

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 201891098 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2018.10.31

(22) Дата подачи заявки
2016.06.07

(51) Int. Cl. *A61Q 11/00* (2006.01)
A61K 8/25 (2006.01)
A61K 8/29 (2006.01)
A61K 8/73 (2006.01)

(54) КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ УХОДА ЗА ПОЛОСТЬЮ РТА

(31) PCT/CN2015/094184; 15198434.1

(32) 2015.11.10; 2015.12.08

(33) CN; EP

(86) PCT/EP2016/062847

(87) WO 2017/080687 2017.05.18

(71) Заявитель:
ЮНИЛЕВЕР Н.В. (NL)

(72) Изобретатель:
Ли Яцзюань, Тан Сюэчжи, Ван
Цзиньфан (CN)

(74) Представитель:
Воробьев В.А., Фелицына С.Б. (RU)

(57) Описана композиция для ухода за полостью рта, содержащая от 5 до 80 мас.% силиката кальция, от 0,4 до 2 мас.% ксантановой камеди и/или ее производных, вещество, оказывающее благоприятное воздействие, и физиологически приемлемый носитель, где вещество, оказывающее благоприятное воздействие, выбирают из окрашивающих веществ, веществ для биоминерализации, противобактериальных веществ или их смесей, и где вещества для биоминерализации представляют собой аморфный фосфат кальция, α -трикальцийфосфат, β -трикальцийфосфат, карбонат кальция, обедненный по кальцию гидроксиапатит ($\text{Ca}_9(\text{HPO}_4)(\text{PO}_4)_5\text{OH}$), дикальцийфосфат (CaHPO_4), дигидрат дикальцийфосфата ($\text{CaHPO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$), гидроксиапатит ($\text{Ca}_{10}(\text{PO}_4)_6(\text{OH})_2$), моногидрат монокальцийфосфата ($\text{Ca}(\text{H}_2\text{PO}_4)_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$), октакальцийфосфат ($\text{Ca}_8\text{H}_2(\text{PO}_4)_6 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$) и тетракальцийфосфат ($\text{Ca}_4(\text{PO}_4)_2\text{O}$) или их смеси.

A1

201891098

201891098

A1

КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ УХОДА ЗА ПОЛОСТЬЮ РТА

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к композициям для ухода за полостью рта, таким как зубные пасты, жевательные резинки, ополаскиватели для полости рта и тому подобное. В частности, настоящее изобретение относится к композиции для ухода за полостью рта, содержащей силикат кальция, дисперсные вещества, оказывающие благоприятное воздействие, и вещество, способствующее осаждению. Изобретение также относится к применению такой композиции для оказания благоприятного воздействия на зубы физического лица.

Уровень техники

Множество продуктов, которые потребляются людьми, оказывает негативное воздействие на их зубы и полость рта. Кислое питье и сладости, например, могут привести к эрозии зубов в результате агрессивного воздействия на эмаль, которая представляет собой внешнее покрытие, защищающее зубы. Помимо этого, продукты на табачной основе, а также напитки, подобные кофе и чаю, могут оставлять пятна или уменьшать белизну зубов индивидуума. Данные вещества, вызывающие появление пятен и изменение окраски, зачастую способны проникать в слой эмали. Данная проблема развивается постепенно в течение многих лет, но приводит к ощутимому изменению окраски эмали зубов индивидуума.

У потребителей всегда было сильное желание иметь здоровые и белые зубы. В композиции для ухода за полостью рта обычно включают вещества, оказывающие благоприятное воздействие, такие как окрашивающие вещества, вещества для биоминерализации и противобактериальные вещества, для доставки к зубам в целях оказания благоприятного воздействия, такого как отбеливание, реминерализация и лучшая гигиена полости рта. Поэтому желательно улучшить эффективность доставки веществ, оказывающих благоприятное воздействие, в целях доведения до максимума эффективности таких веществ, оказывающих благоприятное воздействие.

Однако, обычно добиться высокой степени доставки веществ, оказывающих благоприятное воздействие, из композиций для ухода за полостью рта затруднительно. Данные вещества, оказывающие благоприятное воздействие, не способны сильно связываться с поверхностью зубов, что приводит к легкому их смыванию во время проведения ежедневной процедуры по гигиене полости рта, такой как чистка зубов.

Авторы настоящего изобретения теперь осознали наличие потребности в получении композиции для ухода за полостью рта, которая способна улучшить

эффективность доставки веществ, оказывающих благоприятное воздействие. Как это неожиданно было установлено, осаждение силиката кальция и/или веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхностях зубов может быть усилено с использованием силиката кальция в комбинации с веществами, способствующими осаждению, такими как ксантановая камедь и/или ее производные.

Дополнительная информация

В публикации WO 2008/068149 A (Unilever) раскрывается продукт для ухода за полостью рта, содержащий первую композицию, содержащую нерастворимую кальциевую соль, которая не является солью на основе фосфата кальция, вторую независимую композицию, содержащую источник фосфат-ионов, и средство для доставки каждой из композиций к поверхности зубов. Предпочтительная нерастворимая кальциевая соль представляет собой силикат кальция.

В публикации WO 2012/031785 A (Unilever) раскрываются активные вещества на основе композитных частиц, подходящие для использования в композициях для ухода за полостью рта. Активные вещества на основе композитных частиц имеют ядро и покрытие, при этом покрытие взаимодействует с фосфат-ионами с образованием продуктов реакции между кальцием и фосфатом, которые подходят для связывания с зубной эмалью и/или дентином с целью улучшения характеристик зубов.

В публикации WO 2012/031786 A (Unilever) раскрываются композиции для ухода за полостью рта, содержащие активные вещества на основе композитных частиц, описанные в публикации WO 2012/031785 A (Unilever).

Ни в одном из представленных выше источников дополнительной информации не описывается композиция для ухода за полостью рта, содержащая силикат кальция и вещество, способствующее осаждению, такое как ксантановая камедь и/или ее производные, и, в частности, то, что такая композиция приводит к усилению осаждения силиката кальция и/или веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхностях зубов.

Испытания и определения

Средство для чистки зубов

Термин «средство для чистки зубов» для целей настоящего изобретения обозначает пасту, порошок, жидкость, жевательную резинку или другой продукт для чистки зубов или других поверхностей в полости рта.

Зубная паста

Термин «зубная паста» для целей настоящего изобретения обозначает пастообразное или гелеобразное средство для чистки зубов, предназначенное для

использования совместно с зубной щеткой. В особенности предпочтительными являются зубные пасты, подходящие для использования при чистке зубов щеткой в течение приблизительно двух минут.

Ополаскиватель для полости рта

Термин «ополаскиватель для полости рта» для целей настоящего изобретения обозначает жидкое средство для чистки зубов, предназначенное для использования для ополаскивания полости рта. В особенности предпочтительными являются ополаскиватели для полости рта, подходящие для использования для споласкивания полости рта путем полоскания рта и/или полоскания горла в течение приблизительно половины минуты перед сплевыванием.

Размер частиц

Термин «размер частиц» для целей настоящего изобретения обозначает размер частиц D50. Размер частиц D50 для дисперсного материала представляет собой диаметр в качестве размера частиц, при котором 50% мас. частиц являются более крупными по диаметру, а 50% мас. являются более мелкими по диаметру. Для целей настоящего изобретения размеры частиц и распределение измеряют с использованием приборов Malvern Mastersizer 2000 и Malvern ZetaSizer Nano series.

Композитная частица

Термин «композитная частица» для целей настоящего изобретения обозначает частицу, содержащую ядро из первого компонента и покрытие из второго компонента, где ядро и покрытие образованы из различных материалов.

Вещество, способствующее осаждению

Термин «вещество, способствующее осаждению» для целей настоящего изобретения обозначает материал, который способствует осаждению активных веществ, таких как силикат кальция и/или вещества, оказывающие благоприятное воздействие, из непрерывной фазы композиции на поверхность зубов во время использования композиции.

Показатель преломления

Показатель преломления приводится при температуре 25°C и длине волны 589 нм.

pH

Значение pH приводится при атмосферном давлении и температуре 25°C. Под отсылкой к значению pH композиции для ухода за полостью рта подразумевается значение pH, измеренное при равномерном диспергировании и/или растворении 5 массовых частей композиции в 20 массовых частях чистой воды при 25°C. В частности, значение pH может быть измерено в результате смешивания вручную 5 г композиции для

ухода за полостью рта с 20 мл воды в течение 30 секунд и непосредственно после этого проведения испытания на значение pH при использовании индикатора или pH-метра.

Растворимость

Термины «растворимый» и «нерастворимый» в соответствии с использованием в настоящем документе относятся к растворимости источника (например, подобного кальциевым солям) в воде при 25°C и атмосферном давлении. Термин «растворимый» обозначает источник, который растворяется в воде с образованием раствора, имеющего концентрацию, составляющую по меньшей мере 0,1 моль в расчете на один литр. Термин «нерастворимый» обозначает источник, который растворяется в воде с образованием раствора, имеющего концентрацию, составляющую менее 0,001 моль в расчете на один литр. Поэтому термин «слаборастворимый» определяется как обозначение источника, который растворяется в воде с образованием раствора, имеющего концентрацию в диапазоне от более, чем 0,001 моль в расчете на один литр до менее 0,1 моль в расчете на один литр.

Гидратационная вода

Термин «гидратационная вода» для целей настоящего изобретения обозначает воду, химически объединенную с веществом таким образом, когда она может быть удалена путем нагрева по существу без изменения химического состава вещества. В частности, воду, которая могла бы быть удалена только при нагревании выше 200°C. Потерю воды измеряют с использованием термогравиметрического анализа (ТГА), использующего прибор Netzsch TG. Анализ ТГА проводят в атмосфере N₂ при скорости нагрева 10 градусов/мин в диапазоне от 30 до 900°C.

По существу свободный

Термин «по существу свободный» для целей настоящего изобретения обозначает уровень содержания менее 1,5%, а предпочтительно менее 1,0% и более предпочтительно менее 0,75%, а еще более предпочтительно менее 0,5% и даже более предпочтительно менее 0,1%, а наиболее предпочтительно находящийся в диапазоне от 0,0 до 0,01% мас. в расчете на совокупную массу композиции для ухода за полостью рта, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Двухфазный

Термин «двухфазный» для целей настоящего изобретения обозначает композицию, содержащую две независимые фазы, которые являются физически раздельными.

Вязкость

Вязкость зубной пасты представляет собой величину, измеренную при комнатной температуре (25°C) с использованием вискозиметра Брукфильда, шпинделя № 4 и при

скорости 5 об./мин. Значения приводятся в сантипуазах (сПз = мПа.сек), если не будет указано иное.

Реминерализация

Термин «реминерализация» для целей настоящего изобретения обозначает образование *in situ* (то есть, в полости рта) фосфата кальция на зубах (включая слои на зубах в диапазоне от 10 нм до 20 микронов, предпочтительно от 75 нм до 10 микронов и наиболее предпочтительно от 150 нм до 5 микронов в толщину, включая все охваченные здесь поддиапазоны) для уменьшения вероятности развития чувствительности зубов, кариеса зубов, для регенерирования эмали и/или улучшения внешнего вида зубов в результате отбеливания вследствие образования такого нового фосфата кальция.

Разное

За исключением примеров или случаев, когда явно указано иное, все числа в данном описании изобретения, указывающие на количества материала или условия проведения реакции, физические свойства материалов и/или применение, необязательно могут пониматься как модифицированные словом «приблизительно».

Все количества представлены в расчете на массу конечной композиции для ухода за полостью рта, если не будет указано иное.

Следует понимать, что при указании каких-либо диапазонов значений любой верхний предел может быть скомбинирован с любым нижним пределом.

Во избежание сомнений слово «содержащий» подразумевает слово «включающий», но не обязательно «состоящий из» или «образованный из». Иными словами, указанные стадии или опции необязательно должны быть исчерпывающими.

Раскрытие изобретения, которое представлено в настоящем документе, должно рассматриваться как охватывающее все варианты осуществления, которые можно обнаружить в пунктах формулы изобретения, как множественно зависящие друг от друга вне зависимости от того, что пункты формулы изобретения могут быть сформулированы и в отсутствие множественной зависимости или избыточности.

В случае раскрытия какого-либо признака в отношении конкретного аспекта изобретения (например, композиции по изобретению) такое раскрытие также должно рассматриваться и как относящееся к любому другому аспекту изобретения (например, к способу изобретения) с учетом необходимых изменений.

Сущность изобретения

В первом аспекте настоящее изобретение направлено на композицию для ухода за полостью рта, содержащую:

- а) от 5 до 80% мас. силиката кальция;

- b) от 0,4% до 2% мас. ксантановой камеди и/или ее производных;
- c) вещество, оказывающее благоприятное воздействие; и
- d) физиологически приемлемый носитель;

где вещество, оказывающее благоприятное воздействие, выбирают из окрашивающих веществ, веществ для биоминерализации, противобактериальных веществ или их смесей, и где вещества для биоминерализации представляют собой аморфный фосфат кальция, α -трикальцийфосфат, β -трикальцийфосфат, карбонат кальция, обедненный по кальцию гидроксиапатит ($\text{Ca}_9(\text{HPO}_4)(\text{PO}_4)_5\text{OH}$), дикальцийфосфат (CaHPO_4), дигидрат дикальцийфосфата ($\text{CaHPO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$), гидроксиапатит ($\text{Ca}_{10}(\text{PO}_4)_6(\text{OH})_2$), моногидрат монокальцийфосфата ($\text{Ca}(\text{H}_2\text{PO}_4)_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$), октакальцийфосфат ($\text{Ca}_8\text{H}_2(\text{PO}_4)_6 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$) и тетракальцийфосфат ($\text{Ca}_4(\text{PO}_4)_2\text{O}$) или их смеси.

Во втором аспекте настоящее изобретение направлено на упакованный продукт для ухода за полостью рта, содержащий композицию для ухода за полостью рта по первому аспекту данного изобретения.

В третьем аспекте настоящее изобретение направлено на способ оказания благоприятного воздействия на зубы индивидуума, включающий стадию нанесения композиции для ухода за полостью рта по любому варианту осуществления первого аспекта на по меньшей мере одну поверхность зубов индивидуума.

В четвертом аспекте настоящее изобретение направлено на применение ксантановой камеди и/или ее производных в композиции для ухода за полостью рта по любому варианту осуществления первого аспекта для улучшения осаждения силиката кальция и/или веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхностях зубов.

Все другие аспекты настоящего изобретения будут более наглядны после ознакомления со следующим далее подробным описанием изобретения и примеров.

Подробное описание изобретения

Как теперь было неожиданно обнаружено, композиция для ухода за полостью рта, содержащая силикат кальция, вещество, способствующее осаждению, такое как ксантановая камедь и/или ее производные, может улучшить эффективность доставки веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхности зубов, что оказывает улучшенное благоприятное воздействие на зубы. Термин «эффективность доставки» в соответствии с использованием в настоящем документе обозначает способность к доставке и осаждению веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхности зубов физического лица.

Силикат кальция

В одном предпочтительном варианте осуществления использующийся силикат

кальция представляет собой соединение CaSiO_3 , которое характеризуется низкой растворимостью в воде и доступно на коммерческих условиях под наименованием Sorbosil CA40 в компании PQ Corporation. В еще одном предпочтительном варианте осуществления силикат кальция является нерастворимым, присутствуя в виде композитного материала на основе оксида кальция-диоксида кремния (CaO-SiO_2), что описывается, например, в международной патентной заявке, опубликованной как WO 2008/01517 (Unilever), которая во всей своей полноте включается в настоящий документ посредством ссылки. Для композитного материала на основе силиката кальция соотношение между атомами кальция и кремния (Ca:Si) может находиться в диапазоне от 1:30 до 3:1. Соотношение Ca:Si предпочтительно находится в диапазоне от 1:20 до 2:1, а более предпочтительно от 1:10 до 1:1 и наиболее предпочтительно от приблизительно 1:7 до 1:1,5. Силикат кальция может включать монокальцийсиликат, дикальцийсиликат или трикальцийсиликат. Силикат кальция может находиться в кристаллическом или аморфном состоянии или даже в мезопористом состоянии.

В дополнение к оксиду кальция и диоксиду кремния частицы, содержащие силикат кальция, который не является гидратированным, могут содержать и другие компоненты, такие как катионы металлов, анионы (такие как фосфатные) и тому подобное. Однако предпочтается, чтобы частицы содержали оксид кальция, диоксид кремния в количестве, составляющем по меньшей мере 70% от массы частиц, более предпочтительно по меньшей мере 80%, еще более предпочтительно по меньшей мере 90%, а даже более предпочтительно по меньшей мере 95%. Наиболее предпочтительно частицы состоят из (или по меньшей мере по существу состоят из) оксида кальция, диоксида кремния.

В одном особенно предпочтительном варианте осуществления силикат кальция представляет собой гидрат силиката кальция. Гидрат силиката кальция, предназначенный для использования в настоящем изобретении, содержит по меньшей мере оксид кальция (CaO), диоксид кремния (SiO_2) и воду. По сравнению с обычным силикатом кальция, который не является гидратированным, гидрат силиката кальция содержит гидратационную воду в количестве, составляющем по меньшей мере 5% от массы гидрата силиката кальция, предпочтительно по меньшей мере 10%, более предпочтительно по меньшей мере 15%, даже более предпочтительно по меньшей мере 20%, а наиболее предпочтительно по меньшей мере 25%. Уровень содержания воды обычно составляет не более, чем 50% от массы гидрата силиката кальция, более предпочтительно не более, чем 40%, даже более предпочтительно не более, чем 35%, а наиболее предпочтительно не более, чем 30%.

Гидрат силиката кальция предпочтительно содержит по меньшей мере 20%

диоксида кремния от массы гидрата силиката кальция, более предпочтительно по меньшей мере 30%, еще более предпочтительно по меньшей мере 40%, а наиболее предпочтительно по меньшей мере 55%. Уровень содержания диоксида кремния предпочтительно составляет не более, чем 70% от массы гидрата силиката кальция, более предпочтительно не более, чем 65%, а наиболее предпочтительно не более, чем 60%.

Для обеспечения наличия количества кальция, необходимого для реминерализации, гидрат силиката кальция предпочтительно содержит оксид кальция в количестве, составляющем по меньшей мере 5% от массы гидрата силиката кальция, более предпочтительно по меньшей мере 7%, еще более предпочтительно по меньшей мере 10%, даже более предпочтительно по меньшей мере 12%, а наиболее предпочтительно по меньшей мере 15%. Уровень содержания оксида кальция обычно составляет не более, чем 50% от массы гидрата силиката кальция, более предпочтительно не более, чем 40%, даже более предпочтительно не более, чем 30%, а наиболее предпочтительно не более, чем 25%.

Гидрат силиката кальция предпочтительно содержит Ca и Si при соотношении между атомами (Ca:Si), составляющем менее, чем 1:1, более предпочтительно менее, чем 1:1,2, еще более предпочтительно находящемся в диапазоне от 1:1,5 до 1:4, а наиболее предпочтительно от 1:1,7 до 1:3.

Силикат кальция может быть аморфным или по меньшей мере частично кристаллическим или мезопористым. Силикат кальция предпочтительно является дисперсным, поскольку это обеспечивает наличие максимальной площади поверхности для контакта с зубной тканью. Таким образом, предпочтительно композиция содержит частицы, содержащие силикат кальция. Предпочтительно от 10 до 100%, а в особенности от 25 до 100% и наиболее предпочтительно от 70% до 100% от массы частиц, содержащих силикат кальция, используемых в данном изобретении, характеризуются размером частиц в диапазоне от 100 нм до менее 50 микронов, предпочтительно от 500 нм до 30 микронов, более предпочтительно от 1 микрона до 20 микронов, наиболее предпочтительно от 3 микронов до 15 микронов.

В дополнение к оксиду кальция, диоксиду кремния и воде частицы, которые содержат гидрат силиката кальция, могут содержать и другие компоненты, такие как катионы металлов, анионы (такие как фосфатные) и тому подобное. Однако, предпочтается, чтобы частицы содержали бы CaO, SiO₂ и воду в количестве, составляющем по меньшей мере 70% от массы частицы, более предпочтительно по меньшей мере 80%, еще более предпочтительно по меньшей мере 90%, а даже более предпочтительно по меньшей мере 95%. Наиболее предпочтительно частицы состоят из

(или по меньшей мере по существу состоят из) CaO , SiO_2 и воды.

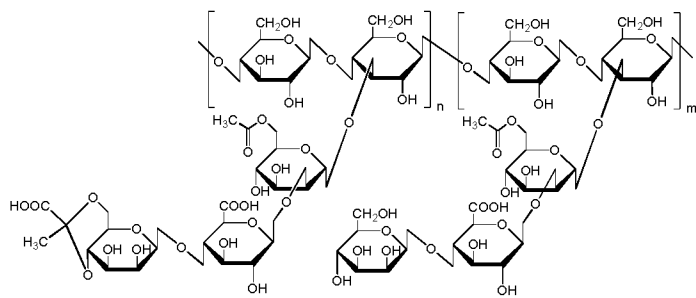
Обычно композиция для ухода за полостью рта настоящего изобретения содержит от 0,1 до 50% мас. силиката кальция, более предпочтительно от 0,2 до 30%, наиболее предпочтительно от 1 до 20%, при расчете на совокупную массу композиции для ухода за полостью рта, включая все охваченные здесь поддиапазоны. В еще одном предпочтительном варианте осуществления композиция для ухода за полостью рта настоящего изобретения содержит от 5 до 80% мас. силиката кальция, более предпочтительно от 5 до 50%, наиболее предпочтительно от 8 до 30%, при расчете на совокупную массу композиции для ухода за полостью рта, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Вещество, способствующее осаждению

Способствующее осаждению вещество, предназначенное для использования в данном изобретении, ограничивается только той степенью, в которой оно может быть использовано в полости рта. В одном предпочтительном варианте осуществления вещество, способствующее осаждению, представляет собой природную камедь, в особенности предпочтительными являются ксантановая камедь и/или ее производные.

Ксантановая камедь представляет собой внеклеточный полисахарид, секретируемый микроорганизмом *Xanthomonas campestris*. Она представляет собой линейную (1,4)-связанную β -D-глюкозную основную цепь (как в целлюлозе), содержащую трисахаридную боковую цепь на каждой второй глюкозе в положении C-3. Данная боковая цепь содержит остаток глюкуроновой кислоты, связанный по варианту (1,4) с концевым маннозным элементарным звеном и по варианту (1,2) со второй маннозой, которая соединяется с основной цепью. Приблизительно 50% от концевых маннозных остатков преобразованы в пируваты, а неконцевой остаток обычно несет ацетильную группу в положении C-6.

Структура ксантановой камеди представлена ниже:



где:

n и m представляют собой целые числа в диапазоне от 0 до 10000, а сумма $n+m$ находится в диапазоне от 10 до 10000, предпочтительно от 100 до 8000, более

предпочтительно от 500 до 5000, наиболее предпочтительно от 1000 до 3000.

Производные ксантановой камеди получают в результате проведения реакции между недериватизированной камедью и четвертичными аммониевыми соединениями в количестве, равном стехиометрическому количеству, требуемому для прохождения полной дериватизации, или более. Четвертичные аммониевые соединения предпочтительно имеют один алкильный или алкенильный заместитель, содержащий от 13 до 24 атомов углерода, и/или два алкильных или алкенильных заместителя, содержащих от 12 до 24 атомов углерода в одном заместителе. Наиболее предпочтительно четвертичное аммониевое соединение представляет собой хлорид алкилдиметилбензиламмония, содержащий алкильную группу, содержащую от 13 до 24 атомов углерода.

Обычно композиция для ухода за полостью рта по настоящему изобретению содержит от 0,4 до 2% мас. ксантановой камеди и/или ее производных, более предпочтительно от 0,5 до 1,5%, наиболее предпочтительно от 0,6 до 1,2% в расчете на совокупную массу композиции для ухода за полостью рта, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Вещество, оказывающее благоприятное воздействие

Термин «вещества, оказывающие благоприятное воздействие» в соответствии с использованием в настоящем документе обозначает активные вещества, традиционно доставляемые к зубам человека и/или в полость рта, включая десны, для усиления или улучшения характеристик данных зубных тканей. Единственное ограничение в отношении веществ, оказывающих благоприятное воздействие, которые могут быть использованы в данном изобретении, заключается в том, чтобы такие вещества подходили для использования в полости рта. Обычно вещества, оказывающие благоприятное воздействие, включают окрашивающие вещества, вещества для биоминерализации, противобактериальные вещества или их смеси. Например, окрашивающее вещество, такое как дисперсные отбеливающие вещества и пигменты, предпочтительно дисперсное отбеливающее вещество. Предпочтительно пигмент, в случае использования такового, является фиолетовым или синим, характеризуясь углом цветового тона h в системе CIELAB в диапазоне от 220 до 320 градусов. Данные пигменты могут быть выбраны из одного или нескольких представителей, перечисленных в базе данных Colour Index International, перечисленных в диапазоне от синего пигмента 1 до синего пигмента 83 и в диапазоне от фиолетового пигмента 1 до фиолетового пигмента 56. Вещества для биоминерализации, предназначенные для реминерализации зубной эмали, могут быть одним или несколькими представителями, выбираемыми из аморфного фосфата кальция,

α -трикальцийфосфата, β -трикальцийфосфата, карбоната кальция, обедненного по кальцию гидроксиапатита ($\text{Ca}_9(\text{HPO}_4)(\text{PO}_4)_5\text{OH}$), дикальцийфосфата (CaHPO_4), дигидрата дикальцийфосфата ($\text{CaHPO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$), гидроксиапатита ($\text{Ca}_{10}(\text{PO}_4)_6(\text{OH})_2$), моногидрата монокальцийфосфата ($\text{Ca}(\text{H}_2\text{PO}_4)_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$), октакальцийфосфата ($\text{Ca}_8\text{H}_2(\text{PO}_4)_6 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$) и тетракальцийфосфата ($\text{Ca}_4(\text{PO}_4)_2\text{O}$); противобактериальные вещества могут быть выбраны из одного или нескольких солей металлов, где металл выбирают из цинка, меди, серебра или их смеси, триклозана, триклозанмонофосфата, триклокарбана, куркумина, четвертичных аммониевых соединений, бисбигуанидов и длинноцепочечных третичных аминов, предпочтительно цинковых солей, в том числе оксида цинка, хлорида цинка, ацетата цинка, аскорбината цинка, сульфата цинка, нитрата цинка, цитрата цинка, лактата цинка, пероксида цинка, фторида цинка, сульфата цинка-аммония, бромида цинка, иодида цинка, глюконата цинка, тартрата цинка, сукцината цинка, формиата цинка, фенолсульфоната цинка, салицилата цинка, глицерофосфата цинка или их смеси.

Вещество, оказывающее благоприятное воздействие, предпочтительно является дисперсным, поскольку это обеспечивает наличие максимальной площади поверхности для контакта с зубной тканью.

В одном предпочтительном варианте осуществления вещество, оказывающее благоприятное воздействие, является дисперсным отбеливающим веществом, предназначенным для отбеливания зубов.

Обычно дисперсное отбеливающее вещество содержит материал, подходящий для физического и незамедлительного улучшения характеристик зубов, а в особенности для отбеливания зубов. В целях обеспечения превосходного эффекта отбеливания предпочтителен материал, характеризующийся высоким показателем преломления, составляющим по меньшей мере 1,9, более предпочтительно по меньшей мере 2,0, даже более предпочтительно по меньшей мере 2,2, даже еще более предпочтительно по меньшей мере 2,4, а наиболее предпочтительно по меньшей мере 2,5. На максимальный показатель преломления материалов конкретных ограничений не накладывают, но предпочтительно он доходит вплоть до 4,0. Предпочтительно материал характеризуется показателем преломления в диапазоне от 1,9 до 4,0.

В особенности подходящие для использования материалы представляют собой соли металлов, а предпочтительными являются соли, где металл выбирают из цинка (Zn), титана (Ti), циркония (Zr) или их комбинации. Предпочтительно соли металлов представляют собой (или по меньшей мере включают) оксид металла, такой как диоксид титана (TiO_2), оксид цинка (ZnO), диоксид циркония (ZrO_2) или их комбинацию. В дополнение к этому, дисперсное отбеливающее вещество также может включать и оксиды

неметаллов, такие как монооксид кремния (SiO).

В одном предпочтительном варианте осуществления дисперсное отбеливающее вещество содержит оксиды металлов, оксиды неметаллов или их комбинацию в количестве, составляющем по меньшей мере 50% от массы отбеливающего вещества, а более предпочтительно по меньшей мере 70%, еще более предпочтительно находящемся в диапазоне от 80 до 100%, а наиболее предпочтительно - от 85 до 95%. В одном в особенности предпочтительном варианте осуществления дисперсное отбеливающее вещество представляет собой диоксид титана на по меньшей мере 50% мас., а наиболее предпочтительно - диоксид титана на величину в диапазоне от 60 до 100% мас. в расчете на совокупную массу отбеливающего вещества, включая все охваченные здесь поддиапазоны. В еще одном особенно предпочтительном варианте осуществления дисперсные отбеливающие вещества являются слаборастворимыми или нерастворимыми в воде, но наиболее предпочтительно нерастворимыми в воде.

В одном предпочтительном варианте осуществления дисперсные отбеливающие вещества представляют собой композитные частицы. Показатель преломления композитной частицы, содержащей более, чем один материал, может быть рассчитан, исходя из показателей преломления и объемных долей составных частей с использованием теории эффективной среды в соответствии с описанием, например, в публикации WO 2009/023353.

Композитная частица содержит ядро из первого компонента и покрытие из второго компонента. Обычно ядро композитной частицы содержит материал, подходящий для использования для физического и незамедлительного улучшения характеристик зубов, а в особенности для отбеливания зубов. В целях обеспечения превосходного эффекта отбеливания предпочтается материал, характеризующийся высоким показателем преломления, составляющим по меньшей мере 1,9, более предпочтительно по меньшей мере 2,0, даже более предпочтительно по меньшей мере 2,2, даже еще более предпочтительно по меньшей мере 2,4, а наиболее предпочтительно по меньшей мере 2,5. На максимальный показатель преломления материала конкретных ограничений не накладывают, но предпочтительно он доходит вплоть до 4,0. Предпочтительно материал характеризуется показателем преломления в диапазоне от 1,9 до 4,0.

В особенности подходящие для использования материалы представляют собой соли металлов, а предпочтительными являются соли, где металлы выбирают из цинка (Zn), титана (Ti), циркония (Zr) или их комбинации. Предпочтительно соли металлов представляют собой (или по меньшей мере включают) оксид металла, такой как диоксид титана (TiO_2), оксид цинка (ZnO), диоксид циркония (ZrO_2) или их комбинацию. В

дополнение к этому, ядро композитной частицы также может содержать и оксиды неметаллов, такие как монооксид кремния (SiO).

Ядро композитной частицы обычно составляет от 3 до 98%, а предпочтительно от 6 до 65% и наиболее предпочтительно от 10 до 55%, от массы композитной частицы в расчете на совокупную массу композитной частицы, включая все охваченные здесь поддиапазоны. В одном предпочтительном варианте осуществления ядро содержит оксиды металлов, оксиды неметаллов или их комбинацию в количестве по меньшей мере 50% от массы ядра, а более предпочтительно по меньшей мере 70%, еще более предпочтительно от 80 до 100%, а наиболее предпочтительно от 85 до 95%. В одном в особенности предпочтительном варианте осуществления ядро представляет собой диоксид титана на по меньшей мере 50% мас., а наиболее предпочтительно - диоксид титана на величину в диапазоне от 60 до 100% мас. в расчете на совокупную массу ядра из первого компонента.

Покрытие из второго компонента содержит материал, подходящий для связывания с зубной эмалью, дентином или ими обоими. Обычно материал покрытия содержит элемент кальций, а необязательно и другие металлы, подобные калию, натрию, алюминию, магнию, а также их смесям, при этом такие необязательные металлы представлены в виде, например, сульфатов, лактатов, оксидов, карбонатов или силикатов. Необязательно материал покрытия может представлять собой оксид алюминия или диоксид кремния. В одном предпочтительном варианте осуществления материал покрытия является подходящим для обеспечения биологического или химического улучшения для зубов, которое является долговременным (например, в результате приводит к образованию гидроксиапатита). Предпочтительно используемое покрытие содержит по меньшей мере 50% мас. элемента кальция, а наиболее предпочтительно по меньшей мере 65% мас. элемента кальция, в расчете на совокупную массу металла в покрытии. В одном особенно предпочтительном варианте осуществления металл в покрытии представляет собой элемент кальций на 80-100% мас. в расчете на совокупную массу металла в покрытии из второго компонента, включая все охваченные здесь поддиапазоны. В еще одном в особенности предпочтительном варианте осуществления ядро и покрытие являются слаборастворимыми или нерастворимыми в воде, но наиболее предпочтительно нерастворимыми в воде.

В одном в особенности желательном варианте осуществления покрытие из второго компонента может содержать, например, фосфат кальция, глюконат кальция, оксид кальция, лактат кальция, карбонат кальция, гидроксид кальция, сульфат кальция, кальциевую соль карбоксиметилцеллюлозы, альгинат кальция, кальциевые соли лимонной

кислоты, силикат кальция, их смесь и тому подобное. В еще одном желательном варианте осуществления источник кальция в покрытии включает силикат кальция.

В другом предпочтительном варианте осуществления покрытие может содержать элемент кальций, который имеет своим происхождением нерастворимый силикат кальция, присутствующий в виде композитного материала на основе оксида кальция-диоксида кремния (CaO-SiO_2) в соответствии с описаниями в международных патентных заявках, опубликованных как WO 2008/015117 и WO 2008/068248.

В случае использования в качестве покрытия композитного материала на основе силиката кальция соотношение между кальцием и кремнием (Ca:Si) может находиться в диапазоне от 1:10 до 3:1. Соотношение Ca:Si предпочтительно находится в диапазоне от 1:5 до 2:1, а более предпочтительно от 1:3 до 2:1 и наиболее предпочтительно от приблизительно 1:2 до 2:1. Силикат кальция может включать монокальцийсиликат, дикальцийсиликат или трикальцийсиликат, при этом соотношения между кальцием и кремнием (Ca:Si) должны пониматься как соотношения между атомами.

Обычно по меньшей мере 30% от площади внешней поверхности ядра из первого компонента покрывают покрытием из второго компонента, предпочтительно по меньшей мере 50% от ядра покрывают покрытием, наиболее предпочтительно от 70 до 100% от площади внешней поверхности ядра из первого компонента покрывают покрытием из второго компонента.

В одном в особенности предпочтительном варианте осуществления дисперсное отбеливающее вещество представляет собой диоксид титана с нанесенным покрытием из силиката кальция.

Дисперсное отбеливающее вещество по настоящему изобретению может иметь различные размеры и формы. Частицы могут иметь вид сферической, пластинчатой или неправильной формы. Диаметр дисперсного отбеливающего вещества зачастую находится в диапазоне от 10 нм до менее 50 микронов, а предпочтительно от 75 нм до менее 10 микронов. В одном в особенности предпочтительном варианте осуществления диаметр частиц находится в диапазоне от 100 нм до 5 микронов, включая все охваченные здесь поддиапазоны. Для композитных частиц в одном предпочтительном варианте осуществления по меньшей мере 40%, а предпочтительно по меньшей мере 60% и наиболее предпочтительно от 75 до 99,5% от диаметра композитной частицы представляют собой ядро, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Композиция для ухода за полостью рта по настоящему изобретению может содержать одно вещество, оказывающее благоприятное воздействие, или смесь из двух и более веществ, оказывающих благоприятное воздействие. Обычно вещество,

оказывающее благоприятное воздействие, присутствует в количестве в диапазоне от 0,25 до 60%, а более предпочтительно от 0,5 до 40% и наиболее предпочтительно от 1 до 30% от совокупной массы композиции для ухода за полостью рта, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Относительное массовое соотношение между силикатом кальция и веществом, оказывающим благоприятное воздействие, может находиться в диапазоне от 1:10 до 4:1, предпочтительно от 1:5 до 3:1, наиболее предпочтительно от 1:3 до 2:1.

Необязательные компоненты

Композиция для ухода за полостью рта по настоящему изобретению, как это установлено, способна обеспечивать реминерализацию зубов без включения источника фосфатов в саму композицию. Как это полагают авторы настоящего изобретения, не желая связывать себя какой-либо теорией, это может быть обусловлено прохождением реакции между силикатом кальция в композиции для ухода за полостью рта по настоящему изобретению и фосфат-ионами в слюне и/или возможным наличием сродства между группами Si-OH и ионами Ca в зубах. Ксантановая камедь и/или ее производные в настоящем изобретении исполняют функцию вещества, способствующего осаждению, которое улучшает осаждение силиката кальция и/или веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхность зубов. Реминерализация силиката кальция в окрестности веществ, оказывающих благоприятное воздействие, дополнительно способствует удерживанию данных веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхностях зубов путем улучшения их стойкости к воздействию усилия сдвига.

Таким образом, в одном варианте осуществления композиция может быть по существу свободна от источника фосфатов.

Для безводных композиций (то есть, композиций, по существу свободных от воды) или двухфазных водных композиций предпочтается подмешивать источник фосфатов в композицию.

Источник фосфатов, который может быть использован в данном изобретении, ограничивается только той степенью, в которой он может быть использован в композиции, подходящей для использования в полости рта. Иллюстративные примеры типов источника фосфатов, подходящих для использования в данном изобретении, включают тринатрийфосфат, мононатрийдигидрофосфат, динатрийдигидрофосфат, пирофосфат натрия, тетранатрийпирофосфат, гексаметафосфат натрия, трикалийфосфат, монокалийдигидрофосфат, дикалийгидрофосфат, их смеси и тому подобное. Источником фосфатов предпочтительно является тот, который является растворимым в воде.

В случае использования источника фосфатов он обычно будет составлять от 0,5 до

22%, а предпочтительно от 2 до 18% и наиболее предпочтительно от 4 до 16%, от массы композиции для ухода за полостью рта в расчете на совокупную массу композиции для ухода за полостью рта, включая все охваченные здесь поддиапазоны. В одном предпочтительном варианте осуществления использующийся источник фосфатов представляет собой тринатрийфосфат и мононатрийдигидрофосфат при массовом соотношении между тринатрийфосфатом и мононатрийдигидрофосфатом в диапазоне от 1:4 до 4:1, предпочтительно от 1:3 до 3:1, а наиболее предпочтительно от 1:2 до 2:1, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Композиция по настоящему изобретению является композицией для ухода за полостью рта и обычно содержит физиологически приемлемый носитель. Носитель предпочтительно содержит по меньшей мере поверхностно-активное вещество, загуститель, увлажняющее вещество или их комбинацию.

Предпочтительно композиция для ухода за полостью рта содержит поверхностно-активное вещество. Предпочтительно композиция содержит по меньшей мере 0,01% поверхностно-активного вещества от массы композиции, более предпочтительно по меньшей мере 0,1%, а наиболее предпочтительно от 0,5 до 7%. Подходящие для использования поверхностно-активные вещества включают анионные поверхностно-активные вещества, такие как натриевые, магниевые, аммониевые или этаноламиновые соли C_8 - C_{18} алкилсерных кислот (например, лаурилсульфат натрия), C_8 - C_{18} алкилсульфоянтарных кислот (например, диоктилсульфосукцинат натрия), C_8 - C_{18} алкилсульфоуксусных кислот (такие как лаурилсульфоацетат натрия), C_8 - C_{18} алкилсаркозина (такие как лаурилсаркозинат натрия), C_8 - C_{18} алкилфосфорных кислот (которые необязательно могут содержать вплоть до 10 этиленоксидных и/или пропиленоксидных элементарных звеньев) и сульфатированных моноглицеринов. Другие подходящие для использования поверхностно-активные вещества включают неионные поверхностно-активные вещества, такие как необязательно полиэтиоксилированные жирнокислотные сорбитановые сложные эфиры, этоксилированные жирные кислоты, сложные эфиры полиэтиленгликоля, этоксилаты жирнокислотных моноглицеридов и диглицеридов и этиленоксид/пропиленоксидные блочные полимеры. Другие подходящие для использования поверхностно-активные вещества включают амфотерные поверхностно-активные вещества, такие как бетаины или сульфобетаины. Также могут быть использованы и смеси из любых из описанных выше материалов. Более предпочтительно поверхностно-активное вещество включает или представляет собой анионное поверхностно-активное вещество. Предпочтительные анионные поверхностно-активные вещества представляют собой лаурилсульфат натрия и/или

додецилбензолсульфонат натрия. Наиболее предпочтительно поверхностно-активное вещество представляет собой лаурилсульфат натрия.

В одном особенно предпочтительном варианте осуществления ксантановая камедь и/или ее производные по настоящему изобретению также ведут себя в качестве единственного загустителя в композиции для ухода за полостью рта.

В еще одном предпочтительном варианте осуществления композиция для ухода за полостью рта, кроме того, содержит загустители, отличные от ксантановой камеди и/или ее производных. В изобретении также может быть использован загуститель, который ограничивается только той степенью, в которой он может быть добавлен к композиции, подходящей для использования в полости рта. Иллюстративные примеры типов загустителей, которые могут быть использованы в данном изобретении, включают натриевую соль карбоксиметилцеллюлозы (SCMC), гидроксипропилцеллюлозу, метилцеллюлозу, этилцеллюлозу, трагакантовую камедь, аравийскую камедь, камедь карайи, альгинат натрия, каррагенан, гуар, ирландский мох, крахмал, модифицированный крахмал, загустители на основе диоксида кремния, в том числе кварцевые аэрогели, силикат магния-алюминия (например, вигум), карбомеры (сшитые акрилаты) и их смеси.

Обычно предпочтительными являются натриевая соль карбоксиметилцеллюлозы и/или карбомер. В случае использования карбомера желательными будут материалы, имеющие среднемассовую молекулярную массу, составляющую по меньшей мере 700000, а предпочтительно желательными будут материалы, имеющие молекулярную массу, составляющую по меньшей мере 1200000, а наиболее предпочтительно материалы, имеющие молекулярную массу, составляющую по меньшей мере приблизительно 2500000. В настоящем документе также могут быть использованы и смеси из карбомеров.

В одном в особенности предпочтительном варианте осуществления карбомер представляет собой продукты Synthalen PNC, Synthalen KP или их смесь. Он был описан в качестве высокомолекулярной и сшитой полиакриловой кислоты и идентифицирован номером в реестре CAS 9063-87-0. Данные типы материалов доступны на коммерческих условиях у поставщиков, подобных компании Sigma.

В еще одном особенно предпочтительном варианте осуществления использующаяся натриевая соль карбоксиметилцеллюлозы (SCMC) представляет собой продукт SCMC 9H. Она была описана в качестве натриевой соли целлюлозного производного, содержащего карбоксиметильные группы, связанные с гидроксигруппами мономеров глюкопиранозной основной цепи, и идентифицирована номером в реестре CAS 9004-32-4. Она доступна у поставщиков, подобных компании Alfa Chem.

Загуститель обычно составляет от 0,01 до приблизительно 10%, более

предпочтительно от 0,1 до 9%, а наиболее предпочтительно от 1,5 до 8%, от массы композиции для ухода за полостью рта, в расчете на совокупную массу композиции, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

В случае композиции для ухода за полостью рта по изобретению в виде зубной пасты или геля она обычно будет характеризоваться вязкостью в диапазоне от приблизительно 30000 до 180000 сантипуазов, а предпочтительно от 60000 до 170000 сантипуазов и наиболее предпочтительно от 65000 до 165000 сантипуазов.

В композиции для ухода за полостью рта по настоящему изобретению предпочтительно используются подходящие увлажняющие вещества, и они включают, например, глицерин, сорбит, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, диглицерин, триацетин, минеральное масло, полиэтиленгликоль (предпочтительно продукт PEG-400), алкандиолы, подобные бутандиолу и гександиолу, этанол, пентиленгликоль или их смесь. Предпочтительные увлажняющие вещества представляют собой глицерин, полиэтиленгликоль, сорбит и их смеси.

Увлажняющее вещество может присутствовать в количестве в диапазоне от 10 до 90% от массы композиции для ухода за полостью рта. Более предпочтительно увлажняющее вещество, представляющее собой носитель, составляет от 25 до 80%, а наиболее предпочтительно от 45 до 70%, от массы композиции, в расчете на совокупную массу композиции, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Композиция для ухода за полостью рта настоящего изобретения может содержать широкий спектр других ингредиентов, которые являются обычными на современном уровне техники с точки зрения улучшения физических свойств и эксплуатационных характеристик. Данные ингредиенты включают противомикробные вещества в дополнение к противобактериальному веществу, оказывающему благоприятное воздействие, которое может быть включено в композицию, противовоспалительные вещества, противокариозные вещества, буферы зубного налета, источники фторидов, витамины, растительные экстракты, десенсибилизаторы, противокалькулезные вещества, биомолекулы, вкусо-ароматические вещества, белковые материалы, консерванты, вещества, придающие непрозрачность, окрашивающие вещества в дополнение к окрашивающему веществу, оказывающему благоприятное воздействие, которое может быть включено в композицию, вещества, регулирующие значение pH, подсластители, дисперсные абразивные материалы, полимерные соединения, буферы и соли для буферирования значения pH и ионной силы композиций и их смеси. Такие ингредиенты обычно и коллективно составляют менее, чем 20% от массы композиции, а предпочтительно от 0,0 до 15% от массы и наиболее предпочтительно от 0,01 до 12% от

массы композиции, включая все охваченные здесь поддиапазоны.

Композиция для ухода за полостью рта по изобретению может быть использована в способе оказания благоприятного воздействия на зубы индивидуума, таких как реминерализация и/или стерилизация и/или отбеливание, включающем нанесение композиции на по меньшей мере одну поверхность зубов индивидуума.

В дополнительном или альтернативном варианте композиция для ухода за полостью рта по изобретению может быть предназначена для использования в качестве лекарственного препарата и/или использована в изготовлении лекарственного препарата в целях оказания благоприятного воздействия при уходе за полостью рта в соответствии с описанием изобретения в настоящем документе таким образом, как в целях отбеливания зубов индивидуума. В альтернативном и предпочтительном варианте применение по изобретению является нетерапевтическим.

В одном предпочтительном варианте осуществления композиция для ухода за полостью рта является однофазной безводной композицией.

В еще одном предпочтительном варианте осуществления композиция для ухода за полостью рта является двухфазной композицией, содержащей источник кальция и источник фосфатов, где в источнике кальция присутствует силикат кальция, и ксантановая камедь и/или ее производные могут быть представлены в любой из двух фаз. Две фазы физически отделены друг от друга вследствие их нахождения в независимых фазах. Доставка двух независимых фаз к зубам может быть одновременной или последовательной. В одном предпочтительном варианте осуществления фазы доставляются одновременно.

Обычно двухфазная композиция доставляется с использованием сдвоенного тюбика, имеющего первое отделение для первой фазы, содержащей источник кальция, и второе отделение для второй фазы, содержащей источник фосфатов, что делает возможным совместное выдавливание двух фаз.

В одном предпочтительном варианте осуществления такой сдвоенный тюбик имеет одно из отделений, окружающее другое. В таких вариантах осуществления одна фаза присутствует в качестве оболочки, окружающей другую фазу в сердцевине. В одном особенно предпочтительном варианте осуществления фаза в качестве сердцевины содержит источник кальция, а фаза оболочки содержит источник фосфатов.

В еще одном предпочтительном варианте осуществления такой сдвоенный тюбик имеет два отделения, расположенные одно рядом с другим в одном и том же тюбике. В таких вариантах осуществления две фазы выдавливаются из тюбика как одна, при этом такое выдавливание обозначается термином «контактное выдавливание». В таком

сдвоенном тюбике может быть использована насосная головка для выжимания из тюбика двух фаз в виде одной фазы.

Двухфазная композиция для ухода за полостью рта может быть гелеобразной композицией, которая содержит две независимые фазы геля, при этом первая содержит источник кальция, а вторая содержит источник фосфатов. Средство доставки может включать ватный стержень или капю, на которую наносят источник кальция и источник фосфатов перед расположением капю в контакте с зубами.

Обычно композиция по изобретению будет упакованной. В форме зубной пасты или геля композиция может быть упакована в обычном металлическом тюбике с ламинатом из пластика или в дозаторе с одним отделением. Она может быть нанесена на зубные поверхности с использованием любого физического средства, такого как зубная щетка, кончик пальца или с использованием аппликатора непосредственно на чувствительную область. В форме жидкого ополаскивателя для полости рта композиция может быть упакована в бутылку, саше или другой обычный контейнер.

Композиция может оказаться эффективной даже в случае использования во время проведения ежедневной процедуры по гигиене полости рта индивидуума. Например, композиция может быть нанесена щеткой на зубы и/или может быть сполоснута по внутреннему пространству полости рта индивидуума. Композиция может быть, например, введена в контакт с зубами в течение периода времени в диапазоне от одной секунды до 20 часов. Более предпочтительно от 1 секунды до 10 часов, еще более предпочтительно от 10 секунд до 1 часа, а наиболее предпочтительно от 30 секунд до 5 минут. Композиция может использоваться ежедневно, например, будучи используемой индивидуумом один раз, два раза или три раза в день. В случае композиции для ухода за полостью рта в виде двухфазной композиции две фазы композиции будут смешивать во время нанесения. Смешанные фазы обычно остаются на зубах в течение от 3 минут до 10 часов, более предпочтительно от 3 минут до 8 часов. Нанесение может осуществляться ежедневно.

Для облегчения понимания настоящего изобретения предлагаются следующие далее примеры. Примеры представлены не в целях ограничения объема формулы изобретения.

Пример 1

Данный пример демонстрирует улучшенное осаждение частиц на поверхностях зубов с использованием силиката кальция в комбинации с ксантановой камедью. Все ингредиенты выражаются в массовых процентах от совокупного состава и в виде уровня содержания активного ингредиента.

Таблица 1

	Образцы						
	1	2	3	4	5	6	7
Сорбит	45	45	45	45	45	45	45
Вода	30	29	29	29	29	29	29
Сополимер PVM/MM ^a	-	1	-	-	-	-	-
Альгинат натрия ^b	-	-	1	-	-	-	-
Ксантановая камедь ^c	-	-	-	1	-	-	-
Каррагенан ^d	-	-	-	-	1	-	-
Сополимер акриламида и акриламидо-трет-бутилсульфоната натрия ^e	-	-	-	-	-	1	-
Сополимер акрилатов ^f	-	-	-	-	-	-	1
Диоксид титана с нанесенным покрытием из силиката кальция ^g	15	15	15	15	15	15	15
Силикат кальция ^h	10	10	10	10	10	10	10

a. Доступный на коммерческих условиях сополимер PVM/MA под торговым наименованием Gantrez® S-97 BF от компании Ashland

b. Доступный на коммерческих условиях альгинат натрия от компании Sinopharm Group Co. Ltd.

c. Доступная на коммерческих условиях ксантановая камедь под торговым наименованием Keldent® Xanthan Gum от компании CP Kelco

d. Доступный на коммерческих условиях каррагенан под торговым наименованием GRINDSTED® Carrageenan CL110 от компании Danisco

e. Доступный на коммерческих условиях сополимер акриламида и акриламидо-трет-бутилсульфоната натрия под торговым наименованием Flopaam AN125 от компании SNP

f. Доступный на коммерческих условиях сополимер акрилатов под торговым наименованием EPITEX™ 66 от компании Dow chemical company

g. Доступный на коммерческих условиях диоксид титана с нанесенным покрытием из силиката кальция от компании KOBOL Products Inc.

h. Доступный на коммерческих условиях силикат кальция (CaSiO₃) под торговым наименованием Sorbosil CA40 от компании P. Q. Company

Таблица 2

Ингредиент	Образцы	
	8	9
Глицерин	75	74
Ксантановая камедь	-	1
Диоксид титана с нанесенным покрытием из силиката кальция ^g	15	15
Силикат кальция ^h	10	10

Методы

Для оценки осаждения частиц на поверхности зубов образцы для испытаний смешивали с водой при соотношении 5 г на 10 г деионизированной воды (ДИ-воды) для

получения суспензии. В качестве контрольных образцов для водных рецептур и безводных рецептур, соответственно, использовали образцы 1 и 8, содержащие коммерческий силикат кальция и частицы.

Диски от компании НАР очищали и внедряли в силастиковый фиксатор. После этого их подвергали обработке с использованием различных суспензий в результате чистки щеткой, следуя тому же самому протоколу. Диски от компании НАР чистили щеткой при использовании суспензии под машиной для чистки зубов щеткой, снабженной зубными щетками. Нагрузка при чистке зубов щеткой составляла 170 г +/- 5 г, и автоматическую чистку щеткой проводили при скорости 150 об./мин. После чистки щеткой в течение 1 минуты диски от компании НАР два раза споласкивали дистиллированной водой и вымачивали в искусственной жидкости полости рта (ИЖПР) в условиях встряхивающейся водяной бани при 37°C и 60,0 об./мин. После вымачивания в течение приблизительно 3 часов диски от компании НАР чистили щеткой с использованием суспензии, используя машину, использующую ту же самую методику, что и на первой стадии. Диски от компании НАР вымачивали в жидкости ИЖПР в течение приблизительно 3 часов до чистки щеткой при использовании суспензии еще раз, следуя той же самой методике, что и на первой стадии. Диски от компании НАР хранили в жидкости ИЖПР в течение ночи (> 12 часов) во встряхивающейся водяной бане при 37°C для имитирования среды в полости рта. После этого диски от компании НАР чистили щеткой при использовании ДИ-воды, используя машину в течение 1 минуты, и высушивали в естественных условиях. Данные стадии рассматриваются как полный цикл обработки. Диски от компании НАР подвергали обработке в течение одного и трех циклов.

Степень осаждения титана измеряли с использованием рентгенофлуоресцентного анализа (РФА), используя волнодисперсионный спектрометр анализа РФА Axios. Более высокая интенсивность в анализе РФА указывает на более высокую степень осаждения титансодержащих частиц на дисках от компании НАР.

Искусственную жидкость полости рта получали в результате объединения ингредиентов из таблицы 3:

Таблица 3

Ингредиент	Количество, г
NaCl	16,07
NaHCO ₃	0,7
KCl	0,448
K ₂ HPO ₃ *H ₂ O	3,27
MgCl ₂ *6H ₂ O	0,622
HCl при 1 моль/л	40 мл

CaCl ₂	0,1998
Na ₂ SO ₄	0,1434
Буфер	Доведение значения pH до 7,0
Вода	Остальное до 2 л

Результаты

Результаты после одного цикла и трех циклов обработки для водных рецептур и безводных рецептур обобщенно представлены, соответственно, в таблице 4 и таблице 5 (погрешность представляет собой среднеквадратическую погрешность для двух результатов измерения).

Таблица 4

Интенсивность в анализе РФА/килоимп./сек	Образцы						
	1	2	3	4	5	6	7
Один цикл	2,90 ± 1,04	3,05 ± 0,47	2,80 ± 0,35	12,03 ± 1,50	1,77 ± 0,45	3,47 ± 0,83	4,87 ± 2,75
Три цикла	2,40 ± 0,25	3,44 ± 0,28	2,63 ± 0,37	14,92 ± 0,82	2,38 ± 0,51	3,78 ± 0,67	2,86 ± 0,28

Таблица 5

Интенсивность в анализе РФА/килоимп./сек	Образцы	
	8	9
Один цикл	1,93 ± 0,71	4,81 ± 0,90
Три цикла	3,27 ± 0,99	7,71 ± 1,74

После одного и трех циклов обработки использовали измерение в анализе РФА для определения степени осаждения титана на дисках от компании НАР. В водных рецептурах, как это можно видеть исходя из результатов, диски от компании НАР, подвергнутые обработке при использовании образца 4, содержащего ксантановую камедь и силикат кальция, продемонстрировали значительно более высокую степень осаждения титана по сравнению с тем, что имело место в случае обработки с использованием других образцов, что указывает на осаждение значительно большего количества частиц на дисках от компании НАР. Аналогичным образом, в безводных рецептурах образец 9, содержащий ксантановую камедь и силикат кальция, продемонстрировал лучшее поведение в отношении осаждения частиц по сравнению с образцом 8, содержащим только силикат кальция.

Пример 2

Данный пример демонстрирует влияние концентрации частиц на эффективность осаждения частиц. Все ингредиенты выражаются в массовых процентах от совокупного состава и в виде уровня содержания активного ингредиента.

Таблица 6

Ингредиент	Образцы					
	10	11	12	13	14	15
Сорбит	45	45	45	45	45	45
Вода	43,5	42	39	36	29	29
Ксантановая камедь ^c	1	1	1	1	1	1
Диоксид титана	0,5	2	5	8	15	-
Диоксид титана с нанесенным покрытием из силиката кальция ^g	-	-	-	-	-	15
Силикат кальция ^h	10	10	10	10	10	10

Методы

Для оценки осаждения частиц на поверхностях зубов использовали тот же самый протокол, что и описанный в примере 1.

Результаты

Результаты после одного цикла и трех циклов обработки обобщенно представлены в таблице 7 (погрешность представляет собой среднеквадратическую погрешность для двух результатов измерения).

Таблица 7

Интенсивность в анализе РФА/килоимп./сек	Образцы					
	10	11	12	13	14	15
Один цикл	0,04 ± 0,07	0,65 ± 0,09	1,76 ± 0,22	3,87 ± 0,25	3,75 ± 0,41	8,82 ± 0,66
Три цикла	0,42 ± 0,10	1,21 ± 0,07	3,15 ± 0,16	4,34 ± 0,17	6,00 ± 0,65	15,39 ± 0,80

После одного цикла обработки диски от компании НАР, подвергнутые обработке с использованием образца 10, содержащего 0,5% TiO₂, продемонстрировали почти что полное отсутствие осаждения титана, в то время как диски от компании НАР, подвергнутые обработке с использованием образцов 13 и 14, содержащих более, чем 5% TiO₂, продемонстрировали намного более высокую степень осаждения титана. Помимо этого, образец 15, содержащий композитные частицы, продемонстрировал лучшее поведение в отношении осаждения частиц по сравнению с образцом 14, содержащим частицы TiO₂ без нанесенного покрытия.

Пример 3

Данный пример демонстрирует влияние концентрации ксантановой камеди на эффективность осаждения частиц. Все ингредиенты выражаются в массовых процентах от совокупного состава и в виде уровня содержания активного ингредиента.

Таблица 8

Ингредиент	Образцы					
	16	17	18	19	20	21
Сорбит	45	45	45	45	45	45
Вода	30	29,9	29,8	29,7	29,5	29

Ксантановая камедь ^c	-	0,1	0,2	0,3	0,5	1,0
Диоксид титана	15	15	15	15	15	15
Силикат кальция ^h	10	10	10	10	10	10

Методы

Для оценки осаждения частиц на поверхностях зубов использовали тот же самый протокол, что и описанный в примере 1.

Результаты

Результаты после одного цикла обработки обобщенно представлены в таблице 9 (погрешность представляет собой среднеквадратическую погрешность для двух результатов измерения).

Таблица 9

Интенсивность в анализе РФА/килоимп./сек	Образцы					
	16	17	18	19	20	21
Один цикл	0,92 ±	1,10 ±	1,38 ±	1,34 ±	2,22 ±	5,83 ±
	0,11	0,14	0,12	0,20	0,23	1,76

Как можно видеть из результатов анализа РФА, концентрация ксантановой камеди важна для эффективности осаждения частиц. В качестве контрольного образца используют образец 16, не содержащий ксантановой камеди. Образцы от 17 до 19, содержащие 0,3% и менее ксантановой камеди, продемонстрировали степень осаждения титана, сравнимую с тем, что имело место для образца 16, что указывает на то, что малое количество ксантановой камеди не способствовало осаждению частиц. Образцы 20 и 21, содержащие более, чем 0,3% ксантановой камеди, продемонстрировали намного лучшее осаждение частиц по сравнению с тем, что имело место для образца 16.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Композиция для ухода за полостью рта, содержащая:

- a) от 5 до 80% мас. силиката кальция;
- b) от 0,4% до 2% мас. ксантановой камеди и/или ее производных;
- c) вещество, оказывающее благоприятное воздействие; и
- d) физиологически приемлемый носитель;

где вещество, оказывающее благоприятное воздействие, выбрано из окрашивающих веществ, веществ для биоминерализации, противобактериальных веществ или их смесей, и где вещества для биоминерализации представляют собой аморфный фосфат кальция, α -трикальцийфосфат, β -трикальцийфосфат, карбонат кальция, обедненный по кальцию гидроксиапатит ($\text{Ca}_9(\text{HPO}_4)(\text{PO}_4)_5\text{OH}$), дикальцийфосфат (CaHPO_4), дигидрат дикальцийфосфата ($\text{CaHPO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$), гидроксиапатит ($\text{Ca}_{10}(\text{PO}_4)_6(\text{OH})_2$), моногидрат монокальцийфосфата ($\text{Ca}(\text{H}_2\text{PO}_4)_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$), октакальцийфосфат ($\text{Ca}_8\text{H}_2(\text{PO}_4)_6 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$) и тетракальцийфосфат ($\text{Ca}_4(\text{PO}_4)_2\text{O}$) или их смеси.

2. Композиция для ухода за полостью рта по п. 1, в которой ксантановая камедь и/или ее производные присутствуют в количестве от 0,5 до 1,5%, предпочтительно от 0,6 до 1,2% от массы композиции.

3. Композиция для ухода за полостью рта по п. 1 или 2, в которой вещество, оказывающее благоприятное воздействие, является дисперсным.

4. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой вещество, оказывающее благоприятное воздействие, является дисперсным отбеливающим веществом.

5. Композиция для ухода за полостью рта по п. 4, в которой дисперсное отбеливающее вещество содержит материал, характеризующийся показателем преломления в диапазоне от 1,9 до 4,0.

6. Композиция для ухода за полостью рта по п. 4, в которой дисперсное отбеливающее вещество представляет собой композитные частицы.

7. Композиция для ухода за полостью рта по п. 6, в которой композитная частица содержит ядро из первого компонента, содержащее соль металла, предпочтительно металл выбран из цинка, титана, циркония или их смеси, и покрытие из второго компонента, содержащее элемент кальций и необязательно калий, натрий, магний, алюминий или их смесь.

8. Композиция для ухода за полостью рта по п. 7, в которой соль металла представляет собой оксид металла, предпочтительно оксид цинка, диоксид титана, диоксид циркония или их смесь.

9. Композиция для ухода за полостью рта по любому из п.п. 6-8, в которой ядро из первого компонента композитной частицы представляет собой диоксид титана.

10. Композиция для ухода за полостью рта по любому из п.п. 6-9, в которой композитная частица представляет собой диоксид титана с нанесенным покрытием из силиката кальция.

11. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой вещество, оказывающее благоприятное воздействие, присутствует в количестве от 0,25 до 60%, предпочтительно от 1 до 30% от массы композиции.

12. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой относительное массовое соотношение между силикатом кальция и веществами, оказывающими благоприятное воздействие, находится в диапазоне от 1:3 до 2:1.

13. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой силикат кальция присутствует в количестве от 5 до 50%, предпочтительно от 8 до 20% от массы композиции.

14. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, дополнительно содержащая источник фосфатов, выбранный из тринатрийфосфата, моноватрийдигидрофосфата, динатрийгидрофосфата, пирофосфата натрия, тетранатрийпирофосфата, гексаметафосфата натрия, трикалийфосфата, монокалийдигидрофосфата, дикалийгидрофосфата или их смеси, предпочтительно тринатрийфосфата, моноватрийдигидрофосфата или их смесей.

15. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, которая является однофазной безводной композицией.

16. Композиция для ухода за полостью рта по п. 14, которая является двухфазной композицией, содержащей кальциевую фазу и фосфатную фазу, где в кальциевой фазе присутствует силикат кальция, а ксантановая камедь и/или ее производные присутствуют в любой из двух фаз.

17. Композиция для ухода за полостью рта по п. 16, в которой кальциевая фаза и фосфатная фаза физически разделены до использования композиции.

18. Применение ксантановой камеди и/или ее производных в композициях для ухода за полостью рта по любому из п.п. 1-17 для улучшения осаждения силиката кальция и/или веществ, оказывающих благоприятное воздействие, на поверхностях зубов.

19. Применение по п. 18, в котором вещество, оказывающее благоприятное воздействие, выбрано из окрашивающих веществ, веществ для биоминерализации, противобактериальных веществ или их смесей.