

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 201992256 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2020.04.14

(22) Дата подачи заявки
2018.02.23

(51) Int. Cl. *A61Q 11/00* (2006.01)
A61K 8/39 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61K 8/86 (2006.01)

(54) КОМПОЗИЦИИ ДЛЯ УХОДА ЗА ПОЛОСТЬЮ РТА

(31) 17170919.9

(32) 2017.05.12

(33) EP

(86) PCT/EP2018/054570

(87) WO 2018/206171 2018.11.15

(71) Заявитель:
ЮНИЛЕВЕР Н.В. (NL)

(72) Изобретатель:
Джойнер Эндрю, Литтлвуд Дэвид
Томас, Филпоттс Кэрол Джейн (GB)

(74) Представитель:
Нилова М.И. (RU)

(57) Композиция для ухода за полостью рта, содержащая неионогенное поверхностно-активное вещество на основе алкоксилированного спирта, пигмент, имеющий угол цветового тона, h, в системе CIELAB от 220 до 320°, и водорастворимую полимерную добавку, улучшающую осаждение.

A1

201992256

201992256

A1

КОМПОЗИЦИИ ДЛЯ УХОДА ЗА ПОЛОСТЬЮ РТА

Настоящее изобретение относится к композициям для ухода за полостью рта, которые улучшают белый цвет зубов.

5

Композиции, содержащие пигменты, которые отбеливают зубы, описаны в документах № WO 16099544 и № WO 150975709.

В документе № EP 1935395 описана отбеливающая композиция, содержащая пигмент, имеющий угол цветового тона, h , в системе CIELAB от 220 до 320 градусов, и растворимую добавку, улучшающую осаждение пигмента.

10

Задачей настоящего изобретения является обеспечение улучшенного отбеливающего эффекта для зубов.

15

КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

В первом аспекте настоящее изобретение относится к композиции для ухода за полостью рта, содержащей неионогенное поверхностно-активное вещество на основе алкоксилированного спирта, пигмент, имеющий угол цветового тона, h , в системе CIELAB от 220 до 320 градусов, и водорастворимую полимерную добавку, улучшающую осаждение.

20

Во втором аспекте настоящее изобретение относится к применению композиции, описанной выше, для улучшения отбеливания зубов.

25

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

30

Композиции согласно настоящему изобретению содержат пигмент, который должен иметь угол цветового тона, h , в системе CIELAB от 220 до

320 градусов, наиболее предпочтительно от 250 до 290 градусов. Подробное описание угла цветового тона можно найти на стр. 57 3-го издания Colour Chemistry за авторством Золлингера (H. Zollinger), опубликованного Wiley-VCH.

5 Под пигментом обычно понимают затенитель/материал, который является нерастворимым в соответствующей среде при соответствующей температуре. Этим он отличается от красителей, которые являются растворимыми. В контексте настоящего изобретения “соответствующая среда” представляет собой слюну человека, жидкую среду, в которой применяют композицию, при температуре
10 полости рта во время чистки зубов, т.е. вплоть до 37°C. В качестве разумного приближения соответствующей средой можно считать воду, и соответствующей температурой можно считать 25°C.

 Предпочтительно пигмент способен отражать количество света, достаточное для того, чтобы обработанный зуб был заметно белее по сравнению с его исходным цветом. Предпочтительно пигмент окрашен так, что его естественный цвет находится в диапазоне от фиолетово-красного до зелено-синего, предпочтительно от фиолетового до синего.

20 Предпочтительно пигмент является фиолетовым или синим, более предпочтительно одним из пигментов, которые перечислены в Colour Index International. Указанные пигменты перечислены, как пигменты от Pigment Violet 1 до Pigment Violet 56 и Pigment Blue от 1 до 83.

25 Предпочтительными пигментами Pigment Violets являются пигменты Pigment Violet 1, 1:1, 1:2, 2, 3, 5:1, 13, 19, 23, 25, 27, 31, 32, 37, 39, 42, 44 и 50.

 Предпочтительными пигментами Pigment Blues являются пигменты Pigment Blue 1, 2, 9, 10, 14, 15, 15:1, 15:2, 15:3, 15:4, 15:6 16, 18, 19, 24:1, 25, 56,
30 60, 61, 62 и 66.

Другими подходящими пигментами являются Pigment Ultramarine Blue и Ultramarine Violet.

Предпочтительно пигмент представляет собой Pigment Blue 15, более
5 предпочтительно Pigment Blue 15:1, 15:2, 15:3, 15:4, 15:5 или 15:6, наиболее предпочтительно 15:1.

Blue Covarine является особенно предпочтительным.

10 Количество пигмента в композиции предпочтительно составляет от 0,001 до 0,3 масс.%, более предпочтительно от 0,005 до 0,1 масс.% и наиболее предпочтительно от 0,01 до 0,08 масс.%. Массовые проценты относятся к общему количеству присутствующего активного вещества и исключают любые носители,
15 которые могут присутствовать. Пигмент может быть равномерно распределен по всей композиции, или он может быть диспергирован во второй фазе, такой как полоска или другая совместно экструдированная вторая фаза.

Композиции согласно настоящему изобретению содержат водорастворимую полимерную добавку, улучшающую осаждение. В контексте
20 настоящего изобретения “водорастворимая” полимерная добавка, улучшающая осаждение, представляет собой материал, который является растворимым в воде, обычно имеет растворимость 0,5 масс.% или более и более типично 5 масс.% или более при 25°C. Кроме того, такой материал остается растворимым после
25 высушивания, т.е. он может быть повторно растворен после высушивания. Такие материалы представляют собой полимеры, но не пленкообразующие полимеры. Растворимость в воде требуется для того, чтобы избежать скопления добавки, улучшающей осаждение, на зубах, что также может являться существенной проблемой для пленкообразующих полимеров.

30 Растворимая полимерная добавка, улучшающая осаждение, усиливает осаждение пигмента на зубах и, таким образом, усиливает изменение цвета, вызываемое пигментом. Более конкретно агент, улучшающий осаждение,

согласно настоящему изобретению способен усиливать осаждение пигмента, такого как Blue Covarine, при включении в композицию в количестве 0,02 масс.%, особенно при содержании самой добавки, улучшающей осаждение, в количестве 1 масс.%.

5

Добавку, улучшающую осаждение, вводят в композицию предпочтительно в количестве от 0,01 to 10 масс.%, более предпочтительно от 0,05 до 5 масс.% и наиболее предпочтительно от 0,1 до 1 масс.%.

10

Добавки, улучшающие осаждение, для применения согласно настоящему изобретению обычно представляют собой высокомолекулярные полимеры, т.е. полимеры с молекулярной массой 200000 или более. Предпочтительные добавки, улучшающие осаждение, представляют собой полимеры типа Gantrez® и высокомолекулярные ПЭГ. Особенно предпочтительные добавки, улучшающие осаждение, представляют собой полимеры типа Gantrez® и высокомолекулярные ПЭГ. Особенно предпочтительные добавки, улучшающие осаждение, представляют собой полимеры типа Gantrez®.

15

Полимеры типа Gantrez® представляют собой сополимеры малеинового ангидрида и метилвинилового эфира, в которых ангидридный фрагмент может находиться в частично или полностью гидролизованной или алкоголизированной форме. Сами полимеры Gantrez® доступны в ISP Inc. Подходящие полимеры Gantrez® представляют собой: Gantrez S-95: молекулярная масса 216000; свободная кислота; Gantrez S-96: молекулярная масса 700000; свободная кислота; Gantrez S-97: молекулярная масса 1500000; свободная кислота; и Gantrez MS-955: молекулярная масса 1060000; соль кальция/натрия.

20

25

Полимеры типа Gantrez®, в которых ангидридный фрагмент полностью гидролизован, являются предпочтительными. Их можно рассматривать как сополимеры малеиновой кислоты и метилвинилового эфира. Особенно предпочтительные сополимеры малеиновой кислоты и метилвинилового эфира имеют молекулярную массу 1000000 или более, и особенно предпочтительным материалом является Gantrez S-97.

30

Высокомолекулярные ПЭГ представляют собой этиленгликолевые полимеры с молекулярной массой 1000000 или более, предпочтительно 2000000 или более. Предпочтительный высокомолекулярный ПЭГ представляет собой Polyox 60K, полимер с молекулярной массой примерно 2000000.

5

Композиция для ухода за полостью рта содержит неионогенное поверхностно-активное вещество на основе алкоксилированного спирта предпочтительно в количестве от 0,2 до 10 масс.% в расчете на общую массу композиции. Предпочтительными являются простые эфиры полиэтиленгликоля и жирных спиртов, в частности эфиры полиэтиленгликоля, содержащие от 20 до 40 этиленоксидных групп на звено. Пример такого неионогенного поверхностно-активного вещества включает группу поверхностно-активных веществ, известных как стеареты, такие как стеарет 30. Более предпочтительно содержание неионогенного поверхностно-активного вещества составляет от 0,5 до 7 масс.% от общей композиции, наиболее предпочтительно от 1 to 5 масс.% от общей композиции.

Предпочтительно, если массовое отношение неионогенного поверхностно-активного вещества к полимерной добавке, улучшающей осаждение, составляет от 5:1 до 40:1, более предпочтительно от 10:1 до 30:1.

В случае присутствия других поверхностно-активных веществ, предпочтительно, если неионогенное поверхностно-активное вещество на основе алкоксилированного спирта составляет по меньшей мере 75 масс.% от общей массы поверхностно-активных веществ в композиции. Предпочтительно отношение неионогенного поверхностно-активного вещества на основе алкоксилированного спирта к поверхностно-активному веществу другого типа составляет более 2:1, более предпочтительно более 3:1, наиболее предпочтительно более 5:1. Хотя могут присутствовать другие поверхностно-активные вещества, такие как анионогенные и амфотерные поверхностно-активные вещества, предпочтительно, если их содержания составляют менее 0,5 масс.% от общей композиции, предпочтительно менее 0,1 масс.% от общей

композиции. Это особенно относится к анионогенным поверхностно-активным веществам.

Предпочтительно композиция для ухода за полостью рта содержит воду, загуститель и абразивный материал. Подходящие загустители включают диоксид кремния и карбонат кальция. Предпочтительным загустителем является оксиды кремния.

Предпочтительные абразивные материалы включают оксиды кремния, оксиды алюминия, карбонаты кальция, фосфаты дикальция, пирофосфаты кальция, гидроксиапатиты, триметафосфаты, нерастворимые гексаметафосфаты и т.д., включая агломерированные абразивные материалы в виде частиц, обычно в количестве от 3 до 60 масс.% композиции для ухода за полостью рта. Наиболее предпочтительными абразивными агентами являются карбонат кальция и диоксид кремния, особенно диоксид кремния.

Композиции для ухода за полостью рта согласно настоящему изобретению могут дополнительно содержать ингредиенты, которые являются обычными в данной области техники, такие как:

противомикробные агенты, например, триклозан, хлоргексидин, соли меди, цинка и олова, такие как цитрат цинка, сульфат цинка, глицинат цинка, цитрат цинка натрия и пирофосфат олова, экстракт сангвинарина, метронидазол, соединения четвертичного аммония, такие как цетилпиридиния хлорид; бис-бигуаниды, такие как хлоргексидина диглюконат, гексетидин, октенидин, алексидин; и галогенированные бисфенольные соединения, такие как 2,2'-метиленис-(4-хлор-6-бромфенол);

противовоспалительные агенты, такие как ибупрофен, флурбипрофен, аспирин, индометацин и т.д.;

средства против кариеса, такие как фториды натрия и олова, аминфториды, монофторфосфат натрия, триметафосфат натрия и казеин;

средства против зубного налета, такие как мочеви́на, лактат кальция, глицерофосфат кальция и полиакрилаты стронция;

5 витамины, такие как витамины А, С и Е;

растительные экстракты;

десенсибилизаторы, например, цитрат калия, хлорид калия, тартрат калия, бикарбонат калия, оксалат калия, нитрат калия и соли стронция;

10 агенты против зубного камня, например, пирофосфаты щелочных металлов, полимеры, содержащие пирофосфиты, органические фосфонаты и фосфоцитраты и т.д.;

15 биомолекулы, например, бактериоцины, антитела, ферменты и т.д.;

ароматизаторы, например, масла перечной мяты и кудрявой мяты;

20 белковые материалы, такие как коллаген;

консерванты;

замутнители;

25 красители;

регуляторы pH;

подсластители;

30 фармацевтически приемлемые носители, например, крахмал, сахароза, вода или системы вода/спирт и т.д.;

увлажнители, такие как глицерин, сорбит, пропиленгликоль, ксилит, лактит и т.д.;

5 связующие вещества и загустители, такие как натриевая соль карбоксиметилцеллюлозы, ксантановая камедь, гуммиарабик и т.д., а также синтетические полимеры, такие как полиакрилаты и карбоксивиниловые полимеры, такие как Carbopol®;

10 буферы и соли для буферизации pH и ионной силы композиции для ухода за полостью рта; и

другие необязательные ингредиенты, которые могут присутствовать, например, отбеливающие агенты, такие как пероксисоединения, например, пероксидифосфат калия, вспенивающие системы, такие как системы на основе бикарбоната натрия и лимонной кислоты, системы для изменения цвета и т.д.

Также для улучшения доставки или стабильности активных ингредиентов можно применять липосомы.

20 Композиции для ухода за полостью рта могут находиться в любой форме, стандартной в данной области техники, например, в виде зубной пасты, геля, мусса, аэрозоля, жевательной резинки, пастилки, порошка, крема, а также может быть получена в виде систем для применения в дозаторах двухкамерного типа. Предпочтительными формами являются зубные пасты.

25

В следующих неограничивающих примерах количества представляют собой массовые проценты, если не указано иное.

30

Таблица 1

Пример	A	1
Сорбит 70/70	66	66
ПЭГ-32	2	2
ТНФ 12-гидрат	0,11	0,11
Blue Covarine	0,075	0,075
Gantrez S97	0,1	0,1%
Zeodent 165	8,9	8,9
Sorbosil AC77	8	8
Sorbosil AC33	1,7	1,7
Целлюлозная камедь 9Н	0,5	0,5
Поверхностно-активное вещество	1,8% ЛСН	1,8% Стеарет 30
Вода и прочие ингредиенты	До 100	До 100

5 Указанные выше составы применяли для отбеливания зубов следующим образом. Извлеченные человеческие резцы и премоляры чистили белой зубной пастой и помещали в стерильную слюну на два часа. После промывания водой измеряли исходный цвет зубов при помощи колориметра. Затем образцы зубов чистили суспензией вода:зубная паста (2:1) испытываемыми зубными пастами в

10 течение 60 секунд при помощи зубной щетки, промывали водой и повторно

измеряли их цвет. Изменения цвета зубов рассчитывали с применением WIO индекса белизны зубов.

Результаты отбеливания приведены в таблице 2.

5

Таблица 2

Пример	Изменение WIO
A	0,4
1	5,6

10

Составы с альтернативными поверхностно-активными веществами.

Таблица 3

Ингредиент	Пр. 2	Пр. В	Пр. С	Пр. D	Пр. Е
Сорбит	69,5	69,5	69,5	69,5	69,5
ПЭГ-32	2	2	2	2	2
Тринатрийфосфат	0,11	0,11	0,11	0,11	0,11
Blue Covarine	0,19	0,19	0,19	0,19	0,19
Gantrez S97	1	1	1	1	1
Zeodent 165	4,5	4,5	4,5	4,5	4,5
Sorbosil AC77	8	8	8	8	8
Sorbosil AC33	1,7	1,7	1,7	1,7	1,7
Целлюлозная камедь 9Н	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
Ароматизатор	1,3	1,3	1,3	1,3	1,3
Стеарет 30	1,8	0	0	0	0
Кокосульфат натрия	0	1,8	0	0	0
Метилкокоилтаурат натрия	0	0	1,8	0	0
Альфа-олефин сульфонат	0	0	0	1,8	0
Кокоилизетионат натрия	0	0	0	0	1,8
Вода и прочие ингредиенты	До 100	До 100	До 100	До 100	До 100

Примеры оценивали по отбеливанию зубов, как описано ранее. Результаты отбеливания приведены в таблице 4.

Таблица 4

Пример	Изменение WIO
2	7,7
В	3,6
С	2,6
D	1,0
Е	1,3

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Композиция для ухода за полостью рта, содержащая неионогенное поверхностно-активное вещество на основе алкоксилированного спирта, пигмент,
5 имеющий угол цветового тона, h , в системе CIELAB от 220 до 320 градусов, и водорастворимую полимерную добавку, улучшающую осаждение.
2. Композиция для ухода за полостью рта по п. 1, в которой полимерная добавка, улучшающая осаждение, содержит сополимеры малеинового ангидрида
10 и метилвинилового эфира, в которых ангидридный фрагмент может находиться в частично или полностью гидролизованной или алкоголизированной форме.
3. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что добавка, улучшающая осаждение, представляет
15 собой полимер с молекулярной массой 200000 или более.
4. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что пигмент имеет угол цветового тона, h , в системе CIELAB от 250 до 290 градусов.
20
5. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой пигмент включает Blue Covarine.
6. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих
25 пунктов, в которой пигмент присутствует в количестве от 0,01 до 0,3 масс.% от общего состава.
7. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих
30 пунктов, в которой неионогенное поверхностно-активное вещество включает этоксилированное неионогенное поверхностно-активное вещество.

8. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой неионогенное поверхностно-активное вещество включает этоксилированное неионогенное поверхностно-активное вещество со степенью этоксилирования от 20 до 40.

5

9. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой неионогенное поверхностно-активное вещество представляет собой стеарет 30.

10

10. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой массовое отношение неионогенного поверхностно-активного вещества к полимерной добавке, улучшающей осаждение, составляет от 10:1 до 30:1.

15

11. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, в которой неионогенное поверхностно-активное вещество на основе алкоксилированного спирта составляет по меньшей мере 75 масс.% от общей массы поверхностно-активных веществ в композиции.

20

12. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов, содержащая воду, загуститель и абразивный агент.

13. Композиция для ухода за полостью рта по п. 12, отличающаяся тем, что загуститель включает диоксид кремния.

25

14. Композиция для ухода за полостью рта по любому из предшествующих пунктов для применения в способе улучшения отбеливания зубов.