



[12] 发 明 专 利 说 明 书

专利号 ZL 00809969.3

[45] 授权公告日 2005 年 7 月 20 日

[11] 授权公告号 CN 1211063C

[22] 申请日 2000.6.9 [21] 申请号 00809969.3

[30] 优先权

[32] 1999.7.2 [33] WO [31] PCT/US99/15131

[86] 国际申请 PCT/US2000/015891 2000.6.9

[87] 国际公布 WO2001/001940 英 2001.1.11

[85] 进入国家阶段日期 2002.1.4

[71] 专利权人 宝洁公司

地址 美国俄亥俄州

[72] 发明人 岳 江 M·M·克里桑蒂

S·马耶蒂 S·C·伯吉斯

李 力 S·米特拉

审查员 刘启明

[74] 专利代理机构 上海专利商标事务所有限公司

代理人 张宜红

权利要求书 3 页 说明书 20 页

[54] 发明名称 用于释放口腔护理物质的含有有机
硅氧烷树脂的组合物

[57] 摘要

本发明揭示了一种向口腔释放口腔护理物质的组合物，它包含：(a)有机硅氧烷树脂；(b)能够溶解有机硅氧烷树脂的挥发性载体；(c)流变调节剂；和(d)至少一种口腔护理物质。本发明还涉及这样的组合物，它含有：(a)有机硅氧烷树脂；(b)二有机基聚硅氧烷基的聚物流体；(c)能够溶解有机硅氧烷树脂和二有机基聚硅氧烷基的聚物流体的挥发性载体；(d)流变调节剂；和(e)至少一种口腔护理物质。本发明还揭示了这些组合物的使用方法。

1. 一种向口腔释放口腔护理物质的组合物，它包含：
 - (a) 有机硅氧烷树脂，含量为组合物重量的 5-70%；
 - 5 (b) 能够溶解所述有机硅氧烷树脂的挥发性载体，含量为组合物重量的 10-90%；
 - (c) 流变调节剂，含量为组合物重量的 0.1-30%；
 - (d) 至少一种口腔护理物质，含量为组合物重量的 0.01-50%。
2. 如权利要求 1 所述的组合物，其中所述的有机硅氧烷树脂含有选自以下单元：(CH₃)₃SiO_{0.5} “M” 单元、(CH₃)₂SiO “D” 单元、(CH₃)SiO_{1.5} “T” 单元、SiO₂ “Q” 单元及其混合单元。
10
3. 如权利要求 2 所述的组合物，其中所述的有机硅氧烷树脂含有 MQ 单元，其中 M:Q 之比为 0.5:1.0-1.5:1.0。
4. 如权利要求 1 所述的组合物，其中所述的挥发性载体选自烃油、挥发性硅氧烷、非烃溶剂及其混合物。
15
5. 如权利要求 1 所述的组合物，其中所述的口腔护理物质包括至少一种口腔护理活性成分，选自牙齿增白剂、抗酒石剂、氟离子源物质、抗菌剂、消炎剂、一种或多种营养素、口腔和咽喉制品、抗氧化剂、H₂ 拮抗剂、止痛活性成分、抗病毒剂、香料、甜味剂、木糖醇、遮光剂、着色剂、表面活性剂、螯合剂、颜料及其混合物。
20
6. 如权利要求 5 所述的组合物，其中所述的口腔护理物质是牙齿增白活性成分，选自过氧化物、金属亚氯酸盐、过硼酸盐、过碳酸盐、过氧酸、过硫酸盐及其混合物。
7. 如权利要求 1 所述的组合物，其中所述的流变调节剂选自有机改性的粘土、二氧化硅、聚乙烯及其混合物。
25
8. 如权利要求 1 所述的组合物，其中所述的流变调节剂的含量为组合物重量的 0.5-10%，口腔护理物质的含量为组合物重量的 0.1-20%。
9. 如权利要求 1 所述的组合物，它还包含二有机基聚硅氧烷基的聚合物流体。
- 30 10. 如权利要求 9 所述的组合物，其中所述的二有机基聚硅氧烷基的聚合

物流体含有式 $(R_2SiO)_n$ 的重复单元, 式中 R 选自含 1-6 个碳原子的单价基团, 含有聚烯化氧基的基团及其混合基团。

11. 如权利要求 10 所述的组合物, 其中所述的二有机基聚硅氧烷基的聚
合物流体以式 R'_3Si 三有机基甲硅烷基为末端基团, 其中 R' 是单价基团, 选
5 自含 1-6 个碳原子的基团、羟基、烷氧基及其混合基团。

12. 如权利要求 10 所述的组合物, 其中所述的 R 选自甲基、乙基、丙基、
异丙基、丁基、异丁基、叔丁基、戊基、己基、乙烯基、烯丙基、环己基、
氨基烷基、苯基、氟烷基及其混合基团。

13. 如权利要求 9 所述的组合物, 其中所述的二有机基聚硅氧烷基的聚
10 合物流体是聚二甲基硅氧烷。

14. 如权利要求 9 所述的组合物, 其中所述的二有机基聚硅氧烷基的聚
合物流体是聚烯化氧改性的聚二甲基硅氧烷。

15. 如权利要求 9 所述的组合物, 其中所述的挥发性载体选自烃油、挥
发性硅氧烷、非烃溶剂及其混合物。

16. 如权利要求 9 所述的组合物, 其中所述的流变调节剂选自有机改性的
15 粘土、二氧化硅、聚乙烯及其混合物。

17. 如权利要求 9 所述的组合物, 其中所述的口腔护理物质包括至少一
种口腔护理活性成分, 选自牙齿增白剂、抗酒石剂、氟离子源物质、抗菌剂、
消炎剂、一种或多种营养素、口腔和咽喉制品、抗氧剂、 H_2 拮抗剂、止痛活
20 性成分、抗病毒剂、香料、甜味剂、木糖醇、遮光剂、着色剂、表面活性剂、
螯合剂、颜料及其混合物。

18. 如权利要求 17 所述的组合物, 其中所述的口腔护理物质是牙齿增白
活性成分, 选自过氧化物、金属亚氯酸盐、过硼酸盐、过碳酸盐、过氧酸、
过硫酸盐及其混合物。

19. 如权利要求 9 所述的组合物, 其中所述的挥发性载体能够溶解有机硅
25 氧烷树脂和二有机基聚硅氧烷基的聚物流体, 而且各组分的含量为:

(a) 有机硅氧烷树脂的含量为组合物重量的 15-45%;

(b) 二有机基聚硅氧烷基的聚物流体的含量为: 有机硅氧烷树脂与二
有机基聚硅氧烷基的聚物流体之比为 10:1-1:10;

30 (c) 挥发性载体的含量为组合物重量的 10-90%;

(d) 流变调节剂含量为组合物重量的 0.5-10%;

(e) 口腔护理物质的含量为组合物重量的 0.1-20%。

20. 如权利要求 4 或 15 所述的组合物，其中所述的挥发性载体选自乙醇、异十二烷、丁酮、乙酸乙酯、乙酸丙酯、甲基九氟异丁基醚、甲基九氟丁基醚及其混合物。

5 21. 一种非治疗性的增白牙齿的方法，它包括向口腔的至少一个表面释放口腔护理物质的方法，它还包括如下步骤：

(1) 向牙齿的釉质上施加权利要求 6 或 17 所述的组合物，(2) 使组合物在牙齿表面上形成一层膜。

用于释放口腔护理物质的
含有有机硅氧烷树脂的组合物

5

发明的领域

本发明涉及用于向牙齿表面释放口腔护理物质的组合物。该组合物在所施加的牙齿表面上形成膜，自膜上会持续释放出口腔护理物质，有长期治疗、预防和/或美容的优点。更具体地说，本发明涉及用于向牙釉质释放口腔护理物质的含有有机硅氧烷树脂的组合物。另外，据认为本发明所述组合物还有向口腔内其他表面例如齿龈、粘膜组织和牙齿表面持续释放物质的优点。

发明的背景

以前已经知道口腔护理产品，各种口腔护理物质或活性成分能够通过它释放到口腔内软和硬组织上。这些口腔护理产品的例子包括例如刷牙助剂，如释放抗龋活性成分如氟化物或其他活性成分以减少可形成斑块的细菌的牙粉产品，和含有气息清新活性成分和/或抗菌活性成分的漱口水。另外，也已经开发了漂白剂，例如能够直接施加到牙齿表面即牙釉质表面的过氧化物。

但是，已经发现，这些常规的产品形式不能提供足以在硬、软口腔组织上保持活性成分的亲和性一段时间，以足够提高或延长由该活性成分提供的治疗、治疗和/或美容的益处。

以前已经尝试了提高口腔护理产品的增白漂白剂、抗菌剂和其他活性成分的亲和性。见例如 1995 年 6 月 20 日授予 Sintov 等人的美国专利 № 5425953，其中使用可溶于水的成膜的纤维素聚合物向牙齿释放漂白剂；授予 Friedman 等人的美国专利 № 5438076，其中使用液态甲基丙烯酸共聚物的组合物释放抗菌药剂；1997 年 7 月 24 日授予 Huang 的国际专利申请 № PCT/CN97/00 揭示了薄膜包衣组合物，它含有纤维素和聚乙烯醇缩醛、香豆酮-茛树脂或虫胶，作为向牙釉质释放漂白剂的成膜剂。

但是，上述体系都是溶于水的，即它们通常在施加后约 1-3 小时内被唾液溶解。因此，它们的耐久度低，不能长期释放组合物内的活性成分。另外，

它们溶于水的性质阻止它们与在水基膜内不稳定的口腔护理活性成分一同使用。过碳酸钠是这种活性成分的一个例子，它在水基膜的高 pH 环境中不稳定。

5 为了提供耐久度较高的施加组合物，有描述使用施加到牙齿上的保护性包衣。见 1995 年 3 月 18 日授予 Schmidt 的美国专利 No. 5401528，其中有机改性的硅酸缩聚物沉积到牙齿上，然后就地聚合固化，包住牙齿，目的是保护它们免于沉积斑块。该体系不是真正的随时间延长而释放活性成分的释放体系，而是提供一个可减少形成斑块的细菌的有害作用的屏障。

虽然这样的屏障包衣有提高耐久度的好处，但是它需要使用特别的装置，而且应用复杂；因此，它不能在家中实施，也不能自己处理。

10 由此能够看出，这些已经开发的产品不能同时提供长期释放口腔护理物质或活性成分和便利地非连续地自己处理和家庭使用的优点。基于上述问题，就需求各种口腔护理物质的便利释放体系，其中活性成分的亲和性有提高。现有技术不能提供本发明的所有这些优点和益处。

15 发明的概述

本发明涉及一种向口腔释放口腔护理物质的组合物，它包含：(a)有机硅氧烷树脂；(b)能够溶解该有机硅氧烷树脂的挥发性载体；(c)流变调节剂；和 (d)至少一种口腔护理物质。本发明还涉及这样的组合物，它含有：(a)有机硅氧烷树脂；(b)二有机基聚硅氧烷基的聚合物流体；(c)能够溶解该有机硅氧烷树脂和二有机基聚硅氧烷基的聚合物流体的挥发性载体；(d)流变调节剂；和 (e)至少一种口腔护理物质。本发明还揭示了这些组合物的使用方法。

20 阅读本文后，本行业内的普通技术人员会明白本发明的这些和其他特性、方面和优点。

25 发明的详细说明

虽然本文所附的权利要求具体指出并清楚说明了本发明的权利要求，但是据认为从下面描述中可更好地明白本发明。

除非另有说明，本文中使用的百分率、比例都是以组合物的总重量为基准。

30 除非另有说明，本文中所述的测试都在 25°C 进行。

除非另有说明，本文中所述的所有各组分的百分率、比例和含量都以组

分的实际用量为基础，不包括溶剂、填料或可以与该组分组合成商品的其他材料。

本文中所述的所有出版物、专利申请和授权专利的内容都参考结合于此。不允许将引用的任何文献作为现有技术得到的任何结论看做本发明的权利要求。

在本文中，“含有”指能够加入不影响最终结果的其他步骤和成分。该词包括“由...组成”和“基本上由...组成”。

有机硅氧烷树脂

硅氧烷树脂是高度交联的聚合的硅氧烷体系。该交联通过在硅氧烷树脂制造过程中，与单官能或二官能或这两种硅烷一同加入三官能和四官能硅烷而进行。正如本行业内众所周知的那样，为形成硅氧烷树脂所需的交联度随加入硅氧烷树脂中的特定硅烷单元而变。总的来说，有足量三官能和四官能硅氧烷单体单元，并由此有足够交联度，使它们干燥成刚性或硬膜的硅氧烷材料，都认为是硅氧烷树脂。在具体的硅氧烷材料中，氧原子与硅原子之比表示交联度的指标。在本文中相对于每个硅原子有至少约 1.1 个氧原子的硅氧烷材料一般就是硅氧烷树脂。氧原子：硅原子之比优选至少约为 1.2:1.0。

根据本行业内普通技术人员所熟知的“MDTQ”速记命名体系，就能够便利地辨别具体的硅氧烷材料和硅氧烷树脂。在该体系中，硅氧烷是根据构成该聚硅氧烷而存在的各种硅氧烷单体单元进行描述的。简要地说，符号 M 表示单官能单元 $(\text{CH}_3)_3\text{SiO}_{0.5}$ ；D 表示二官能单元 $(\text{CH}_3)_2\text{SiO}$ ；T 表示三官能单元 $(\text{CH}_3)\text{SiO}_{1.5}$ ；Q 表示四官能单元 SiO_2 。注意，高达约 5% 的少量硅烷醇或烷氧基官能作为加工的结果也可以存在于树脂结构中。

单元符号中的撇(“’”)例如 M’、D’、T’ 和 Q’ 表示甲基以外的取代基，必须特别说明各自的来源。一般的替换的取代基包括乙烯基、苯基、氨基、羟基等之类的基团。各种单元的摩尔比，或基于表示硅氧烷内每种单元总数的符号下标，或其平均值，或结合分子量具体指明的比例；就完成了在 MDTQ 系统下对硅氧烷材料的描述。硅氧烷树脂中 T、Q、T’ 和/或 Q’ 对 D、D’、M 和/或 M’ 的相对摩尔量越高，就表示交联度越大。但是，如上所述，总交联度也可以用氧与硅之比表示。

有机硅氧烷树脂在约 25℃ 为固态，树脂的平均分子量约为 1000-10000。所述树脂可溶于有机溶剂例如甲苯、二甲苯、异链烷烃和环硅氧烷或下述挥

发性载体,表明树脂没有充分交联至使树脂不溶于挥发性载体。

在本文中优选使用的硅氧烷树脂是 MQ、MT、MTQ 和 MDTQ 树脂,所述 MQ 树脂在 1994 年 7 月 19 日授予 Krzysik 的美国专利 No. 5330747 中有描述。因此,优选的硅氧烷取代基是甲基。尤其优选的是 MQ 树脂,其中 M:Q 之比约为 0.5:1.0-1.5:1.0。象这样的有机硅氧烷树脂是可购买到的树脂,例如购自美国密执安州 Adrian 的 Wacker Silicones Corporation 的 Wacker 803 和 804,和购自 General Electric Company 的 G.E. 1170-002(SR1000)。

组合物中的树脂用量是根据其在配制物中的溶解度,尤其在所用溶剂中的溶解度而定的。通常,本发明中的树脂用量约为 5-70%,优选约为 15-45%,甚至更优选约为 20-40%。

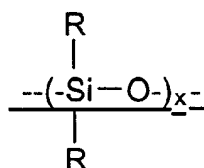
二有机基聚硅氧烷基的聚物流体

除了上述的有机硅氧烷树脂,本发明组合物还可以含有二有机基聚硅氧烷基的聚物流体,与有机硅氧烷树脂组合。所述用于本发明的二有机基聚硅氧烷基的聚物流体的 25℃粘度范围跨度大,约为 10-10,000,000 厘斯托克(cSt)。部分用于本发明的二有机基聚硅氧烷聚合物的 25℃粘度大于 10,000,000cSt,因此用厂商的特定针入度测试表征。该特征的例子是 GE 硅氧烷材料 SE30 和 SE63,针入度性能规格分别为 500-1500 和 250-600(mm 的十分之一)。

在本发明的二有机基聚硅氧烷基的聚物流体中是含有对应于式 $(R_2SiO)_n$ 的重复单元的二有机基聚硅氧烷聚合物,式中 R 是含有 1-6 个碳原子的单价基团,优选选自甲基,乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、叔丁基、戊基、己基、乙烯基、烯丙基、环己基、氨基烷基、苯基、氟烷基及其混合物。用于本发明的二有机基聚硅氧烷聚物流体可以在硅氧烷聚合物主链上含有一个或多个这些基团作为取代基。二有机基聚硅氧烷聚物流体可以以式 (R'_3Si) 的三有机基甲硅烷基为末端基团,其中 R' 是单价基团,选自含 1-6 个碳原子的基团、羟基、烷氧基及其混合物。二有机基聚硅氧烷聚物流体必须能够在溶液中与有机硅氧烷树脂和挥发性载体相容。“能相容”术语指二有机基聚硅氧烷聚物流体、有机硅氧烷树脂和挥发性载体以特定配制物所需的比例混合起来时,形成单相溶液。例如,当使用乙醇作为主要挥发性载体时,粘度较低的二有机基聚硅氧烷聚物流体(粘度约为 10-100cSt)尤其有用。对于粘度较大的聚合物,例如聚(二甲基硅氧烷),本文中称为 PDMS 或硅氧烷胶,

粘度至少为 100,000 cSt, 优选乙醇以外的挥发性载体。

硅氧烷胶对应于下式:



其中 R 是甲基。

- 5 例如所述这些二有机基聚硅氧烷流体是可买到的, 如 SE30 硅氧烷胶和 SF96 硅氧烷流体, 购自 General Electric Company。相似的材料也可以从 Dow Corning 和 Wacker Silicones 买到。

10 优选用于本发明的另一种二有机基硅氧烷基的聚物流体是调节所要求的成膜性能的二甲聚硅氧烷共聚醇(copolyol)。二甲聚硅氧烷共聚醇还能够表征为聚烯化氧改性的聚二甲基硅氧烷, 例如 Witch Corporation 制备, 商品名 Silwet。相似材料也能够从 Dow Corning、Wacker Silicones 和 Goldschmidt Chemical Corporation 和其他硅氧烷厂商买到。

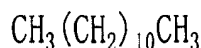
15 在本发明的优选实施方式中, 有机硅氧烷树脂与二有机基聚硅氧烷基的聚物流体之比优选约为 10:1-1:10, 更优选约为 2:1-8:1, 再优选约为 4:1-6:1。

挥发性载体

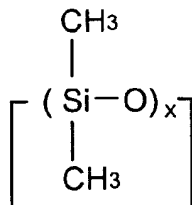
20 在本发明中, 上述有机硅氧烷树脂和二有机基聚硅氧烷基的聚物流体必须易于转移到口腔内的表面, 例如牙釉质上。为了达到释放, 必需将上述树脂或树脂/聚合物组合物加入载体内, 尤其是必须很快从口腔内的表面上挥发, 在施加表面上形成膜的挥发性载体。挥发性载体必须能溶解有机硅氧烷树脂和二有机基硅氧烷基的聚物流体(如果存在于组合物中)。

所述挥发性载体约占组合物的 10-90%, 优选 15-80%, 更优选 20-70%。本发明的挥发性载体选自烃油、挥发性硅氧烷、非烃溶剂及其混合物。

25 用于本发明的烃油包括沸点为 60-260°C 的烃油, 更优选链长约为 C₈-C₂₀ 的烃油, 最优选 C₈-C₂₀ 的异链烷烃。在这些异链烷烃中, 最优选的是选自异十二烷、异十六烷、异二十烷(isoeicosane)、2,2,4-三甲基戊烷、2,3-二甲基己烷及其混合物。最优选异十二烷, 例如以 Permethyl 99A 购自 Permethyl Corporation, 对应于式:



优选的挥发性硅氧烷流体包括有 3、4 和 5 元环结构的环甲基硅酮，对应于式：



- 5 其中 X 约为 3-6。这样的挥发性硅氧烷包括 244Fluid、344Fluid 和 245Fluid 和 345Fluid，都购自 Dow Corning Corporation。

用于本发明的非烃溶剂的总类型包括酯、酮、醇、氟烃和沸点为 60-200 °C 的氟烃醚。尤其有用的非烃溶剂或其混合物包括能够溶解树脂和/或二有机基聚硅氧烷基的聚合物的那些。这样的溶剂包括而不局限于乙醇、丙酮、丁
10 酮、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸戊酯、丁酸乙酯、甲基九氟异丁基醚、甲基九氟丁基醚及其混合物。这些非烃溶剂是容易买到的，例如乙酸乙酯和甲基乙基酮，两者都购自新泽西州 Phillisburg 的 J.T.Baker，和 HFE(甲基九氟异丁基醚与甲基九氟丁基醚的混合物)，3M 公司供货。

流变调节剂

- 15 所述组合物还含有流变调节剂，它抑制组分的沉淀和分离，或以有利于重新分散的方式控制沉淀，并可以控制流变性能。本文所述的合适的流变调节剂包括有机改性的粘土、二氧化硅、聚乙烯及其混合物。优选的亲有机物质的粘土含有季铵化合物(quaternium)-18 锂蒙脱石或十八烷二甲基苄铵锂蒙脱石，例如 Bentone27 和 38™，购自 Rheox；有机粘土分散体例如 Bentone ISD
20 gel™；或锂蒙脱石有机改性的粘土，例如 Bentone 34™，购自 Rheox；或 Claytone Series™，购自 Southern Clay Products；及其混合物。优选的二氧化硅可以是热解二氧化硅，例如 Aerosil™ 系列，购自 Degussa；或 Cab-o-sil™ 系列，购自 Cabot Corporation；二氧化硅凝胶例如 Sylodent™ 或 Sylox™ 系列，购自 W.R.Grace & Co.；或沉淀二氧化硅，例如 Zeothix 265，
25 购自 J.M.Huber Corporation。

流变调节剂在组合物中的含量优选约为组合物的 0.1-30%，更优选约为 0.5-10%，再优选约为 1-3%。

口腔护理物质

口腔护理物质优选含有活性成分，含量为直接使用时，可提高戴者所要求的益处，而不损害所施加的口腔的表面。施加这些活性成分的口腔内的状况的例子包括而不局限于牙齿外观和结构变化、增白、漂白污迹、脱除污迹、
5 脱除斑块、脱除酒石、预防和治疗龋洞、发炎和/或出血牙龈、粘膜伤口、病变、溃疡、口疮溃疡、感冒疮、牙齿凹洞和由上述状况引发的口腔臭味的消除和其他例如由微生物繁殖引起的病况。

合适的口腔护理物质包括通常认为用于口腔时安全并可以改善口腔总外观和/或口腔卫生的任何材料。除非特别指明，本发明组合物中口腔护理物质的
10 含量通常约为 0.01-50%，优选约为 0.1-20%，更优选约为 0.5-10%，再优选约为 1-7%，以组合物重量为基准。

本发明的口腔护理组合物或物质可以包含现有技术中已经揭示的许多活性成分。下面是可以用于本发明的口腔护理活性成分的非限制性例子。

1. 牙齿增白活性成分

15 本发明的口腔护理物质可以含有牙齿增白活性成分。适于增白的活性成分选自过氧化物、金属的亚氯酸盐、过硼酸盐、过碳酸盐、过氧酸、过硫酸盐及其组合物。合适的过氧化物包括过氧化氢、过氧化脲、过氧化钙、过氧化脲及其混合物。最优选过氧化脲。合适的金属亚氯酸盐包括亚氯酸钙、亚氯酸钡、亚氯酸镁、亚氯酸锂、亚氯酸钠和亚氯酸钾。另外的增白活性成分
20 可以是次氯酸盐和二氧化氯。优选的亚氯酸盐是亚氯酸钠。优选的过碳酸盐是过碳酸钠。优选的过硫酸盐是过硫酸氢钾制剂。

2. 抗酒石剂

已知用于牙齿护理产品的抗酒石剂包括磷酸盐。所述磷酸盐包括焦磷酸盐、多磷酸盐、多磷酸盐及其混合物。其中最常用于牙齿护理产品中的是焦
25 磷酸盐。焦磷酸盐和多磷酸盐离子从焦磷酸盐、多磷酸盐释放到牙齿上。用于本发明组合物中的焦磷酸盐包括二碱金属焦磷酸盐、四碱金属焦磷酸盐及其混合物。优选的品种是未水化和水化形式的焦磷酸二氢二钠($\text{Na}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$)、焦磷酸四钠($\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$)和焦磷酸四钾($\text{K}_4\text{P}_2\text{O}_7$)。虽然上述任何焦磷酸盐都可以使用，但是优选焦磷酸四钠。例如优选多磷酸钠和多磷酸三乙醇胺。

30 焦磷酸盐在 Kirk & Othmer, Encyclopedia of Chemical Technology, 第三版, 第 17 卷, Wiley-Interscience Publishers(1982)中有详细描述。

其他的抗结石剂包括焦磷酸盐或多磷酸盐, 1986 年 5 月 20 日授予 Parran & Sakkab 的美国专利№4590066 有描述; 聚丙烯酸酯和其他聚羧酸盐例如 1969 年 2 月 25 日授予 Shedlovsky 的美国专利№3429963 和 1981 年 12 月 8 日授予 Chang 的美国专利№4304766 和 1987 年 4 月 28 日授予 Benedict & Sunberg 5 的美国专利№4661341 所述; 聚环氧丁二酸酯例如 1989 年 7 月 11 日授予 Benedict, Bush & Sunberg 的美国专利№4846650 所述; 乙二胺四乙酸, 1937 年 2 月 15 日授权的英国专利№490384 所述; 次氨基三乙酸和相关化合物, 如 1972 年 7 月 18 日授予 Widder & Briner 的美国专利№3678154 所述; 多磷酸盐, 如 1973 年 6 月 5 日授予 Francis 的美国专利№3737533, 1976 年 10 月 26 10 日授予 Ploger, Schmidt-Dunker & Gloxhuber 的美国专利№3988443 所述, 如 1989 年 10 月 31 日授予 Degenhardt & Kozikowski 的美国专利№4877603 所述。抗结石磷酸盐包括焦磷酸钾和钠; 三多磷酸钠; 二磷酸盐, 例如乙烷-1-羟基-1,1-二磷酸盐、1-氮杂环庚烷-1,1-二磷酸盐和线型二磷酸烷基酯、线型羧酸和柠檬酸钠。

15 可以用来代替焦磷酸盐或与它组合的药剂包括这样的已知物质, 例如合成的阴离子聚合物包括聚丙烯酸酯和马来酸酐或酸与甲基乙烯基醚的共聚物(例如 Gantrez), 例如授予 Gaffar 等人的美国专利№4627977 有描述; 和例如多氨基丙烷磺酸(AMPS)、三水化柠檬酸锌、多磷酸盐(例如三多磷酸盐、六偏磷酸盐)、二磷酸盐(例如 EHDP、AHP)、多肽(例如聚天冬氨酸和聚谷氨酸) 20 及其混合物。

3. 氟离子源物质

众所周知, 氟离子源物质在口腔护理组合物中用作防龋剂。氟离子源物质存在于许多口腔护理组合物中尤其牙膏, 用于该目的。揭示这种牙膏的专利包括 1970 年 11 月 3 日授予 Pader 等人的美国专利№3538230; 1972 年 9 月 25 5 日授予 Pader 的美国专利№3689637; 1973 年 1 月 16 日授予 Colodney 等人的美国专利№3711604; 1975 年 10 月 7 日授予 Harrison 等人的美国专利№3911104; 1976 年 1 月 27 日授予 Roberts 等人的美国专利№3935306; 1977 年 8 月 9 日授予 Wason 的美国专利№4040858。

向牙釉质上施加氟离子有助于防止牙齿变坏。多种产生氟离子的物质都 30 能够在速溶组合物中用作可溶氟化物源物质。产生氟离子的合适物质的例子在 1970 年 10 月 20 日授予 Briner 等人的美国专利№3535421、1972 年 7 月 18

日授权的美国专利№3678154 中可以找到。用于本发明的优选氟离子源物质包括氟化钠、氟化钾和氟化铵。尤其优选氟化钠。速溶组合物与本发明释放体系一同使用时，与牙齿表面接触的组合物内优选形成约 50-10,000ppm、更优选约 100-3000ppm 氟离子。

5 4. 抗菌剂

抗菌剂也能够存在于本发明口腔护理组合物或物质中。这样的药剂可以包括而不局限于 5-氯-2-(2,4-二氯苯氧基)-苯酚，通常称为三氯生，在 1989 年第 11 次编辑的 The Merck Index 第 1529 页(登录号№9573)美国专利№3506720，和 1988 年 1 月 7 日公开的 Beecham Group PLC 的欧洲专利申请№0251591 中有描述；邻苯二甲酸及其盐，包括而不局限于 1991 年 2 月 19 日的美国专利№4994262 所述，优选邻苯二甲酸单钾镁、氯己定(Merck Index, №2090)、双胍啶(Merck Index, №222)、双辛氢啶(Merck Index, №4624)、血根碱(Merck Index, №8320)、氯化苯甲烃铵(Merck Index, №1066)、水杨酰苯胺(Merck Index, №8299)、溴化十二烷基二甲胺(Merck Index, №3411)、氯化十六烷基吡啶鎓(CPC)(Merck Index, №2024)、氯化十四烷基吡啶鎓(TPC)、氯化 N-十四烷基-4-乙基吡啶鎓(TDEPC)、癸双辛胺啶、地莫匹醇、辛哌乙醇和其他哌啶基衍生物；烟酸(nicotin)制剂、锌/锡(二价)离子剂；抗生素例如安灭菌、阿莫西林、四环素、强力霉素、米诺环素和灭滴灵和上述的相似物及其盐；香精油，包括百里酚、香叶醇、香芹酚、柠檬醛、扁柏油酚、桉叶醇、儿茶酚(尤其 4-烯丙基儿茶酚)及其混合物；水杨酸甲酯、过氧化氢、亚氯酸的金属盐和上述物质的混合物。

5. 消炎剂

本发明口腔护理物质或组合物中也可以有消炎剂。这样的消炎剂可以包括而不局限于非甾族消炎剂或 NSAIDs，例如酮洛酸、氟比洛芬、布洛芬、萘普生、吲哚美辛、阿司匹林、酮洛芬、吡罗昔康和甲氯芬那酸。1997 年 5 月 6 日授权的美国专利№5626838 的权利要求中使用 NSAIDs 例如酮洛酸。其中揭示了通过向口腔或口咽局部施加有效量 NSAID，来预防和或初步治疗和修复口腔或口咽的鳞状上皮细胞癌的方法。

6. 营养素

营养素可以改善口腔状况，能够包含于本发明的口腔护理物质或组合物中。营养素包括矿物质、维生素、口腔营养补充剂、肠内营养补充剂及其混

合物。

能够包含于本发明组合物内的矿物质包括钙、磷、氟化物、锌、锰、钾及其混合物。这些矿物质在这样的文献中有描述：Drug Facts and Comparisons(药物信息指南散页)，Wolters Kluer Company, St.Louis, Mo.

5 ©1997，第 10-17 页。

维生素可以与矿物质一同包含于组合物中，或分别使用。维生素包括维生素 C 和 D、维生素 B₁、维生素 B₂、泛酸钙、烟酸、叶酸、烟碱、维生素 B₆、维生素 B₁₂、对氨基-苯甲酸、维生素 P 及其混合物。这些维生素这样的文献中有描述：Drug Facts and Comparisons(药物信息指南散页)，Wolters Kluer

10 Company, St.Louis, Mo. ©1997，第 3-10 页。

口腔营养补充剂包括氨基酸、抗脂肪肝剂、鱼油及其混合物，Drug Facts and Comparisons(药物信息指南散页)，Wolters Kluer Company, St.Louis, Mo. ©1997，第 54-54e 页有描述。氨基酸包括而不局限于 L-色氨酸、L-赖氨酸、蛋氨酸、苏氨酸、左卡尼汀或 L-卡尼汀及其混合物。抗脂肪肝剂包括而不

15 局限于胆碱、肌醇、甜菜碱、亚油酸、亚麻酸及其混合物。鱼油含有大量 Omega-3(N-3)聚不饱和脂肪酸、二十碳五烯酸和二十二碳六烯酸。

肠内营养补充剂包括而不局限于蛋白质制品、葡萄糖聚合物、玉米油、红花油、中等链三甘油酯，Drug Facts and Comparisons(药物信息指南散页)，Wolters Kluer Company, St.Louis, Mo. ©1997，第 55-57 页有描述。

20 7. 口腔和咽喉制品

能够与本发明一同使用的其他物质包括通常已知的口腔和咽喉制品。这样的制品在 Drug Facts and Comparisons(药物信息指南散页)，Wolters Kluer Company, St.Louis, Mo. ©1997，第 520b-527 页有描述。这些制品包括而不

局限于抗真菌剂、抗生素和止痛剂。

25 8. 抗氧剂

通常认为抗氧剂可用于例如本发明的组合物中。抗氧剂在这样的文献中有描述，例如 Cadenas and Packer, The Handbook of Antioxidants, ©1996, Marcel Dekker Inc. 出版。可以用于本发明口腔护理物质或组合物中的抗氧剂包括而不局限于维生素 E、维生素 C、尿酸、类胡萝卜素、维生素 A、黄酮

30 类和多酚类、草药抗氧剂、抗黑变激素、氨基吡啶、硫辛酸及其混合物。

9. H-2 拮抗剂

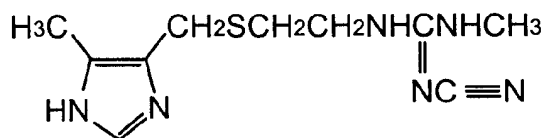
组胺-2 (H-2 或 H2) 受体拮抗剂化合物 (H-2 拮抗剂) 可以用于本发明口腔护理组合中。用于本发明中时, 选择性的 H-2 拮抗剂是阻滞 H-2 受体, 但是对阻滞组胺-1 (H-1 或 H1) 受体没有显著活性的化合物。选择性的 H-2 拮抗剂刺激各种器官的平滑肌收缩, 例如肠和支气管; 低浓度美吡拉敏-一种典型的抗组胺剂药物-能够抑制该作用。涉及这些美吡拉敏敏感性组胺应答的药理学受体被定义为 H-1 受体 (Ash, A. S. F. & H. O. Schild, 英国药理学及化学治疗学杂志, Vol. 27 (1966), p. 427)。组胺还刺激胃酸分泌 (Loew, E. R. & O. Chickering, Proc. Soc. Exp. Biol. Med., Vol. 48 (1914), p. 65), 加速心跳 (Trendelenburg, U., 药理学杂志, Vol. 130 (1960), p. 450), 抑制大鼠宫缩 (Dews, P. B. & J. D. P. Graham, 英国药理学及化学治疗学杂志, Vol. 1 (1946), p. 278); 美吡拉敏及其相关药物对这些作用没有拮抗作用。用于口腔护理组合或产品的 H-2 拮抗剂是那些阻抑参与非美吡拉敏敏感性的、非 H-1 (H-2) 组胺应答的受体, 但不抑制参与美吡拉敏敏感性组胺应答的受体。

选择性 H-2 拮抗剂是那些在临床前 H-2 拮抗剂功能筛选试验中被认定为 H-2 拮抗剂的化合物。选择性 H-2 拮抗剂被认定为是如下化合物: 在基于 H-2 受体功能的筛选模型中, 它们竞争性或非竞争性地抑制组胺介导的作用; 但在基于 H-1 受体功能的筛选模型中则没有显著的组胺拮抗活性。具体地说, 这包括如下化合物: 如 Black J. W., W. A. M. Duncan, C. J. Durant, C. R. Ganellin & E. M. Parsons 在“组胺 H2-受体的定义和拮抗性”中所述, 豚鼠右心房自发搏动体外试验和大鼠胃酸分泌体内试验证明为 H-2 拮抗剂, 而豚鼠回肠收缩体外试验或大鼠胃肌收缩体内试验则证明与 H-2 拮抗活性相比没有明显的 H-1 拮抗活性。较好的是, 选择性 H-2 拮抗剂即使在上述 H-1 试验中在合理的剂量水平也没有明显的 H-1 拮抗活性。通常, 合理的剂量水平是在上述 H-2 试验中实现 90% 组胺抑制所需的最低水平, 实现 99% 组胺抑制的则更好。

符合上述标准的选择性 H-2 拮抗剂包括以下文献所述的化合物: Singer 等已转让给 Procter & Gamble 的 1994 年 1 月 15 日和 1994 年 11 月 15 日的美国专利 5, 294, 433 和 5, 364, 616, 其中的 H-2 拮抗剂选自: 西咪替丁, 依汀替丁, 雷尼替丁, ICIA-5156, 硫替丁, ORF-17578, 鲁匹替丁, 多奈替丁, 法莫替丁, 罗沙替丁, 哌法替丁, 兰替丁, BL-6548, BMY-25271, 唑替丁, 尼扎替丁, 咪芬替丁, BMY-25368 (SKF-94482), BL-6341A, ICI-162846, 雷

索替丁, Wy-45727, SR-58042, BMY-25405, 洛克替丁, DA-4634, 比芬替丁, 舒福替丁, 乙溴替丁, HE-30-256, D-16637, FRG-8813, FRG-8701, 英普咪定, L-643728 和 HB-408。优选西咪替丁(SKF-92334), N-氰基-N'-甲基-N''-(2-(((5-甲基-1H-咪唑-4-基)甲基)硫)乙基)胍:

5



有关西咪替丁还可参见 Merck Index, 第 11 版(1989), p. 354(目录号:1179) 和 Physician's Desk reference, 第 46 版(1992), p. 2228。相关的优选 H-2 拮抗剂包括布立马胺和甲硫米特。

10. 镇痛活性成分

- 10 本发明的口腔护理组合物或产品中还可以包含镇痛剂和脱敏剂, 这包括但不限于氯化锶, 硝酸钾, 天然草药, 例如五倍子, 细辛属, 草澄茄苦素, 高良姜, 黄芩属, 两面针(Liangmianzhen), 白芷(Baizhi)等。

11. 抗病毒活性成分

- 15 本发明可用的抗病毒活性成分包括各种常用与治疗病毒感染的活性成分。此类活性成分可参见 Drug Facts and Comparisons(活页药物资料服务), Wolters Kluwer Company, St. Louis, Mo., ©1997, pp. 402(a)-407(z) (全文结合为参考)。具体的例子包括 Satyanarayana Majeti 的 1998 年 5 月 5 日的美国专利 5,747,070 中所述的抗病毒活性成分。该专利使用亚锡盐来抑制病毒。有关亚锡盐及其他抗病毒活性成分的详细描述可参见 Kirk & Othmer,
- 20 化学技术大全, 第 3 版, Vol.23, Wiley-Interscience Publishers(1982), pp. 42-71。可用于本发明的亚锡盐包括有机的羧酸亚锡盐和无机的卤化亚锡。虽然可以使用氟化亚锡, 但一般仅与其他卤化亚锡或一种或多种羧酸亚锡或其他治疗药联用。

12. 其他成分

- 25 本发明组合物中除以上所述物质外, 还可在口腔护理产品中加入其他需要的组分。其他组分包括但不限于香味剂, 甜味剂, 木糖醇, 乳化剂, 色素, 表面活性剂和乙二胺四乙酸等螯合剂。合适的香味剂包括但不限于薄荷油, 黄樟油, 丁香籽油, 薄荷, 盖醇, 茴香醚, 麝香草酚, 水杨酸甲酯, 桉叶油素, 肉桂, 乙酸 1-萜酯, 一串红, 丁子香脑, 欧芹油, 噁烷酮(oxanone), 冬

青油， α -紫罗兰酮，荷兰薄荷油，干牛至草，柠檬，橙子，丙烯基乙基愈创木酚(guaethol)，肉桂，以及它们的混合物。

也可以在本发明组合物中加入色素，以便更准确地指示组合物实际加到的位置，使得使用者更充分更均匀地使用所述组合物。然而，此类色素并非

5 用于遮蔽牙齿表面可能存在的颜色。

上述附加组分也可以替代前述化合物使用。

实施例

下面实施例进一步描述和说明本发明范围内的实施方式。实施例仅用于
10 说明，不能理解为限制本发明，因为不脱离本发明的精神和范围，可以进行多种变化。

表 1 疏水性口腔护理组合物

组分	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4	实施例 5	实施例 6
有机硅氧烷树脂 ¹	25	25	24.6	25	25	25
硅氧烷胶 ²	12.5	4.2	3.5	2.5	1.8	--
口腔护理物质 ³	17	17	17	17	17	17
挥发性载体 ⁴	44.5	52.8	53.9	54.5	55.2	57.0
有机皂土粘土 ⁵	1	1	1	1	1	1
总计	100	100	100	100	100	100

1. 例如 MQ 树脂，以 1170-002 购自 General Electric;
2. 例如二甲聚硅氧烷胶，以 SE30 或 SE63 购自 General Electric;
- 15 3. 例如过碳酸钠干粉;
4. 例如异十二烷，或 50/50 乙酸乙酯与丁酮的混合物，或乙酸乙酯、乙酸丙酯和 HFE 的混合物。混合溶剂体系中各种溶剂的百分率能够分别在 0-100% 之间变化。
5. 有机皂土 27，购自 Rheox。

20

表 2 疏水性口腔护理组合物

组分	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4
有机硅氧烷树脂 ¹	33.43	33.43	35.14	33.43
硅氧烷胶 ²	5.57	5.57	5.86	5.57
口腔护理物质 ³	19.00	12.00	19.00	19.00
乙酸乙酯	8.00	8.50	8.00	8.00
有机皂土凝胶 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-乙酸丙酯	2.00	2.00	—	2.00
2-丁酮	—	—	19.00	—
氧相二氧化硅 200 ⁷ (SiO ₂)	—	—	1.00	—
香料	—	1.50	—	1.50
总计	100	100	100	100

1. 例如 MQ 树脂，以 1170-002 购自 General Electric;
2. 例如二甲聚硅氧烷胶，以 SE30 购自 General Electric;
3. 例如过碳酸钠干粉;
54. 有机皂土凝胶 IPM，购自 Rheox;
5. DC-200/350 是：二甲基聚硅氧烷，CAS#9016-00-6，购自 Dow Corning;
6. HFE-7100 是甲基九氟异丁基醚、CAS#163702-08-7 和甲基九氟丁基醚、3M 公司制备的 CAS#163702-07-6 的混合物;
7. 氧相二氧化硅 200 是二氧化硅(化学制备)，CAS#112945-52-5，购自
- 10 Degussa AG。

制备方法

表 1 和 2 所示的组合物是非水性的。口腔护理物质分散或溶解于一种溶液，该溶液含有有机硅氧烷树脂、二有机基聚硅氧烷聚物流体、挥发性载体和流变调节剂。

15

表 1 和 2 所示的疏水性组合物合适地以下述方式制成。将 300g 有机硅氧

- 烷树脂溶液(例如 43.7%MQ 树脂的异十二烷溶液,或在 50/50 乙酸乙酯与丁酮的混合溶剂或在乙酸乙酯、乙酸丙酯和 HFE 混合溶剂中的溶液)与 147.30g 二有机基聚硅氧烷聚合物流体溶液(例如 50%SE30 硅氧烷胶在异十二烷中的溶液,或在 50/50 乙酸乙酯与丁酮的混合溶剂或在乙酸乙酯、乙酸丙酯和 HFE 混合溶剂中的溶液)混合。接着将口腔护理物质分散入树脂/胶混合物中。该方法可以在没有硅氧烷胶的情形下实施。
- 5

本文中所述的所有口腔护理物质都能够用上述方法配制。

表 3 增白组合物

组分	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4	实施例 5	实施例 6
乙酸乙酯	18.00	14.85	22.25	20.88	18.96	18.00
2-丁酮	18.00	13.00	13.10	20.88	10.00	18.00
异十二烷	—	10.00	—	—	11.54	—
柠檬油精	—	4.35	—	—	5.00	—
MQ 树脂	28.00	32.50	26.50	27.33	36.00	31.50
SE30 硅氧烷胶	7.00	—	8.80	13.67	—	—
硅氧烷 Visc-100M	—	—	—	—	—	3.50
硅氧烷流体 10 cStk	—	6.50	—	—	9.00	—
有机皂土凝胶 ISD	10.00	—	6.40	9.95	—	10.00
粘土石(Claytone) HY	—	2.45	—	—	3.00	—
Cab-o-Sil	—	—	1.50	—	—	—
过碳酸钠	19.00	—	19.00	7.00	—	19.00
过氧化脲	—	15.00	—	—	5.00	—
氯化氧铋	—	1.15	—	—	—	—
二氧化钛	—	—	1.00	—	1.50	—
香料油	—	—	0.15	—	—	—
氟化钠	—	—	1.00	—	—	—
糖精钠	—	0.20	0.30	0.30	—	—
总计	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00

表 4 口腔护理组合物

组分	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4	实施例 5
乙酸乙酯	24.50	27.75	22.00	19.96	21.10
2-丁酮	24.50	16.30	22.00	10.00	21.10
异十二烷	-	-	-	11.54	-
柠檬油精	-	-	-	5.00	-
MQ 树脂	30.40	33.00	28.80	36.00	32.84
SE30 硅氧烷胶	7.60	11.00	14.40	-	8.21
硅氧烷流体 10 cStk	-	-	-	9.00	-
有机皂土凝胶 ISD	10.00	8.00	10.50	-	11.75
粘土石 (Claytone) HY	-	-	-	3.00	-
Cab-o-Sil	-	1.50	-	-	-
氯化氧铋	-	1.00	-	-	-
二氧化钛	-	-	-	2.00	-
香料油	-	0.15	-	-	-
硝酸钾	-	-	-	-	5.00
亚氯酸钠	3.00	-	-	-	-
三多磷酸盐	-	-	-	2.50	-
氟化钠	-	1.00	-	1.00	-
葡萄糖酸氯己定	-	-	2.00	-	-
糖精钠	-	0.30	0.30	-	-
总计	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00

表 5 口腔护理组合物

组分	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4	实施例 5	实施例 6
乙酸乙酯	26.00	22.00	35.00	28.00	25.77	23.00
2-丁酮	25.95	17.00	9.00	14.50	25.50	23.45
异十二烷	-	10.00	-	-	5.00	-
柠檬油精	-	4.00	-	-	-	-
MQ 树脂	28.00	32.50	33.00	35.00	27.00	28.00
SE30 硅氧烷胶	7.00	-	11.00	5.00	3.00	7.00
硅氧烷流体 10 cStk	-	6.50	-	-	-	-
有机皂土凝胶 ISD	10.00	-	8.00	10.00	10.00	-
粘土石 (Claytone) HY	-	2.00	-	-	-	7.00
Cab-o-Sil M7D	-	-	1.50	-	-	-
氯化氧铋	-	5.00	-	-	-	10.00
二氧化钛	3.00	-	1.00	5.00	2.00	-
香料油	-	-	0.10	-	0.15	0.15
聚甲基硅倍半氧烷 (polymethylsilsesquioxane)	-	-	1.00	-	-	-
聚甲基丙烯酸甲酯	3.00	1.00	-	-	0.50	-
尼龙 12	-	-	-	2.00	-	1.00
二氧化硅	-	-	-	-	0.50	-
FD & C Yellow #5 Al Lake	0.05	-	0.10	-	0.05	0.10
氧化铁红	-	-	-	0.50	0.03	-
糖精钠	-	-	0.30	-	0.50	0.30
总计	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00

表 6: 乙醇基组合物

组分	实施例 1	实施例 2	实施例 3	实施例 4	实施例 5	实施例 6
乙醇	20.90	35.80	41.70	25.89	23.10	23.55
乙酸乙酯	-	-	-	-	4.95	-
丁酸乙酯	10.30	-	-	12.74	11.75	10.9
乙酸异戊酯	-	-	-	-	-	2.65
异十二烷	-	13.00	-	-	-	-
MQ 树脂	35.10	32.85	42.75	47.00	42.00	41.80
硅氧烷 Visc-100M	-	-	-	-	7.15	-
硅氧烷流体 100 cSt	7.80	-	-	9.65	-	8.55
硅氧烷流体 10 cStk	3.90	-	11.40	-	4.00	-
Silwet L-7500	-	-	-	-	-	6.58
有机皂土 27	1.50	-	2.00	1.85	1.35	1.97
粘土石 (Claytone)APA	-	2.00	-	-	-	-
Cab-o-Sil	-	-	-	-	0.45	-
过碳酸钠	19.00	-	-	-	-	-
过氧化脲	-	15.00	-	-	-	-
硝酸钾	-	-	-	-	5.00	-
三多磷酸盐	-	-	-	-	-	2.50
二葡萄糖酸氯己定	-	-	-	2.57	-	-
二氧化钛	1.50	-	2.00	-	-	1.50
香料油	-	-	0.05	-	-	-
氟化钠	-	-	0.10	-	0.25	-
糖精钠	-	0.20	-	0.30	-	-
总计	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00	100.00

制备方法

表 3-6 所示组合物合适地以下述方式制备。将溶剂加入适于使溶剂损失最小的容器内。加入流变调节剂，并混合，直至分散良好。加入硅氧烷树脂并混合，直至完全溶解。加入硅氧烷胶和/或硅氧烷流体，并混合，直至完全溶解。此时，加入任何盐，例如过碳酸钠和/或其他口腔护理活性成分、美容成分例如遮光剂、甜味剂、染料和香料。继续混合，直至均匀。另外，可以采用高剪切混合，以促进混合。装入不透气容器内。

另外，进行最终的混合步骤之前，可以制备硅氧烷树脂和/或硅氧烷胶的预混合物，以促进硅氧烷溶解和易于制备。根据所配制的组合物，成分的加入顺序可以变化，例如可以将流变调节剂的加入转移到较后面的步骤中进行，这样可保持较低粘度，直至混合步骤的较后阶段。

上述表中实施例所揭示和表示的实施方式有许多优点。例如，它们有更好的耐久性，随后可以更好地将口腔护理物质释放到例如牙齿表面上。它们也提供方便、非连续和容易使用的产品形式，这样的产品形式能够产生与常规产品形式很大不同的好效果。另外，在水基膜体系中不稳定的口腔护理活性成分也能够加入到本文所述组合物中，不会损害其稳定性。

使用方法

实施本发明时，为了获得所要求的效果，使用者仅需在所要求的牙齿表面上施加本文所述的含有必需口腔护理物质(一种或多种)的组合物，所述物质例如增白剂、口气清新剂、防龋剂、释痛剂、卫生胶、酒石控制剂等。组合物也可以施加到口腔内其他表面上，例如牙龈和粘膜组织或任何其他口腔表面上。该组合物可以用牙刷、笔状施加器、母鹿脚施加器等，或甚至用手指施加。

施加所述组合物的表面上会很快形成含有口腔护理物质的膜。随着时间延长，当口腔护理物质从膜上释放出来时，口腔护理物质就得以长期释放。所要求的时间期限过去后，通过擦、刷或漱洗口腔内的表面，或在通常刷牙过程中或其他口腔护理过程中，可以容易地脱除任何残留的口腔护理物质。不希望受到理论的束缚，据认为膜可保持约 2-8 小时，与口腔护理物质的活性无关。优选的是，组合施加到口腔内时，几乎看不出来。

施加本发明组合物之前，不需清理口腔。例如，施加组合物之前，使用

者可以选择或可以不选择刷牙或漱口。口腔内的表面也不需干燥或用唾液或水过分湿润。但是，据认为施加组合物时，如果牙齿是干燥的，那么会提高与牙釉质表面的粘合力。

应当明白，本发明不仅涉及向人口腔释放口腔护理物质的方法，而且涉及向动物口腔释放口腔护理物质的方法，例如家养宠物或其他家养动物或捕获的动物。

要明白，本文所述的实施例和实施方式仅用于说明，本行业内的普通技术人员根据它们作出的各种改变和变化都在本发明的范围内。