Tabletten und Pastillen der Erfindung können auch geringe Mengen an Coloriermitteln, Farbstoffen oder Ultraviolettabsorbentien zur Steigerung der Farbe und dergleichen einverleibt werden, um den ästhetischen Wert und die Verbraucherakzeptanz zu erhöhen.

Die festen dosierten Mundpflegemittel werden während etwa 3 bis 5 Minuten langsam im Mund gelöst, was lang anhaltende Mundgeruchsbefreiung, bis zu etwa 12 Stunden, gewährleistet.

Die Mundpflegemittel sollen einen praktikablen pH-Wert aufweisen. Ein pH-Bereich von etwa 4 bis 9, vorzugsweise etwa 5 bis 7,5, wird als am zweckmäßigsten angesehen. Geeignete Substanzen zum Einstellen des pH-Werts sind beispielsweise Saccharinsäure, Zitronensäure, Maleinsäure, Adipinsäure, Succinsäure und

dergleichen.

Die folgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern, wobei sich alle Bestandteile auf das Gewicht beziehen, wenn es nicht anders vermerkt wird.

5

Tabletten
Beispiele 1 bis 3

<u>Bestandteile</u>	<u>1</u>	<u>2</u>	<u>3</u>
10 Sorbit	96,094	93,790	96,0965
Natriumsaccharinat	0,150	0,450	0,150
Kokosnußöl	2,000	3,000	2,000
PEG-40 Sorbitandiisostearat	1,000	1,500	1,000
blauer Farbstoff	0,006	0,010	0,006
15 Zinkchlorid	0,500	0,750	0,500
stark minzhaltiger Aromastoff (Pfefferminz)	0,245	0,490	0,245
Alpha-Jonon	0,005	0,010	0,0025

20

Herstellung der Produkte

Zur Herstellung der Produkte wurde Zinkchlorid mit etwa 5 % der formelmäßigen Menge an gepulvertem Sorbit vorgemischt, anschließend mit dem restlichen Sorbit in einem geeigneten Mischer bis zur gründlichen Dispergierung vermengt. Das Natriumsaccharinat wurde zugesetzt und mit dem Zinksorbitgemisch vermengt. Das Diisostearat-Tensid wurde mit dem Minzaroma, Alpha-Jonon und Farbstoff vorgemischt, diese Vormischung wurde zu dem Gemisch in dem Mischer gegeben und gründlich vermengt. Das Kokosnußöl wurde der Formulierung in dem Mischer zugegeben und gründlich gemischt. Die Formulierung wurde in eine Tablettermaschine, beispielsweise eine drehbare Tabletterpresse eingebracht, um das Endprodukt zu formen. Das Endprodukt ist eine weiße, blaugesprenkelte Tablette mit glatter Oberfläche. Jede Tablette wog 1 1/2 g. Diese Tabletten zeigen verbesserte Eigenschaften zur Verringerung von Mundgeruch und gewährleiten eine beträchtliche Verringerung der Zahnsteinbildung. Sie lösen sich langsam im Mund während etwa 3 bis 30 5 Minuten. Diese Tabletten bekämpfen Mundgeruch über Nacht und bis zu 12 Stunden nach vollständiger Auflösung im Mund.

Beispiel 4

35 Beispiel 1 wurde wiederholt, mit der Ausnahme, daß anstelle des Kokosnußöls 0,4 % Magnesiumstearat eingesetzt wurden und daß der Sorbitgehalt auf 97,694 % erhöht wurde. Dieses Produkt ergab auch blau gesprenkelte, weiße Tabletten, welche über die gleiche, überraschende lang anhaltende, Atem desodorierende sowie zahnsteinverringern den Eigenschaften, wie oben angegeben, verfügten.

40

Beispiel 5

Beispiel 1 wurde wiederholt mit der Ausnahme, daß anstelle des Sorbitträgers Mannit verwendet wurde, wobei man eine Tablette erhielt, deren Wirkung im wesentlichen der von Beispiel 1 entspricht.

Beispiel 6

45 Beispiel 2 wurde wiederholt mit der Ausnahme, daß Lycasin statt Sorbit als Träger verwendet wurde. Lycasin (siehe Roquette Frevas, The Manufacturing Confectioner, Dezember 1983, Seiten 69 bis 74) ist ein hydriertes Stärkehydrolysat, und zwar ein heller, farbloser Sirup einer Viskosität von etwa 2000 cps bei 20 °C, das 75 % Trockensubstanzen enthält, zu denen 6 bis 8 % D-Sorbit, 50 bis 55 % hydrierte Disaccharide, 20 bis 25 % Tri- bis Hexasaccharide und 15 bis 20 % hydrierte höhere Saccharide als Hexasaccharide gehören.

50

Beispiel 7

Beispiel 1 wurde wiederholt mit der Ausnahme, daß anstelle des Sorbits Natriumbicarbonat als Träger verwendet wurde, wobei man Tabletten erhielt, die über längere Zeit Mundgeruch und Zahnsteinbildung 55 verhinderten.

Beispiel 8

Beispiel 2 wurde wiederholt, doch wurde Zinkcitrat als Lieferant für die Zinkionen anstelle von Zinkchlorid eingesetzt. Das Endprodukt war im wesentlichen ebenso wirksam wie die Tabletten von Beispiel 2.

60

Beispiel 9

Beispiel 2 wurde wiederholt, doch wurde Zinkstearat anstelle des Zinkchlorids als Lieferant für die Zinkionen eingesetzt. Das Endprodukt war im wesentlichen ebenso wirksam wie die Tabletten von Beispiel 2.

5 Beispiel 10

Beispiel 1 wurde wiederholt, doch wurde Zinkoxid anstelle der Zinkverbindung als "Transferierungsmittel" (transfer source) für Zink verwendet. Das Endprodukt war im wesentlichen ebenso wirksam wie die Tabletten von Beispiel 1.

10 Beispiel 11

Pastille

<u>Bestandteile</u>	<u>%</u>
Kappakarageenan	2,0
Sorbit	94,094
Natriumsaccharinat	0,150
Kokosnußöl	2,00
PEG-40 Sorbitandiisostearat	1,00
blauer Farbstoff	0,006
Zinkchlorid	0,500
stark minzhaltiger Aromastoff	0,245
Alpha-Jonon	0,005

25 Der Sorbit wurde gründlich mit dem Kappacarageenan vermengt. Zinkchlorid und Saccharin wurden zugegeben und mit dem Sorbit/Carageenangemisch unter Bildung eines pulverförmigen Gemenges vermischt. Der Farbstoff wurde in dem Diisostearattensid dispergiert und dem pulverförmigen Gemisch vor Zugabe von Kokosnußöl zugegeben. Das gesamte Gemisch wurde unter Vermischen auf etwa 115,6 °C erhitzt. Das Gemisch wurde auf 30 82,2 °C abgekühlt, und es wurde der Aromastoff einschließlich Jonon zugesetzt. Das gekühlte Gemisch wurde geformt, bis zur Härte gelagert und aus der Form entnommen. Das erhaltene Produkt ist eine lang wirkende Pastille, die den Mundgeruch verhütet. Sie ist kein überdeckendes Minzbonbon oder "medizinartige" oder "minzartige" Flüssigkeit zum Spülen und dann Wegwaschen. Es ist eine neue, sich langsam lösende Pastille, die 35 eine spezielle Kombination von Zink und Jonon zur anhaltenden Geruchskontrolle enthält, die bequem nach Mahlzeiten, vor dem Schlafengehen, überall verwendet werden kann. Wenn sich die Pastille löst, bilden die wirksamen oder geruchsbekämpfenden Bestandteile mit dem Speichel ein Kontrollsystem, das sogar noch bis über die nächste Mahlzeit hinaus wirksam bleibt. Bei Einnahme vor dem Schlafengehen wirkt sie über Nacht und gegen morgendlichen Mundgeruch. Sie gewährleistet lang anhaltende Munderfrischung. Darüber hinaus steuert sie 40 den Zahnaufbau über Tag durch Bildung einer lang wirkenden Schutzsperre aus der Kombination der aktiven Bestandteile, Zinkionen und Jonon, und ergibt einen reineren, gesünderen Mund.

An die Stelle des in den Beispielen angewandten Alpha-Jonons können andere Jononketon-Terpenderivate treten, wie β-Jonon, Dihydrojonon und Alpha-Methyljonon. In ähnlicher Weise können andere Süßungsmittel an die Stelle von Natriumsaccharinat treten, wie Natriumcyclamat, Chalcone etc. Auch können andere Aromastoffe mit hohem Minzgehalt das Pfefferminzöl ersetzen, wie beispielsweise das Öl von grüner Minze, Wintergrün und 45 dergleichen. Ebenfalls ist es möglich, andere Tenside anstelle von PEG-40-Sorbitandiisostearat zu verwenden, beispielsweise Polyoxyethylen(20)sorbitanmonoisostearat sowie die "Pluronic".

50 **PATENTANSPRÜCHE**

55

- 60 1. Festes Mundpflegemittel gegen Zahnstein und Mundgeruch, vorzugsweise in Form einer zuckerfreien, sich auflösenden Lutschtablette oder Pastille, **dadurch gekennzeichnet**, daß es in einem nichtcariogenen Träger
- eine 0,05 bis 1 Gew.-% Zink liefernde nichttoxische Zinkverbindung und
 - 0,1 bis 2 Gew.-% eines Aromaöls, das ein Jononketon-Terpenderivat aufweist, enthält.

2. Mundpflegemittel nach Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß das Jononketon-Terpenderivat in Mengen von 0,001 bis 1 Gew.-% anwesend ist.
- 5 3. Mundpflegemittel nach Anspruch 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß das Jononketon-Terpenderivat aus der Gruppe aus Alpha-Jonon, Beta-Jonon, Gamma-Jonon, Dihydrojonon, Alpha-Methyljonon und Iron ist.
4. Mundpflegemittel nach Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß die Zinkverbindung wasserlöslich oder schwer löslich ist und mindestens 0,01 mg Zinkionen in 1 ml Wasser liefert.
- 10 5. Mundpflegemittel nach Anspruch 4, **dadurch gekennzeichnet**, daß die Zinkverbindung Zinkstearat ist.
6. Mundpflegemittel nach Anspruch 4, **dadurch gekennzeichnet**, daß die Zinkverbindung Zinkchlorid ist.
- 15 7. Mundpflegemittel nach Anspruch 4, **dadurch gekennzeichnet**, daß die Zinkverbindung Zinkcitrat ist.
8. Mundpflegemittel nach Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß die Zinkverbindung Zinkoxid ist.
9. Mundpflegemittel nach Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß der Träger ein zuckerfreier, wasserlöslicher, mehrwertiger Alkohol in einer Menge von 90 bis 98 Gew.% der Zusammensetzung ist.
- 20 10. Mundpflegemittel nach Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß der feste Träger ein zuckerfreies Natriumbicarbonatsalz in einer Menge von 90 bis 98 Gew.-% der Zusammensetzung ist.
- 25 11. Mundpflegemittel nach Anspruch 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß das Jononketon-Terpenderivat als Bestandteil eines Aromaöls in Mengen von 0,5 bis 1 Gew.-% desselben vorhanden ist.
12. Mundpflegemittel nach Anspruch 9, **dadurch gekennzeichnet**, daß der wasserlösliche mehrwertige Alkohol Sorbit ist.
- 30 13. Mundpflegemittel nach Anspruch 9, **dadurch gekennzeichnet**, daß der wasserlösliche mehrwertige Alkohol Mannit ist.
14. Mundpflegemittel nach Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß der feste Träger ein hydriertes Stärkehydrolysat in einer Menge von 90 bis 98 Gew.-% der Zusammensetzung ist.
- 35