

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6894808号  
(P6894808)

(45) 発行日 令和3年6月30日(2021.6.30)

(24) 登録日 令和3年6月8日(2021.6.8)

(51) Int.Cl.		F I
<b>A 6 1 K</b> 8/34	(2006.01)	A 6 1 K 8/34
<b>A 6 1 K</b> 8/41	(2006.01)	A 6 1 K 8/41
<b>A 6 1 Q</b> 11/00	(2006.01)	A 6 1 Q 11/00
<b>A 6 1 P</b> 1/02	(2006.01)	A 6 1 P 1/02
<b>A 6 1 K</b> 31/047	(2006.01)	A 6 1 K 31/047

請求項の数 7 (全 15 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2017-167154 (P2017-167154)  
 (22) 出願日 平成29年8月31日(2017.8.31)  
 (65) 公開番号 特開2018-39800 (P2018-39800A)  
 (43) 公開日 平成30年3月15日(2018.3.15)  
 審査請求日 令和2年6月12日(2020.6.12)  
 (31) 優先権主張番号 特願2016-172116 (P2016-172116)  
 (32) 優先日 平成28年9月2日(2016.9.2)  
 (33) 優先権主張国・地域又は機関  
 日本国(JP)

(73) 特許権者 000000918  
 花王株式会社  
 東京都中央区日本橋茅場町1丁目14番1  
 〇号  
 (74) 代理人 110000084  
 特許業務法人アルガ特許事務所  
 (72) 発明者 内野 陽介  
 東京都墨田区文花2-1-3 花王株式会  
 社研究所内

審査官 星 浩臣

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 口腔内歯垢分散剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

ペンタエリスリトール、トリメチロールメタン、トリメチロールエタン、トリメチロールプロパン、トリスヒドロキシメチルアミノメタン、及びトリエタノールアミンから選ばれる1種又は2種以上の水溶性化合物(A)を有効成分とする口腔内歯垢分散剤。

【請求項2】

成分(A)の含有量が、0.2質量%以上20質量%以下である請求項1に記載の口腔内歯垢分散剤。

【請求項3】

さらに、分子構造中の第1級水酸基の数が2である糖アルコール(B)を5質量%以上50質量%以下含有する請求項1又は2に記載の口腔内歯垢分散剤。

【請求項4】

成分(B)が、エリスリトール、キシリトール、還元パラチノース、及びマンニトールから選ばれる1種又は2種以上(B1)である請求項3に記載の口腔内歯垢分散剤。

【請求項5】

さらに、尿素、グアニジン又はその塩、及びアニオン界面活性剤から選ばれる1種又は2種以上のタンパク質変性剤(C)を含有する請求項1~4のいずれか1項に記載の口腔内歯垢分散剤。

【請求項6】

水の含有量が、50質量%以上99質量%以下である請求項1~5のいずれか1項に記

載の口腔内歯垢分散剤。

【請求項 7】

さらに、カチオン性殺菌剤を含有する請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の口腔内歯垢分散剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、口腔内歯垢分散剤に関する。

【背景技術】

【0002】

従来より、分子構造中に水酸基を有するエリスリトールやペンタエリスリトール、ポリエリレングリコールやグリセリン等の糖アルコールや多価アルコールは、口腔内に適用するための種々の剤や組成物に用いられている。これらは、具体的には、例えば特許文献 1 に記載されるように香味成分として、或いは特許文献 2 ~ 3 に記載されるように湿潤剤や保湿剤として、良好な香味をもたらす、口腔内の乾燥抑制にも寄与し得る成分である。

【0003】

一方、こうした糖アルコールのなかでも、例えばキシリトールは、口腔内に存在する種々の細菌によってバイオフィルムの 1 種である歯垢（プラーク）が形成されるのを抑制し得る成分としても知られており、特許文献 4 ~ 5 には、かかるキシリトールとデキストラナーゼ、或いはグルカンの硫酸化物やその水溶性塩とを含有する口腔用組成物が開示されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

【特許文献 1】特開 2009 - 114125 号公報

【特許文献 2】特開 2013 - 124220 号公報

【特許文献 3】特開 2010 - 235457 号公報

【特許文献 4】特開平 11 - 100315 号公報

【特許文献 5】特開 2000 - 281547 号公報

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

こうした歯垢は、より詳細には、口腔内の細菌が産生する菌体外多糖（EPS）によって形成され、歯面に強固に定着し、歯垢の内部や深部に細菌が増殖している集塊物である。EPS には主として不溶性グルカンが存在しており、歯垢の増大に伴って、かかる EPS 表層における不溶性グルカンの存在比率が高まり、歯垢内部の細菌を外界から守るバリアとして機能しつつ、細菌の増殖を促進することとなる。

しかしながら、上記特許文献 4 ~ 5 に記載のキシリトールを用いた技術では、歯垢の形成を未然に防止し得たとしても、EPS 表層を破壊しつつ歯垢の深部に至るまで十分に作用を及ぼすことができず、すでに堅固に形成された歯垢を効果的に分散させてこれを除去するには、依然としてさらなる改善を要する。

【0006】

したがって、本発明は、歯垢の表層から深部に至るまで有効に作用し、優れた歯垢分散効果を発揮することのできる口腔内歯垢分散剤に関する。

【課題を解決するための手段】

【0007】

そこで本発明者は、種々検討したところ、分子構造中に特定の水酸基を特定量有し、かつ特定の化学式量の水溶性化合物を有効成分とすることにより、優れた歯垢除去効果を発揮することのできる口腔内歯垢分散剤が得られることを見出した。

【0008】

10

20

30

40

50

すなわち、本発明は、分子構造中の第1級水酸基の数が3以上であり、かつ化学式量が100以上200以下の水溶性化合物(A)を有効成分とする口腔内歯垢分散剤に関する。

【発明の効果】

【0009】

本発明の口腔内歯垢分散剤によれば、すでに堅固に形成された歯垢に対し、表層だけでなく深部に至るまでこれを効果的に分散させて除去することができ、う蝕、歯周病、口臭等の口腔疾患の予防を図ることも可能となる。

【発明を実施するための形態】

【0010】

以下、本発明について詳細に説明する。

本発明の口腔内歯垢分散剤は、分子構造中の第1級水酸基の数が3以上であり、かつ化学式量が100以上200以下の水溶性化合物である成分(A)を有効成分とする。EPSに主として存在する不溶性グルカン、D-グルコースがグリコシド結合で連結したポリマーであるが、本発明者は、そのポリマー構造の随所で分子内水素結合が多々存在していることに着目し、成分(A)の分子構造中に存在する3以上の第1級水酸基が、このポリマー中の水素結合を遮断して、歯垢の強固たる集塊性を脆弱化させることに有効であると考え、成分(A)が歯垢を効果的に分散させる有効成分として有用であることを見出したものである。

【0011】

成分(A)の分子構造中の第1級水酸基の数は、水素結合の遮断によって歯垢を有効に脆弱化させて高い歯垢分散効果を発揮する観点から、3以上であり、好ましくは4以上であり、入手容易性の観点から、好ましくは6以下であり、より好ましくは5以下であり、好ましくは4である。

【0012】

成分(A)は水溶性化合物であり、かかる成分(A)の20の水100gに対する溶解度は、好ましくは3g/100g以上であり、より好ましくは5~70g/100gであり、さらに好ましくは5~60g/100gである。

【0013】

成分(A)の化学式量は、成分(A)の分子構造中に上記有効な数の第1級水酸基を有する観点、水素結合を効果的に遮断して高い歯垢分散効果を発揮する観点、及び入手容易性の観点から、100以上であって、好ましくは120以上であり、より好ましくは130以上であり、200以下であって、好ましくは180以下であり、より好ましくは160以下である。

なお、成分(A)の化学式量は、いわゆる成分(A)の分子量であり、成分(A)を化学式で表したときの、成分元素の原子量の総和により求められる。

【0014】

成分(A)としては、より具体的には、好ましくはペンタエリスリトール、トリメチロールメタン、トリメチロールエタン、トリメチロールプロパン、トリスヒドロキシメチルアミノメタン、及びトリエタノールアミンから選ばれる1種又は2種以上が挙げられる。なかでも、分子構造中の第1級水酸基が上記有効な数である観点、水素結合を効果的に遮断して高い歯垢分散効果を発揮する観点、及び入手容易性の観点から、より好ましくはペンタエリスリトール、トリメチロールエタン、トリメチロールプロパン、トリスヒドロキシメチルアミノメタン、及びトリエタノールアミンから選ばれる1種又は2種以上であり、さらに良好な使用感をも確保する観点から、さらに好ましくはペンタエリスリトール、トリメチロールエタン、及びトリメチロールプロパンから選ばれる1種又は2種以上であり、よりさらに好ましくはペンタエリスリトールである。

【0015】

さらに具体的には、例えば、ペンタエリスリトールは、英語名がPentaerythritolであり、化学式量は136.15、15で、水に対する溶解度は5.6g/100mLであ

10

20

30

40

50

る。日本合成化学工業、東京化成工業、東洋ケミカルズ等から市販されている。

トリメチロールエタンは、別名1,1,1-Tris(hydroxymethyl)ethaneであり、化学式量は120.15、20 で、水に対する溶解度が60 g / 100 mLである。

トリスヒドロキシメチルアミノメタンは、英語名がTris(hydroxymethyl)aminomethaneであり、化学式量は121.14、25 で、水に対する溶解度が50 g / 100 mLである。

トリエタノールアミンは、英語名がTriethanolamine、別名Tris(2-hydroxyethyl)amineであり、化学式量は149.19で、水に易溶性である。

トリメチロールプロパンは、英語名がTrimethylolpropane、別名1,1,1-Tris(hydroxymethyl)propaneであり、化学式量は134.18で、水に易溶性である。

10

#### 【0016】

成分(A)の含有量は、水素結合の遮断によって歯垢を有効に脆弱化させて高い歯垢分散効果を発揮する観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは0.2質量%以上であり、より好ましくは1質量%以上であり、さらに好ましくは2質量%以上であり、よりさらに好ましくは4質量%以上である。また、成分(A)の含有量は、成分(A)の口腔内での溶解性又は分散性を確保する観点から、好ましくは20質量%以下であり、より好ましくは18質量%以下であり、さらに好ましくは15質量%以下である。そして、成分(A)の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは0.2~20質量%であり、より好ましくは1~20質量%であり、さらに好ましくは2~18質量%であり、よりさらに好ましくは4~15質量%である。

20

#### 【0017】

本発明の口腔内歯垢分散剤は、さらに成分(B)として、分子構造中の第1級水酸基の数が2である糖アルコール(B)を含有するのが好ましい。かかる成分(B)は、単独で発揮し得る歯垢分散効果に限界が生じ得るところ、これを上記成分(A)と併用することにより、歯垢分散効果をより一層高めて、効果的に歯垢を除去することができる。

#### 【0018】

成分(B)としては、優れた歯垢分散効果を確保して、効果的に歯垢を除去する観点から、好ましくはエリスリトール、キシリトール、還元パラチノース、及びマンニトールから選ばれる1種又は2種以上(B1)が挙げられ、溶解性や湿潤性、及び風味の観点から、好ましくはソルビトール及びグリセリンから選ばれる1種又は2種(B2)が挙げられる。なかでも優れた歯垢分散効果を確保して、効果的に歯垢を除去する観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤は、成分(B)として、好ましくは成分(B1)を含有し、より好ましくはエリスリトール、及びキシリトールから選ばれる1種又は2種を含有し、さらに好ましくはエリスリトールを含有する。

30

#### 【0019】

成分(B1)の含有量は、優れた歯垢分散効果を確保する観点、及び良好な香味を付与する観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは1質量%以上であり、より好ましくは2質量%以上であり、さらに好ましくは3質量%以上であり、よりさらに好ましくは5質量%以上である。また、成分(B1)の含有量は、歯垢除去効果をより一層高めて、効果的に歯垢を除去する観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは55質量%以下であり、より好ましくは50質量%以下であり、さらに好ましくは40質量%以下であり、よりさらに好ましくは30質量%以下である。そして、成分(B1)の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは1~55質量%であり、より好ましくは2~50質量%であり、さらに好ましくは3~40質量%であり、よりさらに好ましくは5~30質量%である。

40

#### 【0020】

より具体的には、例えば、本発明の口腔内歯垢分散剤が、練歯磨剤や粉歯磨剤等の歯磨剤である場合、成分(B1)の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは5質量%以上であり、より好ましくは10質量%以上であり、さらに好ましくは15質量%以上であり、好ましくは55質量%以下であり、より好ましくは50質量%以下であり、

50

さらに好ましくは45質量%以下である。

また、本発明の口腔内歯垢分散剤が、洗口液や液状歯磨剤等の液剤である場合、成分(B1)の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは1質量%以上であり、より好ましくは2質量%以上であり、さらに好ましくは3質量%以上であり、好ましくは20質量%以下であり、より好ましくは15質量%以下であり、さらに好ましくは12質量%以下である。

【0021】

成分(B2)の含有量は、良好な香味や湿潤効果を確保する観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは1~30質量%であり、より好ましくは2~25質量%であり、さらに好ましくは3~20質量%である。

10

より具体的には、例えば、本発明の口腔内歯垢分散剤が、練歯磨剤や粉歯磨剤等の歯磨剤又は泡吐出容器用液剤である場合、成分(B2)の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは3~30質量%であり、より好ましくは5~25質量%であり、さらに好ましくは10~20質量%である。また、本発明の口腔内歯垢分散剤が、洗口液や液状歯磨剤等の液剤である場合、成分(B2)の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは1~20質量%であり、より好ましくは2~15質量%であり、さらに好ましくは3~12質量%である。

【0022】

成分(A)と成分(B1)の質量比((A)/(B1))は、優れた歯垢分散効果を確保する観点から、好ましくは0.01以上であり、より好ましくは0.05以上であり、さらに好ましくは0.1以上であり、よりさらに好ましくは0.2以上である。成分(A)と成分(B1)の質量比((A)/(B1))は、高い歯垢分散効果によって効果的に歯垢を除去する観点から、好ましくは10以下であり、より好ましくは5以下であり、さらに好ましくは3以下であり、よりさらに好ましくは1以下であり、またさらに好ましくは0.8以下である。そして、成分(A)と成分(B1)の質量比((A)/(B1))は、好ましくは0.01~10であり、より好ましくは0.01~5であり、さらに好ましくは0.05~3であり、よりさらに好ましくは0.1~1であり、またさらに好ましくは0.2~0.8である。

20

【0023】

より具体的には、例えば、本発明の口腔内歯垢分散剤が、練歯磨剤やジェル状歯磨剤である場合は、成分(A)と成分(B1)の質量比((A)/(B1))は、優れた歯垢分散効果を確保する観点から、好ましくは、0.01以上であり、より好ましくは0.05以上であり、さらに好ましくは0.1以上であり、よりさらに好ましくは0.2以上であり、高い歯垢分散効果によって効果的に歯垢を除去する観点から、好ましくは3以下であり、より好ましくは2以下であり、さらに好ましくは1以下であり、よりさらに好ましくは0.8以下である。

30

また、本発明の口腔内歯垢分散剤が、洗口液や液状歯磨剤等の液剤である場合は、成分(A)と成分(B1)の質量比((A)/(B1))は、優れた歯垢分散効果を確保する観点から、好ましくは0.01以上であり、より好ましくは0.1以上であり、さらに好ましくは0.2以上であり、よりさらに好ましくは0.4以上であり、高い歯垢分散効果によって効果的に歯垢を除去する観点から、好ましくは10以下であり、より好ましくは5以下であり、さらに好ましくは3以下である。

40

【0024】

本発明の口腔内歯垢分散剤は、さらに成分(C)として、尿素、グアニジン又はその塩、及びアニオン界面活性剤から選ばれる1種又は2種以上のタンパク質変性剤を含有するのが好ましい。かかる成分(C)は、タンパク質変性効果をもたらす成分であるものの、かかる成分(C)のみでは歯垢分散効果を十分に高めることが困難であるところ、成分(A)と相まって歯垢分散効果を効果的に高めることが可能となる。

【0025】

グアニジンの塩としては、塩酸塩、硫酸塩等の酸付加塩が挙げられる。

50

アニオン界面活性剤としては、高級脂肪酸塩、胆汁酸塩及びその誘導体、アルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、ポリオキシアルキレンアルキル硫酸エステル塩、ポリオキシアルキレンアルキルスルホン酸塩、ポリオキシアルキレンアルキルリン酸エステル塩、N - アシルアミノ酸塩、アルキルメチルタウリン塩、スルホコハク酸エステル塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩等が挙げられる。これらのアニオン界面活性剤のアルキル部分又は脂肪族アシル部分の炭素数は8 ~ 24が好ましい。なかでもより好ましいアニオン界面活性剤としては、炭素数が8 ~ 24のアルキル硫酸エステル塩、アシル基の炭素数が8 ~ 24のN - アシルサルコシン塩、炭素数が8 ~ 24のアルキルメチルタウリン塩、N - アシル酸性アミノ酸塩が挙げられる。

【0026】

成分(C)のタンパク質変性剤の含有量は、成分(A)との併用により口腔内において歯垢分散効果を相乗的に高める観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは0.001質量%以上であり、より好ましくは0.005質量%以上であり、さらに好ましくは0.01質量%以上であり、よりさらに好ましくは0.1質量%以上であり、好ましくは1質量%以下であり、より好ましくは0.8質量%以下であり、さらに好ましくは0.5質量%以下である。

より具体的には、例えば、本発明の口腔内歯垢分散剤が練歯磨剤や粉歯磨剤等の歯磨剤である場合、成分(C)のタンパク質変性剤の含有量は、歯磨き中に歯磨剤が唾液により希釈される間も優れた歯垢分散効果を確保し、さらに成分(A)との併用により歯垢分散効果を相乗的に高める観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは0.1質量%以上であり、より好ましくは0.2質量%以上であり、タンパク質変性効果によって口腔内粘膜に有害性が与えられるのを抑制する観点から、好ましくは2質量%以下であり、より好ましくは1.5質量%以下であり、さらに好ましくは1.2質量%以下である。

【0027】

本発明の口腔内歯垢分散剤において、水の含有量は、歯垢内の水素結合を遮断しつつ水を包含させて、効果的に歯垢の脆弱化を図る観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは50質量%以上であり、より好ましくは55質量%以上であり、さらに好ましくは60質量%以上であり、好ましくは99質量%以下であり、より好ましくは95質量%以下であり、さらに好ましくは90質量%以下である。また、水の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤が成分(B)又は成分(C)、或いは成分(B)及び成分(C)を含有する場合には、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは90質量%以下であり、より好ましくは85質量%以下である。そして、水の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは50 ~ 99質量%であり、より好ましくは55 ~ 95質量%であり、さらに好ましくは60 ~ 90質量%である。また、水の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤が成分(B)又は成分(C)、或いは成分(B)及び成分(C)を含有する場合には、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは50 ~ 90質量%であり、より好ましくは55 ~ 85質量%であり、さらに好ましくは60 ~ 85質量%である。

さらにまた、本発明の口腔内歯垢分散剤が練歯磨剤や粉歯磨剤等の歯磨剤である場合、水の含有量は、適度な粘度をもちつつ、口腔内での分散性と口溶けを確保する観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは12質量%以上であり、より好ましくは15質量%以上であり、好ましくは55質量%以下であり、より好ましくは50質量%以下であり、さらに好ましくは45質量%以下である。

【0028】

成分(A)と水との質量比((A)/水)は、成分(A)の有効成分としての歯垢分散効果が高く、仮に低濃度であっても十分な効果を発揮し得る観点、及びコスト面の観点から、好ましくは0.01以上であり、より好ましくは0.02以上であり、さらに好ましくは0.05以上である。また、成分(A)と水との質量比((A)/水)は、成分(A)の水への溶解性と歯垢分散効果とのバランスを確保する観点から、好ましくは0.5以下であり、より好ましくは0.3以下であり、さらに好ましくは0.2以下である。そして、成分(A)と水との質量比((A)/水)は、好ましくは0.01 ~ 0.5であり、

10

20

30

40

50

より好ましくは0.02~0.3であり、さらに好ましくは0.05~0.2である。

より具体的には、例えば、本発明の口腔内歯垢分散剤が練歯磨剤や粉歯磨剤等の歯磨剤である場合、成分(A)と水との質量比((A)/水)は、成分(A)の有効成分としての歯垢分散効果を確保する観点から、好ましくは0.02以上であり、より好ましくは0.04以上であり、さらに好ましくは0.08以上であり、よりさらに好ましくは0.1以上であり、歯磨剤の使用中に唾液により希釈されても歯垢分散効果を持続させる観点から、好ましくは2以下であり、より好ましくは1.5以下であり、さらに好ましくは1以下であり、よりさらに好ましくは0.8以下である。

#### 【0029】

本発明の口腔内歯垢分散剤は、さらにカチオン性殺菌剤を含有してもよい。本発明の口腔内歯垢分散剤であれば、有効に歯垢を分散させながら深部や細部にわたってカチオン性殺菌剤を行き渡らせることが可能となり、歯垢により外界と遮蔽されていた歯表面等の口腔組織表面に有効に吸着させ、効果的に殺菌効果を発揮させることができる。カチオン性殺菌剤は、むし歯、歯周病、口臭等の原因となる菌に対して殺菌効果を発揮するものであり、かかるカチオン性殺菌剤としては、第四級アンモニウム化合物、ビッグアニド化合物が挙げられる。第四級アンモニウム化合物に属するカチオン性殺菌剤としては、例えば塩化セチルピリジニウム、塩化ベンゼトニウム、塩化デカリウム、塩化ベンザルコニウム、塩化アルキルジメチルアンモニウム、塩化アルキルトリメチルアンモニウム、塩化メチルベンゼトニウム等が挙げられる。また、ビッグアニド化合物に属するカチオン性殺菌剤としては、例えばクロルヘキシジン及びその塩を挙げることができ、好ましくはグルコン酸クロルヘキシジン及び塩酸クロルヘキシジンである。カチオン性殺菌剤としては、これらから選ばれる1種又は2種以上を用いることが好ましく、より好ましくは第四級アンモニウム化合物であり、より好ましくは塩化セチルピリジニウム及び塩化ベンゼトニウムから選ばれる1種又は2種である。

#### 【0030】

カチオン性殺菌剤の含有量は、殺菌性能の確保と、苦味の抑制、及び薬事上の制限等の観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは0.01質量%以上であり、より好ましくは0.02質量%以上であり、さらに好ましくは0.03質量%以上であり、好ましくは0.1質量%以下であり、より好ましくは0.08質量%以下であり、さらに好ましくは0.07質量%以下である。また、カチオン性殺菌剤の含有量は、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは0.01~0.1質量%であり、より好ましくは0.02~0.08質量%であり、さらに好ましくは0.03~0.07質量%である。

#### 【0031】

本発明の口腔内歯垢分散剤は、上記成分の他、本発明の効果を阻害しない範囲で、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油；シヨ糖脂肪酸エステル；ソルビタン脂肪酸エステル；ステアリン酸モノグリセリン、モノステアリン酸デカグリセリン、モノミリスチン酸ペンタグリセリン等のグリセリン脂肪酸エステル；アルキルグルコシド；ポリオキシエチレンモノアルキル（又はアルケニル）エーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレン共重合体等のポリオキシエチレンアルキルエーテル；ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル等のポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル；アミンオキサイド系界面活性剤；モノ-（又はジ-）エタノールアミド、ヤシ油脂肪酸ジエタノールアミド等の脂肪酸アルカノールアミド；ラウリン酸デカグリセリン等のポリグリセリン脂肪酸エステル；並びにポリエチレンポリプロピレングリコール等のポリグリコールから選ばれる1種又は2種以上のノニオン界面活性剤；

ラウリルジメチルアミノ酢酸ベタイン等の酢酸ベタイン、2-アルキル-N-カルボキシメチル-N-ヒドロキシエチル-N-イミダゾリウムベタイン等のイミダゾリニウムベタイン、ラウリルスルホベタインやラウリルヒドロキシスルホベタイン等のアルキルスルホベタイン、ヤシ油脂肪酸アミドプロピルベタイン等のヤシ油脂肪酸アミドアルキルベタイン、及びアルキル-1-ヒドロキシエチルイミダゾリンベタインナトリウム等の長鎖アルキルイミダゾリンベタイン塩から選ばれる1種又は2種以上の両性界面活性剤；

プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、ポリエチレングリコール、及びジプロピレングリコールから選ばれる湿潤剤；

アルギン酸ナトリウム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、カラギーナン、キサンタンガム、ポリアクリル酸ナトリウム、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ペクチン、トラガントガム、アラビアガム、グアーガム、カラヤガム、ローカストビーンガム、ジェランガム、タマリンドガム、サイリウムシードガム、ポリビニルアルコール、コンドロイチン硫酸ナトリウム、及びメトキシエチレン無水マレイン酸共重合体等の粘結剤；

研磨性シリカ（吸油量が50～150 mL / 100 gであり、かかる吸油量とはJIS K 5101-13-2（2004年制定）に準ずる方法により測定される値を意味する）等の研磨剤；

増粘性シリカ（JIS K 5101-13-2（2004年制定）に準ずる方法により測定される吸油量が、200～400 mL / 100 g）；

発泡助剤；パラオキシ安息香酸イソブチル、パラオキシ安息香酸イソプロピル、パラオキシ安息香酸エチル等の保存料；顔料；色素；香料等を適宜含有させることができる。

#### 【0032】

本発明の口腔内歯垢分散剤の剤型は、洗口液や液状歯磨剤等の液剤のような液状であってもよく、練歯磨剤や粉歯磨剤、或いはジェル状歯磨剤等の歯磨剤のようなゲル状、ペースト状又はジェル状であってもよい。また、泡吐出容器に充填し、使用時に吐出口から泡状で吐出させるための泡吐出容器用液剤のような液状であってもよい。

#### 【0033】

上述した本発明の実施態様に関し、さらに以下の口腔内歯垢分散剤を開示する。

[1] 分子構造中の第1級水酸基の数が3以上であり、かつ化学式量が100以上200以下の水溶性化合物（A）を有効成分とする口腔内歯垢分散剤。

[2] 成分（A）の分子構造中の第1級水酸基の数が、好ましくは4以上であり、入手容易性の観点から、好ましくは6以下であり、より好ましくは5以下であり、好ましくは4である上記[1]の口腔内歯垢分散剤。

[3] 成分（A）の20℃の水100 gに対する溶解度が、好ましくは5 g / 100 g以上であり、より好ましくは10～60 g / 100 gである上記[1]又は[2]の口腔内歯垢分散剤。

[4] 成分（A）の化学式量が、好ましくは120以上であり、より好ましくは130以上であり、200以下であって、好ましくは180以下であり、より好ましくは160以下である上記[1]～[3]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

[5] 成分（A）は、好ましくはペンタエリスリトール、トリメチロールメタン、トリメチロールエタン、トリメチロールプロパン、トリスヒドロキシメチルアミノメタン、及びトリエタノールアミンから選ばれる1種又は2種以上であり、より好ましくはペンタエリスリトール、トリメチロールエタン、トリメチロールプロパン、トリスヒドロキシメチルアミノメタン、及びトリエタノールアミンから選ばれる1種又は2種以上であり、さらに好ましくはペンタエリスリトール、トリメチロールエタン、及びトリメチロールプロパンから選ばれる1種又は2種以上であり、よりさらに好ましくはペンタエリスリトールである上記[1]～[4]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

[6] 成分（A）の含有量は、好ましくは0.2質量%以上であり、より好ましくは1質量%以上であり、さらに好ましくは2質量%以上であり、よりさらに好ましくは4質量%以上であり、好ましくは20質量%以下であり、より好ましくは18質量%以下であり、さらに好ましくは15質量%以下である上記[1]～[5]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

#### 【0034】

[7] さらに、分子構造中の第1級水酸基の数が2である糖アルコール（B）を含有する上記[1]～[6]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

[8] 成分（B）は、好ましくはエリスリトール、キシリトール、還元パラチノース、

10

20

30

40

50



及びマンニトールから選ばれる1種又は2種以上(B1)であり、或いは好ましくはソルビトール及びグリセリンから選ばれる1種又は2種であり、好ましくは成分(B)として成分(B1)を含有し、より好ましくはエリスリトール、及びキシリトールから選ばれる1種又は2種を含有し、さらに好ましくはエリスリトールを含有する上記[1]~[7]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

[9]成分(B1)の含有量は、好ましくは1質量%以上であり、より好ましくは2質量%以上であり、さらに好ましくは3質量%以上であり、よりさらに好ましくは5質量%以上であり、好ましくは5.5質量%以下であり、より好ましくは5.0質量%以下であり、さらに好ましくは4.0質量%以下であり、よりさらに好ましくは3.0質量%以下である上記[1]~[8]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

10

[10]本発明の口腔内歯垢分散剤が歯磨剤であるときの成分(B1)の含有量は、好ましくは5質量%以上であり、より好ましくは10質量%以上であり、さらに好ましくは15質量%以上であり、好ましくは5.5質量%以下であり、より好ましくは5.0質量%以下であり、さらに好ましくは4.5質量%以下である上記[1]~[9]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

[11]本発明の口腔内歯垢分散剤が液剤であるときの成分(B1)の含有量は、好ましくは1質量%以上であり、より好ましくは2質量%以上であり、さらに好ましくは3質量%以上であり、好ましくは2.0質量%以下であり、より好ましくは1.5質量%以下であり、さらに好ましくは1.2質量%以下である上記[1]~[9]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

20

[12]成分(A)と成分(B1)の質量比((A)/(B1))は、好ましくは0.01以上であり、より好ましくは0.05以上であり、さらに好ましくは0.1以上であり、よりさらに好ましくは0.2以上であり、好ましくは1.0以下であり、より好ましくは5以下であり、さらに好ましくは3以下であり、よりさらに好ましくは1以下であり、またさらに好ましくは0.8以下である上記[1]~[11]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

[13]成分(B2)の含有量は、良好な香味を確保する観点から、本発明の口腔内歯垢分散剤中に、好ましくは1~30質量%であり、より好ましくは2~25質量%であり、さらに好ましくは3~20質量%である上記[1]~[12]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

30

#### 【0035】

[14]さらに、尿素、グアニジン又はその塩、及びアニオン界面活性剤から選ばれる1種又は2種以上のタンパク質変性剤(C)を含有する上記[1]~[13]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

[15]成分(C)の含有量は、好ましくは0.001質量%以上であり、より好ましくは0.005質量%以上であり、さらに好ましくは0.01質量%以上であり、よりさらに好ましくは0.1質量%以上であり、好ましくは1質量%以下であり、より好ましくは0.8質量%以下であり、さらに好ましくは0.5質量%以下である上記[14]の口腔内歯垢分散剤。

[16]本発明の口腔内歯垢分散剤が歯磨剤であるときの成分(C)の含有量は、好ましくは0.1質量%以上であり、より好ましくは0.2質量%以上であり、好ましくは2質量%以下であり、より好ましくは1.5質量%以下であり、さらに好ましくは1.2質量%以下である上記[14]又は[15]の口腔内歯垢分散剤。

40

#### 【0036】

[17]水の含有量は、好ましくは50質量%以上であり、より好ましくは55質量%以上であり、さらに好ましくは60質量%以上であり、好ましくは99質量%以下であり、より好ましくは95質量%以下であり、さらに好ましくは90質量%以下であり、本発明の口腔内歯垢分散剤が成分(B)又は成分(C)、或いは成分(B)及び成分(C)を含有するときの水の含有量は、好ましくは90質量%以下であり、より好ましくは85質量%以下である上記[1]~[16]いずれか1の口腔内歯垢分散剤。

50

[ 1 8 ] 本発明の口腔内歯垢分散剤が歯磨剤であるときの水の含有量は、好ましくは 1 2 質量%以上であり、より好ましくは 1 5 質量%以上であり、好ましくは 5 5 質量%以下であり、より好ましくは 5 0 質量%以下であり、さらに好ましくは 4 5 質量%以下である上記 [ 1 ] ~ [ 1 6 ] いずれか 1 の口腔内歯垢分散剤。

[ 1 9 ] 成分 ( A ) と水との質量比 ( ( A ) / 水 ) は、好ましくは 0 . 0 1 以上であり、より好ましくは 0 . 0 2 以上であり、さらに好ましくは 0 . 0 5 以上であり、好ましくは 0 . 5 以下であり、より好ましくは 0 . 3 以下であり、さらに好ましくは 0 . 2 以下である上記 [ 1 ] ~ [ 1 8 ] いずれか 1 の口腔内歯垢分散剤。

#### 【 0 0 3 7 】

[ 2 0 ] さらに、カチオン性殺菌剤を含有し、カチオン性殺菌剤が、好ましくは第四級アンモニウム化合物、及びピグアニド化合物から選ばれる 1 種又は 2 種以上であり、より好ましくは第四級アンモニウム化合物であり、さらに好ましくは塩化セチルピリジニウム及び塩化ベンゼトニウムから選ばれる 1 種又は 2 種である上記 [ 1 ] ~ [ 1 9 ] いずれか 1 の口腔内歯垢分散剤。

[ 2 1 ] カチオン性殺菌剤の含有量は、好ましくは 0 . 0 1 質量%以上であり、より好ましくは 0 . 0 2 質量%以上であり、さらに好ましくは 0 . 0 3 質量%以上であり、好ましくは 0 . 1 質量%以下であり、より好ましくは 0 . 0 8 質量%以下であり、さらに好ましくは 0 . 0 7 質量%以下である上記 [ 2 0 ] の口腔内歯垢分散剤。

#### 【 0 0 3 8 】

[ 2 2 ] 練歯磨剤、粉歯磨剤又はジェル状歯磨剤である歯磨剤、或いは洗口液又は液状歯磨剤である液剤である上記 [ 1 ] ~ [ 2 1 ] いずれか 1 の口腔内歯垢分散剤。

[ 2 3 ] 歯垢の表層から深部に至るまで歯垢を分散させるための上記 [ 1 ] ~ [ 2 2 ] いずれか 1 の口腔内歯垢分散剤の使用。

[ 2 4 ] 歯垢の表層から深部に至るまで歯垢を除去するための上記 [ 1 ] ~ [ 2 2 ] いずれか 1 の口腔内歯垢分散剤の使用。

[ 2 5 ] 上記 [ 1 ] ~ [ 2 2 ] いずれか 1 の口腔内歯垢分散剤を口腔内に適用する、歯垢の表層から深部に至る歯垢の分散方法。

#### 【実施例】

#### 【 0 0 3 9 】

以下、本発明について、実施例に基づき具体的に説明する。なお、表中に特に示さない限り、各成分の含有量は質量%を示す。

#### 【 0 0 4 0 】

[ 実施例 1 ~ 1 0、比較例 1 ~ 8 ]

表 1 ~ 2 に示す処方にしたがって、各口腔内歯垢分散剤 ( 全て液状分散剤 ) を調製した。得られた口腔内歯垢分散剤を用い、下記方法にしたがって歯垢分散性の評価を行った。結果を表 1 ~ 2 に示す。

#### 【 0 0 4 1 】

##### 《 歯垢分散効果試験 》

##### 1 ) 刺激唾液の採取

2 0 ~ 3 0 代の健常男性を対象に、デントバフ ストリップ ( 株式会社オーラルケア O r a l C a r e I n c . ) に含まれているガムペレットを噛んでもらい、その都度口の中に溜まった唾液をファルコンチューブに吐き出してもらうことにより、かかるファルコンチューブに唾液を採取した。なお、唾液中の細菌には個人差があるため、1 名の健常男性の唾液により、全ての実施例と比較例について歯垢分散効果試験を行った。

##### 2 ) 歯垢モデルの作製

ファルコンチューブに採取した唾液を、3 0 0 0 r p m / r t / 1 0 m i n にて遠心分離した。分離された上澄み唾液を用い、スクロースを 5 質量%溶液となるように添加した後、攪拌機器 ( v o l t e x、日本ジェネティクス ( 株 ) 製 ) を用いて攪拌し、歯垢モデル試験液を調製した。

次に H A p 基板 ( コスモ・バイオ製、1 c m 角 ) の片面を 4 0 μ m、1 2 μ m、3 μ m

10

20

30

40

50

の研磨紙を用いて鏡面研磨した後、1 N H C l に1分間浸漬して酸脱灰処理を施した。処理後のH A p板をイオン交換水で洗浄して乾燥し、24穴プレートに入れ、上記調製した歯垢モデル試験液を1 m L ずつ添加した後、これをC O<sub>2</sub>パックとともにプラスチックケースに格納して嫌気条件下とし、37 で48時間培養した。

【0042】

3) 歯垢分散効果の評価

減圧ポンプを用い、プレート中の唾液を吸い取り、イオン交換水1 m L を添加して5分間振盪した。次にポンプを用いて水を吸い取り、表1~2で得られた各分散剤1 m L (ペースト状分散剤は、イオン交換水にて4倍希釈液とした)を添加して1時間振盪した。振盪は、振盪機(B i o S h a k e i Q (ワケンビーテック株式会社))を用い、室温(10  
25)、500 r p m の条件で行った。

その後、各分散剤を吸い取り、イオン交換水1 m L を添加して5分間振盪し、これを2回繰り返した。次いで、水を吸い取り、0.1質量%クリスタルバイオレット(C V)溶液を750 μ L 添加して15分間振盪した。

さらにポンプでC V 染色液を吸い取り、イオン交換水1 m L を添加して5分間振盪し、これを2回繰り返した。次いで、水をポンプで吸い取り、エタノール500 m L を添加してピペティングした後、抽出液をイオン交換水で10倍希釈し、吸光度O D<sub>595nm</sub>をマイクロプレートリーダー(TECAN社製 波長可変型吸光マイクロプレートリーダー サンライズレインボーサーモ)で測定した。

また、上記得られた分散剤を用いることなく、イオン交換水で洗浄したのみの吸光度O D<sub>595nm</sub>(初期値)を基準(100%)とし、下記式にしたがって歯垢残存率(%)を算出した。20

なお、得られた歯垢残存率の値が小さいほど、歯垢分散効果が高いことを意味する。

歯垢残存率(%) = { 上記得られた分散剤を用いた際のO D<sub>595nm</sub> / イオン交換水で洗浄したのみのO D<sub>595nm</sub> } × 100

【0043】

【 表 1 】

組成 (質量%)	実施例 1	実施例 2	実施例 3	実施例 4	実施例 5	実施例 6	実施例 7	実施例 8	実施例 9	実施例 10
(A)	ペンタエリスリトール	2	5	15	5	5	5	0	0	0
	トリメチロールプロパン	0	0	0	0	0	0	15	0	0
	トリスヒドロキシメチルアミノメタン	0	0	0	0	0	0	0	15	0
	トリエタノールアミン	0	0	0	0	0	0	0	0	15
(B)	エリスリトール (B1)	0	0	0	10	10	0	0	0	0
	キシリトール (B1)	0	0	0	0	0	10	0	0	0
	ソルビトール (B2)	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	グリセリン (B2)	0	0	0	0	0	0	0	0	0
ラウリル硫酸ナトリウム	0	0	0	0	0.5	0	0.5	0	0	0
イオン交換水	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部
合計	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
全水分量	98.0	95.0	85.0	85.0	84.5	85.0	84.5	85.0	85.0	85.0
(A) / (B1)	-	-	-	0.5	0.5	0.5	0.5	-	-	-
(A) / 全水分量	0.02	0.05	0.18	0.06	0.06	0.06	0.06	0.18	0.18	0.18
歯垢分散性(歯垢残存率,%)	43	35	21	28	18	30	21	40	31	33

【 0 0 4 4 】

10

20

30

40

## 【 表 2 】

組成 (質量%)	比較例 1	比較例 2	比較例 3	比較例 4	比較例 5	比較例 6	比較例 7	比較例 8
ベンタエリスリトール	0	0	0	0	0	0	0	0
トリメチロールプロパン	0	0	0	0	0	0	0	0
トリスヒドロキシメチルアミノメタン	0	0	0	0	0	0	0	0
トリエタノールアミン	0	0	0	0	0	0	0	0
エリスリトール (B1)	15	15	0	0	0	0	0	0
キシリトール (B1)	0	0	15	15	0	0	0	0
ソルビトール (B2)	0	0	0	0	15	0	0	0
グリセリン (B2)	0	0	0	0	0	15	0	0
ジペンタエリスリトール <sup>※1</sup>	0	0	0	0	0	0	1	0
イノシトール <sup>※2</sup>	0	0	0	0	0	0	0	15
ラウリル硫酸ナトリウム	0	0.5	0	0.5	0	0	0	0
イオン交換水	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部	残部
合計	100	100	100	100	100	100	100	100
全水分量	85.0	84.5	85.0	84.5	85.0	85.0	99.0	85.0
(A) / (B1)	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	-	-
(A) / 全水分量	0.00	0.00	0.00	0.00	0.00	0.00	0.00	0.00
歯垢分散性(歯垢残存率,%)	77	60	88	62	102	95	100	90

※1:化学式量=254、分子構造中の第1級水酸基の数=6  
 ※2:化学式量=180、分子構造中の第1級水酸基の数=0、第3級水酸基の数=6

## 【 0 0 4 5 】

[ 実施例 1 1 ~ 1 5、比較例 9 ~ 1 0 ]

表 3 に液状分散剤の処方例、表 4 にペースト状分散剤及び液状分散剤の処方例 ( 実施例 1 3 ~ 1 4 及び比較例 9 はペースト状分散剤、実施例 1 5 及び比較例 1 0 は液状分散剤 ) を示す。

## 【 0 0 4 6 】

10

20

30

40

【表 3】

組成 (質量%)		実施例11	実施例12
(A)	ペンタエリスリトール	5	0
	トリメチロールプロパン	0	15
	ラウリル硫酸ナトリウム	0.5	0
	イオン交換水	残部	残部
合計		100	100
	全水分量	94.5	85.0
(A) / 全水分量		0.05	0.18

10

【 0 0 4 7 】

【表 4】

組成 (質量%)		実施例13	実施例14	比較例9	実施例15	比較例10
(A)	ペンタエリスリトール	10.00	10.00	0.00	5.00	0.00
(B)	エリスリトール (B1)	25.00	25.00	35.00	2.00	7.00
	ソルビトール (B2)	10.00	10.00	10.00	2.00	2.00
	グリセリン (B2)	8.00	5.00	5.00	2.00	2.00
	ラウリル硫酸ナトリウム	1.00	1.00	1.00	0.00	0.00
	POE(40)硬化ヒマシ油	0.00	0.00	0.00	0.40	0.40
	塩化セチルピリジニウム	0.02	0.02	0.02	0.05	0.05
	プロピレングリコール	0.00	0.00	0.00	0.50	0.50
	P E G 6 0 0	2.00	2.00	2.00	0.13	0.13
	カルボキシメチルセルロースナトリウム	0.60	0.60	0.60	0.00	0.00
	キサンタンガム	0.10	0.10	0.10	0.00	0.00
	研磨性シリカ	0.00	3.00	3.00	0.00	0.00
	サッカリンナトリウム	0.02	0.02	0.02	0.00	0.00
	スクラロース	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01
	クエン酸	0.00	0.00	0.00	0.01	0.01
	クエン酸三ナトリウム	0.00	0.00	0.00	0.05	0.05
	香料	0.50	0.50	0.50	0.10	0.10
	イオン交換水	残部	残部	残部	残部	残部
合計		100	100	100	100	100
	全水分量	42.8	42.8	42.8	87.8	87.8
(A) / (B1)		0.4	0.4	0.0	2.5	0.0
(A) / 全水分量		0.23	0.23	0.00	0.06	0.00
剤型		ペースト状	ペースト状	ペースト状	液状	液状

20

30

40

## フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I
A 6 1 K	31/133 (2006.01)	A 6 1 K 31/133
A 6 1 K	31/155 (2006.01)	A 6 1 K 31/155
A 6 1 K	31/17 (2006.01)	A 6 1 K 31/17
A 6 1 K	45/00 (2006.01)	A 6 1 K 45/00

- (56) 参考文献 米国特許第 0 5 9 0 0 2 3 0 ( U S , A )  
 特表 2 0 1 2 - 5 2 6 1 4 2 ( J P , A )  
 特開 2 0 1 0 - 2 3 5 4 5 7 ( J P , A )  
 特開昭 5 8 - 0 3 9 6 2 0 ( J P , A )  
 特開平 0 8 - 2 1 7 6 5 3 ( J P , A )  
 特開平 0 6 - 2 5 6 1 6 7 ( J P , A )  
 国際公開第 2 0 1 2 / 0 9 3 6 4 3 ( W O , A 1 )  
 米国特許第 0 4 7 2 6 9 4 3 ( U S , A )  
 特開平 0 5 - 2 2 9 9 2 3 ( J P , A )  
 特開 2 0 0 7 - 2 1 0 9 1 3 ( J P , A )  
 特開 2 0 1 5 - 0 2 0 9 7 0 ( J P , A )  
 矢納義高ほか、オーラルケアにおけるエリスリトールの有用性、フレグランスジャーナル、2008年 6月15日、第36巻、第6号、p.13-18

## (58) 調査した分野(Int.Cl., DB名)

A 6 1 K 8 / 0 0 - 8 / 0 0  
 A 6 1 Q 1 / 0 0 - 9 0 / 0 0  
 C A p l u s / R E G I S T R Y / M E D L I N E / E M B A S E / B I O S I S ( S T N )  
 J S T P l u s / J M E D P l u s / J S T 7 5 8 0 ( J D r e a m I I I )  
 M i n t e l G N P D