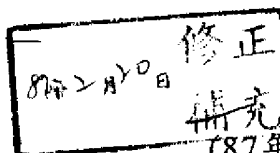


公告本



(87年2月修正頁)

申請日期	84.10.07.
案 號	84110573
類 別	A61K 7/6, 7/6b

412425

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

412425

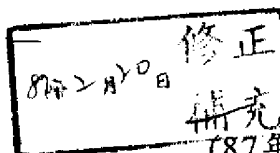
一、發明 名稱	中 文	具有膠囊粒子之牙粉組合物
	英 文	DENTIFRICE COMPOSITION HAVING CAPSULE PARTICLES
二、發明 創作人	姓 名	1. 片山 靖 2. 前田 晃嗣 3. 中井 良三 4. 室井 愛行 5. 岡島 孝雄
	國 籍	1-5 均 日 本
	住、居所	1. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 2. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 3. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 4. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 5. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內
三、申請人	姓 名 (名稱)	日商花王股份有限公司
	國 籍	日 本
	住、居所 (事務所)	日本國東京都中央區日本橋茅場町一丁目14番10號
	代 表 人 姓 名	常盤文克

裝

訂

線

公告本



(87年2月修正頁)

申請日期	84.10.07.
案 號	84110573
類 別	A61K 7/6, 7/6b

412425

A4
C4

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

412425

一、發明 名稱	<table border="1"> <tr> <td>中 文</td> <td>具有膠囊粒子之牙粉組合物</td> </tr> <tr> <td>英 文</td> <td>DENTIFRICE COMPOSITION HAVING CAPSULE PARTICLES</td> </tr> </table>	中 文	具有膠囊粒子之牙粉組合物	英 文	DENTIFRICE COMPOSITION HAVING CAPSULE PARTICLES				
中 文	具有膠囊粒子之牙粉組合物								
英 文	DENTIFRICE COMPOSITION HAVING CAPSULE PARTICLES								
二、發明 創作人	<table border="1"> <tr> <td>姓 名</td> <td> 1. 片山 靖 2. 前田 晃嗣 3. 中井 良三 4. 室井 愛行 5. 岡島 孝雄 </td> </tr> <tr> <td>國 籍</td> <td>1-5 均 日 本</td> </tr> <tr> <td>住、居所</td> <td> 1. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 2. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 3. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 4. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 5. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 </td> </tr> </table>	姓 名	1. 片山 靖 2. 前田 晃嗣 3. 中井 良三 4. 室井 愛行 5. 岡島 孝雄	國 籍	1-5 均 日 本	住、居所	1. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 2. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 3. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 4. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 5. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內		
姓 名	1. 片山 靖 2. 前田 晃嗣 3. 中井 良三 4. 室井 愛行 5. 岡島 孝雄								
國 籍	1-5 均 日 本								
住、居所	1. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 2. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 3. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 4. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內 5. 日本國栃木縣芳賀郡市貝町赤羽2606番地花王股份有限公司研究所內								
三、申請人	<table border="1"> <tr> <td>姓 名 (名稱)</td> <td>日商花王股份有限公司</td> </tr> <tr> <td>國 籍</td> <td>日 本</td> </tr> <tr> <td>住、居所 (事務所)</td> <td>日本國東京都中央區日本橋茅場町一丁目14番10號</td> </tr> <tr> <td>代 表 人 姓 名</td> <td>常盤文克</td> </tr> </table>	姓 名 (名稱)	日商花王股份有限公司	國 籍	日 本	住、居所 (事務所)	日本國東京都中央區日本橋茅場町一丁目14番10號	代 表 人 姓 名	常盤文克
姓 名 (名稱)	日商花王股份有限公司								
國 籍	日 本								
住、居所 (事務所)	日本國東京都中央區日本橋茅場町一丁目14番10號								
代 表 人 姓 名	常盤文克								

裝

訂

線

412425

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C分類：

A6

B6

本案已向：

日本國(地區) 申請專利, 申請日期1994.10.18案號: 6-252031, ☐有 ☐無主張優先權
日本 1994.10.18 6-252032

有關微生物已寄存於：_____，寄存日期：_____，寄存號碼：_____

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

五、發明說明(1)

發明背景

發明領域

本發明係有關牙粉組合物，其含有在刷牙時易於破裂之膠囊且其具有令人喜悅的感覺及良好的產品表觀。

先前技藝討論

傳統上，已知有其中包含各種有效的成份，例如，醫藥成份，香料和色素等的牙粉組合物。於上述牙粉組合物中，係使用明膠，蠟物質，和瓊脂等作為膠囊粒的塗層形成性物質，而其中主要採用的是明膠。

使用明膠作為塗層形成性物質的牙粉組合物之例子包括下列：

- (1)日本專利公開第49-453號揭示一種包含充填著加香料物質的膠囊粒子之牙粉組合物；
- (2)日本專利公開第61-100516號揭示一種含有密封明膠膠囊粒的牙膏；
- (3)日本專利公開第61-225115號揭示雙層膠囊粒，其包含著水溶性醫藥為核心物質，在該核心物質上塗被的親脂性物質，例如蠟狀物質，以及親水性物質，例如，明膠等，塗被在該親脂性物質之上；及一種含有該雙層膠囊粒子，用於口腔中的組合物；及
- (4)日本專利已審查公報第5-41602號揭示一種接著到口腔黏膜的口臭防止劑，其包括水溶性膜，例如明膠，混合口臭防止性成份。

此外，使用蠟狀物質作為塗層形成性物質的牙粉組合物

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

本

訂

五、發明說明(2)

例子包括下列：

(5)日本專利已審查公報第58-20928號揭示一種牙粉，其包含一塗被劑，例如合成樹脂和石蠟，及一粒狀發泡劑及/或與其一起塗被的消泡劑；

(6)日本專利已審查公報第50-25011號揭示一種牙粉，其含有雙塗層細粒膠囊粒子，其中含有作為核心的水溶性醫藥固體粉，在該核心上形成第一塗層的熱塑性樹脂或高熔點蠟狀物質，及在該第一塗層上形成第二塗層之高熔點蠟狀物質，其熔點低於該第一塗層之熔點；

(7)日本專利已審查公報第5-25011號揭示一種具有可變香味的粒狀牙粉組合物，其包含閉合著香料的環糊精粒子，其上塗被著塗被物質，該塗被物質含有蟲膠清漆，甘油脂肪酸酯，和熔媒；及粒狀牙粉基質；和

(8)日本專利公開第1-275520號揭示一種含有一或多種微膠囊粒子的牙粉組合物，該微膠囊粒子含有疏水性醫藥成份及式 C_nH_{2n+2} 所表的線形飽和烴，其中該疏水性醫藥成份對該線形飽和烴的重量比例不大於2。

再者，可能使用瓊脂作為塗層形成性物質的牙粉組合物例子包括下列：

(9)日本專利公開第55-100309號揭示一種含有微膠囊粒子的牙粉組合物，該粒子含有矽酮油為核心物質，其中該膠囊粒子的塗層於刷牙時會破裂，藉而展現出該矽酮油的消泡作用；

(10)日本專利公開第55-102436號揭示一種非透明微膠囊粒

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

五、發明說明(3)

子，其可經由將至少處於部份包埋在塗層中的狀態之不溶性鹽予以沉澱並覆蓋該膠囊粒子的塗層而製得；

(11)日本專利公開第4-222558號(美國專利第5,004,595號)揭示一種傳遞系統，用以輸送粒子以對食品組合物給予補強香味和甜味，其中係用粒狀香料作為核心，而囊包該核心者為一基質，其含有內含強甜味劑的親水性聚合物外塗層。

要摻合在牙粉組合物中的膠囊粒子需要具有下述性質，亦即該膠囊粒子的塗層在使用時要破掉藉而使其內容物釋放出來。不過，在製造使用明膠作為塗層形成性物質的膠囊粒子之情況中，雖然其塗層在使用時易於破裂，但該塗層在製造過程中也容易破裂，因而在製造過程中將內容物不當漏出來。另一方面，在製造使用蠟狀物質作為塗層形成性物質的膠囊粒之情況中，雖然該物質對於製造中的外力有足夠耐性，但該膠囊粒的塗層不易在刷牙時破裂。

致於在使用瓊脂作為塗層形成物質的情況中，可消除使用明膠和蠟狀物質作為塗層形成性物質的情況中所招致的問題。不過，在上引日本專利公開第55-100309號中所揭示的微膠囊粒子具有5至50微米的平均粒度，而日本專利公開第55-102436號中所揭示的非透明微膠囊粒具有5至100微米的粒度，兩者都極為小。於膠囊粒子的粒度為小的情況中，會產生該膠囊粒子傾向於不會被牙刷的尖端所抓住，使得保持未破裂的膠囊粒子易於引起愉悅感的降低。

縱上所述，摻合在上述諸牙粉組合物中的膠囊粒不僅在

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

本

訂

五、發明說明(4)

使用時的破裂容易性上具有問題，而且在其粒度上也有問題。

發明概述

基於解決上述諸問題的觀點，本發明的一項目的因而為提出一種含有具適當粒徑的膠囊粒子之牙粉組合物，該膠囊粒子在使用時容易破裂且可被辨認出其在口腔中的存在，沒有不合適感或異物存在於口腔中之感覺。

基於達到上述目的之觀點，本案發明人已發現使用瓊脂作為塗層形成物質的主要成份之牙粉組合物所用膠囊粒子的適當粒徑範圍，且已完成本發明。

本發明的要旨為提出一種牙粉組合物，其含有使用瓊脂作為主成份且具有0.3至3毫米平均粒徑之膠囊粒子。

繪圖之簡略說明

本發明可從下文的詳細說明和附圖而更完整地了解，但彼等說明和附圖係僅為闡述所用而非用以限制本發明者，其中：

圖1為闡釋測量透明度的方法之簡要圖；

圖2為闡釋測量透明度的方法之簡要圖；且

圖3為闡釋測量膠囊粒子內容物釋出量的檢驗方法之簡要圖。

圖2和3中的指示數字所指者為：

10為量筒；12為牙粉組合物，14為玻璃管，21為環氧樹脂，24為玻璃管，且"a"表厚度。

發明之詳細說明

五、發明說明(5)

本發明要在下面詳細解釋。於本發明中，"膠囊粒子"指的是用塗層形成物質塗被包含醫藥成份，色素，和香料等的內容物而得者。

該膠囊粒子含有以瓊脂為其主要成份之塗被形成性物質。從容易的塗被形成程序觀點來看，該瓊脂較佳者具有高水中溶解度，且更佳者為在常壓和95℃下具有不低於1，更佳者不低於3，且特別者不低於5之水溶度者。

此外，該瓊脂較佳者具有不低於500克/立方公分的充足膠強度(jelly strength)以使所得膠囊粒在牙粉組合物製造過程中不可能破裂。附帶言之，該膠強度係用在濃度為1.5重量%的瓊脂膠上於20秒每單位平方公分條件下可耐受的荷重量評估者，其中該荷重係垂直地施加在該瓊脂上者。例如，在食品用的瓊脂之中，條狀脂具有約400克/平方公分之膠強度，而方塊瓊脂的膠強度為約280克/平方公分。

於本發明中，為了改善愉悅感，可在瓊脂中加入親水性聚合物質或親脂性聚合物質。親水性聚合物的例子包括明膠，海藻酸鈉，鹿角菜膠，羧甲基纖維素，甲基纖維素，羥乙基纖維素，羥丙基纖維素，羥丙基甲基纖維素，阿膠，苦阿爾膠(gum guar)，黃菌膠，酪蛋白，果膠，白蛋白，和聚乙烯醇等。親脂性聚合物質的例子包括蠟狀聚合物，如聚乙烯，聚丙烯，聚苯乙烯，聚氯乙烯，聚丙烯酸，聚甲基丙烯酸，鯨蠟醇，硬脂醇，乙二醇二硬脂酸酯，山梨糖醇三硬脂酸酯，地蠟，石蠟，聚烯烴蠟，蜜蠟，和棕櫚蠟等。該親水性聚合物質和親脂性聚合物質可單獨地或以

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

五、發明說明(6)

兩種或多種的組合使用。

在除了瓊脂外還加用親水性聚合物質或親脂性聚合物質的情況中，該親水性聚合物質或親脂性聚合物質的添加量，從內容物的安定性和愉悅感的改良等而不損及口腔中的釋放性質等觀點來看，較佳者以100份重量的瓊脂計算為1至100份重量，特別者為1至20份重量。

膠囊粒子的內容物沒有特別限制，只要其為用於口腔中的組合物如牙粉等一般所用者即可，彼等內容物包括醫藥成份，香料和色素等。於本發明中，特別較佳者為具有親脂性質者。該內容物可以採取各種合意形式，例如，液體，粉末或凝膠等，取決於該牙粉組合物的形狀及其所用製造方法。

該醫藥成份包括蛀牙防止劑，抗生素，維生素，酵素，消炎劑等。更特定言之，其例子包括氟化鈉，氟化錫，一氟磷酸鈉，維生素E，維生素C，葡聚糖酶，變位酶，氯化鈉，甘草酸鹽，甘草酸，萘；二氫膽固醇，chlorohexidine，表膽固醇，異丙基甲基酚，三氯碳醯替苯胺，triclosan，halocarbon，扁柏酚，尿囊素，凝血酸，propolis，氯化鯨蠟基吡啶，氯化苄乙氧銨，氯苄烷銨，葉綠酸銅鈉，和氯化溶菌酶等。其香料包括香味性醛，酯，和醇。更特定言之，其例子包括薄荷油，薄荷油，丁香油，鼠尾草油，桉樹油，月桂油，肉桂油，檸檬梨莓油，柚子油，薄荷醇，香芹酮，柳酸甲酯，柳酸乙酯，丁香酚，樟腦油，胡椒，玫瑰，異丙基甲基酚，麥芽醇，和洋茴香腦等。其色素包括無

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

本

訂

五、發明說明(7)

機和有機兩種色素。更特定言之，其例子包括無機色素，例如，鈷藍，鈷綠，黃色氯化鐵，二氧化鈦，雲母，鋅粉，和鋁粉；薄片色素，例如，葉綠素銅， β -胡蘿蔔素，和扁柏酚的鐵複合物鹽等。

此外，也可以在膠囊粒子內容物中更摻合溶媒，例如脂肪和油；蠟，煙，高碳脂肪酸，高碳醇，酯，精油，和矽酮油等。

脂肪和油的例子包括天然脂肪和油，例如，大豆油，米糠油，荷荷巴油，鱈梨油，杏仁油，橄欖油，可可油脂，貂油，牛脂，和豬油等；將這些天然脂肪和油氫化所得氫化油，如甘油肉豆蔻酸酯，甘油2-乙基己酸酯，甘油三辛酸酯和甘油三癸酸酯等。這些蠟的例子包括棕櫚蠟，鯨蠟，蜜蠟和羊毛脂等。煙的例子包括液體石蠟，凡士林(vaseline)，石蠟，微晶蠟，地蠟，角鯊烷和降植烷等。高碳脂肪酸的例子包括月桂酸，肉豆蔻酸，棕櫚酸，硬脂酸，二十二烷酸，油酸，亞麻油酸，亞麻脂酸，羊毛脂酸和異硬脂酸等。高碳醇的例子包括月桂醇，鯨蠟醇，硬脂醇，油醇，羊毛脂醇，膽固醇，和2-己基癸醇等。酯類的例子包括辛酸鯨蠟酯，乳酸肉豆蔻酯，乳酸鯨蠟酯，肉豆蔻酸異丙酯，肉豆蔻酸肉豆蔻酯，棕櫚酸異丙酯，己二酸異丙酯，硬脂酸丁酯，和油酸癸酯等。精油的例子包括薄荷油，茉莉油，樟腦油，檜油，橙皮油，芸香油，荳蔻油，肉桂油，香檸檬油，檸檬油，菖蒲油，松油，薰衣草油，月桂油，丁香油，檜葉油，玫瑰油，桉油，檸檬油，薄荷油

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明(8)

，和鼠尾草油等。矽酮油的例子包括二甲基聚矽氧烷。

該膠囊粒子的製造方法例子沒有特別限制，任何傳統已知的製造方法，包括化學方法，例如介面聚合方法和液內塗被硬化法；物理化學法，如膠粒堆積法，以及物理方法，如流床法等都可以使用。特別者，最好是使用雙噴嘴滴液法。

本發明所用膠囊粒子具有用顯微鏡或測徑器測定的平均粒徑0.3至3毫米，更佳者0.5至3毫米，特別者0.5至2毫米。當平均粒徑小於0.3毫米時，該膠囊粒子在刷牙時不會破裂，使得愉悅感明顯降低且使膠囊粒子失去良好表觀。當其平均粒徑超過3毫米時，愉悅感會明顯降低且膠囊粒子會失去良好表觀。膠囊粒子的粒徑分佈為使得80%或更多者適當地落於0.3至3毫米範圍內，特別者90%或更多者在上述範圍內，更特別者95%或更多者在上述範圍內。

此外，該膠囊粒子所具每膠囊粒子的破裂強度較佳者是在0.1至20克，更佳者為1至20克，且特別者1至10克。於上述範圍內，即可抑制牙粉組合物製造和貯存中膠囊粒子內容物的洩漏，且該膠囊粒子在使用時易於破裂而釋放出其內容物。附帶地，該破裂強度係經由在牙粉組合物中取出一粒子上垂直地連續施加一荷重直到破裂為止而測量的，測得的是膠囊粒子塗層破裂時的荷重量。本發明膠囊粒子的破裂強度係用壓縮檢驗裝置 "KES-F3" (Kato Tekkohjo製品)測量的，荷重施加速度為50秒/毫米。

此外，膠囊粒子中的瓊脂塗被比較佳者是在1至30重量%

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(9)

，更佳者1至15重量%，特別者5至15重量%的範圍內，於該範圍內，膠囊粒子具有在使用時的適當破裂性以使其容易地釋放出其內容物。附帶言之，該塗被此係表成以膠囊粒子總重計算的瓊脂重量百分比。

本發明牙粉組合物中膠囊粒子的含量較佳者為0.1至10重量%，特別者為0.5至5重量%，於該範圍內，可適當地得到醫藥成份等的效果，且其愉悅感和表觀皆良好。

除了上述成份外，本發明牙粉組合物可更含有口腔用製包括牙粉等常用的其他溶媒，例如界面活性劑，磨擦劑，增稠劑，溼化劑，香水，甜味劑，防腐劑，和水等。

該水不溶性磨擦劑未特別限制，只要其係通常用為牙齒磨擦劑者即可，其例子包括磷酸氫鈣，磷酸鈣，水不溶性偏磷酸鈉，氧化矽，氫氧化鋁，磷酸鎂，碳酸鈣，焦磷酸鈣，沸石，複合鋁矽酸鹽，碳酸鎂，紅色氧化物，和硫酸鈣等，其可單獨使用或以兩種或多種之組合使用。

水不溶性磨擦劑較佳者具有從0.1至20微米，特別者1至10微米之粒徑。

於本發明中，上述磨擦劑可不經進一步處理即使用，或其可用或不用水不溶性黏合劑將水不溶性磨擦劑彼此黏合和黏著而形成顆粒。

本發明所用水不溶性磨擦劑粒子指的是可用或不用水不溶性黏合劑將水不溶性磨擦劑彼此黏合和黏著在一起而得者。

經由將特殊水不溶性磨擦劑粒子與膠囊粒子摻合在一起

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

表

訂

五、發明說明 (10)

，並選擇特殊粒徑範圍及其組成，可使該水不溶性磨擦劑粒作為該膠囊粒的破裂助劑，致使該膠囊粒子在刷牙時能夠顯著且容易地破裂，藉而使其快速地將其內容物釋放到口腔內。

在水不溶性磨擦劑粒子中的水不溶性磨擦劑之含量，從本發明膠囊粒的破裂性來看，較佳者為10至90重量%，特別者50至90重量%。

此外，該水不溶性黏合劑可為任何種有機或無機的黏合劑。有機黏合劑的例子包括多醣類，例如，羥基纖維素，羧甲基纖維素，羥丙基纖維素，黃菌膠(gum xanthane)和鹿角菜膠；水不溶性纖維，例如天然纖維，聚氯乙烯，聚乙烯，聚丙烯，聚苯乙烯，聚甲基丙烯酸甲酯，尼龍，和矽酮等；及油和脂肪，如石蠟，高碳醇，和蠟等。另外，無機黏合劑的例子包括膠體氧化矽，偏矽酸鋁酸鎂，膨潤土，蒙脫土，高嶺土，合成矽酸鋁，矽酸鈣，氫氧化鋁凝膠，氧化鋁溶膠，碳酸鎂，合成水滑石，氧化鎂，和氫氧化鎂等。其中，以無機黏合劑為較適當，因其可穩定地維持水不溶性磨擦劑粒所具性質而不會引起明顯改變之故。由於僅用噴霧製粒法即可製備該粒子，因此，特別較佳者為採用膠體氧化矽，偏矽酸鋁酸鎂，合成矽酸鋁，和氫氧化鎂等。

這些水不溶性黏合劑可以單獨使用或以兩種或多種組合使用。於黏合劑以組合方式使用之情況中，較佳者為用具有相對粒狀形式且作為溶媒之黏合劑，例如，偏矽酸鋁酸

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

第

訂

3

五、發明說明 (11)

鎂，合成矽酸鋁，和氫氧化鎂等，與具有強黏著性質且可顯著增加顆粒強度之黏合劑，例如，膠體氧化矽和氧化鋁溶膠等組合在一起，因為在彼等組合中，可以經由自由地選擇水不溶性磨擦劑的種類和用量同時保持足夠的強度以達到本發明目的之下得到所欲水不溶性磨擦劑顆粒之故。

在該水不溶性磨擦劑顆粒中的水不溶性黏合劑含量較佳者為5至80重量%，特別者5至50重量%，其中使該顆粒在牙粉製造中不會破裂，且於另一方面，產生適當的黏著強度以使該顆粒可被刷破。

該水不溶性磨擦劑顆粒可更包含醫藥成份和色素，其方式與上文所解釋的膠囊粒子相同。於含有上述成份的情況中，醫藥成份和色素在水不溶性磨擦劑顆粒中的含量適當者為0.01至10重量%。

水不溶性磨擦劑顆粒的製造方法沒有特別限制，任何已知方法，例如噴霧製粒法和擠壓製粒法等，都可以適當地採用。其中，較佳者為噴霧製粒法，以其所得粒子形狀為球形，因而使牙齒較不易受到刷壞，且粒子製造後的處理也因而較容易。

該水不溶性磨擦劑顆粒所具平均粒徑較佳者為50至500微米，特別者100至400微米，更特別者為100至300微米。當其平均粒徑小於50微米時，該顆粒較可能不被牙刷尖端抓住，因而使其難以被正常刷牙所破裂。另一方面，當其平均粒度超過500微米時，該膠囊較不可能被破裂，且使口腔中不合適感或異物感增加，因而明顯降低愉悅感。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

第

訂

五、發明說明 (12)

此外，水不溶性磨擦劑粒較佳者具有每顆粒破裂強度為0.1至10克，特別者1至10克，於該範圍內，可經由顆粒的破裂而增加膠囊粒子的破裂性。本發明磨擦劑顆粒的破裂強度係用熱應力分析儀"SS-10"(Seiko Instruments 所製)測量的，其中係施加一所給荷重(2克/分)直到破裂為止。

本發明牙粉組合物中的水不溶性磨擦劑粒之含量較佳者為1至50重量%，特別者3至30重量%。當該顆粒的含量低於1重量%時，接觸膠囊粒子的顆粒之絕對數目會減少，使得膠囊粒子的破裂可能有困難。當該含量超過50重量%時，不合適感或口腔中有異物感(例如，砂感)會增加，因而明顯地降低愉悅感。

於本發明牙粉組合物中，膠囊粒子與水不溶性磨擦劑顆粒之間的組成重量比例滿足下列關係：

(膠囊粒子)

$$\leq 2$$

(水不溶性磨擦劑顆粒)

更特別者，滿足下示關係式：

(膠囊粒子)

$$\leq 1$$

(水不溶性磨擦劑顆粒)

當膠囊粒子的含量超過水不溶性磨擦劑顆粒的含量兩倍時，接觸膠囊粒子的水不溶性磨擦劑顆粒之絕對數目變小，因而使其較難以使膠囊粒子破裂。此外，更較者，膠囊粒子的破裂強度超過該水不溶性磨擦劑顆粒的破裂強度。

另外，增稠劑的例子包括羧甲基纖維素鈉鹽，聚丙烯酸鈉，羥乙基纖維素，增稠氧化矽，蒙脫土，鹿角菜苷，海藻酸鈉，苦阿爾膠，黃菌膠，和果膠等。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

製

訂

3.

五、發明說明 (13)

溼化劑的例子包括聚乙二醇，丙二醇，山梨糖醇，甘油，麥芽糖醇，木糖醇，等。其中較佳者為甘油和山梨糖醇。

香水的例子包括天然香水，例如，薄荷油，鹿蹄草油，黃樟油，丁香油，紫蘇花油，桉樹油，mayonara油，肉桂油，百里香油，檸檬油，橘子油等；以及合成香水，例如，1-薄荷醇，茴香腦，藏茴香酮，丁香酚，百里香酚，柳酸甲酯，等。

甜味劑的例子包括糖精，糖精鈉，斯替維甙(stevioside)，新橙皮糖二氫查爾酮(neohesperidyl dihydrocarcone)，berururuchine，對-甲氧基肉桂醛，甘草酸鹽，阿斯巴甜(aspartame)(天冬胺鹽基苯丙胺酸甲酯)，等。

防腐劑的例子包括苯甲酸，苯甲酸钠，對羥基苯甲酸酯，等。

本發明所用界面活性劑沒有特別限制，牙粉組合物中常用的任何一種都可以使用。其例子包括非離子界面活性劑，包括鹽基胺基酸鹽，如鹽基穀胺鹽基鈉和鹽基N-甲基甘胺酸鈉鹽，烷基硫酸鹽，如月桂基硫酸鈉等。

此外，在含有用瓊脂作為塗層形成性物質主成份的膠囊粒子之本發明牙粉組合物中，據發現，非離子界面活性劑的使用可使醫藥成份和其他內容物穩定地保持在膠囊粒子內直到使用為止，且在使用中易於破裂膠囊粒子以釋放出內容物，如醫藥成份等到口腔內。

非發明所用非離子界面活性劑的例子包括聚氧化乙烯烷

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

三

五、發明說明 (14)

基醚，聚氧化乙烯烷芳基醚，聚氧化乙烯-聚氧化丙烯烷基醚，聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物，蔗糖脂肪酸酯，甘油脂肪酸酯，丙二醇脂肪酸酯，山梨糖醇脂肪酸酯，烷基糖苷脂肪酸酯，聚氧化乙烯蔗糖脂肪酸酯，聚氧化乙烯二醇脂肪酸酯，聚氧化乙烯山梨糖醇脂肪酸酯，烷基糖苷類，脂肪醇-乙醇醯胺，聚氧化乙烯脂肪酸-乙醇醯胺，聚氧化乙烯脂肪酸二乙醇醯胺，聚氧化乙烯蓖麻油，聚氧化乙烯氫化蓖麻油，及聚氧化乙烯蜜蠟衍生物等。其中，較佳者為聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物，蔗糖脂肪酸酯，烷基糖苷，聚氧化乙烯蔗糖脂肪酸酯，及聚氧化乙烯氫化蓖麻油等。再者，於上述諸非離子界面活性劑中，以具有低流性者較為佳，因為如此一來，膠囊粒子內容物的洩漏量即可極為降低之故。於本發明中，更佳者為聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物，特別是平均分子量為1,000至15,000的聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物。

上述非離子界面活性劑可單獨使用或以兩種或多種的組合使用。牙粉組合物中的非離子界面活性劑含量較佳者為1至40重量%，特別者為3至30重量%，其該範圍內，膠囊粒子內容物的洩漏可以極為降低，膠囊粒子的安定性增加同時也可得良好愉悅感。

口腔用的溶媒含有1至40重量%的界面活性劑，1至75重量%的水不溶性磨擦劑，不超過5重量%，特別者，0.5至5重量%的增稠劑，以及10至85重量%的溼化劑和水之合計量等。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五

五、發明說明 (15)

本發明牙粉組合物可採取合意形式，包括牙膏，牙粉，和液體牙粉等。經由使用透明瓊脂其為透明者且視所用色素而為無色或有色者來形成膠囊粒子的塗層，且使牙粉組合物的其他成份成為透明可見，因而使整個牙粉組合物的外觀因膠囊粒與含該膠囊粒的牙粉組合物兩者所具透明性的增效作用獲得進一步的改良。於牙粉組合物依上文所解釋製成透明者之情況中，其透明度經由目視觀察可清楚地辨認出雙重線而觀察到最大厚度(毫米)予以評估出，其較佳者不小於3毫米，特別者不小於5毫米。順便提及者，該透明度測量法係根據實施例中所述方法進行的。

由於本發明牙粉組合物含有膠囊粒子，其中含有瓊脂作為塗層形成物質的主要成份且其具有0.3至3毫米之平均粒徑，因此該膠囊粒子易於在使用時被刷破，且其內容物，如醫藥成份可因而釋出並穿透在口腔中。此外，由於該膠囊粒子可如此容易地破裂且具有適當的粒徑，使用者沒有不合適感或口腔中有異物感，因而可增加其愉悅感。此外，由於膠囊粒子具有可目視確定的大小，可使得使用者具有安全感且預期有醫藥效用而沒有口腔中有異物之不愉悅感。

此外，在本發明牙粉組合物中，經由使用非離子界面活性劑，因為膠囊內容物在該膠囊粒子的製造和貯存中發生洩漏的可能性極為降低，製造後的長期貯存中，組成變化非常小，因而使其可維持高品質的膠囊粒子。此外，由於膠囊粒子的塗層在使用時容易破裂且其內容物易於釋出，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (16)

加上內容物的組成變化小，因此可以更確定地使所欲含量的內容物在口腔中局部給用。再者，本發明牙粉組合物具有優良的愉悅感，因此特別適用於牙膏中。

膠囊粒子和水不溶性磨擦劑顆粒都可能在刷牙時局部地集中在口腔中的下述部位，如，齒間及牙齒與齒齦之間的隙縫等。於這些部位中，膠囊粒子與水不溶性磨擦劑顆粒之間的接觸頻率顯著地增加，藉而使膠囊粒子更順利地破裂。接觸頻率的增加係因顆粒的膠囊粒子的撞擊而引起的，或因顆粒立即破裂而該破裂顆粒撞擊膠囊粒子而促成的。膠囊粒子的破裂導致膠囊粒子內容物完全且極速地釋出和穿透，因而使其更確實地展現出醫藥成份的效用。此外，該水不溶性磨擦劑顆粒也可作為磨擦劑。

再者，由於水不溶性磨擦劑顆粒易於破裂而該膠囊粒子易被打破，且各具適當的粒徑，因而使用者具有明顯較低的不合適感或口腔中有異物感，藉此增加其愉悅感。

實施例

本發明要用下列製造例，比較製造例，實施例，和比較例等更詳細地解釋，但彼等不是用以限制本發明的範圍者。

製造例 1-1

用下列成份和製造方法製造膠囊粒子。其中的瓊脂係使用商品名為"UP-37"之產品(溶解度:10；膠強度:700克/平方公分；Ina Shokuhin Kogyo K.K.所製)。

膠囊粒子的成份

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

製

訂

3.

五、發明說明 (17)

塗層液體：

瓊脂 5重量%

純水 95重量%

內容物液體：

三(辛酸癸酸)甘油^{*1} 40重量% β -甘草次酸 50重量%

乙醇 10重量%

註*1: ("COCONARD MT", Kao Corporation 製品，其為辛酸和己酸混合物的甘油三酸酯)。

膠囊粒子的製造方法

用雙噴嘴液滴法製造膠囊粒子。其中，將傾注內容物液體所用的噴嘴直徑定在0.8毫米，將傾注塗層液體所用的噴嘴直徑定在1.0毫米，將裝著塗層液體的槽和塗層液體流過的達因(dyne)等的溫度定在75°C，並將冷卻液體的溫度定在25°C。

上面所得膠囊粒子具有平均粒徑1毫米，且其塗被比(coat ratio)為10.2%。其中，平均粒徑係用測徑器測量的，而塗被比的計算方式為將塗層部份的重量其係將一粒膠囊粒子打破，取出其內容物後稱得者除以一粒膠囊粒子的整個重量。附帶言之，在下面的製造例中，除非另有說明，否則其粒徑都是用測徑器測得者。平均粒徑與塗被比兩者皆為20粒膠囊粒測量所得值之平均值。另外，也將一粒膠囊粒打破以用0.0025M磷酸-酸性甲醇水溶液(75 v/v%)萃取內容物液體中的 β -甘草次酸，並將所得萃取液用高性能液相

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (18)

層析術("L-6000", Hitachi Ltd.的製品)予以定量分析。其結果，測得 β -甘草次酸的含量為44.9%。此處，該量係如上述用20個粒子所得值之平均值。

製造例1-2

用下列成份後製造例1-1的相同方式製造膠囊粒子。

膠囊粒子的成份

塗層液體：

瓊脂(與製造例1-1中相同)	10重量%
純水	90重量%

內容物液體：

三-(辛酸癸酸)-甘油	40重量%
β -甘草次酸	50重量%
乙醇	10重量%

上面所製膠囊粒子具有平均粒徑1毫米，及塗被比36.2%。依製備例1-1中的相同方式定量分析一個膠囊粒中的 β -甘草次酸含量，其結果為31.9%。

製造例1-3

用製造例1-1的相同成份與下述製造方法製造膠囊粒子。

膠囊粒係用類似製造例1-1中所述雙噴嘴滴液法，但加上下列更改而製成的：將傾注內容物液體的噴嘴直徑定為0.25毫米，而將傾注塗被液體的噴嘴直徑定為0.35毫米。

上面製得的膠囊粒子具有平均粒徑0.35毫米，其粒徑係用顯微鏡測定的，且其塗被比為10.8%。依製造例1-1中的相同方式定量分析一粒膠囊粒中的 β -甘草次酸含量，其結

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (19)

果為44.6%。

比較製造例1-1

將依製造例1-3方法所製膠囊粒子中，依網篩分類所得粒徑小於0.3毫米的粒子收集起來。上面所得膠囊粒子具有平均粒徑0.24毫米，該粒徑係用顯微鏡測定的，及與製造例1-3中相同的塗被比10.8%。依製造例1-1中的相同方式定量分析一粒膠囊粒中的 β -甘草次酸含量，結果為43.6%。

比較製造例1-2

用製造例1-1中的相同成份及下述製造法製造膠囊粒子。

膠囊粒係用類似製造例1-1中的雙噴嘴滴液法，但加上下列更改之處而製得者：將傾注內容物液體的噴嘴直徑定為2.80毫米，且將傾注塗被液體的噴嘴直徑定為3.50毫米。

上面所得膠囊粒具有平均粒徑3.50毫米，及塗被比9.8%。依製造例1-1中的相同方式定量分析一粒膠囊粒子中的 β -甘草次酸含量，其結果為45.1%。

實施例1-1至1-4及比較例1-1和1-2

含有表1-1中所列組成(以重量百分比(%)表出者)之每一種牙粉組合物係用傳統方法製備的。用每一種牙粉組合物用下文所解釋的方法進行各種檢驗，順便提及者，其所測得的粒徑值不同於製造例和比較例所得值之理由來自於瓊脂可吸收水，因而增加其表觀粒度之事實。其結果列於表1-1中。

(1) 粒度，塗被比，和破裂強度等之測量

粒度，塗被比，和破裂強度等的測量值係用20粒膠囊粒

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

製

訂

五、發明說明 (20)

子測得者，每一種測量方法都詳細解釋過，且所得值皆為平均值。

(2) 透明度

透明度的檢驗方法配合參考圖1和2說明如下。首先，將牙粉組合物置於圖1所示底部有標誌的有刻度量筒10。接著，將底部塞著扁平，無色，透明玻璃板的玻璃管浸在該有刻度量筒10的內部，從玻璃管上方開口進行目視觀察以測定表成厚度"a"(毫米)的透明度在雙重線上可清楚地辨識出來的最終點(參看圖2)。順便言之，於檢驗期間，光源係來自一個40瓦螢光燈透過閂光玻璃提供的。

(3) β -甘草次酸的釋出量(破裂性)

首先，如圖3中所示者，將許多直徑7毫米和長度80毫米的玻璃管(牙齒)黏貼固定在環氧樹脂基座(膠)上以製備牙齒模型。接著，將各為一克的上述諸牙粉組合物準確地稱取在牙刷上，用一荷重(300克/刷過部份)在一秒鐘內擦三或四次進行刷牙。在進行刷擦處理一分鐘或三分鐘後，以類似製造例1-1的方法評估 β -甘草次酸的釋出量。釋出量(重量%)係表成以 β -甘草次酸重量為基礎的測得值比例。

(4) 感覺試驗

將實施例和比較例所列各牙粉組合物給各15個男性和女性使用者，共30個人，年齡為20至40歲者，進行試驗。用下列標準進行感覺(不合適感或口腔中有異物感)和牙粉組合物外觀之感覺試驗，收集每一牙粉組合物的個別評分並平均而完成評估。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

3.

五、發明說明 (21)

[(愉悅感(不合適感或異物感))]

- 1: 無
- 2: 幾乎無
- 3: 輕微
- 4: 有些感覺
- 5: 強烈感覺

[牙粉組合物的表觀]

- 1: 好
- 2: 普遍
- 3: 難以說是好或壞
- 4: 略壞
- 5: 壞

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (22)

表 1-1

	實施例				比較例	
	1-1	1-2	1-3	1-4	1-1	1-2
膠囊粒子						
製造例1-1	2.0	-	2.0	-	-	-
製造例1-2	-	2.0	-	-	-	-
製造例1-3	-	-	-	2.0	-	-
比較製造例1-1	-	-	-	-	2.0	
比較製造例1-2	-	-	-	-	-	2.0
碳酸鈣	30.0	30.0	-	30.0	30.0	30.0
磨擦劑氧化矽	-	-	25.0	-	-	-
山梨糖醇溶液	20.0	20.0	45.0	20.0	20.0	20.0
甘油	10.0	10.0	20.0	10.0	10.0	10.0
羧甲基纖維素鈉鹽	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
月桂基硫酸鈉	1.2	1.2	1.2	1.2	1.2	1.2
糖精鈉	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
對羥基苯甲酸甲酯	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
香水	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
純水	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.
(合計)	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0
膠囊粒子的性質						
粒度(毫米)	1.10	1.13	1.07	0.37	0.24	3.72
塗破比(重量%)	10.2	36.2	10.2	10.8	10.8	9.8
破裂強度(克/粒)	7.8	17.6	8.2	15.6	21.7	1.8
透明度(毫米)	-	-	6.5	-	-	-
釋出量(重量%)						
刷一分鐘後	70.3	59.6	68.7	61.4	27.9	88.1
刷三分鐘後	93.2	82.3	91.9	85.6	54.2	97.6
感覺試驗						
愉悅感	1.2	2.1	1.3	1.5	3.8	4.3
表觀	2.3	2.5	1.4	2.1	3.1	3.6

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

3.

五、發明說明 (23)

從表1-1中明顯可知，於膠囊粒子的粒徑小於0.3毫米(比較例1-1)的情況中，由於膠囊粒子難以刷破，因此內容物釋出量小。此外，殘留在口腔中的未破裂膠囊粒子會導致不良的不合適感或口中有異物感之增加。

另外，於膠囊粒子的粒徑大於3毫米(比較例1-2)的情況中，由於該膠囊粒子易於被刷破，因此其釋出量亦大。不過，由於進行檢驗的個人感到因使用中有尚未破裂的膠囊粒子以及膠囊粒子破裂後殘留的大量瓊脂所導致之不合適感或口腔中有異物感，因此降低其愉悅感且產品的外觀也不好。從上述結果可以確定的是含有其平均粒徑在0.3至3毫米範圍之外膠囊粒子之所有產品都具有不良品質。

附帶地，於塗被比超過30重量%的情況中(實施例1-2)，該膠囊粒子會稍微較不易破裂，因此其內容物釋出量比實施例1-1和1-3的釋出量相對地較為小。此外，於透明度不小於3毫米的情況中，進行檢驗的個人都具有特別優異的愉悅感。

製造例2-1

用下列成份和製造方法製造膠囊粒子。其中所用瓊脂與製造例1-1所用者相同。

膠囊粒的成份

塗被液體：

瓊脂

5重量%

純水

95重量%

內容物液體：

五、發明說明 (24)

三-(辛酸癸酸)-甘油* ¹	40 重量%
1-薄荷醇	50 重量%
乙醇	10 重量%

註*1: ("COCONARD MT", Kao Corporation 所製，其為辛酸和己酸混合物的甘油三酸酯)。

膠囊粒子製造方法

用雙噴嘴滴液法製造膠囊粒子。其中，傾注內容物液體的噴嘴直徑係調定在0.8毫米，傾注塗被液體的噴嘴直徑係調定在1.0毫米，裝塗被液體的槽及塗被液體流經過的達因(dyne)等之溫度係設定在75℃，而冷卻液的溫度係設定在25℃。

上面所得膠囊粒子具有平均粒度1毫米，及塗被比8.5%。其中，平均粒度和塗被比皆係依製造例1-1中的相同方式評估的。此外，也打破一粒膠囊粒子，並用高性能液相層析術("5890", Yokokawa-Hewlett-Packard, Ltd. 所製)定量分析內容物中所含1-薄荷醇的量。其結果測得45.8%的1-薄荷醇含量。此處，所得量亦如上述般為20個粒子所得值的平均值。於上面所得膠囊粒子中，由於瓊脂具有優良的塗層形成性和膠強度，因此製造中的內容物損失少。

製造例2-2

依製造例2-1的相同方式，用下列成份製造膠囊粒。

膠囊粒子的成份

塗被液體:

瓊脂(與製造例1-1中相同)	5 重量%
----------------	-------

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

製

訂

製

五、發明說明 (25)

純水	95 重量 %
內容物液體:	
三-(辛酸癸酸)-甘油	40 重量 %
葉綠酸銅鈉	50 重量 %
乙醇	10 重量 %

上面所得膠囊粒子具有平均粒度1毫米，及塗被比9.8%。另外將一粒膠囊粒打破，用高性能液相層析術("L-6000"，Hitachi, Ltd.所製)定量分析內容物中的葉綠酸銅鈉含量。其結果測得45.1%。此處，所得量亦如上述為20粒的平均值。

比較製造例 2-1

以製造例2-1的相同方式，用下列成份製造膠囊粒。

膠囊粒的成份

塗被液體:

明膠	30 重量 %
純水	70 重量 %

內容物液體:

三-(辛酸癸酸)甘油	40 重量 %
1-薄荷醇	50 重量 %
乙醇	10 重量 %

上面所得膠囊粒子具有平均粒度1毫米，及塗被比21.5%。依製造例2-1中的相同方式定量分析一粒膠囊中的1-薄荷醇含量，測得其為39.3%。本比較例所用明膠具有不良的膠強度，因此膠囊粒製造過程中的內容物損失大。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (26)

比較製造例 2-2

用下述方法製造各含 80 重量% 氫化蓖麻油和 20 重量% 葉綠酸銅鈉的膠囊粒子。

首先，將所給量的葉綠酸銅鈉充分地分散在熔融氫化蓖麻油中。之後將所得混合物噴霧冷卻得到平均粒度為 1 毫米的膠囊粒子。用製造例 2-2 中的相同方式定量分析一個膠囊粒子中的葉綠酸銅鈉含量，測得其量為 20.1%。

實施例 2-1 至 2-4 和比較例 2-1 至 2-4

用傳統方法製造含有表 2-1 所列諸成份(表為重量%)的各牙粉組合物，並用以進行下列試驗例。

試驗例 2-1

將諸實施例和比較例中的每一牙粉組合物貯存在 40℃，用類似製造例 2-1 和 2-2 中的方法測量膠囊粒子內容物(1-薄荷醇或葉綠酸銅鈉)洩漏在牙粉基質物質中的量(表成重量%)隨時間之變化，藉此評估該等膠囊粒子的安定性。其結果加上根據上文解說的方法所測得之破裂強度一起列於表 2-1 中。此處，被等值亦為 20 個粒子所得值之平均值。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

九

五、發明說明 (27)

表 2-1

	實施例				比較例			
	2-1	2-2	2-3	2-4	2-1	2-2	2-3	2-4
膠囊粒								
製造例2-1	2.0	-	-	-	-	-	-	-
製造例2-2	-	2.0	2.0	2.0	-	-	-	-
比較製造例2-1	-	-	-	-	2.0	-	2.0	-
比較製造例2-2	-	-	-	-	-	2.0	-	2.0
磨擦劑氧化矽	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0
山梨糖醇溶液	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0	25.0
甘油	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0
非離子界面活性劑(*)	20.0	20.0	1.2	-	20.0	20.0	-	-
非離子界面活性劑(**)	-	-	-	1.2	-	-	-	-
羧甲基纖維素鈉鹽	-	-	0.8	0.8	-	-	0.8	0.8
月桂基硫酸鈉	-	-	-	-	-	-	1.2	1.2
糖精鈉	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
對羥基苯甲酸甲酯	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
香水	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
純水	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.	Bal.
(合計)	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0
膠囊粒子								
破裂強度(克/粒)	8.2	7.9	7.9	7.9	5.3	30.1	5.3	30.1
洩漏量(重量%)								
一個月後	2.6	2.4	1.8	2.2	21.5	0.9	48.7	20.8
三個月後	5.4	4.1	2.0	4.7	48.9	9.8	79.6	51.7
六個月後	9.6	6.8	2.4	9.3	71.4	27.2	92.1	80.9

註(*)：聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物(平均分子量10000)

(**):月桂基葡萄糖苷(葡萄糖苷聚合度:1.4)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明(28)

從表2-1明顯可知，內容物的洩漏極小，且只有在該膠囊粒同時具有瓊脂作為塗層劑形成物質，及非離子界面活性劑之情況中才如此。

試驗例2-2

用實施例2-2和比較例2-2的牙粉組合物依下述方法測量使用中的內容物(葉綠酸銅鈉)釋出量以評估內容物釋放的容易性。

首先，如圖3中所示者，將許多直徑7毫米和長度80毫米的玻璃管(牙齒)黏貼固定在環氧樹脂基座(膠)上以製備牙齒模型。接著，將各為1克的上述牙粉組合物正確地稱取在牙刷上，並用一所給荷重(300克/被刷部份)在一秒內刷三或四回以進行刷牙。於刷牙處理一分鐘或三分鐘之後，以類似製造例2-2的方法評估葉綠酸銅鈉的釋出量。該釋出量(重量%)表成測得值對膠囊粒子形成時所摻合的葉綠酸銅鈉重量之比例。其結果列於表2-2中。

表2-2

	釋出量(重量%)	
	刷一分鐘後	刷三分鐘後
實施例2-2	68.4	92.8
比較例2-2	8.2	18.7

從表2-2明顯可知，將實施例2-2與比較例2-2的牙粉組合物進行比較時，含有瓊脂作為塗層形成物質者(實施例2-2)具有明顯較大的釋出量。此外，雖然實施例2-2與比較例2-4之間的釋出量差異小，但是在安定性上，該兩牙粉組合

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五

五、發明說明 (29)

物卻有大幅差異，且在牙粉組合物實際使用時，前者具有比後者較佳的愉悅感。

製造例3-1(牙膏組合物)

用傳統方法製備含有下列成份(以重量%表出)的牙膏組合物。

膠囊粒子 ⁽¹⁾	2.0 重量%
水不溶性磨擦劑粒子 ⁽²⁾	6.0 重量%
甘油	30.0 重量%
聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物 (平均分子量:10,000)	20.0 重量%
月桂基硫酸鈉	0.1 重量%
鹿角菜苔	0.2 重量%
糖精鈉	1.0 重量%
對-羥基苯甲酸甲酯	0.2 重量%
香料	0.8 重量%
純水	餘量

(1)該膠囊粒子係用下述方法製得者。

膠囊粒子成份

塗被液體	5 重量%
瓊脂(溶解度:1.2;膠強度:900克/平方公分)	95 重量%
內容物液體:	
三-(辛酸癸酸)-甘油(製造例1-1中所用者)	90 重量%
維生素E	10 重量%

膠囊粒子製造方法

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (30)

以類似製造例1-1的方法在下述更改之下製造膠囊粒子。其中，傾注內容物液體的噴嘴直徑係定在0.40毫米，而傾注塗被液體的噴嘴直徑係定在0.50毫米。上面所得膠囊粒子具有平均粒徑0.50毫米，該粒徑係用顯微鏡測定者，塗被比8.5%，及每粒子破裂強度5.5克。

(2)用下述方法製備水不溶性磨擦劑顆粒。

將含有60重量%磨擦劑氧化矽作為水不溶性磨擦劑，和30重量%的合成矽酸鋁作為水不溶性黏合劑，及10重量%膠體氧化矽等的水漿液置於攪拌混合器內，其中該水漿液含有約60重量%的水含量。在攪拌摻合彼等成份120分鐘後，用噴霧製粒機製造水不溶性磨擦劑顆粒。99%的顆粒具有在50至500微米範圍內的粒度，且其平均粒度為220微米。

用熱應力分析儀"SS-10"(Seiko Instruments所製)測量每一粒磨擦劑顆粒的破裂強度，其中係施加一所給荷重(2克/分)直到破裂為止。其結果測得每一粒子的破裂強度為6.2克。

所得牙膏組合物的透明度係依實施例1-1中的相同方式評估的，測得5.5毫米。

至此，本發明已就此說明過，顯然地，其可以有許多方式的變異。彼等變異不視為遠離本發明旨意和範圍者，因此，所有對於諳於此技者明顯知曉的所有彼等修改都意欲包括在下列申請專利範圍所定範圍之內。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

四、中文發明摘要(發明之名稱： 具有膠囊粒子之牙粉組合物)

本發明牙粉組合物包含膠囊粒子，其含有瓊脂作為塗層形成性物質的主要成份且其平均粒徑為0.3至3毫米；及口腔中使用的媒液。其更可視需要包含非離子界面活性劑及/或水不溶性磨擦性粒子。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

英文發明摘要(發明之名稱： DENTIFRICE COMPOSITION HAVING CAPSULE)
PARTICLES

The dentifrice composition includes capsule particles containing agar as a main component of a coat-forming substance and having an average particle size of from 0.3 to 3 mm, and vehicles for use in oral cavity. It may further contain nonionic surfactants and/or water-insoluble abrasive granules as desired.

訂

線

六、申請專利範圍

1. 一種具有膠囊粒子之牙粉組合物，其含有以瓊脂作為塗層形成性物質的主成份之膠囊粒子，該膠囊粒子具有0.3至3毫米之平均粒徑及用於口腔中的媒液。
2. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該膠囊粒子具有0.5至3毫米之平均粒徑。
3. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該瓊脂具有不低於500克/平方公分之膠強度，該膠強度係由在濃度為1.5重量%的瓊脂凝膠上可耐20秒/每單位平方公分的荷重量予以估測的，該荷重係垂直地施加在瓊脂之上者。
4. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該瓊脂係以1至30重量%的塗被比包含在膠囊粒子中。
5. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該膠囊粒子具有1至20克之每一粒子所具破裂強度，該膠囊粒子所具破裂強度係經由用壓縮檢驗裝置"KES-F3"(Katoh Tekkohjo所製)，在從該具有膠囊粒子之牙粉組合物取出的一個粒子上持續地垂直施加荷重直到破裂為止進行測量的，其中，荷重施加速度為50秒/毫米，測得膠囊粒子塗被層破裂時的荷重量。
6. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該膠囊粒子係用雙噴嘴滴液法製造的。
7. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中更含一或多種非離子界面活性劑作為媒液。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

1. 一種具有膠囊粒子之牙粉組合物，其含有以瓊脂作為塗層形成性物質的主成份之膠囊粒子，該膠囊粒子具有0.3至3毫米之平均粒徑及用於口腔中的媒液。
2. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該膠囊粒子具有0.5至3毫米之平均粒徑。
3. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該瓊脂具有不低於500克/平方公分之膠強度，該膠強度係由在濃度為1.5重量%的瓊脂凝膠上可耐20秒/每單位平方公分的荷重量予以估測的，該荷重係垂直地施加在瓊脂之上者。
4. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該瓊脂係以1至30重量%的塗被比包含在膠囊粒子中。
5. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該膠囊粒子具有1至20克之每一粒子所具破裂強度，該膠囊粒子所具破裂強度係經由用壓縮檢驗裝置"KES-F3"(Kato Tekkohjo所製)，在從該具有膠囊粒子之牙粉組合物取出的一個粒子上持續地垂直施加荷重直到破裂為止進行測量的，其中，荷重施加速度為50秒/毫米，測得膠囊粒子塗被層破裂時的荷重量。
6. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該膠囊粒子係用雙噴嘴滴液法製造的。
7. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中更含一或多種非離子界面活性劑作為媒液。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

8. 根據申請專利範圍第7項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該非離子界面活性劑為一或多種選自下列所成組合之中的化合物：聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物，蔗糖脂肪酸酯，烷基糖苷，聚氧化乙烯蔗糖脂肪酸酯，及聚氧化乙烯氫化蓖麻油。
9. 根據申請專利範圍第7項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該非離子界面活性劑為聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物。
10. 根據申請專利範圍第9項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該聚氧化乙烯-聚氧化丙烯嵌段共聚物具有1,000至15,000的平均分子量。
11. 根據申請專利範圍第1項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其更包含水不溶性磨擦劑作為媒液。
12. 根據申請專利範圍第11項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該水不溶性磨擦劑為具有50至500微米平均粒徑的水不溶性磨擦劑顆粒，該水不溶性磨擦劑顆粒係經由將水不溶性磨擦劑成份彼此黏合和黏著在一起而製得者。
13. 根據申請專利範圍第12項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該水不溶性磨擦劑顆粒具有0.1至10克之每顆粒破裂強度，該水不溶性磨擦劑顆粒的破裂強度係經由使用熱應力分析儀"SS-10"(Seiko Instruments所製)，施加所給荷重(2克/分)直到破裂為止而測量者。
14. 根據申請專利範圍第1至13項中任一項之具有膠囊粒子之牙粉組合物，其中該具有膠囊粒子之牙粉組合物係牙膏

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

形式者。

15. 一種用於具有膠囊粒子之牙粉組合物中的膠囊粒子，其中該膠囊粒子含有瓊脂作為塗層形成性物質的主要成份且具有0.3至3毫米之平均粒徑。

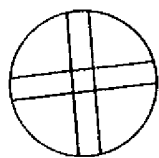
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

413495



線寬:1毫米
線間距:1毫米

圖 1

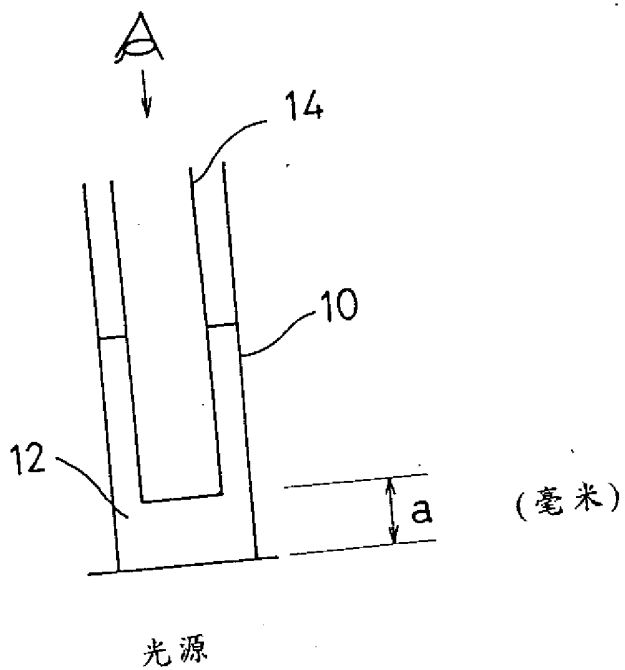


圖 2

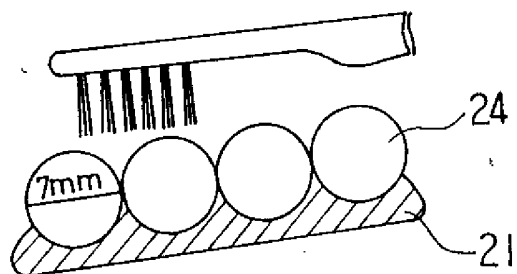


圖 3