



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК  
*A61K 8/97* (2006.01)  
*A61K 8/21* (2006.01)  
*A61K 8/25* (2006.01)  
*A61K 8/36* (2006.01)  
*A61K 8/24* (2006.01)  
*A61K 8/37* (2006.01)  
*A61Q 11/00* (2006.01)

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2004113652/15, 05.11.2002

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
05.11.2002

(30) Конвенционный приоритет:  
06.11.2001 IT MI2001A002322

(43) Дата публикации заявки: 10.04.2005

(45) Опубликовано: 27.10.2007 Бюл. № 30

(56) Список документов, цитированных в отчете о  
поиске: US 5015466 A, 14.05.1991. US 5000944  
A, 19.03.1991. US 5958380 A, 28.09.1999. WO  
0117494 A, 15.03.2001. WO 0030465 A,  
02.06.2000.

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:  
05.05.2004

(86) Заявка РСТ:  
EP 02/12330 (05.11.2002)

(87) Публикация РСТ:  
WO 03/039504 (15.05.2003)

Адрес для переписки:  
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной, рег. № 517

(72) Автор(ы):

КОЛЛЕ Роберто (IT),  
САЛЬМОИРАГИ Гульельмо (IT),  
БАРРИКА Андреа (IT)

(73) Патентообладатель(и):

ПЕРФЕТТИ ВАН МЕЛЛЕ С.П.А. (IT)

## (54) ТВЕРДЫЕ ОРАЛЬНЫЕ КОМПОЗИЦИИ

(57) Реферат:

Настоящее изобретение раскрывает оральные композиции в форме жевательной резинки, содержащие: а) полифосфаты; б) гидратный диоксид кремния; с) источник ионов фторида; d) экстракты или активные ингредиенты

растительного происхождения; е) необязательно антибактериальные/дезинфицирующие агенты. Композиции по изобретению являются полезными в качестве адъювантов в зубной гигиене, в частности для уменьшения отложения зубного камня. 5 з.п. ф-лы.



(51) Int. Cl.

*A61K 8/97* (2006.01)

*A61K 8/21* (2006.01)

*A61K 8/25* (2006.01)

*A61K 8/36* (2006.01)

*A61K 8/24* (2006.01)

*A61K 8/37* (2006.01)

*A61Q 11/00* (2006.01)

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: **2004113652/15, 05.11.2002**

(24) Effective date for property rights: **05.11.2002**

(30) Priority:  
**06.11.2001 IT MI2001A002322**

(43) Application published: **10.04.2005**

(45) Date of publication: **27.10.2007 Bull. 30**

(85) Commencement of national phase: **05.05.2004**

(86) PCT application:  
**EP 02/12330 (05.11.2002)**

(87) PCT publication:  
**WO 03/039504 (15.05.2003)**

Mail address:  
**129010, Moskva, ul. B.Spaskaja, 25, str.3,  
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i  
Partnery", pat.pov. E.E.Nazinoj, reg. № 517**

(72) Inventor(s):

**KOLLE Roberto (IT),  
SAL'MOIRAGI Gul'el'mo (IT),  
BARRIKA Andrea (IT)**

(73) Proprietor(s):

**PERFETTI VAN MELLE S.P.A. (IT)**

(54) **SOLID ORAL COMPOSITIONS**

(57) Abstract:

FIELD: stomatology.

SUBSTANCE: invention discloses oral compositions in form of chew and containing the following components: (a) polyphosphates; (b) hydrated silicon dioxide; (c) source of fluoride ions; (d) extracts or active components of

vegetable origin; (e) antibacterial/disinfecting agents optionally. Proposed compositions are useful as adjuvants in dental hygiene, in particular, for reducing dental calculus formation.

EFFECT: valuable properties of compositions.

6 cl, 1 ex

Настоящее изобретение относится к оральным композициям против зубного камня и налета, полезным в качестве адъювантов в гигиене ротовой полости.

#### ПРЕДПОСЫЛКИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

5 Проблема образования зубного налета и зубного камня изучается давно, и активно исследуются агенты, которые могут использоваться для борьбы с ними и замедления их образования.

10 Механизмы, которые вызывают отложения зубного камня, хорошо известны; данные отложения состоят из кристаллов фосфата кальция, которые осаждаются во внеклеточном матриксе бактериального налета. Патогенетическая роль зубного камня в периодонтальных заболеваниях, таких как пиорея, периодонтит, гингивит и связанные расстройства, также хорошо известна.

15 Доказана эффективность различных веществ в уменьшении или предотвращении образования зубного камня и отложений на зубах, включая растворимые пирофосфаты и полифосфаты, соли цинка, фториды, дифосфонаты, антибактериальные агенты, такие как триклозан, и абразивные вещества, такие как диоксид кремния или оксид алюминия. Данные вещества, комбинированные друг с другом различными способами, включаются в композиции большинства зубных паст против зубного камня, коммерчески доступных в настоящее время. Клиническую эффективность таких зубных паст изучали в многочисленных исследованиях, описанных в J. Clin. Dent. Vol. IV (3), 71-81, 1993.

20 Наиболее распространенные зубные пасты содержат растворимые полифосфаты, связанные с фторидами и диоксидом кремния и, возможно, с полимерами, которые обладают биоадгезивными свойствами, как описано, например, в US 4327977, US 4889713, US 5017362, US 5139769, US 4921693 и EP 492997.

25 Похожие композиции, с добавлением антибактериальных агентов, таких как триклозан, описаны, например, в GB 2200551. Дополнительно к зубным пастам разработаны жевательные резинки и леденцы со сходной композицией.

30 Эффективность таких зубных паст, которые являются предметом многочисленных исследований (J. Clin. Dent. Vol. X(3), 99-102, 1999; Oral Surg. Oral Med. Oral Pathol., Vol. 70(4), 529-536, 1990; J. Clin. Dent. Vol. IX(4), 101-104, 1998), обусловлена ингибированием осаждения фосфата кальция полифосфатами, которые образуют комплексы с ионами кальция в слюне, абразивным действием диоксида кремния, укрепляющим действием фторидов на зубную эмаль и действием биоадгезивных полимеров при их использовании, которые защищают слизистую оболочку и вызывают медленное высвобождение других ингредиентов.

35 Леденцы и жевательные резинки, предназначенные в качестве адъювантов в зубной гигиене и гигиене полости рта вообще, которые обладают свойствами, которые могут быть описаны как средства против зубного камня, против кариозного распада, отбеливающие и/или освежающие дыхание, становятся все более популярными. Главным преимуществом таких форм введения является то, что они могут использоваться свободно и легко в течение дня в любом месте и в любом случае, дополнительно к тому факту, что высвобождение активных элементов (функциональных ингредиентов) является более медленным и более регулярным, чем в случае обычной зубной пасты.

#### ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

45 Настоящее изобретение относится к оральным композициям в твердой форме, предпочтительно в форме жевательной резинки, эффективность которой выше, чем таковая сходных известных композиций.

Композиции по изобретению содержат эффективные количества

- а) полифосфатов, предпочтительно смеси пирофосфатов и трифосфатов щелочных металлов;
- 50 б) абразивного вещества (предпочтительно гидратного диоксида кремния);
- с) источника фторидных ионов;
- д) экстрактов или активных ингредиентов растительного происхождения;
- е) необязательно антибактериальных или дезинфицирующих средств.

Дополнительно к активным ингредиентам, указанным выше, композиции по изобретению могут содержать эксципиенты, подходящие для создания конечной формы введения.

Таким образом, например, композиция жевательной резинки будет требовать подходящей основы, состоящей из резиновой (смоляной) основы, подсластителей, полиспиртов, таких как ксилит, сорбит и маннит, вкусовых добавок, красителей, смягчителей, пластификаторов, стабилизаторов, загустителей и др.

Полифосфатами, применяемыми в данных композициях, могут быть пирофосфаты щелочных металлов (дифосфаты), гексаметафосфаты, триполифосфаты или их смеси. Смесь двунариевого двукислового дифосфата и пентанатриевого или пентакалиевого трифосфата является особенно предпочтительной. Было доказано, что зубная паста, содержащая такую смесь, обеспечивает более заметное уменьшение зубного камня, чем зубная паста, содержащая пирофосфаты, не связанные с трифосфатами (J. Clin. Dent. Vol. IX(4), 101-104, 1998).

Широко, полифосфаты составляют от 0,5 до 5 мас.% всей композиции по данному изобретению.

Функцией абразивного вещества является усиление действия удаления налета, уже имеющегося у обычной жевательной резинки. Оно может быть образовано гидратным диоксидом кремния (в подходящей форме), карбонатом кальция (в подходящей форме) или тальком, отдельно или в смеси друг с другом. Такие абразивные вещества могут также присутствовать полностью или частично, отдельно или в смеси друг с другом, в инкапсулированной форме, в частности инкапсулированными в альгинат кальция. Для жевательной резинки, содержащей микрогранулы гидратного диоксида кремния, инкапсулированные в альгинат кальция, доказана большая эффективность в удалении налета, чем у жевательной резинки с такой же композицией, но без микрогранул (Doc. Os 06.2001 779-781). Согласно настоящему изобретению, инкапсулированные микрогранулы могут содержать красители, вкусовые добавки, функциональные ингредиенты и травяные экстракты. Данное абразивное вещество обычно присутствует в процентном содержании от 0,5 до 7 мас.%.

Подходящие источники ионов фторида включают фторид натрия, фторид калия, фторид аммония, монофторфосфат натрия и другие известные нетоксические соли, содержащие фтор в концентрациях, которые обеспечивают процентное содержание фторида от 0,005 до 0,2 мас.%.

Растительные экстракты, которые могут присутствовать в композиции по изобретению, предпочтительно выбирают из экстрактов *Centella asiatica*, *Malva sylvestris*, *Melaleuca alternifolia*, *Commiphora abyssinica* (мирра), *Krameria triandra* (ратания), *Acacia catechu*, *Medicago sativa* (люцерна), смолы вида *Styrax*, такого как *Styrax benzoin* (стираксовое дерево), *Matricaria recutita* (ромашка), *Echinacea purpurea* (эхинацея) и *Croton lechleri* (драконова кровь). Экстракты тех растений, чья активность известна в течение некоторого времени, являются коммерчески доступными.

Комбинация таких экстрактов придает композициям противовоспалительные/противоотечные, смягчающие, ранозаживляющие, антисептические и вяжущие свойства. Такие свойства являются желательными, по меньшей мере, в двух отношениях в рамках настоящего изобретения:

во-первых, для способствования и усиления уменьшения заболеваний слизистой оболочки полости рта, вызываемых уменьшением зубного камня;

во-вторых, для регулирования и предотвращения контактного стоматита, похожего на тот, который развивается при использовании зубных паст, известного как «стоматит зубной пасты», у особенно предрасположенных людей.

В композициях по изобретению такие экстракты могут быть инкапсулированы в альгинаты вместе с абразивным веществом.

Указанные экстракты могут быть добавлены в композиции в процентном содержании от 0,01 до 2 мас.%.

Композиции по изобретению могут быть получены обычными методиками, путем

добавления и смешивания различных ингредиентов с резиновой (смоляной) основой в случае жевательной резинки, которая затем может быть покрыта оболочками в соответствии с такими же обычными методиками.

Композиции по изобретению могут содержать дезинфицирующее средство или антибактериальный агент, такой как триклозан, соли цинка или оксид цинка, отдельно или комбинированные один с другим, в концентрациях от 0,1 до 5 мас.%. Данные агенты предназначены для борьбы с образованием бактериального налета, который ведет к отложениям зубного камня.

Композиции по изобретению также могут содержать декоративные кристаллы, предпочтительно состоящие из гуммиарабика и красителей, осажденные на поверхности продукта, исключительно с эстетической функцией.

Ежедневное применение жевательной резинки в соответствии с изобретением уменьшает отложения зубного камня и обладает другими полезными эффектами на состояние слизистой оболочки полости рта и десен.

Следующий пример иллюстрирует изобретение более детально.

#### ПРИМЕР

Состав композиции покрытой оболочкой жевательной резинки весом 1,4 г с растительными экстрактами представлен в таблице

Процентный состав композиции (по массе)	
Ингредиент	%
Резиновая (смоляная) основа	25,5
Ксилит	23,5
Сорбит	23,2
Маннит	16
Вкусовое вещество	1,8
Диоксид кремния	3
Гуммиарабик	1
Глицерин	1
Двунариевый двукислый дифосфат	1
Пентанатриевый трифосфат	1
Экстракты мальвы, мирры, центеллы, мелалеуки, ратании и катеху	0,05
Сироп мальтита	0,93
Диоксид титана (E171)	0,7
Быстрое покрытие	0,6
Аспартам	0,6
Ацесульфам	0,05
Карнаубский воск	0,05
Фторид калия	0,02
Всего	100

#### Формула изобретения

1. Оральная композиция в форме жевательной резинки, содержащая
  - a. полифосфаты, выбранные из триполифосфатов, пирофосфатов или их смесей;
  - b. абразивное вещество, выбранное из гидратного диоксида кремния, карбоната кальция и талька, отдельно или в смеси;
  - c. источник ионов фторида;
  - d. экстракты растительного происхождения;
  - e. необязательно антибактериальные/дезинфицирующие агенты,
 где экстракты выбирают из экстрактов *Centella asiatica*, *Malva sylvestris*, *Melaleuca alternifolia*, *Commiphora abyssinica* (мирра), *Krameria triandra* (ратания), *Acacia catechu*, *Medicago sativa* (люцерна), смолы вида *Styrax*, такого как *Styrax benzoin* (стираксовое дерево), *Matricaria recutita* (ромашка), *Echinacea purpurea* (эхинацея) и *Croton lechleri* (драконова кровь).
2. Композиция по п.1, содержащая смесь пирофосфатов и триполифосфатов щелочных металлов.
3. Композиция по п.1, дополнительно содержащая эксципиенты, выбираемые из

резиновой (смоляной) основы, подсластителей, полиспиртов, вкусовых добавок, красителей, смягчителей, пластификаторов, стабилизаторов и загустителей.

4. Композиция по п.1, содержащая экстракты с противовоспалительными, ранозаживляющими, антигеморрагическими, успокаивающими, смягчающими,

5 противоотечными и антисептическими свойствами.

5. Композиция по п.1, содержащая 0,5-5 мас.% полифосфатов, 0,5-7 мас.% абразивного вещества (возможно полностью или частично инкапсулированного), источник ионов фтора, способный гарантировать поглощение фторида от 0,005 до 0,2% и 0,01-2 мас.% растительных экстрактов.

10 6. Композиция по п.1, содержащая дезинфектанты и/или антибактериальные агенты, выбираемые из триклозана, оксида цинка и солей цинка, отдельно или в комбинации друг с другом, в концентрациях от 0,1 до 5%.

15

20

25

30

35

40

45

50