



(51) МПК
A61K 8/00 (2006.01)
A61K 8/44 (2006.01)
A61Q 11/00 (2006.01)

**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
 ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: **2006101676/15, 23.06.2004**

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
23.06.2004

(30) Конвенционный приоритет:
23.06.2003 US 10/601,478
23.06.2004 US 10/875,059

(43) Дата публикации заявки: **10.06.2006**

(45) Опубликовано: **20.06.2009** Бюл. № 17

(56) Список документов, цитированных в отчете о
 поиске: **US 5874068, 23.02.1999. US 5695745,**
09.12.1997.

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
 фазу: **23.01.2006**

(86) Заявка РСТ:
US 2004/020192 (23.06.2004)

(87) Публикация РСТ:
WO 2005/000261 (06.01.2005)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной, рег. № 517

(72) Автор(ы):

БОЙД Томас Дж. (US),
ГАФФАР Абдул (US),
ВИСКИО Дэвид Б. (US)

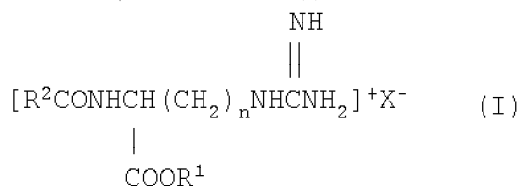
(73) Патентообладатель(и):

КОЛГЕЙТ-ПАЛМОЛИВ КОМПАНИ (US)

**(54) КОМПОЗИЦИИ ДЛЯ ПОЛОСКАНИЯ ПОЛОСТИ РТА, СОДЕРЖАЩИЕ СОЛИ
 АЛКИЛОВЫХ ЭФИРОВ N-АЦИЛАРГИНИНА**

(57) Реферат:

Изобретение относится к стоматологии, в частности к композиции, эффективной для замедления скопления налета на зубах. Композиция включает соединение



Раскрывается стабильная оральная водная

композиция против образования налета, которая включает (а) антибактериальный сложный эфир формулы (I), где R¹ представляет собой алкильную цепь, содержащую от 1 до 8 атомов углерода, R² представляет собой алкильную цепь, содержащую от 6 до 30 атомов углерода, и X представляет собой анион; (b) стабилизирующее поверхностно-активное вещество и (c) влагоудерживающее вещество. Изобретение обеспечивает стабильность средства. 2 н. и 17 з.п. ф-лы, 2 табл.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.
A61K 8/00 (2006.01)
A61K 8/44 (2006.01)
A61Q 11/00 (2006.01)

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: **2006101676/15, 23.06.2004**

(24) Effective date for property rights:
23.06.2004

(30) Priority:
23.06.2003 US 10/601,478
23.06.2004 US 10/875,059

(43) Application published: **10.06.2006**

(45) Date of publication: **20.06.2009 Bull. 17**

(85) Commencement of national phase: **23.01.2006**

(86) PCT application:
US 2004/020192 (23.06.2004)

(87) PCT publication:
WO 2005/000261 (06.01.2005)

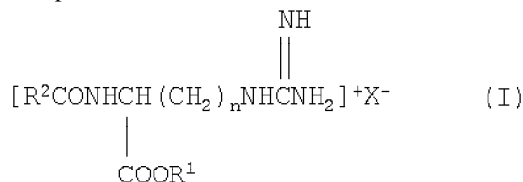
Mail address:
129090, Moskva, ul. B.Spaskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",
pat.pov. E.E.Nazinoj, reg. № 517

(72) Inventor(s):
BOJD Tomas Dzh. (US),
GAFFAR Abdul (US),
VISKIO Dehvid B. (US)

(73) Proprietor(s):
KOLGEJT-PALMOLIV KOMPANI (US)

(54) **MOUTH RINSE COMPOSITION WITH N-ACYL ARGININE ALKYL CARBOXETHYL ESTERS SALTS**

(57) Abstract:
FIELD: personal use articles.
SUBSTANCE: invention refers to dentistry in particular anti tooth accretion composition. Composition consists



combination. Stable oral water composition against tooth accretion includes compound ether (I), where R¹ is alkylene chain with 1 to 8 carbons, R² is alkylene chain with 6 to 30 carbons and X is anion; (b) stabilising surface-active material and (c) humectant.

EFFECT: invention provides stability of the product.

19 cl, 2 tbl, 2 ex

RU 2 358 710 C2

RU 2 358 710 C2

Введение

Данное изобретение, в целом, относится к оральным водным композициям, эффективным для замедления скопления на зубах бактериального налета, точнее к стабильным водным композициям, содержащим антимикробное производное аргинина.

Зубной налет представляет собой мягкое отложение, которое образуется на зубах и состоит из скопления бактерий и бактериальных побочных продуктов. Налет прочно прилипает в точках неровностей или неоднородностей, например на неровных поверхностях конкремента, десневом крае и т.п. Помимо неприглядного вида зубной налет вовлечен в проявление гингивита и других форм периодонтального заболевания.

Для замедления образования зубного налета и появления инфекций в полости рта, связанных с образованием зубного налета, было разработано большое количество различных антибактериальных средств. Например, в патенте США №5874068 описываются оральные водные композиции, содержащие производное аргинина, сложный эфир N^α-ациламиноокислоты и его соли в качестве эффективного соединения для противодействия образованию зубного налета в результате скопления в полости рта бактерий. В соответствии с патентом США №5874068, поскольку алкиловый эфир N^α-лаурил-L-аргинина является нестабильным в водных средах, таких как средства для полоскания полости рта, и обычно подвергается реакциям гидролиза, типичным для сложных эфиров, производное аргинина было стабилизировано в отношении гидролиза введением в средство для полоскания полости рта одноатомного спирта формулы ROH, где R представляет собой алкильную группу, содержащую от 1 до 8 атомов углерода, причем указанная формула включает одноатомный спирт, такой как этанол, который присутствует в средстве для полоскания полости рта в концентрации в интервале от примерно 10 до примерно 35% об./об.

Патент США №5874068 обеспечивает также стабильность средства для полоскания полости рта, содержащего спирт ROH, обеспечением кислотного буфера, такого как бензоат/бензойная кислота, сукцинат/янтарная кислота, ацетат/уксусная кислота или другие орально приемлемые буферы со значениями констант диссоциации в желательном интервале рН для стабилизации алкилового эфира N^α-лаурил-L-аргинина, предпочтительно со значением рН в интервале от 3 до 7, наиболее предпочтительно в интервале от 4 до 5.

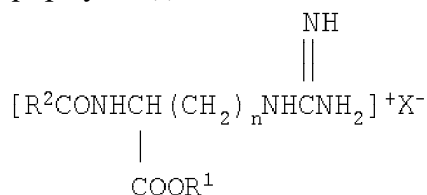
Другой публикацией уровня техники, относящейся к антибактериально эффективным производным аргинина, является патентная публикация UK №1352420, в которой описываются производные алкилового эфира аргинина, проявляющие антибактериальную активность в полости рта в отношении бактерий, принадлежащих роду *Lactobacillus*, основной патоген, вызывающий зубной кариес, а также бактерий, относящихся к роду *Staphylococcus*, основной патоген, вызывающий альвеолярную пиорею.

В патенте США №5266306 описывается оральная композиция, содержащая бактерицидное количество хлорида цетилпиридиния и производного аргинина, алкилового эфира N^α-ациламиноокислоты, такого как гидрохлоридная соль метилового эфира N^α-кокоил-L-аргинина, причем соль производного аргинина является эффективной для промотирования абсорбции хлорида цетилпиридиния на поверхностях зубов.

Сущность изобретения

В соответствии с данным изобретением предлагается химически стабильная оральная водная композиция, включающая

(а) безопасное и эффективное количество антибактериального сложного эфира формулы (I)



где R^1 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 1 до 8 атомов углерода, R^2 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 6 до 30 атомов углерода, и X представляет собой анион;

(b) стабилизирующее поверхностно-активное вещество;

(c) влагоудерживающее вещество;

(d) воду.

В одном варианте осуществления данного изобретения композиция включает спирт. В еще одном варианте осуществления данного изобретения композиция не содержит кислотный буфер.

В соответствии с другим аспектом данное изобретение предлагает композиции, включающие

(а) безопасное и эффективное количество антибактериального сложного эфира формулы (I), представленной выше;

(b) поверхностно-активное вещество;

(c) влагоудерживающее вещество;

(d) воду;

где указанная композиция по существу свободна от одноатомных спиртов.

Было установлено, что композиции и способы данного изобретения обеспечивают преимущества по сравнению со стабильными водными композициями для полоскания полости рта, в которых применяются антибактериальные сложные эфиры, известные в данной области техники, включая одно или несколько из следующих преимуществ: повышенная биодоступность и эффективность антибактериального сложного эфира, возможность снизить значение pH раствора средства для полоскания полости рта, включающего антибактериальный сложный эфир, возможность исключения кислотного буфера при одновременном упрощении производства средства для полоскания полости рта, возможность получать препарат средства для полоскания полости рта, не содержащего спирта, а также стабильное средство для полоскания полости рта, содержащее спирты.

Дополнительные способы применения, преимущества и варианты осуществления данного изобретения выявляются в представленном далее описании.

Описание

При рассмотрении описания данного изобретения должны приниматься во внимание приведенные далее определения и не ограничивающие рекомендации, приведенные в описании. Заголовки (такие как “Введение” и “Сущность изобретения”), а также подзаголовки (такие как “Водный носитель”, “Антибактериальный сложный эфир”, “Поверхностно-активное вещество”, “Необязательные ингредиенты” и “Способы”), используемые в данном описании, предназначены только для общей организации тематических текстов в описании данного изобретения и не предназначены для ограничения описания данного

изобретения или любого его аспекта. В частности, предмет, раскрытый в разделе “Введение”, может включать аспекты технологии, включенные в объем данного изобретения, и может не включать перечисление публикаций предшествующего уровня. Объект, раскрытый в разделе “Сущность изобретения”, не является

5
исчерпывающим или полным описанием всего объема данного изобретения или любых из его воплощений. Классификация или обсуждение материала в пределах раздела данного описания в качестве имеющего особое применение приведено для удобства и не следует делать вывод, что материал должен обязательно или

10
исключительно функционировать в соответствии с классификацией, приведенной в данном разделе, когда он используется в любой заданной композиции.

Цитирование любых ссылок не составляет обоснование того, что данные ссылки являются уровнем техники или имеют какое-либо отношение к патентоспособности изобретения, раскрываемого в данном описании. Любое обсуждение содержания

15
ссылок, приведенных в разделе “Введение”, предназначено только для обеспечения в целом краткого изложения утверждений, сделанных авторами указанных ссылок, и не подтверждает точность содержания данных ссылок. Содержания всех публикаций, упомянутых в разделе “Описание” данного изобретения, полностью

20
введены в описание данного изобретения в виде ссылок.

Описание и любые конкретные примеры, раскрывающие варианты осуществления данного изобретения, предназначены только для иллюстрации, а не для ограничения объема данного изобретения. Кроме того, цитирование множества вариантов осуществления данного изобретения, обладающих заявленными отличительными

25
признаками, не подразумевает исключение других вариантов осуществления данного изобретения, обладающих дополнительными отличительными признаками, или других вариантов осуществления данного изобретения, включающих различные сочетания заявленных отличительных признаков. Конкретные примеры

30
предоставлены с целью иллюстрации, как получать и применять композиции и способы данного изобретения, и, кроме случаев, оговоренных особо, не предназначены представлять, что данные варианты осуществления были или не были выполнены или испытаны.

Термины “предпочтительные” и “предпочтительно”, используемые в данном описании, относятся к вариантам осуществления данного изобретения, которые в

35
некоторых условиях предоставляют некоторые преимущества. Однако другие варианты осуществления данного изобретения в таких же или других условиях также могут быть предпочтительными. Кроме того, указания на один или несколько

40
предпочтительных вариантов осуществления данного изобретения не подразумевают, что другие варианты осуществления не являются полезными и не предназначены для исключения других вариантов осуществления из объема данного изобретения.

Подразумевается, что используемый в данном описании термин “включать” и его варианты не является ограничивающим, так что перечень перечисленных в списке

45
предметов не исключает других аналогичных предметов, которые также могут применяться в веществах, композициях, устройствах и способах данного изобретения.

Все процентные содержания в композициях, приведенные в данном описании, за

50
исключением особо оговоренных случаев, даны по массе общей композиции.

Термин “по существу”, используемый в данном описании в характеристике композиции или способа данного изобретения, показывает, что характеристики могут изменяться без существенного влияния на химические или физические

показатели композиции или способа.

Термин “примерно”, используемый в данном описании при описании значения параметра композиции или способа данного изобретения, показывает, что вычисление или изменение значения допускает небольшое отклонение без существенного влияния на химические или физические показатели композиции или способа. Если по некоторой причине отклонение, предоставляемое термином “примерно”, не является очевидным для данной области техники в его обычном значении, то данный термин означает возможное отклонение значения на величину до 5%.

Водный носитель

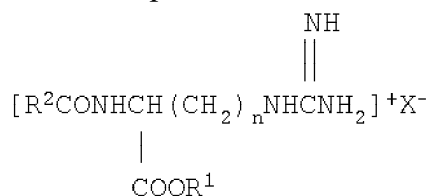
Вода может составлять от примерно 50% мас. до примерно 80% мас., предпочтительно от примерно 55% мас. до примерно 75% мас. оральных водных композиций данного изобретения. Указанное количество воды включает свободную добавленную воду и количество воды, которое вводится с другими веществами.

Оральную водную композицию данного изобретения, такую как средство для полоскания полости рта, получают с использованием носителя, который содержит воду и влагоудерживающее вещество. Влагоудерживающее вещество обычно представляет собой смесь влагоудерживающих веществ, таких как глицерин и сорбит, и многоатомный спирт, такой как пропиленгликоль, бутиленгликоль, гексиленгликоль, полиэтиленгликоль. Содержание влагоудерживающего вещества находится в интервале от примерно 5% мас. до примерно 40% мас., предпочтительно от примерно 10% мас. до примерно 30% мас. Содержание воды находится в интервале от примерно 50% мас. до примерно 80% мас., предпочтительно от 55% мас. до примерно 75% мас.

В некоторых вариантах осуществления данного изобретения носитель средства для полоскания полости рта может дополнительно включать одноатомный спирт общей формулы R'OH, где R' представляет собой алкильную группу, содержащую от 1 до 8 атомов углерода. Оральная водная композиция, содержащая одноатомный спирт, стабилизируется с помощью стабилизирующей поверхностно-активной системы, как более подробно описано ниже. В других вариантах осуществления данного изобретения носитель средства для полоскания полости рта может быть свободным от одноатомного спирта. В предпочтительном варианте осуществления данного изобретения композиция не включает кислотный буфер. В различных вариантах осуществления данного изобретения значение pH композиции находится в интервале от примерно 5 до примерно 8, необязательно от примерно 6 до примерно 8, необязательно от примерно 6 до примерно 7.

Антибактериальный сложный эфир

В предпочтительных вариантах осуществления данного изобретения антибактериальный сложный эфир представлен формулой



где R¹ представляет собой алкильную цепь, содержащую от 1 до 8 атомов углерода, предпочтительно от 1 до 3 атомов углерода, наиболее предпочтительно 3 атома углерода; R² представляет собой алкильную цепь, содержащую от 6 до 30 атомов углерода, предпочтительно от 10 до 12 атомов углерода, и их смеси; и X

представляет собой анион. В различных вариантах осуществления данного изобретения фрагмент R²CO включает остаток природной жирной кислоты, такой как природная жирная кислота, выбранный из группы, состоящей из жирной кислоты кокосового масла, остатка жирной кислоты таллового масла, или остаток моноосновной жирной кислоты, такой как выбранный из группы, состоящей из лауроил (C₁₂), миристил (C₁₄), стеароил (C₁₈) жирно-кислотных остатков и их смесей. В одном варианте осуществления данного изобретения фрагмент R²CO включает лауроильный остаток жирной кислоты.

X может представлять собой любой противоион, который обеспечивает приемлемую степень растворимости в воде (предпочтительно, по меньшей мере, примерно 1 г в 1 л воды). Примеры противоионов X, которые образуют соли антибактериального сложного эфира определенной выше формулы, включают соли неорганических кислот, например соли, включающие атомы галогенов (например, хлорид или бромид) или дигидрофосфат, или соли органических кислот, такие как ацетат, тартрат, цитрат или пирролидонкарбоксилат (PCA). Хлоридная соль является предпочтительной.

Примеры предпочтительных для осуществления данного изобретения антибактериальных сложных эфиров, представленных определенной выше формулой, где n равно 3, включают метиловый эфир N¹-кокоил-L-аргинина, этиловый эфир N^α-кокоил-L-аргинина, пропиловый эфир N^α-кокоил-L-аргинина, метиловый эфир N^α-стеароил-L-аргинина, гидрохлорид этилового эфира N^α-стеароил-L-аргинина. Термин “кокоил” представляет собой сокращенное название остатка жирной кислоты кокосового масла, и хлоридные соли данных соединений, данные сложноэфирные соединения и их соли в данном описании названы производными аргинина. Производные аргинина и их соли, в частности, проявляют прекрасное ингибирующее действие в отношении микроорганизмов, обладающих относительно сильной резистентностью, таких как *S. aureus*, *S. mutants*, *F. nucleatum*, которые вовлечены в образование зубного налета на зубах. Производное аргинина, предпочтительное для осуществления данного изобретения, представляет собой хлоридную соль этиллауроиларгинина.

Антибактериальный сложный эфир данного изобретения присутствует в оральных водных композициях в концентрации от примерно 0,05% мас. до примерно 2,0% мас., предпочтительно от примерно 0,075% мас. до примерно 1% мас.

Поверхностно-активное вещество

Поверхностно-активные вещества (ПАВ), применимые для осуществления данного изобретения, включают неионные и цвиттерионные поверхностно-активные вещества. Подходящие неионные поверхностно-активные вещества, применимые в данном изобретении, включают блок-сополимеры поли(оксиэтилена) и поли(оксипропилена). Такие сополимеры являются коммерчески доступными под непатентованным названием “полоксамеры”, которое используется в сочетании с числовым индексом для обозначения индивидуальной идентификации каждого сополимера. Содержание этиленоксида и пропиленоксида в полоксамерах может изменяться, что приводит к полоксамерам с широким спектром химических структур и молекулярных масс.

Предпочтительная группа неионных поверхностно-активных веществ, применимых в данном изобретении, включает продукты конденсации сорбитановых сложных эфиров жирных кислот с этиленоксид(полисорбатами), такими как

сорбитанмоноолеат, содержащий от примерно 20 до примерно 60 молей этиленоксида (например, "Tweens", торговая марка ICI US, Inc.). Особенно предпочтительными полисорбатами являются Polysorbat 20 (полиоксиэтилен 20 сорбитанмонолаурат, Tween 20) и Polysorbat 80 (полиоксиэтилен 20 сорбитанмоноолеат, Tween 80).

В некоторых предпочтительных вариантах осуществления данного изобретения антибактериальный алкиловый эфир N^α-ациламинокислоты стабилизирован в водном растворе с помощью поверхностно-активной системы (т.е. стабилизирующая поверхностно-активная система). Термин "стабилизирующая поверхностно-активная система" означает, что включается поверхностно-активное вещество, которое сохраняет биологическую доступность антибактериального ингредиента алкилового эфира N^α-ациламинокислоты, которое, как полагают, по существу предотвращает гидролиз алкилового эфира N^α-ациламинокислоты без необходимости введения дополнительных ингредиентов, таких как кислотные буферы. Таким образом, в некоторых предпочтительных вариантах осуществления данного изобретения водная композиция включает стабилизированную поверхностно-активную систему, включающую цвиттерионные поверхностно-активные вещества, наиболее предпочтительно бетаиновые поверхностно-активные вещества, которые, как установлено, стабилизируют антибактериальный алкиловый эфир N^α-ациламинокислоты без введения кислотного буфера, сохраняя таким образом биодоступность антибактериального сложного эфира. Таким образом, цвиттерионные поверхностно-активные вещества, применимые в некоторых вариантах осуществления данного изобретения, в частности бетаиновые поверхностно-активные вещества, включают поверхностно-активные вещества, описанные в патенте США №5180577. Типичные алкилдиметилбетаины включают децилбетаин-2-(N-децил-N,N-диметиламмоний)ацетат, кокобетаин- или 2-(N-кок-N,N-диметиламмоний)ацетат, миристилбетаин, пальмитилбетаин, лаурилбетаин, цетилбетаин, стеарилбетаин и т.п. Типичными примерами амидобетаинов являются кокоамидоэтилбетаин, кокоамидопропилбетаин, лаураамидопропилбетаин и т.п. Предпочтительным бетаином является кокоамидопропилбетаин.

Поверхностно-активное вещество присутствует в оральных водных композициях данного изобретения в концентрации в интервале от примерно 0,1% мас. до примерно 5% мас., предпочтительно от примерно 0,6% мас. до примерно 2,0% мас.

Необязательные ингредиенты

В композицию для полоскания полости рта данного изобретения могут также вводиться любые подходящие флаворанты или подслащивающие вещества. Примерами подходящих флаворантов являются ароматизирующие масла, например масла кудрявой мяты, перечной мяты, винтергреновое масло, масло сассафраса, гвоздики, шалфея, эвкалипта, майорана, корицы, лимона и апельсина, и метилсалицилат. Подходящие подслащивающие вещества включают сахарозу, лактозу, мальтозу, сорбит, ксилит, цикламат натрия, периллартин и натриевую соль сахарина. Флаворанты и подслащивающие вещества могут вместе составлять от 0,01% мас. до 5% мас. или более композиции для полоскания полости рта, и такие концентрации придают средству для полоскания полости рта приятный вкус, приемлемый для потребителя.

Оральная композиция данного изобретения может дополнительно содержать фторирующий агент для способствования профилактике зубного кариеса, а также

антибактериальные соли металлов, галогенированные дифениловые эфиры и ферменты. Фторирующие агенты, подходящие для применения в оральных композициях данного изобретения, включают фторид натрия, фторид калия, фторид олова и комплексные фториды, такие как монофторфосфат натрия. Фторирующий агент наиболее желательно присутствует в количестве, обеспечивающем содержание фторидного иона в композиции в интервале от 1000 до 2000 м.д.

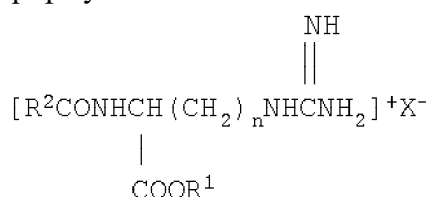
Примеры антибактериальных солей металлов, подходящих для применения в данном изобретении, включают соли олова, такие как хлорид олова, глюконат олова, соли цинка, такие как хлорид цинка, глюконат цинка, цитрат цинка, и соли меди, такие как глюконат меди. Примеры простых галогенированных дифениловых эфиров включают триклозан, и ферменты включают папаин и глюкоамилазу. Данные ингредиенты могут присутствовать в композиции данного изобретения в концентрациях от примерно 0,1% мас. до примерно 2% мас.

В оральные композиции данного изобретения могут также включаться добавки против зубного камня, совместимые с антибактериальными сложными эфирами, такие как этиллауроиларгинин. Примеры таких добавок против зубного камня включают катионные полифосфонаты, такие как водорастворимые четвертичные аминокалкиленфосфоновые производные, описанные в патенте США №4118472. Данные добавки против зубного камня могут вводиться в оральные композиции данного изобретения в концентрации от примерно 0,1% мас. до примерно 5% мас.

Добавки против зубного камня, которые не совместимы с антибактериальными сложными эфирами, такие как пирофосфатные и полифосфатные соли, могут вводиться в один компонент двухкомпонентной оральной композиционной системы, в которой первый компонент содержит антибактериальный сложный эфир, а второй компонент содержит несовместимую соль против зубного камня, причем первый и второй компоненты поддерживаются разделенными друг от друга, пока не диспергируются и не объединяются для применения на зубы.

Способы

Данное изобретение дополнительно предлагает способ получения стабильной водной оральной композиции против зубного налета, включающий смешение безопасного и эффективного количества антибактериального сложного эфира формулы



где R^1 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 1 до 8 атомов углерода, R^2 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 6 до 30 атомов углерода, и X представляет собой анион. Антибактериальный ингредиент смешивается со стабилизирующей поверхностно-активной системой, влагоудерживающим веществом и водой с получением водной композиции. В некоторых вариантах осуществления данного изобретения оральная композиция по существу свободна от кислотного буфера.

Приведенные далее примеры дополнительно описывают и демонстрируют варианты осуществления данного изобретения.

Пример 1

Средство для полоскания полости рта данного изобретения с pH, равным 5,0,

получают растворением в воде каждого из ингредиентов, приведенных в таблице 1 ниже, при перемешивании в стеклянной емкости смешения.

Таблица I

Ингредиент	% мас.
Этиллауроиларгинат HCl (ELAH)	0,1
Сорбит	10,0
Глицерин	10,0
Пропиленгликоль	7,0
Polysorbat 20	0,8
Кокоамидопропилбетаин	0,8
Натриевая соль сахарина	0,03
Флаворант	0,10
Вода	Баланс

После хранения в течение 9 месяцев при комнатной температуре концентрация ELAH остается неизменной и составляет 0,1% мас., как определено газовой хроматографией-масс-спектрометрией.

Пример 2

Средство для полоскания полости рта данного изобретения получают растворением в воде каждого из ингредиентов, представленных в таблице II ниже, при перемешивании в стеклянной емкости смешения. Этиллауроиларгинат (ELA) может включаться в концентрациях 0,1, 0,2 или 0,3 процента (мас.).

Таблица II

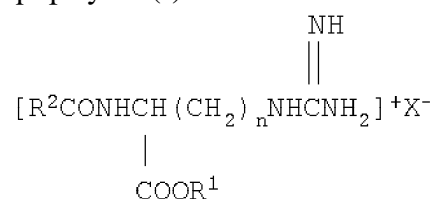
Ингредиент	% мас.
Этиллауроил аргинат HCl (ELAH)	0,1 или 0,2, или 0,3
Этиловый спирт	15,0
Сорбит	10,0
Глицерин	10,0
Пропиленгликоль	7,0
Кокоамидопропилбетаин	0,6
Натриевая соль сахарина	0,03
Флаворант	0,10
Вода	Баланс

Описание данного изобретения и примеры, представленные в нем, являются только типичными примерами и, следовательно, изменения, которые не отходят от сущности данного изобретения, как подразумевается, включены в объем данного изобретения. Такие изменения не должны рассматриваться как отступление от сущности и объема данного изобретения.

Формула изобретения

1. Стабильная водная оральная композиция против образования налета, которая включает

(а) безопасное и эффективное количество антибактериального сложного эфира формулы (I)



где R^1 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 1 до 8 атомов углерода, R^2 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 6 до 30 атомов углерода, и X представляет собой анион;

(b) стабилизирующее поверхностно-активное вещество, выбранное из неионного поверхностно-активного вещества или цвиттерионного поверхностно-активного вещества;

(c) влагоудерживающее вещество, выбранное из группы многоатомных спиртов; и
(d) воду,

где указанная композиция не содержит кислотный буфер.

2. Композиция по п.1, где n равно 3.

3. Композиция по п.2, где указанный антибактериальный сложный эфир включает гидрохлоридную соль этиллауроиларгинина.

4. Композиция по п.1, где концентрация указанного антибактериального сложного эфира находится в интервале от примерно 0,02% до примерно 2 мас.%.
5. Композиция по п.1, где указанное стабилизирующее поверхностно-активное вещество представляет собой цвиттерионное поверхностно-активное вещество.

6. Композиция по п.5, где указанное стабилизирующее поверхностно-активное вещество представляет собой бетаиновое поверхностно-активное вещество.

7. Композиция по п.1, дополнительно включающая спирт.

8. Композиция по п.7, где указанный спирт является одноатомным и представлен формулой $R'OH$, где R' представляет собой алкильную группу, содержащую от 1 до 8 атомов углерода.

9. Композиция по п.7, где указанный спирт является многоатомным.

10. Композиция по п.9, где указанный многоатомный спирт представляет собой пропиленгликоль.

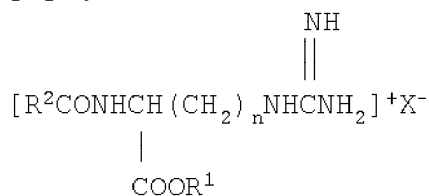
11. Композиция по п.1, где композиция по существу свободна от одноатомного спирта.

12. Композиция по п.1, где указанное влагоудерживающее вещество представляет собой смесь многоатомных спиртов.

13. Композиция по п.1, значение рН которой находится в интервале от примерно 6 до примерно 8.

14. Стабильная водная оральная композиция против образования налета, которая включает

(a) безопасное и эффективное количество антибактериального сложного эфира формулы (I)



где R^1 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 1 до 8 атомов углерода, R^2 представляет собой алкильную цепь, содержащую от 6 до 30 атомов углерода, и X представляет собой анион;

(b) стабилизирующее поверхностно-активное вещество, выбранное из неионного поверхностно-активного вещества или цвиттерионного поверхностно-активного вещества;

(c) влагоудерживающее вещество, выбранное из группы многоатомных спиртов; и
(d) воду;

где указанная композиция по существу свободна от одноатомных спиртов,
где указанная композиция не содержит кислотный буфер.

15. Композиция по п.14, где n равно 3.

5 16. Композиция по п.15, где указанный антибактериальный сложный эфир
включает гидрохлоридную соль этиллауроиларгинина.

17. Композиция по п.14, где концентрация указанного антибактериального
сложного эфира находится в интервале от примерно 0,02% до примерно 2 мас.%.

10 18. Композиция по п.14, где указанное стабилизирующее поверхностно-активное
вещество представляет собой цвитерионное поверхностно-активное вещество.

19. Композиция по п.14, значение рН которой находится в интервале от
примерно 6 до примерно 8.

15

20

25

30

35

40

45

50