

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4674980号
(P4674980)

(45) 発行日 平成23年4月20日(2011.4.20)

(24) 登録日 平成23年2月4日(2011.2.4)

(51) Int. Cl.	F 1	
A 6 1 K 8/49	(2006.01)	A 6 1 K 8/49
A 6 1 K 8/43	(2006.01)	A 6 1 K 8/43
A 6 1 K 8/86	(2006.01)	A 6 1 K 8/86
A 6 1 Q 11/00	(2006.01)	A 6 1 Q 11/00

請求項の数 2 (全 7 頁)

(21) 出願番号	特願2001-50116 (P2001-50116)	(73) 特許権者	000106324 サンスター株式会社 大阪府高槻市朝日町3番1号
(22) 出願日	平成13年2月26日(2001.2.26)	(72) 発明者	齋藤 徹 大阪府高槻市上土室5-30-1 サン スター土室事業所内
(65) 公開番号	特開2002-255771 (P2002-255771A)	審査官	小川 知宏
(43) 公開日	平成14年9月11日(2002.9.11)	(56) 参考文献	特開平10-212220 (JP, A) 特開平10-120539 (JP, A)
審査請求日	平成20年2月25日(2008.2.25)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 アルコール無配合液体口腔用組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

(a) カチオン系殺菌剤として、塩化セチルピリジニウムまたは塩酸クロルヘキシジンの何れか一つ(b)ポリオキシエチレン(60EO)硬化ヒマシ油、(c)平均分子量が200から800のポリエチレングリコールを含有し、かつ(a)の配合量が0.01~0.1重量%、(c)の配合量が1~5重量%であり、(a)と(c)の配合量比が、1:30~1:100であることを特徴とするエタノール無配合液体口腔用組成物。

【請求項2】

液体歯磨、マウスウォッシュ、リンス、低粘度ジェルの何れかである請求項1に記載のエタノール無配合液体口腔用組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、カチオン系殺菌剤による歯牙の着色を抑制したアルコール無配合液体口腔用組成物に関する。

【0002】

【従来の技術】

虫歯や歯周炎の原因である歯垢(プラーク)の除去や付着予防(プラークコントロール)は、口腔衛生において重要である。従来、プラーク細菌を殺菌する目的でカチオン系抗菌剤を配合した口腔用組成物が提案されている。しかし、カチオン系殺菌剤を長期間使用する

と、歯牙が着色するという問題がある。

【0003】

カチオン系殺菌剤の使用による歯牙着色の問題を解決するため、例えば、WO-9316681には、カチオン性殺菌剤とポリビニルピロリドンとを併用してなる口腔用組成物によって、カチオン系殺菌剤による歯牙の着色を抑制するところが記載されている。しかし、ポリビニルピロリドンは製剤系での安定性が悪く、長期保存により製剤の変色が起こるといった問題がある。また、特開昭57-188510号公報には、第4級アンモニウム化合物とテトラアルカリ金属のピロリン酸塩を特定のpHに調整することにより、第4級アンモニウム化合物由来の歯牙着色を減少させることが記載されている。しかし、テトラアルカリ金属のピロリン酸塩は味が悪いという問題がある。すなわち上記のいずれの場合でも、その効果は十分であるとはいえない。

10

【0004】

ポリエチレングリコールは、主に分散剤や湿潤剤として製剤の安定化を目的として配合されている。例えば、特開昭56-77221号公報にはアニオン性活性剤を含有する透明の歯磨組成物中に、特定のポリエチレングリコールを配合することで、低温下におけるアニオン性活性剤の析出を防止できることが記載されている。また、特開平03-109315号公報には、ポリオキシエチレン・ポリオキシプロピレンブロックコポリマ-系界面活性剤で構成される水性ゲルに、塩化セチルピリジニウムおよび特定量のポリエチレングリコールで配合することにより塩化セチルピリジニウムを安定に配合し、良好な性状を有する歯磨組成物について記載されている。さらに、特表平09-510192号公報には、キサンタンガム等の沈澱防止剤により安定に懸濁された、粒状シリカ研磨剤と、ソルビト-ル及び特定分子量のポリエチレングリコールを含む湿潤剤系とからなる液体歯磨剤は、歯の浄化性に優れていることが記載されている。これらはいずれもカチオン系殺菌剤による歯牙着色の抑制については言及されていない。

20

【0005】

【発明が解決しようとする課題】

すなわち、本発明はカチオン系殺菌剤による歯牙着色を抑制した1価アルコール無配合液体口腔用組成物を提供するものである。

【0006】

【問題点を解決するための手段】

本発明者らはかかる事情に鑑み鋭意検討をかさねた結果、カチオン系殺菌剤にポリオキシエチレン硬化ヒマシ油およびポリエチレングリコールを配合したアルコール無配合の液体口腔用組成物は、カチオン系殺菌剤による歯牙の着色を抑制することを見出し、本発明を完成するに至った。

30

【0007】

【発明の実施の形態】

本発明のアルコール無配合液体口腔用組成物で用いるカチオン系殺菌剤は、特に限定されるものではないが、塩化セチルピリジニウムまたはクロルヘキシジン塩類が好ましい。その配合量は、組成物全量に対して0.01~0.1重量%であり、0.01重量%より少ないと、十分な殺菌効果が発揮されず、0.1重量%より多いと、苦味の問題が起こることがある。

40

【0008】

本発明の1価アルコール無配合液体口腔用組成物で用いるポリオキシエチレン硬化ヒマシ油は、特に限定されるものではないが、そのエチレンオキシドの付加モル数が10~100モルが好ましく、特に40~60モルが好ましい。またその配合量は、組成物全量に対して0.01~5重量%が好ましく、0.1~1重量%が特に好ましい。0.01重量%より少ないと、十分な可溶化力が得られない場合があり、5重量%より多いと、ミセル中へのカチオン系殺菌剤の取り込みによる殺菌活性の低下が生じる恐れがある。

【0009】

本発明のポリエチレングリコールは、その平均分子量が200~800が好ましく、その

50

配合量は、カチオン性殺菌剤の配合量に対しての配合量比が、1 : 30 ~ 1 : 100 が好ましく、且つ、組成物全量に対し1 ~ 5重量%が好ましい。1重量%より少ないと歯牙着色の抑制が不十分で、5重量%より多いと苦味の問題が生じる。

【0010】

本発明のアルコール無配合液体口腔用組成物は、液体歯磨、マウスウォッシュ、リンス、低粘度ジェルなどの形態で提供できる。ここでいうアルコール無配合液体口腔用組成物とは1価アルコール無配合液体口腔用組成物、特にエタノール無配合無配合液体口腔用組成物であることを示す。

【0011】

本発明のアルコール無配合液体口腔用組成物は前記の成分に加えて、さらに組成物の形態に応じた以下のような適当な成分を本発明の効果を損なわない範囲で配合することができる。

【0012】

例えば、界面活性剤として、ノニオン界面活性剤または両性界面活性剤から選ばれる。例えば、ノニオン界面活性剤としてはショ糖脂肪酸エステル、マルトース脂肪酸エステル、ラクトース脂肪酸エステルなどの糖脂肪酸エステル、脂肪酸アルカノールアミド類、ソルビタン脂肪酸エステル、脂肪酸モノグリセライド、ポリオキシエチレン付加係数が8 ~ 10、アルキル基の炭素数が13 ~ 15であるポリオキシエチレンアルキルエーテル系またはポリオキシエチレン付加係数が10 ~ 18、アルキル基の炭素数が9であるポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル系ノニオン界面活性剤などが挙げられる。両性イオン界面活性剤としては、N-ラウリルジアミノエチルグリシン、N-ミリスチルジエチルグリシンなどのN-アルキルジアミノエチルグリシン、N-アルキル-N-カルボキシメチルアンモニウムベタイン、2-アルキル-1-ヒドロキシエチルイミダゾリンベタインナトリウムがあげられる。これらの界面活性剤は、単独または2種以上を組み合わせることで配合することができる。その配合量は、通常、組成物全量に対して0.01 ~ 30重量%、好ましくは0.1 ~ 5重量%である。

【0013】

香味剤として、メントール、カルボン酸、アネトール、オイゲノール、サリチル酸メチル、リモネン、オシメン、n-デシルアルコール、シトロネール、-テルピネオール、メチルアセタート、シトロネニルアセタート、メチルオイゲノール、シネオール、リナロール、エチルリナロール、チモール、スペアミント油、ペパーミント油、レモン油、オレンジ油、セージ油、ローズマリー油、珪皮油、シソ油、冬緑油、丁子油、ユーカリ油、ピメント油などの香料を、単独または2種以上を組み合わせることで組成物全量に対して0.1 ~ 重量%、好ましくは0.5 ~ 5重量%程度の割合で配合することができる。

【0014】

また、サッカリンナトリウム、アセスルファムカリウム、ステビオサイド、ネオヘスペリジルジヒドロカルコン、グリチルリチン、ペリラルチン、タウマチン、アスパラチルフェニルアラニルメチルエステル、-メトキシシンナミックアルデヒドなどの甘味剤を、組成物全量に対して0.01 ~ 1重量%、好ましくは0.05 ~ 0.5重量%の割合で配合することができる。

【0015】

本発明の口腔用組成物においては、使用感を損なわない程度の粘性を持たせるために、カチオン化ヒドロキシエチルセルロース、アルギン酸ナトリウムなどのアルカリ金属アルギネート、アルギン酸プロピレングリコールエステル、キサンタンガム、トラガントガム、カラヤガム、アラビヤガム、カラギーナンなどのガム類、ポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウム、カルボキシビニルポリマー、ポリビニルピロリドンなどの合成粘結剤、シリカゲル、アルミニウムシリカゲル、ビーガム、ラポナイトなどの無機粘結剤などの1種又は2種以上が配合され得る。これらの配合量は通常0.1重量%以下である。

【0016】

さらに、湿潤剤として、ソルビット、グリセリン、エチレングリコール、プロピレングリ

10

20

30

40

50

コール、1,3-ブチレングリコール、ポリプロピレングリコール、キシリット、マルチット、ラクチットなどを単独または2種以上を組み合わせて配合することができる。配合量は、通常、組成物全量に対して3～70重量%である

【0017】

なお、本発明の口腔用組成物には、カチオン性殺菌剤以外の薬効成分として、酢酸d,l-トコフェロール、コハク酸トコフェロール、またはニコチン酸トコフェロールなどのビタミンE類、ドデシルジアミノエチルグリシンなどの両性殺菌剤、トリクロサン、イソプロピルメチルフェノールなどの非イオン性殺菌剤、デキストラナーゼ、アミラーゼ、プロテアーゼ、ムタナーゼ、リゾチーム、溶菌酵素(リテックエンザイム)などの酵素、モノフルオロリン酸ナトリウム、モノフルオロリン酸カリウムなどのアルカリ金属モノフルオロオロフォスフェート、フッ化ナトリウム、フッ化第一錫などのフッ化物、トラネキサム酸やイプシロンアミノカプロン酸、アルミニウムクロルヒドロキシアラントイン、ジヒドロコレステロール、グリチルリチン塩類、グリチルレチン酸、グリセロフォスフェート、クロロフィル、塩化ナトリウム、カロペプタイド、水溶性無機リン酸化合物などを、単独または2種以上を組み合わせて配合することができる。

【0018】

【実施例】

以下の実施例により本発明をさらに詳細するが、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。実施例中、[%]は特に断らない限り[重量%]である。

以下に評価方法を示す。

1. 歯牙着色評価試験

アクリル板(10mm×30mm×5mm)を0.3%牛血清アルブミンに2分間漬す。そのアクリル板を蒸留水に30秒間浸漬して洗浄後、試験サンプルに2分間漬す。蒸留水に30秒間浸漬して洗浄後、紅茶(10g/1000ml沸騰水で抽出し、2分後にガーゼに通して葉を取り除いたもの)に60分間漬す。蒸留水に30秒間浸漬して洗浄後、自然乾燥する。上記の操作を10回繰り返す、アクリル板表面の着色を、測定波長395nmで吸光度を測定する。

【0019】

2. 評価基準:

吸光度に応じて下記の通りに評した。

吸光度	0.6未満	: 5
	0.6以上 0.8未満	: 4
	0.8以上 1.0未満	: 3
	1.0以上 1.2未満	: 2
	1.2以上	: 1

評価基準の数値が大きいかほど歯牙着色抑制効果が高いことを示す。結果を表1に示す。

【0020】

【表1】

10

20

30

40

	実施例1	実施例2	実施例3	実施例4	比較例1	比較例2	比較例3	比較例4
塩化セチルピリジニウム	0.05	0.1			0.05	0.1		
塩酸クロルヘキシジン			0.01	0.1			0.01	0.1
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油(60EO)	5	5	5	5	5	5	5	
PEG100						3		
PEG200		3						
PEG400	5			5				5
PEG800			1					
PEG1000							1	
香料	0.1	0.1	0.1		0.1	0.1	0.1	
サッカリン	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01
グリセリン	10	10	10	10	10	10	10	10
pH調整剤	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
精製水	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部
歯牙着色抑制効果	5	4	5	5	1	1	2	3

PEG:ポリエチレングリコールを表す。

【0021】

表1の結果により、平均分子量200～800のポリエチレングリコールを1.0%～5.0%配合した実施例1～3の試験サンプルは、ポリエチレングリコールを無配合の比較例1、または平均分子量1000のポリエチレングリコールを配合した比較例2及び3の試験サンプルに比べて、歯牙着色抑制効果が極めて優れていることが明らかである。さらに比較例4の試験サンプルのようにポリオキシエチレン硬化ヒマシ油を無配合の場合、実施例1、4の試験サンプルのような効果が見られないことが分かった。

【0022】

実施例5

以下の処方により、常法に従い、マウスウォッシュを製造した。

成分名	配合量 (%)
グリセリン	15.0
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 (EO)	4.0
ポリエチレングリコール400	3.0
香料	0.1
サッカリンナトリウム	0.01
塩化セチルピリジニウム	0.05
クエン酸ナトリウム	0.05
酢酸トコフェロール	0.02
フッ化ナトリウム	0.05
精製水	残部
合計	100.0

得られたマウスウォッシュについては、上記の歯牙着色評価試験法で評価したところ、優れた抑制効果を示した。

【0023】

実施例 6

以下の処方により、常法に従い、液体歯磨剤を製造した。

成分名	配合量 (%)	
ソルビット	10.0	
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 (EO)	5.0	
香料	0.05	
ポリエチレングリコール400	5.0	10
サッカリンナトリウム	0.01	
グルコン酸クロルヘキシジン	0.05	
クエン酸ナトリウム	0.05	
酢酸トコフェロール	0.02	
フッ化ナトリウム	0.05	
精製水	残部	
合計	100.0	20

得られた液体歯磨剤については、上記の歯牙着色評価試験法で評価したところ、優れた抑制効果を示した。

【0024】

実施例 7

以下の処方により、常法に従い、低粘度ジェルを製造した。

成分名	配合量 (%)	
ソルビット	10.0	
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油 (EO)	3.0	30
香料	0.2	
ポリエチレングリコール400	1.0	
サッカリンナトリウム	0.01	
グルコン酸クロルヘキシジン	0.05	
ヒドロキシエチルセルロース	0.01	
酢酸トコフェロール	0.05	
フッ化ナトリウム	0.05	40
精製水	残部	
合計	100.0	

得られた低粘度ジェルについては、上記の歯牙着色評価試験法で評価したところ、優れた抑制効果を示した。

【0025】

【発明の効果】

カチオン系殺菌剤にポリオキシエチレン硬化ヒマシ油およびポリエチレングリコールを配合する本発明によれば、カチオン系殺菌剤による歯牙の着色を抑制するアルコール無配合の液体口腔用組成物が提供できる。

フロントページの続き

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B名)

A61K 8/49

A61K 8/43

A61K 8/86

A61Q 11/00