РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** (11) **2 259 193** (13) **C2**

(51) МПК[7] **A 61 K 7/16, A 61 P 1/02**

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: **2003120062/15, 04.12.2001**

(24) Дата начала действия патента: **04.12.2001**

(30) Приоритет: **05.12.2000 US 09/730,143**

(43) Дата публикации заявки: **10.02.2005**

(45) Опубликовано: **27.08.2005 Бюл. № 24**

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: **US 5000944 A, 19.03.1991. RU 2132182 C1, 27.06.1999. RU 2001116132 A, 20.04.2003. US 4138477, 06.12.1979.**

(85) Дата перевода заявки PCT на национальную фазу: **07.07.2003**

(86) Заявка PCT:
US 01/46895 (04.12.2001)

(87) Публикация PCT:
WO 02/45678 (13.06.2002)

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

(72) Автор(ы):
ОИК Диего А. (US),
ПРЕНСАЙП Майкл (US),
БЛЭКУЭЛЛ Берни (US),
БРАУН Джеймс Р. (US),
ХАССАН Махмуд (US)

(73) Патентообладатель(ли):
КОЛГЕЙТ-ПАЛМОЛИВ КОМПАНИ (US)

RU 2259193 C2

(54) СОДЕРЖАЩЕЕ ЦИНК СРЕДСТВО УМЕНЬШЕННОЙ ОСТРОТЫ ДЛЯ ЧИСТКИ ЗУБОВ

(57) Реферат:

Изобретение относится к области стоматологии и касается средств для чистки зубов и способу их получения. Композиция для полости рта содержит орально приемлемый носитель, содержащий комплекс, образованный в носителе из соли цинка, анионного поликарбоксилатного полимера и пирофосфатной соли. Способ получения стабильной композиции заключается в приготовлении приемлемого для полости рта носителя, содержащего воду и увлажнители и смешивание с носителем соли цинка, анионного поликарбоксилатного полимера и пирофосфатной соли с образованием комплекса цинк/анионный поликарбоксилат/пирофосфат. Способ позволяет получить стабильную композицию, которая позволяет устранить неприятный запах изо рта и обладает улучшенными вкусовыми характеристиками при использовании потребителем. 2 н. и 12 з.п. ф-лы, 1 табл.

RU 2259193 C2

RUSSIAN FEDERATION

(19) **RU** (11) **2 259 193** (13) **C2**

(51) Int. Cl.[7] **A 61 K 7/16, A 61 P 1/02**

FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: **2003120062/15, 04.12.2001**

(24) Effective date for property rights: **04.12.2001**

(30) Priority: **05.12.2000 US 09/730,143**

(43) Application published: **10.02.2005**

(45) Date of publication: **27.08.2005 Bull. 24**

(85) Commencement of national phase: **07.07.2003**

(86) PCT application:
US 01/46895 (04.12.2001)

(87) PCT publication:
WO 02/45678 (13.06.2002)

Mail address:
129010, Moskva, ul. B.Spasskaja, 25, str.3, OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery", pat.pov. S.A.Dorofeevu

(72) Inventor(s):
OIK Diego A. (US),
PRENSAJP Majkl (US),
BLEhKUEhLL Berni (US),
BRAUN Dzhejms R. (US),
KhASSAN Makhmud (US)

(73) Proprietor(s):
KOLGEJT-PALMOLIV KOMPANI (US)

(54) ZINC-CONTAINING AGENT FOR TEETH CLEANSING WITH REDUCED SHARPNESS

(57) Abstract:

FIELD: medicine, stomatology.

SUBSTANCE: invention relates to agents used for teeth cleansing and a method for their preparing. Composition for mouth cavity comprises an orally acceptable carrier containing complex formed in carrier and consisting of zinc salt, anionic polycarboxylate polymer and pyrophosphate salt. Method for preparing the stable composition involves preparing a carrier acceptable for mouth cavity and moistening agents and mixing a carrier with zinc salt, anionic polycarboxylate polymer and pyrophosphate salt to form the complex zinc/anionic polycarboxylate/pyrophosphate.

Method provides preparing the stable composition that allows removing unpleasant mouth odor and elicits improved taste indices in using.

EFFECT: improved and valuable properties of agent.

14 cl, 1 tbl, 1 ex

RU 2259193 C2

RU 2259193 C2

Настоящее изобретение касается композиции средства для чистки зубов, полезного для уменьшения неприятного запаха изо рта и, более конкретно, касается освежающего дыхание продукта для ухода за полостью рта с пониженной остротой для устранения неприятного запаха, содержащего комбинацию солей цинка и пирофосфата.

Неприятный запах изо рта, или галитоз, является следствием действия гнилостных микроорганизмов на соответствующие компоненты зубного налета, прилипших к слизистой оболочке остатков пищи и клеточных элементов слюны с образованием содержащих серу летучих соединений, прежде всего сероводорода, метилмеркаптана и следовых количеств метилсульфида.

Включение солей цинка в продукты ухода за полостью рта для уменьшения неприятного запаха изо рта хорошо известно из уровня техники, например, из патентов США №№4,138,477 и 5,000,944. Однако острый вкус солей цинка является основным недостатком при их использовании в продуктах для ухода за полостью рта, создающим неприятную горечь во рту.

Патент США №4,138,477 раскрывает содержащую соль цинка композицию для полости рта с уменьшенной остротой, причем эта композиция содержит цинк-полимерный комплекс, образованный взаимодействием соли цинка с анионным полимером, содержащим радикалы карбоновой, сульфоновой и/или фосфоновой кислоты.

В патенте США 5,000,944 описан содержащий цинк продукт для полости рта для профилактики зубного камня, не обладающий остротой, содержащий в качестве основного компонента цинк/фосфатный комплекс, имеющий по меньшей мере 50%-ную растворимость в воде, образованный взаимодействием соли цинка с полифосфатом натрия или калия путем растворения соли цинка в растворе полифосфата, такого как пирофосфат, триполифосфат, гексаметафосфат и их сочетания.

Недостатком комплексных солей цинка/полифосфата является то, что хотя острота существенно снижается, средства для чистки зубов, содержащие соли цинка и полифосфата, имеют тенденцию к нестабильности, когда в процессе хранения образуются поликристаллические куски; при этом полагают, что их образование вызвано агрегацией кристаллов цинк-полифосфатного комплекса. Эти куски различимы невооруженным глазом и имеют значительную твердость, таким образом, образование таких цинк/полифосфатных кристаллов является весьма нежелательным и препятствует одобрению потребителем продукта для ухода за зубами. Поэтому в данной области существует потребность в средствах, с помощью которых можно как повысить стабильность, так и смягчить вкус продуктов для ухода за полостью рта так, чтобы такие продукты стали более приемлемыми для потребителя.

В соответствии с настоящим изобретением предлагается стабильная водная композиция для ухода за полостью рта, предназначенная для устранения неприятного запаха изо рта, имеющая ограниченную остроту, причем эта композиция содержит комплекс, образованный из соли цинка, анионного поликарбоксилатного полимера и полифосфатной соли, включенных в качестве ингредиентов в композицию для полости рта.

Как будет показано ниже, присутствие комплекса цинк-анионный поликарбоксилатный полимер-пирофосфат в продукте для ухода за полостью рта неожиданно обеспечивает получение стабильного продукта с существенно уменьшенной остротой, обладающий улучшенными вкусовыми характеристиками при использовании потребителем.

В практическом осуществлении настоящего изобретения источником иона цинка, используемым для образования комплекса цинк-анионный поликарбоксилатный полимер-пирофосфат, в композиции для ухода за полостью рта обычно является соль цинка, которая полностью или частично растворима в воде, например, нитрат цинка, сульфат цинка, цитрат цинка, хлорид цинка, причем предпочтительным из них является цитрат цинка. Соль цинка обычно включают в композицию для ухода за полостью рта по изобретению при концентрации от около 1 до около 5 мас.%, и предпочтительно от около 1,5 до около 3 мас.%.

Анионные поликарбоксилатные полимеры, используемые для получения комплекса

цинк-анионный поликарбоксилатный полимер-пирофосфат, обычно используют в их свободнокислотной форме или, предпочтительно, в форме частично или полностью нейтрализованных водорастворимых солей щелочных металлов (например, калия и, предпочтительно, натрия) или аммония. Предпочтительными являются 1:4-4:1 сополимеры малеинового ангидрида или кислоты с другим полимеризуемым этилен-ненасыщенным мономером, предпочтительно метилвиниловый эфир/малеиновый ангидрид, имеющий молекулярный вес (M.W.) примерно от 30000 до 1800000, наиболее предпочтительно примерно от 30000 до 700000. Такие сополимеры доступны, например, от ISP Corporation под торговым наименованием Gantez, например, AN 139 (M.W. 500000), AN 119 (M.W. 250000); S-97 фармацевтического качества (M.W. 700000), AN 169 (M.W. 1200000-1800000) и AN 179 (M.W. выше 1800000); из которых предпочтительным является сополимер S-97 фармацевтического качества (M.W. 700000).

Анионный поликарбоксилатный полимер используют в количествах, эффективных для образования комплекса цинк-полимер-полифосфат в композиции для полости рта. Для этого анионный поликарбоксилатный полимер включают в композицию для ухода за полостью рта в количестве от около 0,1 до около 10 мас.%, предпочтительно от около 0,2 до около 3,0 мас.%.

Соли пирофосфатов, используемые для получения комплексов цинк/анионный полимер/пирофосфат, включают диосновные или тетраосновные пирофосфатные соли металлов, такие как $Na_2P_2O_7$, $K_2P_2O_7$, $Na_2K_2P_2O_7$, $Na_2H_2P_2O_7$ и $K_2H_2P_2O_7$. Пирофосфатные соли включают в композицию для полости рта по изобретению при концентрации от около 1 до около 5 мас.%, и предпочтительно, от около 0,5 до около 3 мас.%.

Для получения композиции средства для чистки зубов по изобретению, ингредиенты, включающие соль цинка, анионный поликарбоксилатный полимер и пирофосфатную соль, вводят в продукт для ухода за полостью рта, который включает носитель, содержащий воду, увлажнитель, поверхностно-активное вещество и полирующий состав.

Увлажнитель обычно представляет собой смесь увлажнителей, таких как глицерин, сорбит и полиэтиленгликоль с молекулярной массой 200-1000, но могут также использоваться и другие смеси увлажнителей и отдельные увлажнители. Содержание увлажнителя находится в пределах от около 10 до около 80 мас.%, и предпочтительно, от около 30 до около 50 мас.%. Содержание воды находится в пределах от около 10 до около 25 мас.%.

В качестве ингредиента компонента средства для чистки зубов, которое включает соли калия, могут быть включены неорганические загустители, включающие белую сажу, такую как Cabosil, доступную от Cabot Corporation, и загустители на основе двуокиси кремния, доступные от Crosfield Chemicals, имеющие наименование Sorbosil TC-15 или Sylox 15 от W.R.Grace.

В композицию для ухода за полостью рта по изобретению могут быть включены органические загустители на основе природных или синтетических смол. Примерами таких загустителей являются каррагенан, ксантановая смола, натрий карбоксиметилцеллюлоза, крахмал, поливинилпирролидон, гидроксиэтилпропилцеллюлоза, гидроксибутилметилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза и гидроксиэтилцеллюлоза. Органический загуститель может быть включен в композицию по изобретению в концентрации от около 0,25 до около 2 мас.%, и предпочтительно, от около 0,5 до около 1 мас.%.

В композицию для ухода за полостью рта по изобретению могут быть включены поверхностно-активные вещества в качестве ингредиента, обеспечивающего вспенивающие свойства. Поверхностно-активное вещество предпочтительно является анионным, подходящие примеры которого включают высшие алкилсульфаты, такие как лаурилсульфат калия или натрия, который является предпочтительным, моносульфаты моноглицеридов высших жирных кислот, такие как соль моносульфатированного моноглицерида жирных кислот гидрированного кокосового масла, алкиларил-сульфонаты, такие как додецилбензол-сульфонат натрия, сульфоацетаты высших жирных кислот,

сложные эфиры высших жирных кислот 1,2 дигидроксипропан-сульфоната и практически полностью насыщенные высшие алифатические ациламиды низших алифатических амино-карбоновокислотных соединений, например, те, которые имеют 12-16 атомов углерода в жирнокислотных, алкильных или ацильных радикалах, и т.п.Примерами таких последних амидов являются N-лауроил-саркозин и соли N-лауроил, N-миристоил или N-пальмитоил-саркозина. Поверхностно-активное вещество обычно присутствует в композиции для ухода за полостью рта по изобретению в концентрации от около 0,5 до около 5,0 мас.%.

В композицию для ухода за полостью рта по изобретению могут быть включены абразивные средства, и предпочтительными абразивными средствами являются кремнистые вещества, такие как диоксид кремния. Предпочтительным диоксидом кремния является аморфный гидрированный диоксид кремния, такой как Sorbosil AC-35, поставляемый фирмой Crosfield Chemicals, или Zeodent 115 и Zeodent 165 фирмы Huber Company, но можно также использовать и другие абразивные средства, в том числе метафосфат натрия, метафосфат калия, трикальцийфосфат, дигидрат фосфата кальция, безводный дикальцийфосфат, пирофосфат кальция, ортофосфат магния, карбонат кальция, бикарбонат натрия, тригидрат оксида алюминия, силикат алюминия, кальцинированный оксид алюминия и бентонит. Концентрация абразивного средства в композиции для ухода за полостью рта по изобретению обычно составляет от 5 до около 40 мас.%, и предпочтительно, от 10 до 30 мас.%.

Другие ингредиенты, которые могут быть включены в композицию для ухода за полостью рта по изобретению, включают пигмент, подсластитель, отдушку и консервант. В композициях белой зубной пасты обычно выбирают пигмент на основе диоксида титана, рутила, и его содержание обычно находится в пределах от 0,5 до 1,25 мас.%, предпочтительно от 0,75 до 1 мас.%. Содержание подсластителя будет соответствовать обычному содержанию искусственного или синтетического подсластителя, т.е. обычно подсластитель присутствует в количестве от 0,1 до 1 мас.%, предпочтительно от 0,3 до 0,5 мас.%. Содержание отдушки, которая предпочтительно представляет собой смешанный ароматизатор типа «перечная мята» и «ментол», обычно находится в пределах от 0,5 до 2 мас.%, предпочтительно от 0,5 до 1,5 мас.%. Для получения желаемого цвета можно использовать F.D.&C красители в подходящих количествах. Содержание других компонентов или добавок содержащего соль калия средства для чистки зубов обычно не превышает 10 мас.%, часто будет менее 5 мас.%, и может даже составлять 0%.

Для получения композиции для ухода за полостью рта по изобретению соль цинка добавляют к смеси воды, увлажнителя и анионного поликарбоксилатного полимера и диспергируют в обычном смесителе до тех пор, пока смесь не превратится в визуально однородную суспензию. В этот момент можно также добавить пирофосфатную соль, препочтительно предварительно растворенную в виде водного раствора. Другие водорастворимые ингредиенты, например фторидные соли и подсластители, такие как натрий-сахарин, также можно добавить в этот момент. Полученную смесь можно нагреть до 100-110°F и перемешивать в течение 1-30 минут с получением гомогенной гелевой фазы. Смесь переносят в вакуумный смеситель. Затем добавляют абразивное средство и перемешивают в течение 10-30 минут при высокой скорости в вакууме, примерно при 5-100 мм рт.ст., предпочтительно 5-150 мм рт.ст., с получением гомогенной смеси. Затем к пасте добавляют поверхностно-активное вещество и отдушку с последующим перемешиванием еще в течение 10-20 минут в вакууме при 5-50 мм рт.ст. Полученный продукт представляет собой стабильное вяжущее средство для чистки зубов с текстурой, подобной текстуре обычных зубных паст или гелей, с pH в пределах 5-8, предпочтительно 6,5-7,5, например, 7, и с удовлетворительным вкусом.

Приведенный ниже пример более подробно иллюстрирует настоящее изобретение, но необходимо понимать, что изобретение не ограничено этим. Все количества, указанные в описании и в формуле изобретения, являются массовыми количествами.

Пример

Водное средство для чистки зубов получали смешиванием ингредиентов,

перечисленных в приведенной ниже таблице.

Таблица

Ингредиент	мас.%
Деионизированная вода	17,54
Тригидрат цитрата цинка	2,00
Gantrez S-97 (13% раствор)	11,54
ПЭГ 600	3,00
Глицерин	11,50
Каррагенан	0,400
Натрий карбоксиметилцеллюлоза	0,60
Сорбит (70% раствор)	24,60
Натрий-сахарин	0,300
Тетранатрий-пирофосфат	2,0
Диоксид титана	1,00
Фторид натрия	0,32
Диоксид кремния	22,20
NaOH (50% раствор)	0,60
Отдушка	1,20
Лаурилсульфат натрия	1,20
Всего	100,00

После хранения состава для чистки зубов в герметично закрытых пластмассовых тюбиках в течение 8 недель при 40°F, комнатной температуре, 105°F и 120°F не было замечено никаких образований кристаллического вещества.

Вяжущие и вкусовые свойства состава для чистки зубов оценивались дегустатором на приемлемость вяжущих и вкусовых характеристик в сравнении с коммерческим невяжущим антибактериальным средством для чистки зубов, которое не содержит ионов цинка, и с коммерческим средством для чистки зубов, известным как имеющее острый вкус, которое содержит 2 мас.% цитрата цинка.

Дегустатор оценил средство по изобретению для чистки зубов как обладающее незначительным острым вкусом.

В отличие от этого при получении средства для чистки зубов в соответствии с Примером, когда в композицию средства для чистки зубов включали цитрат цинка вместе с 1 мас.% тетранатрий пирофосфата и 7 мас.% триполифосфата натрия, а анионный поликарбоксилатный полимер Gantrez S-97 не был включен в композицию средства для чистки зубов, композиция имела низкую остроту, однако через 15 дней хранения в пластмассовых тюбиках при комнатной температуре в средстве для чистки зубов происходило образование нежелательных кристаллов.

Формула изобретения

1. Стабильная, содержащая цинк водная композиция для полости рта, имеющая низкую остроту, содержащая орально приемлемый носитель, содержащий комплекс, образованный в носителе из соли цинка, анионного поликарбоксилатного полимера и пирофосфатной соли, причем потребитель при использовании такой композиции ощущает меньшую остроту.

2. Композиция по п.1, в которой соль цинка представляет собой цитрат цинка.

3. Композиция по п.1, в которой пирофосфатная соль представляет собой тетранатрий пирофосфат или тетракалий пирофосфат.

4. Композиция по п.1, в которой анионный поликарбоксилатный полимер представляет собой сополимер винилового эфира/малеинового ангидрида.

5. Композиция по п.1, в которой сополимер присутствует в композиции в концентрации от 0,1 до 10 мас.%.

6. Композиция по п.4, в которой соль цинка присутствует в композиции в концентрации от 1 до 5 мас.%.

7. Композиция по п.1, в которой пирофосфатная соль присутствует в композиции в концентрации от 0,5 до 3,0 мас.%.

8. Способ получения стабильной, содержащей цинк композиции для полости рта, имеющей низкую остроту, предусматривающий приготовление приемлемого для полости рта носителя, содержащего воду и увлажнители и смешивание с носителем соли цинка, анионного поликарбоксилатного полимера и пирофосфатной соли с образованием комплекса цинк/анионный поликарбоксилат/пирофосфат, причем потребитель при использовании такой композиции ощущает меньшую остроту.

9. Способ по п.8, в котором соль цинка представляет собой цитрат цинка.

10. Способ по п.8, в котором пирофосфатная соль представляет собой тетранатрий пирофосфат или тетракалий пирофосфат.

11. Способ по п.8, в котором анионный поликарбоксилатный полимер представляет собой сополимер винилового эфира/малеинового ангидрида.

12. Способ по п.11, в котором сополимер присутствует в композиции в концентрации от 0,1 до 10 мас.%.

13. Способ по п.8, в котором соль цинка присутствует в композиции в концентрации от 1 до 5 мас.%.

14. Способ по п.8, в котором пирофосфатная соль присутствует в композиции в концентрации от 0,5 до 3,0 мас.%.