

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3854619号
(P3854619)

(45) 発行日 平成18年12月6日(2006.12.6)

(24) 登録日 平成18年9月15日(2006.9.15)

(51) Int. Cl.		F I
A 6 1 K 8/89	(2006.01)	A 6 1 K 8/89
A 6 1 Q 11/00	(2006.01)	A 6 1 Q 11/00

請求項の数 13 (全 29 頁)

(21) 出願番号	特願2004-502964 (P2004-502964)	(73) 特許権者	590005058
(86) (22) 出願日	平成15年5月9日(2003.5.9)		ザ プロクター アンド ギャンブル カ ンパニー
(65) 公表番号	特表2005-527603 (P2005-527603A)		アメリカ合衆国オハイオ州, シンシナティ ー, ワン プロクター アンド ギャンブ ル プラザ (番地なし)
(43) 公表日	平成17年9月15日(2005.9.15)	(74) 代理人	100057874
(86) 国際出願番号	PCT/US2003/014694		弁理士 曾我 道照
(87) 国際公開番号	W02003/094877	(74) 代理人	100110423
(87) 国際公開日	平成15年11月20日(2003.11.20)		弁理士 曾我 道治
審査請求日	平成16年11月5日(2004.11.5)	(74) 代理人	100084010
(31) 優先権主張番号	60/378,994		弁理士 古川 秀利
(32) 優先日	平成14年5月9日(2002.5.9)	(74) 代理人	100094695
(33) 優先権主張国	米国 (US)		弁理士 鈴木 憲七

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ジカルボキシ官能化ポリオルガノシロキサン類を含む口腔ケア組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

口腔に許容可能なキャリア、及び式 $X(R^4 R^5 SiO)_p(R^6 ASiO)_q Y$ のジカルボキシ官能化シロキサンポリマーを少なくとも0.1重量%含む口腔ケア組成物であって、式中、

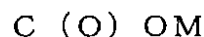
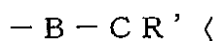
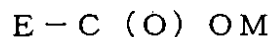
Xは、式 $R^1 R^2 R^3 SiO-$ のトリオルガノシロキシル末端基、又はZ末端基(ここで、Zは-OHを表す)を表し、

Yは、式 $-SiR^3 R^2 R^1$ のトリオルガノシリル末端基、又はW末端基(ここで、Wは水素である)を表し、

$R^1 \sim R^6$ は、同一であっても又は異なってもよく、それぞれ、直鎖又は分枝鎖のC1~C8アルキルラジカル、又はフェニルラジカルを表し、

Aは、次式のジカルボン酸ラジカルを表し、

【化1】



式中、

Bは、任意に炭素原子数1~30個のアルキルラジカル1つ以上で置換された、炭素原子数2~30個のアルキレン残基を表し、

R' は、水素原子、又は炭素原子数 1 ~ 30 個のアルキルラジカルを表し、
E は、不存在であるか、又は任意に炭素原子数 1 ~ 30 個のアルキルラジカル 1 つ以上で置換された、炭素原子数 1 ~ 5 個のアルキレン残基であり、及び

M は、H、あるいは、アルカリ金属、アルカリ土類金属、及び置換若しくは非置換アンモニウム、ピペリジニウム又はアルカノールアミンからなる群から選択される陽イオンであり、

p は、0 ~ 1000 の範囲の平均値であり、

q は、1 ~ 100 の範囲の平均値であり、

Z 末端基及び W 末端基の数と、X 末端基及び Y 末端基の総数との比が、0 / 100 ~ 75 / 100 であり、練り歯磨き、歯磨剤、歯磨き粉、局所用口腔用ゲル、口内洗浄剤、歯科用溶液、義歯製品、口内スプレー、薬用キャンディ、口腔用錠剤、チューインガム、含浸させた歯科用器具、およびペットチューズから選択される形態である、口腔ケア組成物。

【請求項 2】

R¹ ~ R⁶ がメチルラジカルを表す、請求項 1 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 3】

E が炭素原子数 1 ~ 3 個のアルキレン残基である、請求項 1 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 4】

p が 0 ~ 500 の範囲の平均値である、請求項 1 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 5】

p が 5 ~ 200 の範囲の平均値である、請求項 1 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 6】

q が 1 ~ 50 の範囲の平均値である、請求項 1 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 7】

前記ジカルボキシ官能化シロキサンポリマーが、

- (CH₂)_n - CH (COOM)₂ 又は

- (CH₂)_n - CH (COOM) - CH₂ COOM

から選択されるジカルボン酸ペンダント基のうちの 1 つ又はこれらの組み合わせを含み、式中、n は 2 ~ 30 である、請求項 1 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 8】

漂白剤、歯色改变剤、酵素、抗歯石剤、フッ化物イオン供給源、抗菌剤、抗炎症剤、H₂拮抗物質、鎮痛剤、抗ウイルス剤、義歯接着剤、香味剤、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される口腔ケア剤を更に含む、請求項 1 又は 7 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 9】

前記口腔ケア剤が、前記組成物の 0.1 重量% ~ 20.0 重量% の量の漂白剤である、請求項 8 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 10】

前記漂白剤が、過酸化物質類、過ホウ酸塩類、過炭酸塩類、過酸類、過硫酸塩類、亜塩素酸塩類、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項 9 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 11】

前記漂白剤が、過酸化水素、過酸化尿素、過酸化カルシウム、過炭酸ナトリウム、亜塩素酸ナトリウム、亜塩素酸カリウム、及びこれらの混合物からなる群から選択される、請求項 10 に記載の口腔ケア組成物。

【請求項 12】

被験者の歯又は歯科補綴物を洗浄及びホワイトニングするため、歯の染みを防止又は低減するため、並びに歯に光沢、平滑さ、及び良い感触の効果を提供するための、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物の使用。

【請求項 13】

歯及び他の口腔表面を疎水性に改質し、歯及び他の口腔表面への口腔ケア活性剤の送達及び保持を向上させるのに有効な量の、請求項 1 もしくは 7 に記載のジカルボキシ官能化

シロキサンポリマーを含む該口腔ケア活性剤用のキャリアを、前記組成物中に包含させることを含む、口腔ケア組成物の効力を高める方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、表面を処理及び改質する組成物及び方法、並びに陰イオン基、特にカルボキシ基を含むペンダント部分で官能化されたシロキサンポリマー類を含む組成物で処理された表面への活性剤の送達を向上させる組成物及び方法を提供する。好適な表面に適用される場合、カルボキシ官能化シロキサンポリマー類を含む本組成物は、処理される表面上に実質的に疎水性のコーティングを形成する。これらのポリマー類は、ポリマーの陰イオン基と結合又は連結を形成することができる、陽イオン性部位を有する表面に効果的に沈着する。処理される表面は、カルボキシ官能化シロキサンポリマーの沈着のため疎水性になり、これにより、その表面に洗浄の容易さ、染みの除去及び防止、ホワイトニングなどの様々な最終用途の効果が付与される。カルボキシ官能化シロキサンポリマーは更に、表面への活性剤の沈着を向上させ、処理される表面へのこれらの活性物質の保持及び効力を改善する役割をする。本発明は、口腔ケア、ヘアケア及びスキンケア、パーソナルケア、化粧品、並びに布帛及び硬質表面の洗浄及びコンディショニングなどの様々な用途に有用である。

10

【背景技術】

【0002】

このような表面に、洗浄の容易さ；汚れ、染み、及び細菌や他の望ましくない沈着物の付着に対する抵抗性；撥水性；並びにホワイトニング、光沢、柔軟性、平滑性及び潤滑性などの外観や質感の効果を含めた特性を付与するために、表面を改質する手段を有することが望ましい。当該技術分野は、これらのうちの1つ以上の効果を提供することを目的とする無数の製品で溢れているが、これらの効果を付与する改善された手段が引き続き探求されている。

20

【0003】

特に、表面を疎水性に改質することは、前述の効果を提供する際に有利である。例えば、疎水性表面は、ほとんどの汚れ及び染みを撥ねる傾向があり、従って、洗浄が更に容易である。洗浄の容易さ及び染み防止の効果のため、布帛、セラミック、磁器、ガラス及び歯などの表面を疎水性に改質することができる。布帛、紙、皮革、皮膚及び毛髪の疎水性コーティングはまた、柔軟性、平滑さ及び潤滑性を含めた望ましい質感の特性を提供する。

30

【0004】

米国特許第5,032,387号；同5,165,913号；同5,057,308号（全てヒル（Hill）ら）などに記載のように、ポリジメチルシロキサン類（PDMS）のようなポリアルキルシロキサン類を含めたシリコン油類は、それらの疎水性の性質のため、例えば、食物粒子、細胞の破片及び歯垢の前駆体の歯への付着を抑制するため、口腔衛生調製物中に包含されることが提案されてきた。米国特許第5,422,098号（ロラ（Rolla）ら）は、PDMSなどの液体シリコン油、及びその中に溶解される脂肪溶解性抗菌剤を含む歯磨剤を開示しており、これは、抗菌剤の唾液中への緩速な放出のため、歯垢形成に対する歯の保護に有用であると記載されている。しかし、PDMSポリマー類は、PDMSの歯への付着及び保持が不良であるため、一般に、歯をコーティングするのに成功裡には使用されなかった。シリコンの表面への付着を改善するため、カルボキシ基、酸無水物基、多価アルコール基及びアミノ基などの官能基の付加によるシリコンの変性が提案されてきた。このような変性シリコンは、繊維、織物、皮革、毛髪及び皮膚、歯、紙、プラスチック、木材、金属、ガラス、石及びコンクリートを含めた様々な表面の改質に提案されてきた。例えば、アミノアルキルシリコンは、米国特許第5,078,988号；同5,154,915号；同5,188,822号；及び同5,427,770号（全て、チーズブロー・ポンズ（Chese-brough-Ponds）に譲渡）、並びに米国特

40

50

許第 6, 153, 567 号; 同 6, 129, 906 号及び同 6, 024, 891 号(全てプロクター・アンド・ギャンブル(Procter & Gamble)に譲渡)に記載されている。カルボキシル基又は酸無水物基を含有するシリコン類は、米国特許第 4, 501, 619 号; 同 4, 563, 347 号; 同 4, 587, 320 号; 同 4, 944, 978 号; 同 5, 063, 044 号; 同 5, 280, 019 号(全てダウ・コーニング(Dow Corning)に譲渡); 米国特許第 4, 857, 212 号(トレイ・シリコン(Toray Silicone)に譲渡); 米国特許第 4, 701, 269 号; 同 4, 931, 062 号; 同 5, 702, 490 号; 及び同 6, 007, 801 号(全て BASF に譲渡); 米国特許第 4, 658, 049 号(チッソ(Chisso)に譲渡); 米国特許第 4, 844, 888 号(ジレット(Gillette)に譲渡); 米国特許第 5, 248, 783 号及び同 5, 296, 625 号(共にシルテック(Siltech)に譲渡); 米国特許第 5, 015, 700 号及び同 5, 504, 233 号(バッカー・ヒエミー(Wacker Chemie)に譲渡); 日本特許 04/120014 (JP Patent Publication No.04/120014) 及び米国特許第 5, 210, 251 号(花王(Kao)に譲渡); 米国特許第 4, 876, 152 号(PPG に譲渡); 米国特許第 4, 342, 742 号(ロリアル(L'Oréal)に譲渡); 並びに米国特許第 5, 536, 304 号及び同 5, 888, 491 号(共に 3M に譲渡)に開示されている。ジメチコンコポリオールは、米国特許第 5, 759, 523 号; 同 5, 827, 505 号; 同 5, 862, 282 号; 同 6, 004, 538 号; 及び同 6, 129, 906 号(全てプロクター・アンド・ギャンブル(Procter & Gamble)に譲渡)に開示されている。

10

【0005】

20

この分野における相当に多数の研究があっても、表面に沈着してこれらの表面特性を改質し、それによって前述の様々な効果を表面に提供できる永続的なポリマーが引き続き探求されている。従って、本発明は、表面を改質する永続的なシロキサンポリマー類、及びこれらのポリマー類を含む組成物を提供するが、これらは、例えば、歯及び他の口腔内表面への適用に効果が見られる。

【0006】

ヒトの歯は、象牙質と呼ばれる内部の柔軟層、及び内部構造を保護するエナメル質と呼ばれる外側の硬質層で構成されている。歯のエナメル質層は、天然には半透明の白色又は僅かにオフホワイト色である。典型的な条件では、エナメル質表面は、ペリクルと呼ばれる唾液タンパク質の薄い層でコーティングされている。エナメル質又はペリクルのいずれか又はその両方は、変色したり、又は染みになったり、望ましくない外観を外側に呈する可能性がある。更に、歯のエナメル質層は、主に、多孔質の表面構造を作り出すヒドロキシアパタイト鉱物結晶で作られる。エナメル質の多孔質の性質は、染みになる構成成分及び変色させる物質が歯の構造に浸透することを可能にし、それを染みのついた外観にするものであると考えられている。歯の変色は、エナメル質/ペリクル上の外因性のもの、又はエナメル質及び歯牙質に浸透する内因性のもののいずれか、又はその両方である。

30

【0007】

口腔の健康を確実にする口腔の効果的な洗浄には、歯垢及び結石の制御が必要である。歯垢及び歯の結石の形成は、虫歯、歯肉炎、歯周病及び歯の喪失の主要な原因である。歯垢は、細菌、上皮細胞、白血球、マクロファージ及びその他の口腔の滲出物の混合マトリクスである。細菌は、歯垢マトリクスのおよそ4分の3を構成する。歯垢のいずれの所与の試料も、400種類もの異なる微生物を含有する可能性がある。この混合物には、好気性及び嫌気性細菌の両方、真菌及び原生動物が含まれる。ウイルスもまた歯の歯垢の試料中に見出された。

40

【0008】

有機体と口腔の滲出物のこのマトリクスは拡張を続け、近接する他の増殖する歯垢と合体する。細菌は、口腔内に見出されるスクロースからレバン及びグルカンを合成し、微生物にエネルギーを提供する。これらのグルカン、レバン及び微生物は、歯垢の連続的増殖のための粘着性の骨格を形成する。

【0009】

50

また、歯垢は、結石形成の核の役割をする。歯の結石や歯石と呼ばれることがあるものは、歯肉縁の歯表面に形成される沈着物である。歯肉縁上歯石は、主として唾液管開口部付近；例えば、下顎前歯の舌面上、上顎第一及び第二臼歯の頬面上、並びに後臼歯遠心面上に見られる。成熟した結石は、骨、エナメル質及び象牙質に類似したヒドロキシアパタイト結晶格子構造中に配置された、主としてリン酸カルシウムである無機部分からなる。有機部分もまた存在し、落屑上皮細胞、白血球、唾液堆積物、食物の残屑及び様々な種類の微生物からなる。成長中の歯垢はまた、結石により形成されたもののような比較的不規則な表面に最も容易に付着することができる。結石が成熟し、硬くなるにつれ、結石は、食物色素の吸収により染みになったり、又は変色しない場合は、色が白色若しくは帯黄色に見えるようになる。審美的観点から見苦しく及び望ましくないことに加えて、成熟した結石の付着は、歯肉の炎症の慢性的原因となる。

10

【0010】

歯垢及び結石の増殖を抑制又は阻止がなされないと、口腔の健康に有害となる。歯垢及び結石の形成は、虫歯、歯肉肉芽腫生成、歯周病及び最終的に歯の喪失につながる可能性がある。更に結石及び歯垢は、行為及び環境要因と共に、歯の審美的外観に著しく影響する歯の染みの形成につながる。歯に染みがつく傾向の一因となる行為及び環境要因には、コーヒー、茶、コーラ又はタバコ製品の日常的な使用、及びまたクロルヘキシジンのような染みを促進する口腔用製品の使用が挙げられる。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

20

【0011】

特定のカルボキシ官能化シロキサノポリマー類を含む本組成物は、歯に疎水性コーティングを沈着させることによって、抗歯垢、抗結石、及び染み防止効果を提供し、該疎水性コーティングは、汚れ、染み、及び細菌や他の望ましくない沈着物の付着に対する抵抗性を賦与するのに十分な時間、歯の上に保持される。更に、本組成物は、漂白剤などの口腔ケア活性物質の歯の表面への送達及び保持を向上させ、ホワイトニング及び染み除去を改善させる。

【課題を解決するための手段】

【0012】

本発明は、天然歯及び歯科補綴物の洗浄及びホワイトニングに使用し、歯垢、結石、及び歯に表面沈着する染みを予防、低減、又は除去する口腔用組成物を提供し、該組成物は、歯及び他の口腔表面にポリマーを効果的に沈着させ、その表面に長時間保持される永続的なコーティングを形成する製剤中に、カルボキシ官能化シロキサノポリマーを少なくとも約0.1重量%含む。本ポリマーは、カルボキシ基を含有するペンダント部分を有する疎水性シロキサノ鎖鎖を含み、極性表面、即ち、陽イオン性部位を有する表面に沈着する能力を有する。組成物は、水性ベース又は本質的に非水性ベースであってよく、漂白剤及び色変剤を含めた歯ホワイトニング剤、抗菌剤、酵素、フッ化物、減感剤及び香味料などの1つ以上の口腔ケア活性物質を更に含んでもよい。本発明は更に、天然歯及び歯科補綴物を洗浄及びホワイトニングする方法；歯垢、虫歯、歯石、及び表面沈着する歯の染みを防止、低減、又は除去する方法；並びに、本組成物を投与することによって、光沢、平滑さ及び歯の良い感触の効果を提供する方法に関する。

30

40

【0013】

本発明のこれら及び他の特徴、態様及び利点は、次の詳細な説明から当業者に明らかになる。

【発明を実施するための最良の形態】

【0014】

本明細書は、本発明を詳細に指摘し明確に請求する特許請求の範囲でまとめられるが、本発明は、以下の説明からよりよく理解されるものと考えられる。

本明細書で用いられるすべての百分率及び比は、特に指定しない限り、送達される口腔用製剤全体ではなく、特定の口腔用組成物の重量による。すべての測定は、特に指定しな

50

い限り25で行われる。

本明細書では、「含む」とは、最終結果に影響を及ぼさない他の工程及び他の成分を加えることができることを意味する。この用語には、「からなる」及び「から本質的になる」という用語が包含される。

【0015】

「口腔用組成物」とは、通常の使用過程では、特定の治療剤の全身投与の目的で意図的に嚥下されず、むしろ口腔の活性を目的として実質的にすべての歯の表面及び/又は口腔組織と接触させるのに十分な時間、口腔内に保持される製品を意味する。本発明の口腔用組成物は、練り歯磨き、歯磨剤、歯磨き粉、歯磨ジェル、歯肉下用ジェル、口内洗浄剤、義歯製品、口内スプレー、薬用キャンディ、口腔用錠剤又はチューインガムの形態であってもよい。口腔用組成物はまた、口腔表面に直接適用する、又は貼付するストリップ又はフィルム上に組み込まれてもよい。

10

【0016】

本明細書で使用するとき、用語「歯磨剤」とは、特に指定しない限り、ペースト、ジェル又は液体製剤を意味する。歯磨剤組成物は、単一相組成物であってもよく、又は2つ以上の別々の歯磨剤組成物の組み合わせであってもよい。歯磨剤組成物は、深くまで達する縞状、表面的な縞状、ペーストを囲むゲルを有する多層状又はこれらの任意の組み合わせのような、いかなる所望の形態であってもよい。2つ以上の別個の歯磨剤組成物を含む歯磨剤中の各歯磨剤組成物は、ディスペンサーの物理的に分離された区画内に収容され、同時に投与されてもよい。

20

【0017】

本明細書で使用するとき、用語「ディスペンサー」とは、歯磨剤などの組成物を分配するのに好適なあらゆるポンプ、チューブ、又は容器を意味する。

【0018】

本明細書で使用するとき、用語「歯」とは、天然歯、並びに人工歯又は歯科補綴物を指す。

【0019】

本明細書で使用するとき、用語「口腔に許容可能なキャリア」とは、本発明の組成物中に用いるあらゆる安全且つ有効な物質を意味する。このような物質には、フッ化物イオン供給源、抗結石剤、緩衝剤、研磨艶出物質、過酸化物質供給源、アルカリ金属重炭酸塩、増粘物質、保湿剤、水、界面活性剤、二酸化チタン、香味料系、甘味剤、キシリトール、着色剤、及びこれらの混合物が挙げられる。

30

【0020】

本明細書において、用語「歯石」及び「結石」とは、同じ意味で用いられ、石化した歯垢付着物を指す。

【0021】

本発明に従い、歯、セラミックス、皮膚、布帛、毛髪、ガラス及び紙などの極性表面に適用するため、カルボン酸基で官能化された少なくとも1つのシロキサンポリマーを必須成分として含む組成物が提供される。組成物は、ポリマーを処理される表面に効果的に沈着させる製剤中にカルボキシ官能化シロキサンポリマーを少なくとも約0.1%含む。本ポリマーは、疎水性シロキサン主鎖、及びカルボキシ基を含有するペンダントの陰イオン性部分を含み、洗浄及び洗剤組成物などの水性ベースの製剤から、並びに本質的に非水性ベースの製剤から表面に沈着させる能力を有する。好適な表面に適用されるとき、カルボキシ官能化シロキサンポリマーを含む本組成物は、処理される表面上に実質的に疎水性のコーティングを形成し、コーティングは処理される表面上に長時間保持される。

40

【0022】

本発明で有用なカルボキシ官能化シロキサンポリマー類は、極性表面に付着し、静電相互作用、即ち、ポリマーのペンダントのカルボキシ基と、処理される表面上の陽イオン又は他の正電荷を有する部位との錯体形成によって、極性表面上にコーティングを形成すると考えられる。例えば、口腔用の用途の場合、カルボキシ基は歯の中に存在するカルシウ

50

ムと相互作用すると考えられる。布帛の場合はカルシウムイオン又はセルロース基と；毛髪又は皮膚の場合はタンパク質残基と；ガラス又はセラミックの場合はカルシウム及び他の金属イオンと相互作用する場合がある。従って、カルボキシ基は、表面にシロキサンポリマー主鎖を固定し、それによって表面を疎水性に改質するのに役立つ。

【0023】

好ましくは、ポリシロキサン主鎖の官能基ペナントは、2つのカルボキシ基を含み、その結果、特に、正電荷を有するカルシウムイオンを含有する歯などの表面でのポリマーの沈着及び保持が改善される。カルボキシ基と歯の表面との相互作用は、陰イオン性のカルボキシ基が正電荷を有するカルシウムイオンと錯体を形成する静電的な性質のものである。

10

【0024】

本発明で有用なジカルボン酸官能化ポリオルガノシロキサン類は、式 $X(R^4R^5SiO)_p(R^6ASiO)_qY$ を有し、
式中、

X末端基は、式 $R^1R^2R^3SiO-$ のトリオルガノシロキシル末端基、又はZ末端基（ここで、Zは、 $-OH$ を表す）を表し、

Y末端基は、式 $-SiR^3R^2R^1$ のトリオルガノシリル末端基、又はW末端基（ここで、Wは $-H$ を表す）を表し、

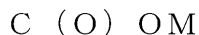
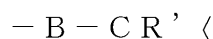
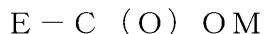
$R^1 \sim R^6$ は、同一であっても又は異なってもよく、それぞれ、直鎖又は分岐鎖のC1～C8アルキル、又はフェニルラジカル、好ましくはメチルラジカルを表し、

20

Aは、次式のジカルボン酸ラジカルを表し、

【0025】

【化1】



式中、

Bは、任意に炭素原子数1～30個のアルキルラジカル1つ以上で置換された、炭素原子数2～30個、好ましくは炭素原子数3～8個のアルキレン残基を表し、

30

R' は、水素原子、又は炭素原子数1～30個のアルキルラジカルを表し、

Eは、存在しないか、又は任意に炭素原子数1～30個のアルキルラジカル1つ以上で置換された、炭素原子数1～5個、好ましくは炭素原子数1～3個のアルキレン残基であり、及び

Mは、H、陽イオン、又は任意にヒドロキシ又はアルコキシ基で置換された、炭素原子数1～4のアルキルラジカルであり、

pは、0～1000、好ましくは0～500、より好ましくは5～200の範囲の平均値であり、

qは、1～100、好ましくは1～50の範囲の平均値であり、

Z末端基及びW末端基の数と、末端基X及びYの総数との比は、0/100～75/100、好ましくは0/100～30/100の範囲である。

40

【0026】

好ましい実施形態では、p/q比は、1/3～99/1（シロキシル単位に対してペナントの二酸基1～75%に対応する）、好ましくは1/1～10/1である。Zが $-OH$ 及び/又はYがHである生成物は、副生成物である。

【0027】

ジカルボキシラジカルの陽イオン塩は、アルカリ金属（ナトリウム、カリウム、リチウム）塩、アルカリ土類金属（カルシウム、バリウム）塩、非置換又は置換アンモニウム（メチル-、ジメチル-、トリメチル-、若しくはテトラメチルアンモニウム、ジメチルピペリジニウム）塩とすることができるか、又はアルカノールアミン（モノエタノールアミ

50

ン、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン)から誘導することができる。

ジカルボキシラジカル(M = アルキル)のモノ - 又はジエステル誘導体に加えて、本発明は、アミド及びジアミド誘導体を含む。

【0028】

本ジカルボキシ官能化シロキサンポリマー類は、一般に、例えば、米国特許第3,159,601号、同3,159,662号、及び同3,814,730号に記載のような、有効量のヒドロシリル化金属触媒(白金)の補助による、ポリアルキル水素シロキサンと、ジカルボキシA基の前駆体である - オレフィン系酸無水物とのヒドロシリル化反応、続いて酸無水物基の加水分解によって調製される。

【0029】

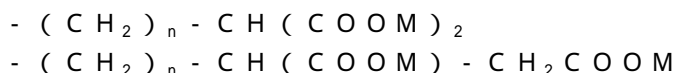
ヒドロシリル化反応は、20 ~ 200 の温度、好ましくは60 ~ 120 の温度で、好ましくは白金カースデッド(KARSTEDT)触媒(白金が1 ~ 300重量ppm、好ましくは5 ~ 50重量ppm)の補助で実施できる。ポリアルキル水素シロキサンと - アルケニル酸無水物の相対的な量は、化学量論的に過剰の - アルケニル酸無水物(ポリアルキル水素シロキサン1モル当り、 - アルケニル酸無水物が多くとも5モル、好ましくはポリアルキル水素シロキサン1モル当り、 - アルケニル酸無水物が多くとも2モル)に相当する。

【0030】

加水分解反応は、水で、室温 ~ 150、好ましくは40 ~ 120 の範囲の温度で、触媒を用いて又は触媒を用いずに実施できる。反応の好適な触媒は、0.05 ~ 5%の範囲の量の、TiCl₄、ZnCl₂、MgCl₂などのルイス酸、又はCH₃COOH、H₂SO₄、HCl、KOH、NaHCO₃などのブレンステッド酸若しくは塩基とすることができる。

【0031】

好ましいポリマー類は、



のジカルボン酸ペンダント基のうちの1つ、又はそれらの組み合わせを有し、式中、nは2 ~ 30である。

【0032】

好ましい実施形態では、官能化ポリオルガノシロキサン中の二酸ペンダント基Aは、 - (CH₂)₃ - CH(COOM) - CH₂COOMであり、ポリマーは、ポリアルキル水素シロキサンと、アリルコハク酸無水物とのヒドロシリル化反応、続いて酸無水物基の加水分解によって調製される。好ましくは、ポリアルキル水素シロキサンは、ポリジメチル水素シロキサンであり、ポリマーはトリメチルシリル基で終端をなす。

【0033】

カルボン酸基は、静電相互作用、水素結合、又はカチオンとの錯化を介して陽イオン性表面及び荷電表面に対する容易な結合/固着を提供する。このような結合により、適用の際、電荷相互作用が駆動力となり、ポリマーは容易に沈着し、処理される表面にコーティングを形成し、同時に、結合が強いほどコーティングは長時間保持される、又は耐久性がある。ポリシロキサン主鎖は、表面を疎水性に改質するが、これは、表面に撥水性、速乾性、染み防止性、洗浄の容易さ、柔軟性、及び潤滑性を含めた特性を付与する。PDMSなどの非官能化ポリシロキサンと比較して、本ポリマーは、コーティングの沈着及び保持の容易さの点だけでなく、より低濃度を必要とすること、及び通常の界面活性剤類と共に処方及び乳化することが容易であるという点で、より良好に機能する。更により有利なことに、本ポリマーは、例えば、漂白剤及び色改変剤を含めた歯ホワイトニング剤、抗菌剤、虫歯予防剤、酵素、化粧品成分、香味料及び芳香剤などの他の活性剤のキャリアの役割をする能力を有し、従って、それらの活性が必要な表面に、活性剤を持続放出するための非常に有効なマトリックスの役割をすることができる。ポリマーコーティングの別の重要な利点は、永続性、又は長時間表面に固着する又は付着する能力である。具体的には、永

10

20

30

40

50

続性は、ポリマーコーティングが処理される表面上に保持され、それによって処理される表面上に沈着した活性剤が迅速に洗い流されることを防止する保護バリアの役割をする能力に関する。永続性は、活性剤と、処理される表面との長時間の接触を可能にするため、永続性は重要である。その結果、表面に送達される漂白、抗菌、虫歯予防、又は他の活性物質の効力が向上する。本発明は、永続的な疎水性コーティングを歯又は他の口腔表面に沈着させる口腔ケア組成物を提供し、該コーティングは、特に繰り返しの使用で、所望の効果を付与するのに十分な時間、保持される。

【 0 0 3 4 】

特に、歯磨剤又は口内洗浄剤などの日常使用する口腔ケア組成物からの漂白剤の送達に関して、疎水性ポリシロキサン主鎖、及びジカルボキシ基を含有するペンダント部分を有する本ポリマーは、特に繰り返しの使用で、漂白剤の送達、及び顕著なホワイトニング効果を提供するのに十分な時間、漂白剤を歯に保持することを促進するのに特に適している。出願者らは、漂白剤を含有する従来の歯磨剤は、漂白剤が十分な時間、歯に保持されないため、一般に、ホワイトニング効果を提供することにおいて無効であることを見出した。従って、漂白剤を沈着させ、長い接触時間、保持する永続的なポリマーの本使用方法は、新規な手法である。

10

【 0 0 3 5 】

本明細書に記載の特定のポリシロキサン構造にもかかわらず、歯に沈着し付着するのに、また漂白活性物質の送達及び保持を促進するのに好適に官能化された他の疎水性ポリマー類が、所望のホワイトニング効果を提供することが予測される。「好適に官能化された」とは、ポリマーが、カルシウムイオンとの錯化などによって、歯の表面と相互作用し、歯の表面上に永続的な疎水性コーティングを形成する官能基を含有することを意味する。表面に「永続的な疎水性コーティングを形成する」とは、例えば、表面の水との接触角の少なくとも約 15° の増大によって測定されるように、表面の疎水特性が増大し、増大した疎水特性が少なくとも約 5 分間維持されることを意味する。例えば、本ジカルボキシ官能化ポリシロキサンを含む組成物で処理した後、歯のエナメル質の水との接触角は、pH、口腔環境の状態、及び歯の表面特性を含めた多数の要因に応じて、約 20° ~ 約 50° にて増大する場合がある。

20

【 0 0 3 6 】

一態様では、本発明は、口腔に許容可能なキャリア中に、ジカルボキシ官能化シロキサンポリマーを少なくとも約 0.1% 含む、日常使用する口腔ケア組成物を提供し、これは、歯に疎水性コーティングを沈着させ、コーティングは、各使用後、少なくとも約 5 分間 ~ 約 8 時間保持される。本口腔用組成物は、全体的な洗浄、歯垢の抑制、ホワイトニング、染み除去、並びに天然歯及び歯科補綴物の染み防止を向上させる。特定の作用機構に限定されることを所望しないが、本官能化シロキサンポリマーのカルボキシ基は、歯の表面に存在する正電荷を有するカルシウムイオンと錯化すると考えられる。カルシウム/ポリマー錯体は、ポリマーが少なくとも 2 つのカルボキシ基を含有し、二価のカルシウムイオンと錯化して 5 員環構造、6 員環構造及び 7 員環構造を形成するとき、特に安定である。このような錯体形成は、歯にポリマーコーティングを沈着及び保持させる駆動力である。歯のポリマーコーティングは、染みがつくこと及び歯垢形成を防止するバリアの役割をすると考えられる。ポリフェノール化合物（カテコール及びタンニン）などの色素体又は染み物質は、お茶、コーヒー、ワイン、コーラ、及び様々な果実類及びベリー類などの種々の食品の構成要素である。これらの食品の摂取で、歯に染み物質の付着を生じることは既知である。本組成物が歯磨き又はすすぎなどによって口腔に適用されるとき、疎水性シロキサンポリマーコーティングが歯に沈着する。従って、色素体が口腔に取り込まれるとき、それらは、歯の表面の替わりにシロキサンポリマーコーティングと接触し、そのため、歯に染みが形成されることを防止する。新しく形成される歯垢が、歯の上に形成されるのを防止することもでき、ポリマーコーティングは歯垢が茶、ビール、赤ワインなどのような摂取製品から有色構成成分を吸収し、歯に染みを形成する能力を抑制する。

30

40

【 0 0 3 7 】

50

更に、本ジカルボキシ官能化ポリマー類は、漂白剤及び他の歯ホワイトニング剤、抗菌剤、フッ化物、減感剤、及び香料などの口腔ケア活性剤のキャリアの役割をし、それらが意図される機能を果たすことができる口腔表面にこれらの活性物質が沈着し、保持されることを促進する能力を有する。また、ポリマーコーティングは、口腔ケア活性物質が口腔表面と密接に接触する状態に保持する保護バリアの役割をし、それによって漂白又は抗菌効果などの活性が更に長続きすることを確実にすると考えられる。効果的な漂白は、染みを除去し、より白い歯に導く。口腔表面上での抗菌剤の保持が向上すると、その結果、歯肉炎、歯周病、及び歯の歯垢を含めた様々な歯の疾病の病原体である口腔微生物、又はそれらの疾病と関連する口腔微生物が減少する。

【0038】

従って、本発明の他の態様では、全体的な洗浄、ホワイトニング、染み除去、並びにヒトの歯及び歯科補綴物における染みの蓄積の防止のために使用する組成物が提供され、該組成物は、口腔に許容可能なキャリア中に、カルボキシ官能化シロキサンポリマーを少なくとも約0.1%、及び歯ホワイトニング剤を約0.1%～約20.0%、好ましくは歯ホワイトニング剤を約1%～約10%の組み合わせを含む。

【0039】

本発明で使用する好適なコポリマーは、ローディア (Rhodia) から入手可能で、プロピルコハク酸ペンダント基を有し、平均分子量 (AMW) が約300～約300,000の範囲のシロキサンポリマーである。好ましいポリマー類は、平均分子量が1000～10,000の範囲であり、シロキシル単位に対するペンダントの二酸基が約1%～75%のものである。ポリマーは、本歯磨剤、リンス、チューインガムなどの組成物中に、約0.1重量%～約20重量%、好ましくは約0.5重量%～約5重量%組み込まれる。これより多く約80%までの量を、ペイントオン若しくはリーブオンゲルなどの口腔用ゲルに、又は義歯接着剤に使用してもよい。

【0040】

本発明の口腔ケア組成物に使用してもよい歯ホワイトニング活性物質には、過酸化物質類、過ホウ酸塩類、過炭酸塩類、過オキシ酸類、過硫酸塩類、金属亜塩素酸塩、及びこれらの組み合わせなどの漂白剤又は酸化剤などが挙げられる。好適な過酸化物質化合物には、過酸化水素、過酸化尿素、過酸化カルシウム及びこれらの混合物が挙げられる。好ましい過炭酸塩は、過炭酸ナトリウムである。他の好適なホワイトニング剤には、過硫酸カリウム、過硫酸アンモニウム、過硫酸ナトリウム及び過硫酸リチウム、並びに過ホウ酸塩一及び四水和物、及びピロリン酸ナトリウム過酸化水素化物 (peroxyhydrate) が挙げられる。好適な金属亜塩素酸塩としては、亜塩素酸カルシウム、亜塩素酸バリウム、亜塩素酸マグネシウム、亜塩素酸リチウム、亜塩素酸ナトリウム及び亜塩素酸カリウムが挙げられる。好ましい亜塩素酸塩は、亜塩素酸ナトリウムである。追加のホワイトニング活性物質は、次亜塩素酸塩及び二酸化塩素であってもよい。

【0041】

本発明の口腔用組成物は、歯磨剤、練り歯磨き、歯磨き粉、局所用口腔用ゲル、口内洗浄剤、義歯製品、口内スプレー、薬用キャンディ、口腔用錠剤又はチューインガムの形態であってもよい。口腔用組成物はまた、口腔表面に直接適用する、又は貼付するストリップ若しくはフィルム上に組み込まれてもよい。

【0042】

水性の形態の本口腔ケア組成物は、最適には、約4.0～約10.0の範囲のpHを有する。組成物の好ましいpHは、約5.0～約8.0である。

前述の構成成分に加えて、本口腔ケア組成物は追加の構成成分を含んでもよく、これらは次の項に記載される。

【0043】

(口腔に許容可能なキャリア)

口腔に許容可能なキャリアは、局所口腔投与に好適な1つ以上の混和性のある固体若しくは液体充填希釈剤、又はカプセル封入物質を含む。本明細書で使用するとき、「混和性

10

20

30

40

50

のある」とは、組成物の構成成分が、組成物の安定性及び/又は有効性を実質的に減少させるような様式で相互作用することなしに混合され得ることを意味する。

【0044】

本発明のキャリア又は賦形剤は、歯磨剤（非研磨剤ゲル及び歯肉縁下適用のためのゲルを含む）、口内洗浄剤、口内スプレー、チューインガム及び薬用キャンディ（口臭予防用ミントを含む）の通常及び従来の構成成分を含むことができるが、それについては以下により詳細に説明する。

【0045】

使用すべきキャリアの選択は、基本的に、組成物を口腔内に導入する方法によって決定される。練り歯磨き（歯磨ゲルなどを含む）を使用する場合は、例えば、米国特許第3,988,433号（ベネディクト（Benedict））に開示されているように、「練り歯磨きキャリア」（例えば、研磨物質、発泡剤、結合剤、保湿剤、香味剤及び甘味剤などを含む）を選択する。口内洗浄剤を使用する場合は、例えば、米国特許第3,988,433号（ベネディクト（Benedict））に開示されているように「口内洗浄剤キャリア」（例えば、水、香味剤及び甘味剤などを含む）を選択する。同様に、口内スプレーを使用する場合には「口内スプレーキャリア」を選択し、薬用キャンディを使用する場合には「薬用キャンディキャリア」（例えば、キャンディベース）を選択するが、キャンディベースは、米国特許第4,083,955号（グラベンステッター（Grabensetter）ら）に開示されており、チューインガムを使用する場合には、例えば、米国特許第4,083,955号（グラベンステッター（Grabensetter）ら）に開示されている「チューインガムキャリア」（例えば、ガムベース、着香剤、甘味剤などを含む）を選択する。小袋を使用する場合、「小袋キャリア」（例えば、小袋バッグ、着香剤及び甘味剤）を選択する。歯肉縁下ゲルを使用する場合（歯周ポケットの中に又は歯周ポケットの周りに活性物質を送達させるため）、例えば、米国特許第5,198,220号（ダマニ（Damani）、1993年3月30日）及び第5,242,910号（ダマニ（Damani）、1993年9月7日）に開示されている、「歯肉縁下ゲルキャリア」を選択する。他の有用なキャリアには、例えば、米国特許第5,213,790号（ルカコヴィク（Lukacovic）ら、1993年5月23日発行）、同5,145,666号（ルカコヴィク（Lukacovic）ら、1992年9月8日発行）及び同5,281,410号（ルカコヴィク（Lukacovic）ら、1994年1月25日発行）、並びに米国特許第4,849,213号（シェーファー（Schaeffer））及び同4,528,180号（シェーファー（Schaeffer））に開示されるもののような二相歯磨剤製剤が挙げられる。本発明の組成物の調製に好適なキャリアは、当該技術分野において周知である。それは、味、価格、貯蔵安定性などのような二次的考察に応じて選択される。

【0046】

本発明の組成物は、歯肉縁下ゲルを含む非研磨剤ゲルの形態であってもよく、これは水性であっても又は非水性であってもよい。水性ゲルは、一般に、増粘剤（約0.1%～約20%）、保湿剤（約10%～約55%）、香味剤（約0.04%～約2%）、甘味剤（約0.1%～約3%）、着色剤（約0.01%～約0.5%）、及び残部の水を含む。その組成物は、虫歯予防剤（フッ化物イオンとして約0.05%～約0.3%）、及び抗結石剤（約0.1%～約13%）を含んでもよい。

【0047】

本発明の組成物はまた、練り歯磨き、歯磨ゲル、及び歯磨き粉のような、歯磨剤の形態であってもよい。このような練り歯磨き及び歯磨ゲルの構成成分は、一般に、1つ以上の、歯科用研磨剤（約5%～約50%）、界面活性剤（約0.5%～約10%）、増粘剤（約0.1%～約5%）、保湿剤（約10%～約55%）、着香剤（約0.04%～約2%）、甘味剤（約0.1%～約3%）、着色剤（約0.01%～約0.5%）、及び水（約2%～約45%）を含む。このような練り歯磨き又は歯磨ゲルはまた、虫歯予防剤（フッ化物イオンとして約0.05%～約0.3%）、及び抗結石剤（約0.1%～約13%）の1つ以上を含んでもよい。歯磨き粉はもちろん、実質的にすべての非液体の構成成分を

含有する。

【0048】

本発明の他の好ましい組成物は、口内スプレーを含む口内洗浄剤である。このような口内洗浄剤及び口内スプレーの構成成分は、典型的には、水（約45%～約95%）、エタノール（約0%～約25%）、保湿剤（約0%～約50%）、界面活性剤（約0.01%～約7%）、着香剤（約0.04%～約2%）、甘味剤（約0.1%～約3%）、及び着色剤（約0.001%～約0.5%）のうちの1つ以上を含む。このような口内洗浄剤及び口内スプレーはまた、虫歯予防剤（フッ化物イオンとして約0.05%～約0.3%）、及び抗結石剤（約0.1%～約3%）の1つ以上を含んでもよい。

【0049】

本発明の他の好ましい組成物は、灌注流体を含む歯科用溶液である。このような歯科用溶液の構成成分は、一般に、水（約90%～約99%）、防腐剤（約0.01%～約0.5%）、増粘剤（0%～約5%）、着香剤（約0.04%～約2%）、甘味剤（約0.1%～約3%）、及び界面活性剤（0%～約5%）のうちの1つ以上を含む。

【0050】

チューインガム組成物は、典型的には、ガムベース（約50%～約99%）、着香剤（約0.4%～約2%）、及び甘味剤（約0.01%～約20%）のうちの1つ以上を含む。

【0051】

用語「薬用キャンディ」とは、本明細書で使用するとき、口臭予防のミントキャンディ、トローチ、香錠、微小カプセル、及び凍結乾燥形態を含めた即溶性の固体形態（ケーキ、ウエファース、薄膜、錠剤）及び圧縮錠を含む。用語「即溶性の固体形態」とは、本明細書で使用するとき、固形剤形を口腔に入れた後、約60秒未満、好ましくは約15秒未満、より好ましくは約5秒未満で固形剤形が溶解することを意味する。即溶性の固体形態については、本発明の譲渡人に譲渡されたPCT国際公開特許WO95/33446及びPCT国際公開特許WO95/11671、米国特許第4,642,903号、米国特許第4,946,684号、米国特許第4,305,502号、米国特許第4,371,516号、米国特許第5,188,825号、米国特許第5,215,756号、米国特許第5,298,261号、米国特許第3,882,228号、米国特許第4,687,662号、米国特許第4,642,903号に開示されている。

【0052】

薬用キャンディには、香味をつけたベース中に治療薬を含む円板形状の固体が挙げられる。そのベースは、硬いシュガーキャンディ、グリセリンゼラチン、又は糖と糖を成形するために十分な粘液との組み合わせであってもよい。これらの剤形は、概ね、レミントン、薬学の科学及び臨床、19版、第II巻、92章、1995年（Remington: The Science and Practice of Pharmacy, 19th Ed., Vol. II, Chapter 92, 1995）に記載されている。薬用キャンディ組成物（圧縮錠剤型）は、典型的には、1つ以上の充填剤（圧縮性糖）、香味剤、及び潤滑剤を含む。本明細書で想到される種類のマイクロカプセルは、米国特許第5,370,864号（ピーターソン（Peterson）ら、1994年12月6日発行）に開示されている。

【0053】

更に別の態様では、本発明は、本組成物を含浸させた歯科用器具を提供する。歯科用器具は、歯及び口腔内のその他の組織に接触するための用具を含み、前記用具には、本ジカルボキシ官能化シロキサンプリマーを含む組成物が含浸される。歯科用器具は、デンタルフロス又はテープ、チップ、ストリップ、フィルム及びポリマー繊維を含めた、含浸された繊維であってもよい。

【0054】

本発明の組成物中に含まれていてもよいキャリア又は口腔ケア賦形剤の種類は、特定の非限定例と共に、次の通りである。

【0055】

10

20

30

40

50

(研磨剤)

本発明の組成物の局所的口腔キャリア中に有用な歯の研磨剤は、多くの異なる物質を含む。選択される物質は、目的の組成物中で混和性があり、象牙質を過度に削らないものでなければならない。好適な研磨剤としては、例えば、ゲル及び沈殿物を含むシリカ、不溶性のポリメタリン酸ナトリウム、水和アルミナ、炭酸カルシウム、オルトリン酸二カルシウム二水和物、ピロリン酸カルシウム、リン酸三カルシウム、ポリメタリン酸カルシウム、並びに尿素及びホルムアルデヒドの粒子状縮合生成物のような樹脂性研磨剤物質が挙げられる。

【 0 0 5 6 】

本組成物に使用する別の種類の研磨剤は、米国特許第 3, 0 7 0, 5 1 0 号 (クーリー (Cooley) 及びグラベンシュテッター (Grabenstetter)、1962年12月25日発行) に記載されている粒子状熱硬化性重合樹脂である。好適な樹脂としては、例えば、メラミン類、フェノール類、尿素類、メラミン - 尿素類、メラミン - ホルムアルデヒド類、尿素 - ホルムアルデヒド類、メラミン - 尿素 - ホルムアルデヒド類、架橋エポキシド類、及び架橋ポリエステル類が挙げられる。

10

【 0 0 5 7 】

様々な種類のシリカ歯科用研磨剤は、歯のエナメル質又は象牙質を過度に研磨させない優れた歯の洗浄及び艶出性能という特有の効果があるので好ましい。他の研磨剤と同様に、本明細書のシリカ研磨艶出物質は、一般に、約 0.1 ~ 約 30 ミクロン、好ましくは約 5 ~ 約 15 ミクロンの範囲の平均粒径を有する。研磨剤は、沈降シリカ又はシリカキセロゲルのようなシリカゲルであってもよく、米国特許第 3, 5 3 8, 2 3 0 号 (ペイダー (Pader) ら、1970年3月2日発行) 及び米国特許第 3, 8 6 2, 3 0 7 号 (ディギュリオ (DiGiulio)、1975年1月21日発行) に記載されている。好ましいのは、W. R. グレース・アンド・カンパニー (W.R. Grace & Company) のダビソン化学部門 (Davis on Chemical Division) から、商品名「シロイド (Syloid)」として市販されているシリカキセロゲルである。J. M. ヒューバー・コーポレーション (J.M. Huber Corporation) により商品名ゼオデント (Zeodent) (登録商標) として市販されているもの、特にゼオデント (登録商標) 1 1 9、ゼオデント (登録商標) 1 1 8、ゼオデント (登録商標) 1 2 8、ゼオデント (登録商標) 1 0 9 及びゼオデント (登録商標) 1 2 9 の名称を有するシリカなどの沈降シリカ材料もまた好ましい。本発明の練り歯磨きに有用なシリカの歯の研磨剤の種類については、米国特許第 4, 3 4 0, 5 8 3 号 (ウェイソン (Wason)、1982年7月29日発行)、並びに本発明の譲受人に共に譲渡された米国特許第 5, 6 0 3, 9 2 0 号 (1997年2月18日発行)、同 5, 5 8 9, 1 6 0 号 (1996年12月31日発行)、同 5, 6 5 8, 5 5 3 号 (1997年8月19日発行)、同 5, 6 5 1, 9 5 8 号 (1997年7月29日発行)、同 5, 7 1 6, 6 0 1 号 (1998年2月10日発行)、及び米国特許仮出願番号 6 0 / 3 0 0 7 6 6 (2001年6月25日出願) に、更に詳細に記載されている。

20

30

【 0 0 5 8 】

研磨剤の混合物を使用することができる。本発明の歯磨剤組成物中の研磨剤の合計量は、好ましくは約 6 重量% ~ 約 7 0 重量% であり、練り歯磨きは、好ましくは組成物の約 1 0 重量% ~ 約 5 0 重量% の研磨剤を含有する。本発明の溶液、口内スプレー、口内洗浄剤及び非研磨ゲル組成物は、典型的には研磨剤を含有しない。

40

【 0 0 5 9 】

(界面活性剤)

本発明の任意成分の 1 つは、界面活性剤であり、好ましくは、サルコシネート界面活性剤類、イセチオネート界面活性剤類、及びタウレート界面活性剤類からなる群から選択されるものである。本明細書に用いるのに好ましいのは、これらの界面活性剤のアルカリ金属塩又はアンモニウム塩である。本明細書において最も好ましいのは、ラウロイルサルコシネート、ミリストイルサルコシネート、パルミトイルサルコシネート、ステアロイルサルコシネート及びオレオイルサルコシネートのナトリウム塩とカリウム塩である。

50

【0060】

この界面活性剤は、本発明の組成物中に、全組成物の約0.1重量%～約2.5重量%、好ましくは約0.3重量%～約2.5重量%、最も好ましくは約0.5重量%～約2.0重量%で存在し得る。

【0061】

他の好適な混和性のある界面活性剤類を、本発明の組成物中に、任意に、又はサルコシネート界面活性剤と組み合わせて使用できる。好適な任意界面活性剤は、米国特許第3,959,458号(アグリコラ(Agricola)ら、1976年5月25日)、米国特許第3,937,807号(エーフル(Haefele)、1976年2月10日)、及び米国特許第4,051,234号(ギースケ(Gieske)ら、1988年9月27日)に更に完全に記載されている。

10

【0062】

本明細書で有用な好ましい陰イオン性界面活性剤としては、アルキルラジカルの炭素原子数が10～18個である水溶性のアルキル硫酸塩、及び炭素原子数10～18個の脂肪酸のスルホン化モノグリセリドの水溶性塩が挙げられる。ラウリル硫酸ナトリウム及びココナツモノグリセリドスルホン酸ナトリウムは、この種類の陰イオン性界面活性剤の例である。陰イオン性界面活性剤の混合物も使用できる。

【0063】

本発明に有用な好ましい陽イオン性界面活性剤は、約8～18個の炭素原子を含有する1つのアルキル長鎖を有する脂肪族四級アンモニウム化合物の誘導体として広く定義されることができ、例えば、ラウリルトリメチルアンモニウムクロリド、セチルピリジニウムクロリド、セチルトリメチルアンモニウムブロミド、ジ-イソブチルフェノキシエチル-ジメチルベンジルアンモニウムクロリド、ココナツアルキルトリメチルアンモニウムニトライト、セチルピリジニウムフルオリドなどである。好ましい化合物は四級アンモニウムフッ化物であり、米国特許第3,535,421号(1970年10月20日ブライナー(Briner)ら)に記載されているが、ここで、該四級アンモニウムフッ化物は、洗剤の特性を有する。特定の陽イオン性界面活性剤はまた、本明細書に開示された組成物中で殺菌剤としても作用することができる。クロルヘキシジンのような陽イオン性界面活性剤は、本発明に用いるのに好適であるが、口腔の硬組織に染みをつける可能性があるために好ましくない。当業者はこの可能性について承知しており、この制限を念頭において陽イオン性界面活性剤を組み込むべきである。

20

30

【0064】

本発明の組成物に用い得る好ましい非イオン性界面活性剤は、アルキレンオキシド基(本質的には親水性)と、本質的には脂肪族又はアルキル芳香族であってもよい有機疎水性化合物との縮合によって生成される化合物として広く定義されることができ、好適な非イオン性界面活性剤の例としては、プルロニック、アルキルフェノールのポリエチレンオキシド縮合物、プロピレンオキシドとエチレンジアミンとの反応生成物とエチレンオキシドとの縮合から得られた生成物、脂肪族アルコールのエチレンオキシド縮合物、長鎖三級アミンオキシド、長鎖三級ホスフィンオキシド、長鎖ジアルキルスルホキシド、及びこのような物質の混合物が挙げられる。

40

【0065】

本発明で有用な好ましい双性イオン性合成界面活性剤は、脂肪族四級アンモニウム、ホスホニウム及びスルホニウム化合物の誘導体として広く定義されることができ、その脂肪族基は直鎖又は分枝鎖であってもよく、その際脂肪族置換基の1つは約8～約18個の炭素原子を含有し、1つは、例えば、カルボキシ、スルホネート、サルフェート、ホスフェート又はホスホネートのような陰イオン性水溶性基を含有する。

【0066】

好ましいベタイン界面活性剤は、米国特許第5,180,577号(ポールフカ(Polefka)ら、1993年1月19日発行)に開示されている。典型的なアルキルジメチルベタインには、デシルベタイン又は2-(N-デシル-N,N-ジメチルアンモニオ)アセ

50

テート、ココベタイン又は2-(N-ココ-N,N-ジメチルアンモニオ)アセテート、ミリスチルベタイン、パルミチルベタイン、ラウリルベタイン、セチルベタイン、セチルベタイン、ステアリルベタインなどが挙げられる。アミドベタインは、ココアミドエチルベタイン、ココアミドプロピルベタイン、ラウラミドプロピルベタインなどにより例示される。選択されるベタインは、好ましくはココアミドプロピルベタイン、より好ましくはラウラミドプロピルベタインである。

【0067】

(抗結石剤)

本組成物はまた、抗結石剤、好ましくは、ポリアクリレート、及び例えば、米国特許第4,627,977号(ガファー(Gaffar)ら)に記載されている無水マレイン酸又はマレイン酸とメチルビニルエーテルとのコポリマー(例えば、ガントレズ(Gantrez))、並びに例えば、ポリアミノプロパンスルホン酸(AMPS)、クエン酸亜鉛三水和物、ポリペプチド(例えば、ポリアスパラギン酸及びポリグルタミン酸)、及びこれらの混合物を含めた合成陰イオン性ポリマーを含んでもよい。

10

【0068】

(キレート化剤)

別の好ましい任意試剤は、酒石酸及びその製薬上許容できる塩、クエン酸及びアルカリ金属クエン酸塩、並びにこれらの混合物のようなキレート化剤である。キレート化剤は、細菌の細胞壁に見出されるカルシウムを錯体にすることができる。キレート化剤はまた、このバイオマスが損なわれないうように保持するのを助けるカルシウムの架橋からカルシウムを取り除くことにより歯垢を崩壊させることができる。しかしながら、カルシウムが高すぎる親和性を有するキレート化剤を用いることは結果として歯の脱鈣質化をもたらす可能性があり、これは本発明の目的及び意図に反するために、望ましくない。

20

【0069】

クエン酸ナトリウム及びクエン酸カリウムは、好ましいアルカリ金属クエン酸塩であり、クエン酸ナトリウムが最も好ましい。また好ましいのは、クエン酸/アルカリ金属クエン酸塩の組み合わせである。本明細書で好ましいのは、酒石酸のアルカリ金属塩である。本明細書に用いるのに最も好ましいのは、酒石酸二ナトリウム、酒石酸二カリウム、酒石酸カリウムナトリウム、酒石酸水素ナトリウム及び酒石酸水素カリウムである。本発明に用いるのに好適なキレート化剤の量は、約0.1%~約2.5%、好ましくは約0.5%~約2.5%、より好ましくは約1.0%~約2.5%である。酒石酸塩キレート化剤は、単独でも又は他の任意キレート化剤と組み合わせても用いることができる。好ましくはこれらのキレート化剤は、カルシウム結合定数が約 $10^1 \sim 10^5$ であり、洗浄を改善し、歯垢及び結石の形成を減少させる。

30

【0070】

本発明で使用するのに好適なキレート化剤の更に別の可能性のある群は、陰イオン性高分子ポリカルボキシレートである。こうした物質は当該技術分野において周知であり、その遊離酸又は部分的に若しくは好ましくは完全に中和された水溶性アルカリ金属塩(例えば、カリウム、好ましくはナトリウム)若しくはアンモニウム塩の形態で使用される。無水マレイン酸又はマレイン酸と、別の重合可能なエチレン性不飽和モノマー、好ましくはメチルビニルエーテル(メトキシエチレン)との、平均分子量(AMW)が、約30,000~約1,000,000の1:4~4:1のコポリマーが好ましい。これらのコポリマーは、例えば、GAFケミカルズコーポレーション(GAF Chemicals Corporation)のガントレズ(Gantrez)AN139(AMW500,000)、AN119(AMW250,000)、好ましくはS-97医薬品等級(AMW70,000)として入手可能である。

40

【0071】

他の有効な高分子ポリカルボキシレート類には、無水マレイン酸とエチルアクリレート、ヒドロキシエチルメタクリレート、N-ビニル-2-ピロリドン又はエチレンとの1:1コポリマー(後者は、例えば、モンサント(Monsanto)EMA No.1103、AM

50

W10, 000及びEMA等級61として入手可能である)及びアクリル酸とメチルメタクリレート若しくはヒドロキシエチルメタクリレート、メチルアクリレート若しくはエチルアクリレート、イソブチルビニルエーテル又はN-ビニル-2-ピロリドンとの1:1コポリマー等が挙げられる。

【0072】

追加の有効な高分子ポリカルボキシレート類は、米国特許第4,138,477号(ガファル(Gaffar)、1979年2月6日)、及び米国特許第4,183,914号(ガファル(Gaffar)ら、1980年1月15日)に開示されており、無水マレイン酸とスチレン、イソブチレン又はエチルビニルエーテルとのコポリマー;ポリアクリル酸、ポリイタコン酸及びポリマレイン酸;並びにユニロイヤル(Uniroyal)ND-2として入手可能な、AMWが1,000ほどに低いスルホアクリルオリゴマーが挙げられる。

10

【0073】

(フッ化物供給源)

25で組成物中にフッ化物イオン濃度をもたらすのに十分な量で、追加の水溶性フッ化物化合物を歯磨剤及び他の口腔用組成物中に存在させることは一般的であり、及び/又はそれが約0.0025重量%~約5.0重量%、好ましくは0.005重量%~約2.0重量%で用いられた場合に、追加の虫歯予防効果を提供する。様々なフッ化物イオン生成物質が、本組成物中の可溶性フッ化物の供給源として使用され得る。好適なフッ化物イオン生成物質の例が、米国特許第3,535,421号(ブライナー(Briner)ら、1970年10月20日発行)及び米国特許第3,678,154号(ウィダー(Widder)ら、1972年7月18日発行)に見られる。代表的なフッ化物イオン供給源には、フッ化第一スズ、フッ化ナトリウム、フッ化カリウム、モノフルオロリン酸ナトリウム、及び他の多くのものが挙げられる。フッ化第一スズ及びフッ化ナトリウムと同様に、これらの混合物も特に好ましい。

20

【0074】

(歯ホワイトニング剤及び歯色改変物質)

歯のホワイトニング剤としての漂白剤に加えて、歯色改変物質が本発明に有用な口腔ケア活性物質の中に考慮されてもよい。これらの物質は、歯の色を改変するのに適しており、消費者を満足させる。これらの物質は、歯の表面に適用されると、光の吸収及び、又は反射に関してその表面を改質する粒子を含む。このような粒子を含有するフィルムが1本の又は複数の歯の表面に適用されると、このような粒子は外観上の効果を提供する。

30

【0075】

本発明に最も有用な粒子には、化粧品技術に日常的に使用される顔料及び着色料が含まれる。本組成物に使用される顔料及び、又は着色料については、歯の表面に当てる光源に及ぼす効果の制限以外に、特別な制限はない。顔料及び着色料には、無機白色顔料、無機着色顔料、真珠化剤、増量剤粉末などが挙げられ、日本公開特許 特開平9-100215(1997年4月15日発行)を参照のこと。具体例は、タルク、雲母、炭酸マグネシウム、炭酸カルシウム、ケイ酸マグネシウム、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、シリカ、二酸化チタン、酸化亜鉛、赤色酸化鉄、褐色酸化鉄、黄色酸化鉄、黒色酸化鉄、フェロシアン化アンモニウム鉄、マンガンバイオレット、ウルトラマリン、ナイロン粉末、ポリエチレン粉末、メタクリレート粉末、ポリスチレン粉末、絹粉末、結晶性セルロース、デンプン、チタン酸雲母、酸化鉄チタン酸雲母、オキシ塩化ビスマス及びこれらの混合物よりなる群から選択される。最も好ましいのは、二酸化チタン、オキシ塩化ビスマス、酸化亜鉛及びこれらの混合物からなる群より選択されるものである。一般に安全であると認識される顔料は、C.T.F.A.化粧品原料便覧(Cosmetic Ingredient Handbook)、第3版、化粧品工業会、ワシントンD.C.(1982年)に列挙されている。

40

【0076】

顔料は、典型的には、不透明化剤及び着色料として使用される。これらの顔料は、処理された粒子として、又は未処理の顔料そのものとして使用することができる。典型的な顔料の濃度は、消費者が所望する特別な影響力に対して選択される。例えば、典型的には、

50

特に濃い色の歯、又は染みのある歯には、歯の色を薄くするのに十分な量の顔料を使用する。これに対して、個々の歯又は歯の染みが他の歯よりも色が薄ければ、歯の色を濃くする顔料が有用な場合がある。顔料及び着色料の濃度は、一般に、組成物の約0.05%～約20%、好ましくは約0.10%～約15%、最も好ましくは約0.25%～約10%の範囲で使用される。

【0077】

(増粘剤)

練り歯磨き又はゲルを調製する際に、組成物の望ましい稠度を提供するため、使用の際に望ましい活性物質放出特性を提供するため、貯蔵安定性を提供するため、及び組成物の安定性を提供するためなどに、幾らかの増粘物質を添加することが必要である。好ましい増粘剤は、カルボキシビニルポリマー、カラゲナン、ヒドロキシエチルセルロース、ラポナイト (Laponite)、並びにカルボキシメチルセルロースナトリウム及びカルボキシメチルヒドロキシエチルセルロースナトリウムなどのセルロースエーテルの水溶性塩である。カラヤゴム、キサントガム、アラビアゴム、及びトラガカントゴムなどの天然ゴムも使用することができる。更に質感を改善するために、コロイド状ケイ酸アルミニウムマグネシウム又は微粉碎シリカを、増粘剤の一部として使用することができる。

10

【0078】

増粘剤又はゲル化剤の好ましい部類としては、ペンタエリスリトールのアルキルエーテル若しくはスクロースのアルキルエーテルで架橋されたアクリル酸のホモポリマー、又はカルボマーの部類が挙げられる。カルボマーは、B.F.グッドリッチからカーボポール (Carbopol) (登録商標) シリーズとして市販されている。特に好ましいカーボポール (Carbopol) としては、カーボポール (Carbopol) 934、940、941、956、及びこれらの混合物が挙げられる。

20

【0079】

ラクチドとグリコリドモノマーとのコポリマーである、約1,000～約120,000(数平均)の範囲の分子量を有するコポリマーは、「歯肉縁下ゲルキャリア」として歯周ポケットの中又は歯周ポケットの周りに活性物質を送達するのに有用である。これらのポリマーは、米国特許第5,198,220号(ダマニ(Damani)、1993年3月30日発行)及び同5,242,910号(ダマニ(Damani)、1993年9月7日発行)、並びに同4,443,430号(マテイ(Mattei)、1984年4月17日発行)に記載されている。

30

【0080】

練り歯磨き又はゲル組成物全体の約0.1重量%～約15重量%、好ましくは約2重量%～約10重量%、より好ましくは約4重量%～約8重量%の量の増粘剤を使用することができる。チューインガム、薬用キャンディ(口臭予防用ミントキャンディを含む)、小袋、非研磨ゲル及び歯肉縁下ゲルには、より高濃度で使用することができる。

【0081】

(保湿剤)

本発明の組成物の局所的口腔キャリアの別の任意構成成分は保湿剤である。保湿剤は、練り歯磨き組成物が空気に曝されて硬化しないようにしたり、口への潤い感を組成物に与えたり、及び特定の保湿剤については練り歯磨き組成物に望ましい甘い香味を付与するのに役立つ。保湿剤は、純粋な保湿剤を基準にすると、一般に本明細書の組成物の約0重量%～約70重量%、好ましくは約5重量%～約25重量%を構成する。本発明の組成物中に用いるのに好適な保湿剤としては、グリセリン、ソルビトール、キシリトール、ブチレングリコール、ポリエチレングリコール及びプロピレングリコールのような食用多価アルコール、特にソルビトール及びグリセリンが挙げられる。

40

【0082】

(香味剤及び甘味剤)

本組成物には香味剤もまた添加することができる。好適な着香剤としては、ウインターグリーン油、ペパーミント油、スペアミント油、クローブの芽の油、メントール、アネト

50

ール、サリチル酸メチル、オイカリプトール、カシヤ、1-メンチルアセテート、セージ、オイゲノール、オランダセリ油、オキサノン(oxanone)、イリゾン、マジヨラム、レモン、オレンジ、プロペニルグエトール、シナモン、バニリン、チモール、リナロール、CGAとして知られるシンナムアルデヒドグリセロールアセタール、及びこれらの混合物が挙げられる。着香剤は、一般に組成物中で、組成物の約0.001重量%~約5重量%の濃度で用いられる。

【0083】

使用できる甘味剤としては、スクロース、グルコース、サッカリン、ブドウ糖、果糖、ラクトース、マンニトール、ソルビトール、フルクトース、マルトース、キシリトール、サッカリン塩、タウマチン、アスパルテーム、D-トリプトファン、ジヒドロカルコン、アセスルファム及びシクラメート塩、特にシクラメートナトリウム及びサッカリンナトリウム、並びにこれらの混合物が挙げられる。組成物は、これらの試剤を組成物の約0.1重量%~約10重量%、好ましくは約0.1重量%~約1重量%含有するのが好ましい。

10

本発明の組成物では、任意成分として、香味剤及び甘味剤に加え、冷却剤、唾液分泌剤、加温剤及び局部麻酔剤を使用することができる。これらの剤は組成物中に、組成物の約0.001重量%~約10重量%、好ましくは約0.1重量%~約1重量%の濃度で存在する。

【0084】

冷却剤は、様々な物質のいずれかとすることができる。このような物質に含まれるのは、カルボキサミド、メントール、ケタール、ジオール、及びこれらの混合物である。本組成物に好ましい冷却剤は、「WS-3」として商業的に既知であるN-エチル-p-メンタン-3-カルボキサミド、「WS-23」として既知であるN,2,3-トリメチル-2-イソプロピルプタンアミド、及びこれらの混合物などの、パラメンタンカルボキサミド剤である。追加の好ましい冷却剤は、メントール、高砂(Takasago)製のTK-10として既知である3-1-メントキシプロパン-1,2-ジオール、ハーマン・アンド・ライマー(Haarmann and Reimer)製のMGAとして既知であるメントングリセロールアセタール、及びハーマン・アンド・ライマー(Haarmann and Reimer)製のフレスコラト(Frescolat)(登録商標)として既知であるメンチルラクテートからなる群から選択される。本明細書で使用するとき、メントール及びメンチルという用語には、これらの化合物の右旋性異性体及び左旋性異性体、並びにこれらのラセミ混合物が含まれる。TK-10については、米国特許第4,459,425号(アマノ(Amano)ら、1984年7月10日発行)に記載されている。WS-3及び他の剤は、米国特許第4,136,163号(ワトソン(Watson)ら、1979年1月23日発行)に記載されている。

20

30

【0085】

本発明の好ましい唾液分泌剤としては、高砂(Takasago)製のジャンブ(Jambu)(登録商標)が挙げられる。好ましい加温剤としては、トウガラシ、及びベンジルニコチネートのようなニコチネートエステルが挙げられる。好ましい局部麻酔剤としては、ベンゾカイン、リドカイン、クローブの芽の油、及びエタノールが挙げられる。

【0086】

(アルカリ金属重炭酸塩)

40

本発明はまたアルカリ金属重炭酸塩を含んでもよい。アルカリ金属重炭酸塩は水溶性であり、安定化されていない場合には、水性系で二酸化炭素を放出する傾向がある。重曹としても既知である重炭酸ナトリウムは、好ましいアルカリ金属重炭酸塩である。本組成物は、アルカリ金属重炭酸塩を約0.5%~約30%、好ましくは約0.5%~約15%、最も好ましくは約0.5%~約5%含有してもよい。

【0087】

(その他のキャリア)

商業的に好適な口腔用組成物の調製に用いられる水は、好ましくはイオン含有量が低く、有機不純物を含まないことが必要である。水は一般に、本明細書の水性組成物の約5重量%~約70重量%、好ましくは約20重量%~約50重量%を構成する。この水の量に

50

は、添加される遊離水に加えて、ソルビトールなど他の物質と共に導入される水が含まれる。

【 0 0 8 8 】

ポロキサマーを本組成物に使用してもよい。ポロキサマーは、非イオン性界面活性剤として分類される。これは、乳化剤、結合剤、安定剤、及び他の関連機能として機能してもよい。ポロキサマーは、一級ヒドロキシ基で末端をなす二官能性ブロックポリマーであり、分子量が 1,000 ~ 15,000 の範囲である。ポロキサマーは、BASF によりプルロニクス (Pluronic) 及びプルラフロ (Pluraflo) の商品名で販売されている。本発明に好ましいポロキサマーは、ポロキサマー (Poloxamer) 407 及びプルラフロ (Pluraflo) L4370 である。

10

【 0 0 8 9 】

本組成物に使用してもよい他の乳化剤には、B.F.グッドリッチ (B.F.Goodrich) から入手可能なペミュレン (Pemulen) (登録商標) シリーズなどのポリマー乳化剤が挙げられ、これは、主に疎水性物質用の乳化剤として有用な高分子量のポリアクリル酸ポリマー類である。

二酸化チタンもまた本組成物に添加されてもよい。二酸化チタンは、組成物に不透明度を加える白色粉末である。二酸化チタンは、一般に、歯磨剤組成物の約 0.25 重量% ~ 約 5 重量% を構成する。

【 0 0 9 0 】

本組成物の pH は、好ましくは緩衝剤の使用により調整される。本明細書で使用するとき、緩衝剤とは、組成物の pH を約 pH 4.0 ~ 約 pH 10.0 の範囲に調整するために用いることができる試剤を指す。緩衝剤には、リン酸一ナトリウム、リン酸三ナトリウム、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム、酸性ピロリン酸ナトリウム (sodium acid pyrophosphate)、クエン酸、及びクエン酸ナトリウムが挙げられる。緩衝剤は、本組成物の約 0.5 重量% ~ 約 10 重量% の濃度で投与され得る。歯磨剤組成物の pH は、例えば、水が 3 部に対して歯磨剤 1 部である、3 : 1 の水性スラリーの歯磨剤から測定する。

20

【 0 0 9 1 】

本組成物中に用いられてもよい他の任意の試剤には、アルキルジメチコンポリオール及びアルコキシジメチコンポリオールから選択されるジメチコンポリオール、例えば、C12 ~ C20 アルキルジメチコンポリオール及びこれらの混合物が挙げられる。非常に好ましいのは、商品名アビル (Abil) EM90 で市販されているセチルジメチコンポリオールである。ジメチコンポリオールは、一般に、約 0.01 重量% ~ 約 25 重量%、好ましくは約 0.1 重量% ~ 約 5 重量%、より好ましくは約 0.5 重量% ~ 約 1.5 重量% の濃度で存在する。ジメチコンポリオールは、歯の良い感触の効果を提供するのに役立つ。

30

【 0 0 9 2 】

(その他の活性剤)

本口腔用組成物はまた、抗菌剤などの他の活性剤を含んでもよい。こうした剤の中に含まれるのは、ハロゲン化ジフェニルエーテル、フェノール及びその同族体を含めたフェノール化合物、モノアルキル及びポリアルキル並びに芳香族ハロフェノール類、レゾルシノール及びその誘導体、ビスフェノール化合物及びハロゲン化サリチルアニリド類、安息香酸エステル類及びハロゲン化カルバニリド類のような水不溶性非陽イオン性抗菌剤である。水溶性抗菌剤には、とりわけ四級アンモニウム塩類及びビス - ピクアニド塩類が挙げられる。トリクロサンモノホスフェートは、補助的な水溶性抗菌剤である。四級アンモニウム剤には、四級窒素上の置換基のうちの 1 つ又は 2 つが炭素原子数約 8 ~ 約 20 個、典型的には約 10 ~ 約 18 個の炭素鎖長 (典型的にはアルキル基) を有する一方、残りの置換基 (典型的にはアルキル基又はベンジル基) は、炭素原子数約 1 ~ 約 7 個などの、より少ない炭素原子数、典型的にはメチル基又はエチル基を有するものが挙げられる。臭化ドデシルトリメチルアンモニウム、塩化テトラデシルピリジニウム、臭化ドミフェン、塩化 N - テトラデシル - 4 - エチルピリジニウム、臭化ドデシルジメチル (2 - フェノキシエチ

40

50

ル)アンモニウム、塩化ベンジルジメチルステアリルアンモニウム、塩化セチルピリジニウム、四級化5-アミノ-1,3-ビス(2-エチル-ヘキシル)-5-メチル-ヘキサヒドロピリミジン、及び塩化メチルベンゼトニウムは、典型的な四級アンモニウム抗細菌剤の代表例である。その他の化合物は、米国特許第4,206,215号(ベイリー(Bailey)、1980年6月3日発行)に開示されているようなビス[4-(R-アミノ)-1-ピリジニウム]アルカンである。また、ビスグリシン酸銅、グリシン酸銅、クエン酸亜鉛、及び乳酸亜鉛のような他の抗菌剤も包含されてもよい。酵素は、本組成物に使用されてもよい別の種類の活性物質である。有用な酵素には、プロテアーゼ、溶解酵素、歯垢マトリックス抑制物質及びオキシダーゼの分類に属するものが挙げられ、プロテアーゼには、パパイン、ペプシン、トリプシン、フィシン、プロメリンなどが挙げられ;細胞壁溶解酵素にはリゾチームが挙げられ;歯垢マトリックス抑制物質には、デキストラナーゼ、ミュータナーゼが挙げられ;オキシダーゼにはグルコースオキシダーゼ、ラクテートオキシダーゼ、ガラクトースオキシダーゼ、尿酸オキシダーゼ、ペルオキシダーゼ(ホースラディッシュペルオキシダーゼ、ミエロペルオキシダーゼ、ラクトペルオキシダーゼ、クロロペルオキシダーゼを含める)が挙げられる。オキシダーゼはまた、抗菌特性に加えて、ホワイトニング/洗浄活性も有する。こうした剤は、米国特許第2,946,725号(ノリス(Norris)ら、1960年7月26日)、及び米国特許第4,051,234号(ギースキー(Gieske)ら、1977年9月27日)に開示されている。他の抗菌剤には、クロルヘキシジン、トリクロサン、トリクロサン-リン酸塩、及び香味油(チモールなど)が挙げられる。トリクロサン及びこの種類の他の剤は、米国特許第5,015,466号(パーラン・ジュニア(Parran,Jr)ら、1991年5月14日発行)、及び米国特許第4,894,220号(ナビ(Nabi)ら、1990年1月16日)に開示されている。抗歯垢の効果を提供するこれらの試剤は、歯磨剤組成物の約0.01重量%~約5.0重量%の濃度で存在してもよい。

【0093】

(使用方法)

本発明はまた歯の洗浄及び艶出し、並びに染み、歯垢、歯肉炎及び結石などの歯のエナメル質上での発生を減少する方法にも関する。

【0094】

本明細書の使用法は、使用者の歯のエナメル質表面及び口腔粘膜に、本発明による口腔用組成物を接触させることを含む。使用法は、歯磨剤を用いるブラッシング、歯磨剤スラリー若しくは口内洗浄剤を用いるすすぎ、又はガム製品の咀嚼によってもよい。他の方法には、局所口腔用ゲル、口内スプレー、又はストリップ若しくはフィルムなどの他の形態を被験者の歯及び口腔粘膜と接触させることが挙げられる。組成物を、ブラシ、ペンアプリーケータ、若しくはドーズフットアプリーケータ(doe's foot applicator)などで、又は更には指で、歯、歯肉、若しくは他の口腔表面に直接適用してもよい。対象は、その歯の表面が口腔用組成物に接触する、いかなるヒト又は他の動物であってもよい。「他の動物」とは、家庭用ペット、又は他の家畜、又は捕獲されている動物を含むものとする。例えば、使用方法には、イヌの歯を歯磨剤組成物の1つを用いてブラッシングすることが挙げられる。別の例には、効果を確認するのに十分な時間、ネコの口を口腔用組成物ですすぐことが挙げられる。ペットのケア製品、例えば、チューズ(chews、かんでよい犬用おもちゃ)及びおもちゃを、本口腔用組成物を含有するように配合してもよい。本コポリマーを含む組成物は、比較的柔軟であるが強く丈夫な材料、例えば、生皮、天然繊維又は合成繊維製のロープ、及びナイロン、ポリエステル又は熱可塑性ポリウレタン製のポリマー物品に組み込まれる。動物が製品を噛む、なめる又はかじるときに、組み込まれた活性要素が動物の口腔内の唾液媒体内に放出され、効果的なブラッシング又はすすぎに匹敵する。

【実施例】

【0095】

次の実施例は本発明の範囲内の実施形態を更に記載し例示する。これらの実施例は単に

例示することが目的であり、本発明の制限として解釈されるべきでなく、これらの多くの変更が発明の精神及び範囲から逸脱することなく可能である。特に指定しない限り、本明細書で使用される割合は全て組成物の重量によるものである。

【0096】

(実施例1)

(ペンダント - $(\text{CH}_2)_3 - \text{CH}(\text{COOH}) - \text{CH}_2\text{COOH}$ 基を有するジカルボキシ官能化ポリジメチルシロキサンの調製)

500 ml の反応容器に、アリルコハク酸無水物 93.7 g (即ち、0.67 mol)、トルエン 52 g、及びカードテッド (Kardtedt) 触媒溶液 1.01 g (ヘキサメチルジシロキサン中に Pt が 0.1%) を添加する。反応マスを 90 に加熱し、式 $\text{Me}_3\text{SiO}(\text{SiMe}_2\text{O})_9(\text{SiMeHO})_4\text{SiMe}_3$ を有し、3.75 mol の SiH/kg を含有するポリジメチル水素シロキサン 120 g (即ち、SiH が 0.45 mol) を 3 時間にわたって添加する。添加終了時に変換されている SiH の量 (ガゾメトリー (gazoetry) によって決定される) は、96.1% であり、添加終了の 2 時間後は 100% である。揮発性物質は、真空下 (0.3 kPa (3 mbar))、150 で 10 時間にわたる蒸発で除去される。次いで、無水コハク酸官能基を加水分解するため、脱塩水 15 g を添加する。加水分解反応の後、赤外線分析を行う (酸の吸収帯は 1714 cm^{-1} 、酸無水物の吸収帯は 1863 及び 1782 cm^{-1})。加水分解反応が完了したとき (48 時間)、水を共沸により除去するためトルエン 100 g を添加する。粘稠な油 133.5 g (収量 82% に対応する) が回収される。

得られた生成物の一般構造式 $\text{Me}_3\text{SiO}(\text{SiMe}_2\text{O})_9(\text{SiMeAO})_4\text{SiMe}_3$ が、NMR 分析によって確認され、式中、A は、 $-(\text{CH}_2)_3 - \text{CH}(\text{COOH}) - \text{CH}_2\text{COOH}$ を表す。

【0097】

(実施例2)

(ペンダント - $(\text{CH}_2)_3 - \text{CH}(\text{COOH}) - \text{CH}_2\text{COOH}$ 基を有するジカルボキシ官能化ポリジメチルシロキサンの調製)

500 ml の反応容器に、アリルコハク酸無水物 49.8 g (即ち、0.36 mol)、トルエン 44 g、及びカードテッド (Kardtedt) 触媒溶液 1.139 g (ヘキサメチルジシロキサン中に Pt が 0.1%) を添加する。反応マスを 90 に加熱し、式 $\text{Me}_3\text{SiO}(\text{SiMe}_2\text{O})_{100}(\text{SiMeHO})_{15}\text{SiMe}_3$ を有し、1.77 mol の SiH/kg を含有するポリジメチル水素シロキサン 150.3 g (即ち、SiH が 0.266 mol) を 1 時間にわたって添加する。添加終了時に変換されている SiH の量 (ガゾメトリー (gazometry) によって決定される) は、86% であり、添加終了の 16 時間後は 100% である。揮発性物質は、真空下 (0.6 kPa (6 mbar))、150 で 10 時間にわたる蒸発で除去される。トルエン 101 g を添加し、反応マスを濾過する。次いで、無水コハク酸官能基を加水分解するため、脱塩水 6.7 g を添加する。加水分解反応の後、赤外線分析を行う (酸の吸収帯は 1714 cm^{-1} 、酸無水物の吸収帯は 1866 及び 1788 cm^{-1})。加水分解反応が完了したとき (6 日)、水を共沸により除去する。粘稠な油 146.3 g (収量 80% に対応する) が回収される。

得られた生成物の一般構造式 $\text{Me}_3\text{SiO}(\text{SiMe}_2\text{O})_{100}(\text{SiMeAO})_{15}\text{SiMe}_3$ が、NMR 分析によって確認され、式中、A は、 $-(\text{CH}_2)_3 - \text{CH}(\text{COOH}) - \text{CH}_2\text{COOH}$ を表す。

【0098】

(実施例3)

研磨されたウシのエナメル質表面に 1% 溶液として適用される、官能化シロキサンポリマー類の保持

研磨されたウシのエナメル質表面に 1% 溶液として適用される、本発明によるジカルボキシ官能化シロキサンポリマー類の沈着及び保持を、他の官能基を含有する他のシロキサンポリマーと比較する。異なるシロキサンポリマー類の溶液を、MIBK (メチルイソブ

10

20

30

40

50

チルケトン) 中 1% の濃度で調製した。各溶液 6 l を樹脂中に固定された、約 1 cm^2 の表面積を有する、清浄で研磨されたウシのエナメル質標本に直接適用した。溶液を周囲条件下で蒸発させ、初期の水との接触角 (WCA) をクリュス DSA-10 システムを使用して測定した。次いで、エナメル質標本を超純水中に 5 分間浸漬し、空気乾燥させた後、水との接触角を再測定した。次いで、標本をブラッシング機 (150 g の圧力でオーラル B (Oral-B) の頭部が平坦な歯ブラシと重なる V-8) で、水を用いて、1 分間及び 10 分間ブラッシングし、WCA を各インターバルで再測定した。本研究では未処理のエナメル質標本が対照として含まれた。結果を以下の表 I に要約する。酸無水物及びその加水分解された二酸で官能化されたシロキサンポリマーは、表面の疎水性がより大きいことを示す比較的高い WCA 値で実証されるように、ウシのエナメル質ブラッシング模型で最良の保持特性を示し、これは、10 分間のブラッシング後でさえ維持された。

10

【0099】

【表 1】

(表 I. 官能化シロキサンポリマー類で処理されたウシのエナメル質表面の水との接触角)

シロキサンポリマーの官能基	平均分子量	処理後のWCA	5分 H2O浸漬	1分ブラッシング	10分ブラッシング
ポリエーテル	15000	25.70	34.35	35.32	
アミン	17000	65.86	61.12	54.56	
ポリエーテル/ポリオール	14000	83.19	85.01	51.68	
プロピルコハク酸無水物	1600	92.31	90.00	91.46	92.51
プロピルコハク酸無水物	360	93.96	92.15	86.52	65.28
プロピルコハク酸	10000	86.38	96.83	83.08	84.75
プロピルコハク酸	1700	28.19	70.34	82.9	86.53
エナメル質対照		48.39	50.75	42.97	54.86

20

【0100】

(実施例 4)

(研磨されたウシのエナメル質上にブラシで塗布される 1% の濃度の歯磨剤スラリー溶液として適用される、官能化シロキサンポリマー類の沈着及び保持)

官能化シロキサンポリマー類は、 Crest (登録商標) 虫歯予防処方歯磨剤及び水 (1:3) と混合され、スラリー中に 1% の濃度で各ポリマーを含有する歯磨剤スラリーが得られた。樹脂中に固定された、約 1 cm^2 の表面積を有する、清浄で研磨されたウシのエナメル質標本を各スラリーに入れ、5 分間浸漬した。標本を取出した後、超音波処理し、超純水中ですすいだ。次いで、それらを空気乾燥させ、エナメル質表面で水との接触角 (WCA) 測定を行った。標本をブラッシング機 (150 g の圧力でオーラル B (Oral-B) の頭部が平坦な歯ブラシと重なる V-8) に取付け、1 分間及び 10 分間、調製したスラリーでブラッシングした。前述と同じ方法を使用して各インターバルの後、WCA を再測定した。本研究では未処理のエナメル質標本が対照として含まれた。結果を以下の表 II に示す: 本発明による、二酸官能化シロキサンポリマーは、試験された他の官能化シロキサンポリマー類よりも良好にエナメル質上に沈着及び保持され、プロピルコハク酸官能化ポリマー (AMW = 1700) は、最良の沈着及び保持を有した。酸無水物官能化ポリマーはまた、比較的高い WCA 値で示されるように、疎水性表面を維持したが、疎水性は二酸官能化ポリマーを用いたものほど良好には保持されなかった。コポリオール官能化ポリマーは、これらのブラッシング条件下でエナメル質にほとんど保持されなかった。

30

40

【0101】

【表2】

官能基	AMW	水との接触角測定		
		5分浸漬	1分ブラッシング	10分ブラッシング
プロピルコハク酸	1700	82.33	98.85	98.77
プロピルコハク酸	10000	53.19	55.87	49.77
プロピルコハク酸無水物	1600	84.0	70.0	68.0
ポリオール／ポリエーテル	14000	57.0	25.0	25.0
露出エナメル質対照		26.0	25.0	25.0

【0102】

10

(実施例5)

(ウシのエナメル質上の外因性染みに対する、プロピルコハク酸官能化シロキサンポリマーと過酸化カルバミド(CP)との混合物の漂白性能)

二酸官能化シロキサンポリマー及び10%過酸化カルバミドを含む本発明による組成物の、外因性染みに対する漂白性能を、カーボポールゲル、又は水及び同濃度の過酸化カルバミドを含む組成物の性能と比較する。ウシのエナメル質標本を樹脂中に取付け、染みをつける溶液に暴露させ、エナメル質表面に濃い染みを誘導した。偏光フィルターで制御された採光条件(D55光)下で、フジ(Fuji)HC1000デジタルカメラを使用して、ベースラインCIE(国際照明委員会(International Commission of Illumination))のL*a*b*値を測定した。過酸化カルバミド(尿素過酸化水素、シグマ(Sigma)U-1753)を次の試験物質、即ち、プロピルコハク酸官能化シロキサンポリマー(AMW=1700)、5%カーボポールゲル、及び超純水中に10%濃度で混合した。各試験材料混合物約10mgをウシ標本のエナメル質表面に適用し、次いで、超純水15mLを収容する個々のバイアル瓶の中に標本を入れた後、バイアル瓶を37℃に設定された恒温器内のロッカー上に30分間置いた。30分の終了時に、MIBKを用いて表面を綿棒でやさしく拭くことによってその処理物を取り除いた。標本を吸取り紙で乾かし、3次元色空間の数式であるL*、a*、及びb*の変化について測定したが、式中、L*はy軸上の明度を表し、a*はx軸上の彩度(赤~緑)を表し、及びb*はz軸上の彩度(黄~青)を表す。次いで、後の処理を同じ方法で適用し、この手順を14回の処理で、7時間の合計暴露時間、繰り返した。要約した結果をL*対ベースラインの変化として、以下の表IIIに示す。二酸官能化シロキサンポリマーは、カーボポールゲル、又は水性条件下で同濃度の過酸化カルバミドを含有する水と対比して、外因性染みに対する漂白効果を向上させる。

20

30

【0103】

【表3】

(表III. 外因性染みのついたウシのエナメル質の、 ΔL^* 、対、ベースライン)

処理	処理時間			
	1時間	3時間	5時間	7時間
プロピルコハク酸官能化シロキサンポリマー+10%CP	3.5	12	22	29
カーボポールゲル+10%CP	0	5	9	12
超純水+10%CP	0	1	3	5

40

【0104】

(実施例6)

(プロピルコハク酸官能化シロキサンポリマー及び過酸化カルバミド(CP)を含有する歯磨剤でブラッシングした後の、内因性的な変色をした抜歯されたヒトの歯の漂白)

抜歯されたヒトの白歯からあらゆる軟組織を取り除いてきれいにし、研磨/予防し、あらゆる歯石又は外因性の染みを除去した。それらを樹脂中に取付け、偏光フィルターで制御された採光条件(D55光)下で、フジ(Fuji)HC1000デジタルカメラを使用して、ベースラインCIEのL*a*b*値を測定した。過酸化カルバミド(尿素過酸化水

50

素、シグマ (Sigma) U - 1753) を、溶解したプロピルコハク酸官能化シロキサンポリマー (AMW = 1700) を含有するメチルイソブチルケトン (MIBK) 溶液に添加した。溶媒を蒸発させて除去し、次いで、得られるスラリーが 10% CP 及び 5% ポリマーを含有するように、CP / ポリマーの残留物を Crest) 虫歯予防歯磨剤のスラリーに添加した。10% CP のみを含有する比較のスラリーも作成した。オーラル B (Oral B) のヘッドが平坦な歯ブラシをスラリーに浸し、スラリーを臼歯の一面にブラシで塗布し、50 回ハンドストロークした。歯の全面でこれを繰り返した (頬側、舌側遠心、及び唇側をそれぞれ 50 ストロークした)。次いで、超純水 15 mL を収容する個々のバイアル瓶に標本を入れた後、バイアル瓶を 37 に設定された恒温器内のロッカー上に 1 時間置いた。1 時間の終了時に、MIBK を用いて表面を綿棒でやさしく拭くことによって処理物を取り除いた。比較のスラリーを受ける標本を同じ方法で処理した。歯を吸取り紙で軽く乾かし、L*、a*、b* 色空間の変化について測定した。次いで、後の処理を同じ方法で適用し、この手順を 7 時間の合計暴露時間、繰り返した。結果を L* 対ベースラインの変化として、以下の表 I V に示す。これらの結果から、二酸官能化シロキサンポリマーを含む本組成物は、歯の表面の過酸化カルバミドの保持を助ける歯磨剤スラリーから歯の表面に送達されるとき、過酸化カルバミド単独と対比して、抜歯されたヒトの歯の内因性の変色 / 染みに対して極めて大きい漂白効果を提供することが実証される。結果から、更に、二酸官能化シロキサンポリマーが、歯の表面上での過酸化カルバミドの保持を助け、その結果、長時間にわたると漂白効果が大きくなることが実証される。

10

【0105】

20

【表 4】

(表 I V. 内因性染みのついたヒトのエナメル質の、 ΔL^* 、対、ベースライン)

処理	処理時間			
	1時間	3時間	5時間	7時間
5%プロピルコハク酸シロキサンポリマー (AMW=1700)+10%CP	1	2	3	4
10%CP	0.5	1	1	1

【0106】

(実施例 7)

(局所口腔用ゲル)

30

本発明による局所口腔用ゲルは、以下のように示される。これらの組成物は従来の方法を用いて製造される。

【0107】

【表 5】

構成成分	7A	7B	7C	7D	7E	7F	7G
香味料	5.000	5.000	0.500	0.500	0.500	0.500	0.500
メントール	0.200	0.200					
サッカリン	0.200	0.200	0.100	0.100	0.100	0.100	0.100
プロピルコハク酸ポリシロキサンポリマー (AMW=1700又は10000)	3.000	3.000	70.000	75.000	66.000	80.000	75.00
過酸化尿素	10.000		20.000	15.000	15.000		
トリクロサン						0.300	
塩化セチルピリジニウム							1.00
ペミュレン (Pemulen) TR1	1.000	1.000					
二塩基リン酸ナトリウム	0.200	0.200					
ポロキサマー407	9.000	10.500					
プルラフロ (Pluraflo) L4370	適量	適量					
ポリエチレングリコール600			適量	適量	適量	適量	適量

40

【0108】

(実施例 8)

(歯磨剤組成物)

本発明による歯磨剤組成物を以下に示す。これらの組成物は従来の方法を用いて製造さ

50

れる。

【 0 1 0 9 】

【 表 6 】

構成成分	8A	8B	8C	8D	8E	8F
色FD&Cブルー#1		0.300			0.200	0.200
カルボマー956	2.000			2.000	0.300	0.300
クエン酸			0.180			
香料	0.900	1.100	1.000	0.900	1.200	0.800
サッカリン	0.300	0.400	0.450	0.400	0.300	0.350
グリセリン	10.000	30.000	30.000	適量		
リン酸一ナトリウム		0.500			0.590	0.500
リン酸三ナトリウム					1.450	1.400
キサンタンガム					0.475	0.500
水酸化ナトリウム(50%溶液)	1.100					
ポリエチレングリコール 40 SDIS			1.240			
ポロキサマー 407、NF		15.000	15.000	5.000		
粉末化ポリエチレン		20.000	15.430			
シリカ				10.000	20.000	15.000
スズ酸ナトリウム			0.090			
フッ化ナトリウム	0.243	0.243	0.243	0.243	0.243	0.243
ソルビトール(70%溶液)					50.000	40.000
アルキル硫酸ナトリウム(28%溶液)	3.000				4.000	5.000
プロピルコハク酸ポリシロキサンポリマー		5.000		3.000		1.000
プロピルコハク酸／プロピレングリコール エステルポリシロキサンポリマー	3.000		2.000		4.000	
過酸化尿素	10.000			4.000		
過酸化水素(35%溶液)		5.000	3.000			
トリクロサン	0.300				0.300	
塩化セチルピリジニウム			0.530			
ビタミンE						2.000
水、精製USP	適量	適量	適量		適量	適量

10

20

【 0 1 1 0 】

(実施例 9)

(チューインガム組成物)

本発明によるコーティングされたチューインガムを含めたチューインガム組成物を以下に示す。

30

【 0 1 1 1 】

【 表 7 】

構成成分	9A	9B
キシリトール	16.700	16.700
ガムベース(例えばプレスティジーPL(Prestige-PL)、 カフォッサ(Cafosa))	28.000	28.000
プロピルコハク酸官能化ポリシロキサン(AMW=1700)	5.000	5.000
尿素過酸化水素		10.000
水素添加デンプン加水分解物(85%固形分)	8.000	8.000
グリセリン	7.000	7.000
マンニトール	5.000	5.000
香料	1.600	1.600
アスパルテーム	0.200	0.200
噴霧乾燥メントール	0.150	0.150
ソルビトール	適量	適量

40

【 0 1 1 2 】

【表 8】

9C構成成分	コア	コーティング	合計
	1g/ピース	0.35g/ピース	1.35g/ピース
ソルビトール	49.35	—	36.56
ガムベース ¹	25.0	—	18.52
プロピルコハク酸官能化シロキサンポリマー (AMW=1700)	5.0	—	3.70
尿素過酸化水素	5.0	—	3.70
フッ化ナトリウム	—	0.08	0.02
キシリトール	—	—	—
水素添加デンプン加水分解物	5.0	—	3.70
マンニトール	2.0	—	1.48
グリセリン	5.0	—	3.70
二酸化チタン	—	2.0	0.52
香味料	2.0	2.0	2.00
追加の噴霧乾燥香味料	1.5	—	1.11
スクラロース	0.05	0.03	0.05
アセルスファムカリウム	0.10	0.10	0.10
ソルビトール ²	—	95.25	24.70
ポリソルベート60	—	0.30	0.08
不溶性食用グリッター ³ (ブリリアント・ブルー)	—	0.04	0.01
蠟 ⁴	—	0.20	0.05

¹ 米国ニュージャージー州エディソン、パークアベニュー 3773、L.A.ドレフュス社 (L.A.Dreyfus Company, 3775 Park Avenue, Edison, New Jersey, US)、スペイン、バルセロナ、08029、カラブリア 267、カフォサ・ガム (Cafosa Gum, Calabria 267, 08029, Barcelona, Spain) などの供給元から予め供給されたガムベースを含めた、幾つかの成分を含む。

² ソルビトールの濃度は乾燥後の絶対濃度を指す；ソルビトールは 70% 水溶液として添加される。

³ 米国コネチカット州ウェストヘブーン、ヘファーナンドライブ 301、ワトソン食品社 (Watson Foods Company Incorporated, 301 Hefernan Drive, West Haven, Connecticut, USA) によって供給される

⁴ 蠟の濃度は乾燥後の絶対濃度を指し、蠟は 28% エタノール溶液として添加され；用いられる蠟は、ドイツ、エルムスホルン、カウル社 (Kaul GmbH, Elmshorn, Germany) により供給されるもののような幾つかの成分を含む。

【0113】

(製造指示)

(実施例 9A 及び 9B)

ガムベースを ~ 45 まで加熱し柔らかくする。混合過程中ずっと、混合機の容器キャピティを ~ 45 に維持する。ガムベースをダブルシグマブレードミキサーの混合キャピティに添加し、5 分間混合する。マンニトール及び噴霧乾燥メントールを添加する。2 分間混合する。グリセリンを添加し、2 分間混合する。キシリトールの 50% を添加し、2 分間混合する。水素添加デンプン加水分解物を添加し、5 分間混合する。ソルビトールの 50% を添加し、3 分間混合する。キシリトールの残りの 50%、シリコン、及びアスパルテムを添加し、3 分間混合する。香味料を添加し、3 分間混合する。実施例 9B の場合、活性酸素の損失を最小限にするため、およそ室温で、終わり頃に漂白剤を添加する。

【0114】

(製造指示)

(実施例 9C)

コア製剤：穏やかに加熱して、ガムベースを柔らかくし、マンニトール、噴霧乾燥香味料、グリセリン、キシリトールの 50%、水素添加デンプン加水分解物、ソルビトールの

50%を添加し、完全に混合する。キシリトールの残りの50%、シロキサンポリマー及び尿素過酸化水素(必要な場合)、及びアスパルテム、残りの香味料を添加し、更に混合する。チューインガム原体の塊を、所望の形状及び大きさの不連続片に、ロール及び刻み装置を用いて形成する。

【0115】

コーティング溶液：二酸化チタン及びポリソルベート60~70%ソルビトール水溶液を添加し、混合する。香味料、続いてスクラロース及びアセスルファムカリウムを添加し、更に混合する。

コア製剤のコーティング：ガム片をコーティングパン中に設置し、コーティング溶液を塗布して、部分的に乾燥させる。所望のコーティングの厚さ又は重量を達成するまで、コーティング工程を繰り返す。透明な70%ソルビトール水溶液を適用し、濡れている間に、スペックルを製品表面上に乾式噴霧し、乾燥させる。透明な70%ソルビトール水溶液の2回目のコーティングを適用し、続いて蠟をコーティングし、製品を完全に乾燥させる。

10

【0116】

(実施例10)

(口内洗浄剤)

【0117】

【表9】

構成成分重量	重量%
水	29.000
プロピレングリコール	53.459
安息香酸ナトリウム	0.320
安息香酸	0.021
サッカリンナトリウム	0.700
プロピルコハク酸官能化ポリシロキサン(AMW=1700)	5.000
ポロキサマー407	10.000
香味料	1.500

20

実施例10の口内洗浄剤は次のように調製される：水、ポロキサマー及びプロピレングリコールを混合する。次に、香味料、安息香酸、及びシロキサンポリマーを添加する。最後に、安息香酸ナトリウム及びサッカリンナトリウムを添加し、均一になるまで混合する。

30

【0118】

(実施例11)

(義歯接着組成物)

クリーム状の義歯接着剤組成物は、次の構成成分と一緒にブレンドすることによって製造することができる：

【0119】

【表10】

構成成分	11A	11B	11C	11D
白鉱物油	23.93	23.93	23.93	0
ペトロラタム、白	21.77	20.87	11.87	0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	20.00	20.00	20.00	20.00
二酸化ケイ素、コロイド状	1.14	1.14	1.14	1.14
着色剤(オパティント・レッド・ダイ(Opatint Red Dye))	0.06	0.06	0.06	0.06
プロピルコハク酸官能化ポリシロキサン(AMW=1700)	0.10	1.00	10.00	45.8
アルキルビニルエーテル/マレイン酸(AVE/MA)コポリマー塩	33.00	33.00	33.00	33.00

40

流体構成成分(赤色染料、プロピルコハク酸ポリシロキサン、ペトロラタム、鉱油)を50~60で視覚的に均一になるまで混合する。次いで、粉末構成成分(コロイド状二酸化ケイ素、CMC、いずれかのAVE/MAコポリマー複合塩)を容器中で一緒に振とうブレンドする。その後、粉末を液体中に混合し、均一なピンク色のクリームを形成した。AVE/MA塩、ペトロラタム、及び/又はCMCの各濃度を10gまで増加又は減少

50

させることにより、クリーム組成物を改質してもよい。また、Ca / Zn 塩又は Mg / Ca / Zn 塩などの様々な AVE / MA ポリマー複合塩の混合物、及び / 又は酸を使用することによって、前記のクリーム組成物を改質することができる。使用する際、被験者は、0.1 ~ 2 g の上記クリーム組成物を義歯につける。次いで、被験者はその義歯を自分の口腔に挿入し、所定の位置に押しつける。

フロントページの続き

- (74)代理人 100111648
弁理士 梶並 順
- (74)代理人 100122437
弁理士 大宅 一宏
- (72)発明者 マジエティ, サチャナラヤナ
アメリカ合衆国オハイオ州、ミドルタウン、チェリー、ローレル、ドライブ 8305
- (72)発明者 レノ, エリザベス アン ブラウン
アメリカ合衆国オハイオ州、フェアフィールド、ヴィーナス、レーン 5553
- (72)発明者 コバックス, スティーヴン アンドラス
アメリカ合衆国オハイオ州、ラヴランド、レヴィンウッド、テラス 112
- (72)発明者 オリエ, フィリップ
フランス国、69007 リオン、グランデ、リュ、デ、ラ、ギロティエ 177
- (72)発明者 グランドルフ, ウィリアム マイケル
アメリカ合衆国オハイオ州、メイソン、キーンランド、ウェイ 6933

審査官 川口 裕美子

- (56)参考文献 特開平04 - 120014 (JP, A)
特開平02 - 164437 (JP, A)
特開2001 - 226486 (JP, A)
特開平01 - 318041 (JP, A)
特開平02 - 107639 (JP, A)
特表平09 - 506104 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A61K 8/89
A61Q 11/00
C08G 77/04