

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(11) 039435

(13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2022.01.27

(21) Номер заявки
201891844

(22) Дата подачи заявки
2017.03.28

(51) Int. Cl. *A61Q 11/00* (2006.01)
A46B 9/00 (2006.01)
A46B 1/00 (2006.01)
A61C 3/00 (2006.01)

(54) ПРОДУКТ ДЛЯ УХОДА ЗА ПОЛОСТЬЮ РТА

(31) 16165732.5

(32) 2016.04.18

(33) EP

(43) 2019.05.31

(86) PCT/EP2017/057327

(87) WO 2017/182239 2017.10.26

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
ЮНИЛЕВЕР АЙПИ ХОЛДИНГС Б.В.
(NL)

(72) Изобретатель:
Бласко Алессандро, Ланди Джованна
(IT), Муччо Мануэла (GB)

(74) Представитель:
Нилова М.И. (RU)

(56) JP-A-2001000457
DE-A1-102011011323
WO-A2-2013050432
FR-A1-2989868

(57) Предложен продукт для ухода за полостью рта, содержащий композицию для ухода за полостью рта и лопаточку для нанесения композиции для ухода за полостью рта для уменьшения чувствительности зубов, причем композиция содержит ингредиент, уменьшающий чувствительность зубов, и имеет вязкость от 8000 до 40000 мПа·с при 25°C, причем лопаточка содержит широкую, по существу плоскую поверхность для нанесения, выступающую из стержня, а из поверхности для нанесения выступает по меньшей мере один выступ, длина которого превышает его высоту, при этом выступ выполнен в виде концентрических колец или ребра в виде спирали.

039435

B1

039435

B1

Область техники

Настоящее изобретение относится к продукту и способам для лечения гиперчувствительности зубов.

Уровень техники

Гиперчувствительность зубов представляет собой болезненное состояние, которым страдает до 20% взрослого населения. Гиперчувствительные зубы могут быть чувствительны к холоду, теплу, воздуху или сахаросодержащим продуктам питания. Считается, что гиперчувствительность зубов связана с общим увеличением открытых корневых поверхностей зубов вследствие пародонтита, истирания зубной щеткой или циклической усталости тонкой эмали около эмалево-дентинного соединения.

Существуют две категории методов лечения гиперчувствительности зубов, основанные на двух видах воздействия. Первая категория - деполаризующие нерв агенты - представляет собой фармацевтические вещества, такие как нитрат калия, которые оказывают действие путем вмешательства в нейронную передачу болевого сигнала.

Вторая категория, известная как запечатывающие агенты, действует путем физической блокировки открытых концов дентинных канальцев, в результате чего уменьшается движение дентинной жидкости и снижается раздражение, связанное с напряжением сдвига, которое описывается гидродинамической теорией.

Пример запечатывающего агента приведен в US 5270331, в котором описан десенситайзер (десенсибилизатор), запечатывающий дентинные канальцы, содержащий полиакриловую кислоту, например полимерные материалы Carbopol®. Другая композиция для запечатывания дентинных канальцев раскрыта в US 5374417, в котором описана калиевая соль синтетического анионного полимера, такого как поликарбоксилат.

Существует постоянная потребность в эффективных продуктах, которые облегчают нанесение композиции на зубы и снижают гиперчувствительность.

Краткое описание изобретения

Настоящее изобретение относится к продукту для ухода за полостью рта, содержащему композицию для ухода за полостью рта и лопаточку для нанесения композиции для ухода за полостью рта для уменьшения чувствительности зубов, причем композиция содержит ингредиент, уменьшающий чувствительность зубов, и имеет вязкость от 8000 до 40000 мПа·с при 25°C, причем лопаточка содержит широкую, по существу плоскую поверхность для нанесения, выступающую из стержня, а из поверхности для нанесения выступает по меньшей мере один выступ, длина которого превышает его высоту, при этом выступ выполнен в виде концентрических колец или ребра в виде спирали.

В частном варианте реализации лопаточка выполнена из полужесткого материала для обеспечения возможности свободного перемещения вперед и назад поверхности для нанесения.

В частном варианте реализации лопаточка содержит множество выступов.

В частном варианте реализации количество выступов лопаточки составляет от 1 до 10.

В частном варианте реализации количество выступов лопаточки составляет от 3 до 8.

В частном варианте реализации ширина выступа лопаточки составляет меньше высоты его выступа.

В частном варианте реализации длина выступа лопаточки по меньшей мере в 15 раз превышает его ширину.

В частном варианте реализации лопаточка выполнена из эластомерного материала.

В частном варианте реализации композиция дополнительно содержит полимерный загуститель.

В частном варианте реализации полимерный загуститель выбран из группы, состоящей из ксантановой камеди, геллановой камеди и их смесей.

В частном варианте реализации композиция дополнительно содержит добавку, способствующую нанесению.

В частном варианте реализации добавка, способствующая нанесению, представляет собой полимер на основе сополимера метилвинилового эфира и малеинового ангидрида.

В частном варианте реализации композиция дополнительно содержит гидроокись кремния.

Подробное описание изобретения

Продукт для ухода за полостью рта в соответствии с изобретением содержит лопаточку для нанесения продукта для ухода за полостью рта на зубы. Форма лопаточки такова, что продукт прилипает к лопаточке, но при этом может быть легко нанесен на зубы. Лопаточка содержит широкую, по существу плоскую поверхность для нанесения, выступающую от стержня, причем из поверхности для нанесения выступают множество выступов, длина которых превышает их высоту.

Предпочтительно кромка поверхности для нанесения на противоположном конце стержня является криволинейной.

Лопаточка предпочтительно выполнена из полужесткого материала для обеспечения возможности перемещения поверхности для нанесения вперед и назад. Более предпочтительно лопаточка выполнена из эластомерного материала, наиболее предпочтительно эластомерный материал представляет собой термоупругий материал.

Предпочтительно поверхность лопаточки, предназначенная для нанесения, выступает перпендикулярно центральной линии стержня.

Предпочтительно длина выступов на лопаточке меньше высоты выступа. Также предпочтительно длина выступа на лопаточке по меньшей мере в 5 раз, более предпочтительно в 10 раз больше ширины выступа. Если выступ выполнен в виде непрерывного кольца, длину определяют как длину окружности этого кольца.

В одном из вариантов реализации изобретения выступы лопаточки расположены рядами, по существу перпендикулярными линии, находящейся на поверхности для нанесения около стержня. Предпочтительно линия перпендикулярна ручке. Предпочтительно количество выступов лопаточки составляет от 3 до 8.

Предпочтительно между поверхностью для нанесения и стержнем имеется ободок.

Предпочтительно выступы лопаточки имеют форму ребер.

Во втором варианте реализации выступ лопаточки выполнен в виде концентрических колец.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением предпочтительно находятся в форме сывотки, стабильная вязкость которой составляет от 6000 до 100000 мПа·с, более предпочтительно от 10 до 60000 мПа·с, наиболее предпочтительно от 15 до 40000 мПа·с. Вязкость следует измерять при 25°C с помощью вискозиметра Брукфилда с подставкой Helipath, Т-стойкой и Т-образным шпинделем, вращающимся со скоростью 5 об/мин. Минимальный диаметр емкости для образца, в которой проводят измерение, составляет 5 см, минимальная высота - 10 см. Величину вязкости следует регистрировать через 60 с после начала измерения. В контексте настоящего изобретения стабильная вязкость означает, что вязкость существенно не изменяется во время хранения; как правило, это происходит через 3 недели или более после получения композиции.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением обычно содержат водную непрерывную фазу. Вода, как правило, составляет от 40 до 89 мас.% в расчете на общую массу композиции, более предпочтительно от 50 до 70 мас.%.

Предпочтительно композиции в соответствии с настоящим изобретением дополнительно содержат увлажняющие компоненты. Содержание увлажняющего компонента обычно составляет от 10 до 50%, более предпочтительно от 15 до 40 мас.% в расчете на общую массу композиции. Предпочтительные увлажняющие компоненты, содержащиеся в указанных выше количествах, включают полиолы, особенно предпочтительными являются сорбит, глицерин и их смеси.

Предпочтительно композиция содержит камедь, более предпочтительно геллановую камедь и/или ксантановую камедь. Особенно предпочтительно камедь представляет собой ксантановую камедь. Предпочтительно содержание ксантановой камеди составляет от 0,05 до 1,2 мас.% в расчете на общую массу композиции, более предпочтительно от 0,1 до 1,0 мас.%.

Предпочтительно композиция содержит ингредиенты, которые уменьшают чувствительность зубов. Предпочтительным ингредиентом, обеспечивающим указанный эффект, является гидроокись кремния. Предпочтительно средний размер частиц гидроокиси кремния составляет менее 15 мкм, более предпочтительно менее 10 мкм, наиболее предпочтительно от 1 до 6 мкм. Предпочтительно содержание указанной гидроокиси кремния составляет от 1 до 10 мас.% в расчете на общую массу композиции, более предпочтительно от 3 до 8 мас.% в расчете на общую массу композиции.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением могут содержать соль калия, выбранную из цитрата, лактата или хлорида, предпочтительно соль металла представляет собой цитрат. Предпочтительно содержание соли калия, в частности цитрата калия, составляет от 1 до 10 мас.% в расчете на общую массу композиции, более предпочтительно от 2 до 5 мас.% в расчете на общую массу композиции. Указанные соли способствуют предотвращению чувствительности зубов.

Еще одним агентом, снижающим чувствительность зубов, является НАР (гидроксиапатит кальция). Предпочтительно содержание НАР составляет от 0,5 до 10 мас.% в расчете на общую массу композиции, более предпочтительно от 1 до 8 мас.% в расчете на общую массу композиции.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением содержат соль цинка, предпочтительно сульфат цинка, цитрат цинка или хлорид цинка, более предпочтительно сульфат цинка. Предпочтительно содержание соли цинка составляет от 0,05 до 1,0 мас.% в расчете на общую массу композиции, более предпочтительно от 0,1 до 0,5 мас.%.

Предпочтительно содержание этанола в композиции в целом составляет менее 0,1 мас.%.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением могут содержать консервант. Предпочтительно консервант представляет собой бензоат натрия, более предпочтительно систему, полученную из этилгексилглицерина, феноксиэтанола и бензилового спирта. Предпочтительно содержание консерванта, представляющего собой описанную смешанную систему, составляет от 0,5 до 2 мас.% в расчете на общую массу композиции. Указанное содержание относится к общему содержанию консервирующей системы.

Предпочтительно pH композиции при 25°C составляет от 5,6 до 8,0, более предпочтительно от 6,0 до 7,5.

Композиция в соответствии с настоящим изобретением может содержать добавку, способствующую

щую нанесению. Термин "добавка, способствующая нанесению" в контексте настоящего изобретения в целом означает материал, который способствует нанесению входящих в состав композиции агентов, уменьшающих чувствительность зубов.

Применение композиции в контексте настоящего изобретения обычно включает нанесение композиции на зубы с помощью описанного выше аппликатора.

Подходящие добавки, способствующие нанесению, для применения в настоящем изобретении обычно растворяются или диспергируются в воде при температуре 25°C.

Предпочтительно добавки, способствующие нанесению, для применения в настоящем изобретении являются водорастворимыми. Термин "водорастворимый" в данном контексте в целом означает, что растворимость в воде добавки, способствующей нанесению, составляет по меньшей мере 10 г/л при 25°C, более предпочтительно по меньшей мере 30 г/л при 25°C (при этом растворимость определяют в небуферной дистиллированной воде). Особенно предпочтительно, чтобы добавка, способствующая нанесению, оставалась водорастворимой после высыхания для возможности повторного растворения. Это предотвращает нежелательное накопление на зубах добавки, способствующей нанесению, после неоднократного применения композиции.

Подходящие добавки, способствующие нанесению, применяемые в изобретении, включают полимерные материалы, предпочтительно водорастворимые полимерные материалы, как определено выше.

Полимерные материалы для применения в качестве добавок, способствующих нанесению, в изобретении могут быть природными или синтетическими, а также могут быть ионными или неионными.

Предпочтительно указанные полимерные материалы являются высокомолекулярными. Термин "высокомолекулярный" в данном контексте в целом означает, что молекулярная масса полимера составляет по меньшей мере 50000 г/моль, более предпочтительно по меньшей мере 500000 г/моль. Подходящим методом определения молекулярной массы указанных полимерных материалов является гель-проникающая хроматография с полиэтиленгликолем в качестве стандарта.

Конкретные примеры подходящих классов полимерного материала для применения в качестве добавки, способствующей нанесению, в соответствии с настоящим изобретением включают следующие.

Водорастворимые высокомолекулярные линейные гомополимеры этиленоксида, характеризующиеся общей формулой $\text{H}(\text{OCH}_2\text{CH}_2)_n\text{OH}$. Указанные материалы обычно называют полиэтиленоксидами (или альтернативно полиоксипропиленами или полиэтиленгликолями). В общей формуле n обычно имеет среднее значение по меньшей мере 2000, предпочтительно по меньшей мере 50000.

Водорастворимые высокомолекулярные эфиры целлюлозы, такие как метилцеллюлоза, гидроксипропилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза, натрий карбоксиметилцеллюлоза и натрий карбоксиметилгидроксипропилцеллюлоза.

Предпочтительный класс полимерного материала для применения в качестве добавки, способствующей нанесению, в настоящем изобретении включает водорастворимые высокомолекулярные полимеры с анионными боковыми группами вдоль основной цепи полимера.

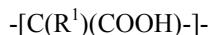
Конкретные примеры указанных материалов включают полимеры на основе поли(карбоновых кислот). Полимеры на основе поли(карбоновых кислот) представляют собой, как правило, полимеры, содержащие в своей структуре группы -COOH или группы, которые являются производными от групп -COOH, такие как группы соли, сложного эфира или ангидрида.

Например, полимеры на основе поли(карбоновых кислот) могут содержать в своей структуре звенья

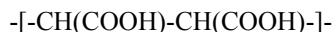
$$-[\text{C}(\text{R}^1)(\text{COOH})]-$$

где R^1 выбран из водорода, C_{1-3} алкила, C_{1-3} алкокси или C_{1-3} гидроксиалкила. Предпочтительно R^1 представляет собой водород.

Предпочтительный тип полимера на основе поли(карбоновых кислот) содержит в структуре соседние звенья

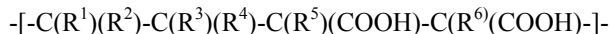


где R^1 , как определено выше, представляет собой, например, полимеры на основе малеиновой кислоты, которые обычно содержат звенья



и/или соли или сложные эфиры указанных звеньев, или указанные звенья в форме ангидридов, в которых группы -COOH на соседних атомах углерода циклизуются с образованием кольцевой системы.

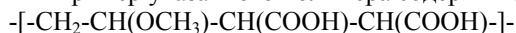
Например, полимеры на основе поли(карбоновых кислот) могут содержать звенья с парами карбоксильных групп на соседних атомах углерода полимерной цепи, например полимеры, содержащие в структуре звенья



и/или соли или сложные эфиры указанных звеньев, или указанные звенья в форме ангидридов, в которых группы -COOH на соседних атомах углерода циклизуются с образованием кольцевой системы; при этом R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 и R^6 каждый независимо выбран из водорода, C_{1-3} алкила или C_{1-3} алкокси. Предпочтительно R^1 и R^2 представляют собой водород, R^3 представляет собой водород, R^4 представляет собой метокси, R^5 и R^6 - водород. Указанный полимер на основе поли(карбоновой кислоты) может быть

описан как полимер на основе сополимера метилвинилового эфира и малеинового ангидрида и является коммерчески доступным, например, под торговым наименованием Gantrez®.

Особенно предпочтительный пример указанного полимера содержит звенья



в своей структуре, в которой группы -COOH находятся в форме свободной кислоты. Полимеры могут быть линейными или сшитыми. Более предпочтительно полимер является линейным. Полимеры указанного типа коммерчески доступны, например, под торговым наименованием Gantrez® S. Наиболее предпочтительно молекулярная масса указанного полимера составляет по меньшей мере 500000 г/моль (например, Gantrez® S-96), наиболее предпочтительно по меньшей мере 1000000 г/моль (например, Gantrez® S-97).

Альтернативные полимеры, которые могут быть использованы, содержат звенья, как описано выше, в форме ангидрида, т.е. две соседние группы -COOH циклизуются с образованием кольцевой системы. Указанные полимеры коммерчески доступны под торговым наименованием Gantrez®AN, например Gantrez®AN-119, Gantrez®AN-903, Gantrez®AN-139 и Gantrez®AN-169.

Могут быть использованы альтернативные полимеры, содержащие звенья, как описано выше, в форме неполной соли, например, в которой некоторые свободные группы -COOH превращаются в соль металла группы I или группы II, такую как соль натрия, или кальция, или смешанную натриево-кальциевую соль. Указанные полимеры коммерчески доступны под торговым наименованием Gantrez®MS, например Gantrez®MS-955.

Могут быть использованы альтернативные полимеры, содержащие звенья, как описано выше, в форме неполного эфира, например, в которой некоторые свободные группы -COOH этерифицированы C₁₋₁₆алкилом, например этилом или н-бутилом. Указанные полимеры коммерчески доступны под торговым наименованием Gantrez®ES, например Gantrez®ES-225 или Gantrez®ES-425.

Также возможно применение смесей любых описанных выше материалов.

Общее содержание добавки, способствующей нанесению, как определено выше, в композициях в соответствии с настоящим изобретением составляет от 0,001 до 5,0 мас.%, предпочтительно от 0,005 до 4,0 мас.%, более предпочтительно от 0,01 до 2,0 мас.% от общей массы добавки, способствующей нанесению, как определено выше, в расчете на общую массу композиции.

Композиция может содержать небольшие количества поверхностно-активного вещества в расчете на общую массу композиции. Содержание поверхностно-активного вещества, если оно присутствует, предпочтительно составляет менее 3 мас.% в расчете на общую массу композиции, более предпочтительно от 0,2 до 2 мас.%, наиболее предпочтительно менее 0,5-1,5 мас.% в расчете на общую массу композиции.

Подходящие поверхностно-активные вещества включают анионные поверхностно-активные вещества, такие как натриевая, магниевая, аммониевая или этаноламиновая соль C₈-C₁₈-алкил сульфатов (например, лаурилсульфат натрия), C₈-C₁₈-алкилсульфосукцинатов (например, диоктилсульфосукцинат натрия), C₈-C₁₈-алкилсульфоацетатов (например, лаурилсульфоацетат натрия), C₈-C₁₈-алкилсаркозинатов (например, лаурилсаркозинат натрия), C₈-C₁₈-алкилфосфатов (которые необязательно могут содержать до 10 звеньев этиленоксида и/или пропиленоксида), а также сульфированные моноглицериды.

Другие подходящие поверхностно-активные вещества включают неионные поверхностно-активные вещества, такие как необязательно полиэтиоксилированные эфиры сорбита и жирной кислоты, этоксилированные жирные кислоты, сложные эфиры полиэтиленгликоля, простые эфиры полиэтиленгликоля, этоксилаты моноглицеридов и диглицеридов жирных кислот и блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида. Другие подходящие поверхностно-активные вещества включают амфотерные поверхностно-активные вещества, такие как бетаины или сульфобетаины. Также возможно применение смесей любых описанных выше материалов. Особенно предпочтительным является эфир полиэтиленгликоля стеарет-30.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением также могут содержать дополнительные необязательные ингредиенты, которые обычно применяют в данной области, такие как источники ионов фторида, средства против зубного камня, буферы, ароматизаторы, подсластители, красители, замутняющие агенты, дополнительные агенты против чувствительности зубов и противомикробные агенты.

Краткое описание чертежей

Фиг. 1 представляет собой вид сверху примера лопаточки для сравнения.

На фиг. 2 представлен вид сверху первого варианта реализации лопаточки в соответствии с настоящим изобретением.

На фиг. 3 представлен вид сверху второго варианта реализации лопаточки в соответствии с настоящим изобретением.

На фиг. 2 показана лопаточка (1), имеющая стержень (2), на одном конце которого имеется плоская поверхность (3) для нанесения. Плоская поверхность для нанесения снабжена рядом ребер (4). Ребра расположены таким образом, что они по существу перпендикулярны ободку (5) между поверхностью для нанесения и стержнем.

На фиг. 3 показана лопаточка (6), имеющая стержень (7), на одном конце которого имеется плоская

поверхность (8) для нанесения. Плоская поверхность для нанесения снабжена концентрическими кольцами (9). Между поверхностью для нанесения и стержнем имеется ободок (10).

Далее изобретение описано с помощью следующих неограничивающих примеров.

Примеры

Композицию подготовили в соответствии с примером 1.

Ингредиент	Мас. %
Вода и второстепенные вещества	до 100
Некристаллизующийся сорбит	15,0
Глицерин	15,0
Гидроокись кремния	5,0
Цитрат калия	3,0
Гидроксипатит	2,0
Стеарет-30	1,0
Ксантановая камедь	0,75
Сополимер метилвинилового эфира и малеиновой кислоты	0,5
Сульфат цинка	0,20
Монофторофосфат натрия	0,17
Геллановая камедь	0,05

Дентинные диски из здоровых, некариозных человеческих моляров полировали до толщины примерно 500 мкм. Использовали соответствующее оборудование для измерения гидравлической проводимости дисков до и после нанесения в примере 1 с использованием одной из лопаточек, представленных на фиг. 1, 2 или 3.

В таблице показано среднее снижение расхода текучей среды, выраженное в процентах от исходного уровня после обработки.

Щетка	Снижение расхода, %	Разовая доза
Щетка А	31,73	9,58
Щетка В	45,51	9,99
Щетка С	49,07	10,95

Сравнение снижения расхода текучей среды для нанесения тремя щетками в данном исследовании показывает, что Щетка С явно превосходит Щетку В по уменьшению расхода текучей среды и статистически превосходит щетку А. Снижение расхода текучей среды соответствует схеме

$$\text{Щетка С} = \text{Щетка В} > \text{Щетка А}$$

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Продукт для ухода за полостью рта, содержащий композицию для ухода за полостью рта и лопаточку для нанесения композиции для ухода за полостью рта для уменьшения чувствительности зубов, причем композиция содержит ингредиент, уменьшающий чувствительность зубов, и имеет вязкость от 8000 до 40000 мПа·с при 25°C, причем лопаточка содержит широкую, по существу плоскую поверхность для нанесения, выступающую из стержня, а из поверхности для нанесения выступает по меньшей мере один выступ, длина которого превышает его высоту, при этом выступ выполнен в виде концентрических колец или ребра в виде спирали.

2. Продукт по п.1, в котором лопаточка выполнена из полужесткого материала для обеспечения возможности свободного перемещения вперед и назад поверхности для нанесения.

3. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором лопаточка содержит множество выступов.

4. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором количество выступов лопаточки составляет от 1 до 10.

5. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором количество выступов лопаточки составляет от 3 до 8.

6. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором ширина выступа лопаточки меньше высоты выступа.

7. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором длина выступа лопаточки по меньшей мере в 15 раз превышает его ширину.

8. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором лопаточка выполнена из эластомерно-

го материала.

9. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором композиция дополнительно содержит полимерный загуститель.

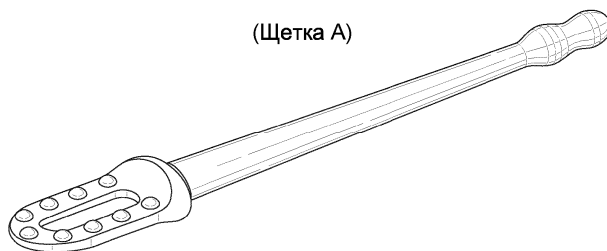
10. Продукт по п.9, в котором полимерный загуститель выбран из группы, состоящей из ксантановой камеди, геллановой камеди и их смесей.

11. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором композиция дополнительно содержит добавку, способствующую нанесению.

12. Продукт по п.11, в котором добавка, способствующая нанесению, представляет собой полимер на основе сополимера метилвинилового эфира и малеинового ангидрида.

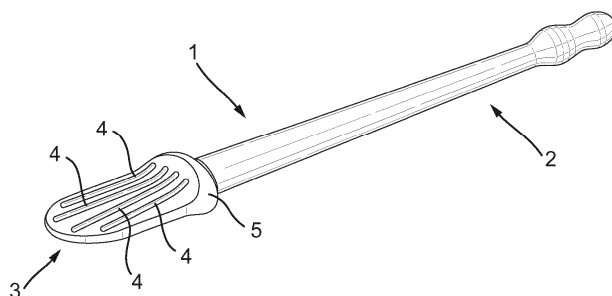
13. Продукт по любому предшествующему пункту, в котором композиция дополнительно содержит гидроокись кремния.

(Щетка А)



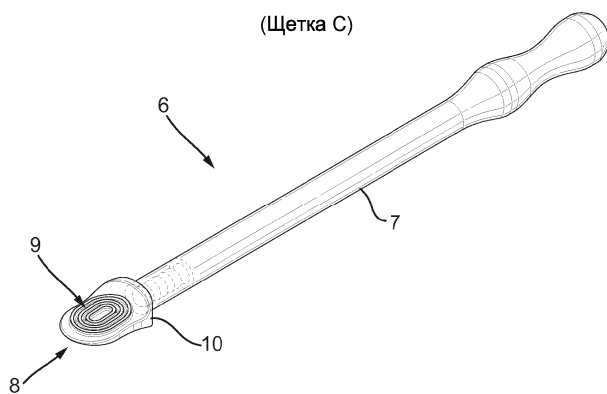
Фиг. 1

(Щетка В)



Фиг. 2

(Щетка С)



Фиг. 3



Евразийская патентная организация, ЕАПВ

Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2