



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 發明說明書公開本

(11) 公開編號：TW 200948387 A1

(43) 公開日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 01 日

---

(21) 申請案號：098103766 (22) 申請日：中華民國 98 (2009) 年 02 月 06 日

(51) Int. Cl. :            *A61K8/44*    (2006.01)            *A61K8/97*    (2006.01)  
                              *A61K8/92*    (2006.01)            *A61Q11/00* (2006.01)

(30) 優先權：2008/02/08      美國                      61/027,429

(71) 申請人：美國棕欖公司 (美國) COLGATE-PALMOLIVE COMPANY (US)  
                  美國

(72) 發明人：普倫西比 麥克 PRENCIPE, MICHAEL (US)；羅賓森 理查 ROBINSON,  
                  RICHARD SCOTT (US)；科莉 瑞尼希 KOHLI, RAJNISH (GB)；蘇利文 理查  
                  SULLIVAN, RICHARD J. (US)

(74) 代理人：林秋琴；何愛文

申請實體審查：有    申請專利範圍項數：36 項    圖式數：0            共 25 頁

---

(54) 名稱

組成物與裝置 (一)

COMPOSITIONS AND DEVICES

(57) 摘要

本發明提供含有漂白劑和鹼性胺基酸的牙齒美白組成物及其使用裝置，以及其使用方法。



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 發明說明書公開本

(11) 公開編號：TW 200948387 A1

(43) 公開日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 01 日

---

(21) 申請案號：098103766 (22) 申請日：中華民國 98 (2009) 年 02 月 06 日

(51) Int. Cl. :            *A61K8/44*    (2006.01)            *A61K8/97*    (2006.01)  
                              *A61K8/92*    (2006.01)            *A61Q11/00* (2006.01)

(30) 優先權：2008/02/08      美國                      61/027,429

(71) 申請人：美國棕欖公司 (美國) COLGATE-PALMOLIVE COMPANY (US)  
                  美國

(72) 發明人：普倫西比 麥克 PRENCIPE, MICHAEL (US) ; 羅賓森 理查 ROBINSON,  
                  RICHARD SCOTT (US) ; 科莉 瑞尼希 KOHLI, RAJNISH (GB) ; 蘇利文 理查  
                  SULLIVAN, RICHARD J. (US)

(74) 代理人：林秋琴；何愛文

申請實體審查：有    申請專利範圍項數：36 項    圖式數：0            共 25 頁

---

(54) 名稱

組成物與裝置 (一)

COMPOSITIONS AND DEVICES

(57) 摘要

本發明提供含有漂白劑和鹼性胺基酸的牙齒美白組成物及其使用裝置，以及其使用方法。

## 六、發明說明：

### 【發明所屬之技術領域】

此專利申請案聲稱擁有 2008 年 2 月 8 日提出之美國專利申請案號 61/027,424 的權利，藉由引述將其內容併入於此。

5 本發明提供含有漂白劑和鹼性胺基酸的牙齒美白組成物及其使用裝置，以及其使用方法。

### 【先前技術】

牙齒美白產品已為技術中所習知，以及包括以非處方藥販售的產品和方法，或用於專業服務。一漂白裝置利用盛漂白組成物的托盤然後將其塗佈於牙齒。請看例如美國專利 10 5,746,598 和 5,376,006，藉由引述將其內容併入於此。另一種為黏附於牙齒表面的條狀漂白裝置。請看例如美國專利 5,891,453、6,436,297、5,879,691、6,277,458、5,894,071，藉由引述將其內容併入於此。其他漂白裝置為述於美國專利 15 6,669,930、美國專利公開案 2005/0038181 和 WO 2002/032961 的液體牙齒美白膠，藉由引述將其內容併入於此。使用此類裝置雖然可美白牙齒，但是其通常無法用於其他適應症的治療齲齒。事實上，此類裝置亦可能造成一些口腔疾病的惡化。例如，配戴此類裝置的使用者傾向維持長期張口狀態因而導致增加唾液蒸發量的口乾症。

20 使用此類產品雖然可美白牙齒，但是仍亟需發展能同時美白牙齒和治療齲齒例如同時減少或抑制齲齒形成、減少或抑制牙齒去礦化和促進再礦化，及/或治療口乾症的組成物。

## 【發明內容】

## 發明之摘要

本發明組成物能促進或改善口腔衛生及/或包括心血管的身體健康，例如藉由減少經由口腔組織的可能全身性感染。

5 本發明係關於組成物和裝置，其可傳遞鹼性胺基酸如精胺酸以及美白牙齒的美白劑至口腔，以及例如：(i) 減少或抑制蛀牙的形成；(ii) 減少、修補或抑制早期琺瑯質病變，例如藉由定量光激發螢光技術(QLF)或電齶齒測量法(ECM)的測定；(iii) 減少或抑制牙齒的去礦化及促進再礦化；(iv) 減少牙齒過敏性；(v) 減少或抑制齒齦炎；(vi) 促進口腔內潰瘍或傷口的癒合；(vii) 降低產酸菌的濃度；(viii) 增加精胺酸溶解菌的相對濃度；(ix) 抑制口腔內微生物生物膜的形成；(x) 吃甜食之後上升及/或維持牙垢 pH 在至少 pH 5.5 的程度；(xi) 減少牙垢的積聚；(xii) 清潔牙齒和口腔；(xiii) 免疫牙齒對抗致齶菌；(xiv) 促進包括心血管健康的身體健康，例如減少經由口腔組織造成全身性感染的可能性；(xv) 減少牙齒的腐蝕；及/或(xvi) 治療、緩和或減少口乾症。可單獨使用此類的組成物和裝置或協同含其他鹼性胺基酸的組成物如潔齒劑組成物以傳遞鹼性胺基酸至口腔。

20 已建議使用精胺酸和其他鹼性胺基酸於口腔保健以及認為其在對抗齶齒形成和牙齒敏感具有顯著效益。已認為口腔內鹼性胺基酸被某些非生齶齒類型細菌例如血鏈球菌(*S. sanguis*)所代謝，其將與口腔內牙齒的生齶齒菌例如變異鏈球菌(*S. mutans*)產生競爭作用。精胺酸溶解菌能利用精胺酸和其

他鹼性胺基酸產生氫而上升環境 pH，同時齲齒菌則將糖代謝成乳酸而降低牙斑 pH 和使牙齒去礦化，最後造成齲齒。此外鹼性胺基酸例如精胺酸促進牙齒的再礦化、幫助腐蝕的修補以及封堵與牙齒過敏有關的微管。許多患者抱怨在美白治療後的牙齒過敏，此可能歸因於美白化學物質刺激微管內的神經末梢之故。

本發明因此包括組成物 1.0 的一種牙齒漂白組成物含有：

- a. 接觸牙齒美白劑時能漂白牙齒表面的有效量牙齒美白劑；以及
- b. 游離或鹽型的鹼性胺基酸。

本發明亦包括下列的組成物：

- 1.1 組成物 1.0 其中該鹼性胺基酸係精胺酸、離胺酸、瓜胺酸、鳥胺酸、肌酸、組胺酸、二胺基丁酸、二胺基丙酸，其鹽及/或其組合。
- 1.2 組成物 1.0 或 1.1 其中該鹼性胺基酸具有 L-構型。
- 1.3 任何上述組成物其中該鹼性胺基酸係精胺酸。
- 1.4 任何上述組成物其中該鹼性胺基酸係 L-精胺酸。
- 1.5 任何上述組成物含有鹽型的鹼性胺基酸。
- 1.6 任何上述組成物含有精胺酸磷酸鹽。
- 1.7 任何上述組成物含有精胺酸鹽酸鹽。
- 1.8 任何上述組成物含有精胺酸過碳酸鹽。
- 1.9 任何上述組成物含有精胺酸重碳酸鹽。
- 1.10 任何上述組成物含有從約 0.1 至約 50% 重量比的鹼性

胺基酸。

1.11 任何上述組成物進一步含有一基質材料。

1.12 任何上述組成物其中該牙齒美白劑和鹼性胺基酸被分散於基質材料內。

5 1.13 任何上述組成物進一步含有聚羧乙烯 (carboxypolymethylene)。

1.14 任何上述組成物進一步含有聚羧乙烯之反應產物的基質材料。

1.15 任何上述組成物含有聚乙烯吡咯啉酮。

10 1.16 任何上述組成物進一步含有黏性及/或抗唾液稀釋的基質材料而使牙齒組成物被置於牙托內及牙托被置於牙齒上時該牙齒組成物可使牙托在牙齒上的位置保持例如至少約 1、2、3、4 或 5 小時而不使牙托產生明顯的壓力。

15 1.17 任何上述組成物進一步含有水。

1.18 任何上述組成物進一步含有甘油。

1.19 任何上述組成物進一步含有聚乙二醇。

1.20 任何上述組成物具有約 5 至約 12 的 pH。

1.21 任何上述組成物具有約 6.1 的 pH。

20 1.22 任何上述組成物其中該牙齒美白劑係選自由過氧化物、金屬亞氯酸鹽、過硼酸鹽、過碳酸鹽、過氧酸、次氯酸鹽及其組合所構成的群組。

1.23 任何上述組成物其中該美白劑係過氧化氫或過氧化氫源例如過氧化尿素或過氧化物鹽或複合物(舉例如過

氧化磷酸鹽、過氧化碳酸鹽、過硼酸鹽、過氧化矽酸鹽或過硫酸鹽；例如過氧化磷酸鈣、過硼酸鈉、過氧化碳酸鈉、過氧化磷酸鈉和過硫酸鉀)，或過氧化氫高分子複合物例如過氧化氫-聚乙烯吡咯啉酮高分子複合物。

1.24 任何上述組成物含有過氧化醯胺、過硼酸鈉、過碳酸鈉，及/或過氧化氫。

1.25 任何上述組成物其中以選自三乙醇胺、氫氧化鈉或鹼性胺基酸之鹼調節 pH。

1.26 組成物 1.25 其中該鹼性胺基酸係精胺酸、離胺酸、瓜胺酸、鳥胺酸、肌酸、組胺酸、二胺基丁酸、二胺基丙酸，其鹽及/或其組合。

1.27 組成物 1.25 或 1.26 其中該鹼性胺基酸係選自氫氧化物、鹽酸鹽、重碳酸鹽、磷酸鹽，及/或其組合的游離或鹽型。

1.28 組成物 1.27 其中該鹼性胺基酸係選自精胺酸重碳酸鹽和精胺酸氫氧化物。

1.29 任何上述組成物進一步含有選自氟化亞錫、氟化鈉、氟化鉀、單氟磷酸鈉、氟矽酸鈉、氟矽酸銨、氟化胺、氟化銨，及其組合的氟化鹽。

1.30 任何上述組成物含有抗菌劑選自鹵化二苯醚(例如三氯沙)；草藥萃取物和精油(例如迷迭香萃取物、茶樹萃取物、木蘭萃取物、瑞香酚、薄荷醇、桉葉醇、香葉醇、香芹酚、檸檬醛、檜木醇、兒茶酚、甲基水楊酸、

表沒食子兒茶素沒食子酸酯、表沒食子兒茶素、沒食子酸、碧桃茉莉萃取物、沙棘萃取物)；雙胍抗菌劑(例如沙威隆(chlorhexidine)、阿立西定(alexidine)或奧替尼啉(octenidine))；季銨化合物(例如氯化鯨蠟基吡啶(CPC)、氯化苜烷銨、氯化十四烷基吡啶(TPC)、N-十四烷基-4-乙基氯化吡啶(TDEPC))；苯酚殺菌劑；海克西定(hexetidine)；奧替尼啉；血根鹼；優碘；地莫匹醇(delmopinol)；薩利氟(salifluor)；金屬離子(例如鋅鹽如檸檬酸鋅、亞錫鹽、銅鹽、鐵鹽)；血根鹼(sanguinarine)；蜂膠和氧化劑(例如過氧化氫、緩衝過氧硼酸鈉或過氧碳酸鈉)；酞酸及其鹽；單過酞酸及其鹽和酯；抗壞血酸硬脂酸酯；油醯基肌胺酸；烷基硫酸鹽；二辛基硫琥珀酸鹽；柳醛苯胺；溴化杜每芬(domiphen)；地莫匹醇(delmopinol)；辛哌醇及其他哌啶基衍生物；菸鹼酸製劑；亞氯酸鹽；以及上述任何的混合物。

### 1.31 任何上述組成物其係一種凝膠。

本發明另一具體實施例係一種漂白患者牙齒的方法包括塗佈任一組成物 1.0~1.31 至牙齒，例如以一薄膜。該組成物可被乾燥，以及該乾燥組成物被黏附至牙齒直至掉落或剝離。

本發明另一具體實施例包括一種用於漂白患者牙齒的方法，其包含將任一組成物 1.0~1.31 塗佈於大小足以覆蓋被漂白牙齒表面的載運支架；將支架置於牙齒上而使至少一部分的組成物 1.0~1.31 接觸被漂白的牙齒；使牙托維持在牙齒上

位置至少一小時；從牙齒上卸除該牙托。該載運支架可呈牙托狀 其中該牙托具有可保持一定量之任一組成物 1.0~1.31 的構造。該載運支架亦可為例如撓性條帶的條狀，其中組成物 1.0~1.31 於黏附牙齒條帶的一側上形成一薄膜。在另一具體實施例中，該載運支架具有可覆蓋多於一顆牙齒以上的大小。

熟習本領域之技術者將瞭解本發明的其他具體實施例。

### 發明之詳細說明

一“有效量”係足以在口腔內產生所欲治療或預防效應而不造成例如刺激或過敏反應之不良副作用的數量。

除非另有明示，否則此處所述鹼性胺基酸包括游離或鹽型鹼性胺基酸。

牙齒潔白劑已為技術中所習知，以及包括可安全用於口腔內提供漂白或除污斑的任何材料。適當潔白劑為過氧化物、金屬亞氯酸鹽、過硼酸鹽、過碳酸鹽、過氧酸，及其組合。適當過氧化物包括過氧化氫、過氧化鈣、過氧化醯胺，及其組合。適當金屬亞氯酸鹽包括亞氯酸鈣、亞氯酸鋇、亞氯酸鎂、亞氯酸鈉，及亞氯酸鉀。適當過氧化氫源包括過氧化尿素或過氧化物鹽或複合物(舉例如過氧化磷酸鹽、過氧化碳酸鹽、過硼酸鹽、過氧化矽酸鹽或過硫酸鹽；例如過氧化磷酸鈣、過硼酸鈉、過氧化碳酸鈉、過氧化磷酸鈉和過硫酸鉀)，或過氧化氫高分子複合物例如過氧化氫-聚乙烯吡咯啉酮高分子複合物。牙齒潔白劑的有效濃度及有效治療數次亦為技術中所習知。

可被用於本發明組成物內的鹼性胺基酸不僅包括天然鹼性胺基酸例如精胺酸、離胺酸和組胺酸亦包括分子內具有羥基和胺基的任何鹼性胺基酸。因此，鹼性胺基酸包括但不侷限於精胺酸、離胺酸、瓜胺酸、鳥胺酸、肌酸、組胺酸、二胺基丁酸、二胺基丙酸，其鹽或其組合。在一特定具體實施例中，該鹼性胺基酸係選自精胺酸、瓜胺酸和鳥胺酸，較佳為精胺酸例如 L-精胺酸。

如此處所述，提及一鹼性胺基酸時亦包括其鹽。由於本發明的組成物和裝置擬被用於口腔內，因此用於本發明之鹽在提供的數量和濃度之下必需為安全。適當鹽類包括在提供的數量和濃度之下通常被視為生理上可接受之醫藥上可接受鹽的技術中習知鹽類。生理上可接受鹽包括衍自醫藥上可接受無機或有機酸或鹼者，例如可形成生理上可接受陰離子之酸的酸加成鹽例如鹽酸鹽或溴化鹽，以及可形成生理上可接受陽離子之鹼的鹼加成鹽，例如衍自鹼金屬如鉀和鈉或鹼土金屬如鈣和鎂者。可利用技術中已知的標準程序獲得生理上可接受鹽，例如藉由反應一足量鹼性化合物如胺與可產生一生理上可接受陰離子的適當酸。

本發明組成物含有一有效量的鹼性胺基酸。因此，該組成物可含有從約 1 至約 50% 重量比的鹼性胺基酸，例如約 1、2、3、4、5、10、15、20、25、30、35、40 或 45%。

本發明組成物可選擇性地被懸浮於一基質內。適當基質可安全被用於口腔內和不輕易溶解於口腔內，以及不與牙齒潔白劑或鹼性胺基酸產生反應。

基質材料已為技術中所習知，以及通常為水膨性聚合物例如聚羧乙烯、羧甲基纖維素、羧丙基纖維素、泊洛沙姆 (poloxamer)、紅藻膠、維格姆凝膠 (veegum)、羧乙烯聚合物、聚乙炔吡咯啉酮，以及天然膠例如刺梧桐膠、三仙膠、關華豆膠、阿拉伯膠、黃耆樹膠，及其混合物。

一種較佳基質材料為聚羧乙烯。先前已測定具有高黏度之過飽和聚羧乙烯水組成物具有從約 3.5 至約 12% 的聚羧乙烯濃度，以及可從其製備緩釋牙齒組成物。由於本發明組成物具有不含水或非水溶性組分，因此可能具有例如從約 15 至約 35% 的更高聚羧乙烯濃度。

聚羧乙烯可供應自各種的來源，包括 B.F. Goodrich 公司的商品 Carbopol 例如 Carbopol 934P 和 Carbopol 940。

已發現聚羧乙烯可混合甘油而使大量的聚羧乙烯被分散於水中。此類組成物內的甘油含量已為技術中所習知，例如從約 20 至約 70% 重量比。甘油可選擇性地被聚丙烯、山梨糖醇、聚乙二醇或其他多元醇所取代。

存在聚羧乙烯可降低本發明組成物的 pH。為避免侵蝕牙齒琺瑯質的低 pH 以及保留鹼性胺基酸效益的優點，本發明組成物可具有從約 5 至 12 的 pH 範圍，例如約 5.5 至約 6.5，例如約 6.1。可利用技術中已知的任何鹼將預期終濃度的組成物調節成生理上可接受的 pH，例如氫氧化鈉或三乙醇胺，或以鹼性胺基酸或其鹽。

另一種較佳基質為聚乙炔吡咯啉酮，請看美國專利案號 6,730,316，藉由引述將其內容併入於此。

該鹼性胺基酸以及即使不溶於該基質的任何其他成分較佳為被均勻分佈於基質內。

本發明組成物適合直接塗佈至一或多顆牙齒，例如以一薄膜。該薄膜可黏附至牙齒以及在掉落或剝離之前在牙齒表面上維持 1 至 30 分鐘。

本發明組成物可藉由載運支架例如技術中習知的牙托或牙帶被施予至一或多顆牙齒。

當該載運支架係一牙托時，該牙托具有保持一定量例如約 0.5 至約 5 毫升之本發明任一組成物的構造。牙托及其製造方法已為技術中所習知。該牙托通常具有能適合配戴者口腔的形狀，以及配適一或多顆牙齒的通道。本發明組成物通常被分散於該通道內，然後以牙托將其黏附於牙齒。

當該載運支架係一條帶時，本發明之牙齒美白組成物可被施予或塗佈於該條帶上。此類牙帶及其製造方法已為技術中所習知。牙帶通常具有可彎折及適合形成圍繞一顆或複數顆鄰近牙齒之彎曲狀的撓曲度和剛度。該牙帶亦具有可儲放漂白組成物的淺牙周袋。漂白組成物的黏稠和黏附性質通常使牙帶可回復地附著於一或鄰近牙齒上。然而，該牙帶的附著力極低而使配戴者可輕易地將其撕除。

在本發明的一具體實施例中，該組成物選擇性地包括一有效量的氟化物或氟離子源例如可溶性氟化鹽。可利用各種氟離子產生材料作為本發明的可溶性氟化物源。適當氟離子產生材料的實例已述於授予 Briner 等人的美國專利案 3,535,421；授予 Parran Jr. 等人的美國專利案 4,885,155 以及授

予 Widder 等人的美國專利案 3,678,154, 藉由引述將其併入於此。

代表性氟離子源包括但不侷限於氟化亞錫、氟化鈉、氟化鉀、單氟磷酸鈉、氟矽酸鈉、氟矽酸銨、氟化胺、氟化銨，及其組合。在某些具體實例中，該氟離子源包括氟化亞錫、  
5 氟化鈉、單氟磷酸鈉，及其混合物。

在某些具體實施例中，本發明的口腔保健組成物亦可含有足以提供約 25 至 25,000 ppm 氟離子，通常至少約 500 ppm 例如約 500 至約 2000 ppm，例如約 1000 至約 1600 ppm 如約  
10 1450 ppm 的氟離子源或供氟成分。氟化物的適當濃度將視特定的運用而定。例如用於漱口液時，通常具有約 100 至約 250 ppm 的氟化物。用於一般消費性牙膏時，通常具有約 1000 至約 1500 ppm 而兒童用牙膏則稍低。潔齒劑或專業用敷料具有高至 5,000 或甚至 25,000 ppm 的氟化物。

在一具體實施例中本發明組成物可加入約 0.01 至約 10  
15 重量%的氟離子源或在另一具體實施例中約 0.03 至約 5 重量%，以及在另一具體實施例中約 0.1 至約 1 重量%重量比的組成物。提供適當氟離子濃度的氟化鹽重量明顯將視鹽內的反離子重量而定。

在本發明的另一具體實施例中，該組成物可選擇性地含有一防腐劑、抗微生物劑或抗菌劑以進一步增強鹼性胺基酸的有益效應，該抗藥劑可選自鹵化二苯醚(例如三氯沙)；草藥  
20 萃取物和精油(例如迷迭香萃取物、茶樹萃取物、木蘭萃取物、瑞香酚、薄荷醇、桉葉醇、香葉醇、香芹酚、檸檬醛、

檜木醇、兒茶酚、甲基水楊酸、表沒食子兒茶素沒食子酸酯、  
表沒食子兒茶素、沒食子酸、碧桃茉莉萃取物、沙棘萃取物)；  
雙胍抗菌劑(例如沙威隆、阿立西定(alexidine)或奧替尼啶  
(octenidine))；季銨化合物(例如氯化鯨蠟基吡啶(CPC)、氯化  
5 苜烷銨、氯化十四烷基吡啶(TPC)、N-十四烷基-4-乙基氯化吡  
啶(TDEPC))；苯酚殺菌劑；海克西定(hexetidine)；奧替尼啶；  
血根鹼；優碘；地莫匹醇(delmopinol)；薩利弗(salifluor)；金  
屬離子(例如鋅鹽如檸檬酸鋅、亞錫鹽、銅鹽、鐵鹽)；血根鹼  
(sanguinarine)；蜂膠和氧化劑(例如過氧化氫、緩衝過氧硼酸  
10 鈉或過氧碳酸鈉)；酞酸及其鹽；單過酞酸及其鹽和酯；抗壞  
血酸硬脂酸酯；油醯基肌胺酸；烷基硫酸鹽；二辛基硫琥珀  
酸鹽；柳醛苯胺；溴化杜每芬(domiphen)；地莫匹醇  
(delmopinol)；辛哌醇及其他哌啶基衍生物；菸鹼酸製劑；亞  
氯酸鹽；以及上述任何的混合物。

15 該組成物可進一步含有干擾或預防細菌附著的藥劑例如  
尼泊金甲酯(solbrol)或殼聚糖。

在本發明的另一具體實施例中，該組成物較佳為含有消  
炎劑例如非類固醇消炎藥。

20 本發明組成物亦可包含香料。可被用於本發明實務的香  
料包括，但不侷限於精油和各種的調味醛、酯、醇，以及類  
似材料。精油的實例包括留蘭香油、薄荷油、冬清油、黃樟  
油、丁香油、桉葉油、馬鬱蘭油、肉桂油、檸檬油、萊姆精  
油、葡萄柚油和橙油。此類化學物質亦可使用甲醇、香芹酮  
(carvone)和大茴香腦(anethole)。有用的香料亦包括甜味劑例

如蔗糖、阿斯巴甜(aspartaine)、糖精。本發明組成物亦含有色素。

由於口腔組織係全身性感染的出入口，因此加強口腔衛生亦有助於改善身體健康。良好口腔衛生與包括心血管健康的身體健康有關。由於特別指精胺酸的鹼性胺基酸為供應 NO 合成徑路的氮源而加強口腔組織內的微循環，因此本發明的組成物及方法可提供特殊的效益。提供較低的酸性口腔環境亦有助於降低胃不適及產生不利於與胃潰瘍有關之螺旋桿菌的環境。精胺酸為高度表現特定免疫細胞受體例如 T-細胞受體所必需，因而精胺酸可增強有效的免疫反應。本發明的組成物及方法因而可用於強化身體健康，包括心血管的健康。

全部使用期間，每一個值的扼要範圍描述均屬於本發明的範圍內。任何在該範圍內之值均可被選擇作為該範圍的界標。此外，藉由引述將全部引證於本發明揭示內的參考文獻完整併入於此。若本發明與所引述文獻的定義發生衝突時以本發明的揭示為準。很清楚地當描述配製物時可如同一般技術根據其成分進行描述，而儘管這些成分在實際製造、儲存和使用配製物時可能相互反應，但是此類產品亦仍屬於所述配製物的範圍。

利用下列實例進一步描述和證明本發明範圍內的舉例性具體實施例。該實例僅提供作為說明的用途以及由於其可作出許多不偏離本發明精神和範圍的改良而不得推論本發明僅侷限於該範圍。熟習本領域之技術者應瞭解本發明此處所示和說明者之外的各種改良而仍屬於附錄的申請專利範圍內。

**【實施方式】****實例 1**

藉由混合下列成分製備牙齒漂白組成物：

牙齒潔白劑	10%
鹼性胺基酸	50%
水	40%

5

**實例 2**

將 25 克 L-精胺酸加入 50 克水以形成淤漿。將 5 克的 10% 過氧化醯胺溶液加入該淤漿，以及將該淤漿施用於離體牙齒。在處理 2 小時之後洗除該組成物，及與比色板比較時呈現較白的牙齒。

10

**實例 3**

將 25 克 L-精胺酸重碳酸鹽加入 50 克水以形成溶液。將 5 克的 10% 過氧化醯胺溶液加入該溶液，以及在體外浸泡一顆取自抽煙者(約每天抽 25 根香煙，已有五個月未看過牙齒衛生師)的經染色牙齒。在處理 2 小時之後洗除該組成物，及與比色板比較時呈現較白的牙齒。

15

**實例 4**

藉由混合下列成分製備牙齒漂白組成物：

過氧化醯胺	10%
水	21%
甘油	57%
Carbopol 934P	7%
L-精胺酸	5%

20

**實例 5**

以濃縮氫氧化鈉溶液將實例 4 的組成物調節至 pH 10。

**實例 6**

以氫氧化精胺酸的 40% 溶液將實例 4 的組成物調節至 pH 9。

**實例 7**

以精胺酸重碳酸鹽的 60% 溶液將實例 4 的組成物調節至 pH 8。

**實例 8**

將 1 克的三氣沙加入 99 克的實例 4 或 7 組成物。

**實例 9**

將實例 4、5、6、7 和 8 的足量組成物加入牙托以覆蓋牙齒。該牙托被貼附於患者的上牙約 3 小時然後移除。與比色板比較時以組成物處理的牙齒在處理後呈現較白的顏色。

**實例 10**

藉由混合下列成分製備液體潔白凝膠組成物：

液體潔白凝膠基配製物	
成分	% 重量比
水	足量
Carbopol	1.00
95% 乙醇	34.80
甘油	5.00
PEG 600	10.00
PEG 2M	14.00

過氧化氫	25.00
85%磷酸	0.05
單鹼式磷酸鈉	0.05
精胺酸磷酸鹽	5
總計	100

### 實例 11

藉由混合下列成分製備壓敏潔白黏性凝膠組成物：

5

組成物成分	A	B
BIO 壓敏矽膠黏著劑 (中/高黏度)*	30.0	30.0
塑性凝膠(Plastigel)	34	34
過碳酸鈉	25	-
PVP H2O2 cx**	-	25.0
糖精	0.8	0.50
香料	14.00	
PEG 400	-	-
聚異丁烯	-	-
精胺酸重碳酸鹽	1.0	10.0
* 溶解於 60%重量比二甲基矽酮		
** cx=交聯		

### 【圖式簡單說明】

無

10

### 【主要元件符號說明】

無

# 發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：98103766

A61K 8/44 (2006.01)

※申請日：98.2.6

※IPC 分類：

A61K 8/97 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

A61K 8/92 (2006.01)

組成物與裝置(一)

A61Q 11/00 (2006.01)

COMPOSITIONS AND DEVICES

二、中文發明摘要：

本發明提供含有漂白劑和鹼性胺基酸的牙齒美白組成物及其使用裝置，以及其使用方法。

三、英文發明摘要：

The present invention provides tooth-whitening compositions comprising a bleaching agent and a basic amino acid, together with devices for application thereof, and methods of use therefor.

## 七、申請專利範圍：

1. 一種含有效量之牙齒潔白劑及游離或鹽型鹼性胺基酸的組成物。
2. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其中該鹼性胺基酸係精胺酸、離胺酸、瓜胺酸、鳥胺酸、肌酸、組胺酸、二胺基丁酸、二胺基丙酸，其鹽及/或其組合。
3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之組成物，其中該鹼性胺基酸具有 L-構型。
4. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其中該鹼性胺基酸係精胺酸。
5. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其中該鹼性胺基酸係 L-精胺酸。
6. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其中該鹼性胺基酸係鹽型。
7. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其含有精胺酸磷酸鹽。
8. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其含有精胺酸鹽酸鹽。
9. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其含有精胺酸過碳酸鹽。
10. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其含有精胺酸重碳酸鹽。
11. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其中該組成物含有從約 0.1 至約 50%重量比的鹼性胺基酸。

12. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有一基質材料。
13. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其中該牙齒潔白劑和鹼性胺基酸被分散於一基質材料內。
- 5 14. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有聚羧乙烯(carboxypolymethylene)。
15. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有聚羧乙烯之反應產物的基質材料。
16. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有  
10 聚乙烯吡咯啉酮。
17. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有黏性及/或抗唾液稀釋的基質材料而使牙齒組成物被置於牙托內及牙托被置於牙齒上時該牙齒組成物可使牙托保持在牙齒上的位置而不使牙托產生明顯的壓力。
- 15 18. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有水。
19. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有甘油。
20. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有  
20 聚乙二醇。
21. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其具有約 5 至約 12 的 pH。
22. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其具有約 6.1 的 pH。

23. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其中該牙齒潔白劑係選自過氧化物、過氧化物、金屬亞氯酸鹽、過硼酸鹽、過碳酸鹽、過氧酸，及其組合。
24. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其含有過氧化醯胺、過硼酸鈉、過碳酸鈉、過氧化氫，或其組合。
25. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其中以選自三乙胺、氫氧化鈉或鹼性胺基酸將 pH 調節至約 7 至約 9。
26. 如申請專利範圍第 1 項之組成物，其中該鹼性胺基酸係精胺酸、離胺酸、瓜胺酸、鳥胺酸、肌酸、組胺酸、二胺基丁酸、二胺基丙酸，其鹽及/或其組合。
27. 如申請專利範圍第 25 或 26 項之組成物，其中該鹼性胺基酸係選自氫氧化物、過氧化物、重碳酸鹽，及/或其組合的鹽型。
28. 如申請專利範圍第 27 項之組成物，其中該鹼性胺基酸係選自精胺酸重碳酸鹽和氫氧化精胺酸。
29. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有選自氟化亞錫、氟化鈉、氟化鉀、單氟磷酸鈉、氟矽酸鈉、氟矽酸銨、氟化胺、氟化銨，及其組合的氟化鹽。
30. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其進一步含有含有抗菌劑選自鹵化二苯醚(例如三氯沙);草藥萃取物和精油(例如迷迭香萃取物、茶樹萃取物、木蘭萃取物、瑞香酚、薄荷醇、桉葉醇、香葉醇、香芹酚、檸檬醛、檜木醇、兒茶酚、甲基水楊酸、表沒食子兒茶素沒食子酸酯、表沒食子兒茶素、沒食子酸、碧桃茉莉萃取物、沙棘萃取物);雙

瓜抗菌劑(例如沙威隆、阿立西定或奧替尼啶);季銨化合物(例如氯化鯨蠟基吡啶(CPC)、氯化苄烷銨、氯化十四烷基吡啶(TPC)、N-十四烷基-4-乙基氯化吡啶(TDEPC));苯酚殺菌劑;海克西定;奧替尼啶;血根鹼;優碘;地莫匹醇;薩利弗(salifluor);金屬離子(例如鋅鹽如檸檬酸鋅、亞錫鹽、銅鹽、鐵鹽);血根鹼;蜂膠和氧化劑(例如過氧化氫、緩衝過氧硼酸鈉或過氧碳酸鈉);酞酸及其鹽;單過酞酸及其鹽和酯;抗壞血酸硬脂酸酯;油醯基肌胺酸;烷基硫酸鹽;二辛基硫琥珀酸鹽;柳醛苯胺;溴化杜每芬;地莫匹醇;辛哌醇及其他哌啶基衍生物;菸鹼酸製劑;亞氯酸鹽;以及上述任何的混合物。

31. 如上述申請專利範圍中任一項之組成物，其係為一種凝膠。
32. 一種用於漂白患者牙齒的裝置，其包括大小足以覆蓋被漂白牙齒表面的載運支架，該支架塗佈以申請專利範圍第 1 至 31 項中任一項的組成物。
33. 如申請專利範圍第 32 項之裝置，其中該支架係一牙托。
34. 如申請專利範圍第 32 項之裝置，其中該支架係一牙帶。
35. 一種漂白牙齒的方法，其包括獲得大小足以覆蓋被漂白牙齒表面的載運支架；以申請專利範圍第 1 至 31 項中任一項的組成物塗佈該支架；將支架置於牙齒上而使至少一部分的組成物接觸被漂白的牙齒表面；使該牙托維持在牙齒上位置至少一小時；以及從牙齒上卸除該牙托。
36. 一種美白牙齒的方法，其包括選擇性地將申請專利範圍

第 1~31 項中任一項的組成物施予至被美白的牙齒而獲得  
(i) 減少或抑制蛀牙的形成；(ii) 減少、修補或抑制早期琺瑯質病變；(iii) 減少或抑制牙齒的去礦化及促進再礦化；(iv) 減少牙齒過敏性；(v) 減少或抑制齒齦炎；(vi) 促進口腔內潰瘍或傷口的癒合；(vii) 降低產酸菌的濃度；(viii) 增加精胺酸溶解菌的相對濃度；(ix) 抑制口腔內微生物生物膜的形成；(x) 吃甜食之後上升及/或維持牙垢 pH 在至少 pH 5.5 的程度；(xi) 減少牙垢的積聚；(xii) 清潔牙齒和口腔；(xiii) 免疫牙齒對抗致齲菌；(xiv) 促進包括心血管健康的身體健康；(xv) 減少牙齒的腐蝕；及/或(xvi) 治療、緩和或減少口乾症。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（無）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

無