



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I524902 B

(45)公告日：中華民國 105 (2016) 年 03 月 11 日

(21)申請案號：103146439

(22)申請日：中華民國 102 (2013) 年 08 月 09 日

(51)Int. Cl. : *A61K8/38 (2006.01)* *A61K8/55 (2006.01)*
A61K8/362 (2006.01) *A61K9/08 (2006.01)*
A61Q11/00 (2006.01)

(30)優先權：2012/08/10 世界智慧財產權組織 PCT/US12/50269

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

(72)發明人：西蒙 艾瑞克 SIMON, ERIC (US)；佛吉 林恩 FRUGE, LINH (US)；科赫爾 卡爾史丹 KOHRS, KARSTEN (DE)；皮爾希 席拉 PILCH, SHIRA (US)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希；何愛文

(56)參考文獻：

US 6447757B1

審查人員：徐永任

申請專利範圍項數：9 項 圖式數：0 共 19 頁

(54)名稱

漱口水

MOUTHWASH

(57)摘要

本發明提供具有改良味道、結合良好美白功效之漱口水調配物，其包含美白劑例如過氧化氫連同第一種酸例如檸檬酸與第二種酸例如磷酸之組合物。於進一步具體實例中，該漱口水可包含蔗糖素與糖精之組合物、酸性聚合物、一或多種抗牙垢劑(例如，鹼性焦磷酸鹽)、順丁烯二酸酐與甲基乙烯基酯之共聚物及其他成分。

The invention provides mouthwash formulations having improved taste, coupled with good whitening efficacy, which comprise a whitening agent such as hydrogen peroxide together with a combination of a first acid such as citric acid and a second acid such as phosphoric acid. In further embodiments, the mouthwashes may comprise a sucralose and saccharin combination, an acidic polymer, one or more anticalculus agents, e.g., alkali pyrophosphate salts, copolymers of maleic anhydride and methyl vinyl ether and other ingredients.

公告本

發明摘要

※ 申請案號：

103146439 (由102128569分割)

※ 申請日：

102.8.9

※IPC 分類：A61K 8/38 (2006.01)

A61K 8/55 (2006.01)

A61K 8/362 (2006.01)

A61K 9/08 (2006.01)

A61Q 11/00 (2006.01)

【發明名稱】 漱口水

MOUTHWASH

【中文】

本發明提供具有改良味道、結合良好美白功效之漱口水調配物，其包含美白劑例如過氧化氫連同第一種酸例如檸檬酸與第二種酸例如磷酸之組合物。於進一步具體實例中，該漱口水可包含蔗糖素與糖精之組合物、酸性聚合物、一或多種抗牙垢劑(例如，鹼性焦磷酸鹽)、順丁烯二酸酐與甲基乙烯基酯之共聚物及其他成分。

【英文】

The invention provides mouthwash formulations having improved taste, coupled with good whitening efficacy, which comprise a whitening agent such as hydrogen peroxide together with a combination of a first acid such as citric acid and a second acid such as phosphoric acid. In further embodiments, the mouthwashes may comprise a sucralose and saccharin combination, an acidic polymer, one or more anticalculus agents, e.g., alkali pyrophosphate salts, copolymers of maleic anhydride and methyl vinyl ether and other ingredients.

【代表圖】

【本案指定代表圖】：無

【本代表圖之符號簡單說明】：

無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：

無

發明專利說明書

【發明名稱】 漱口水

MOUTHWASH

【技術領域】

本發明提供具有改良味道、結合良好美白功效之漱口水調配物，尤指一種包含有效量之美白劑例如過氧化氫連同第一種酸例如檸檬酸與第二種酸例如磷酸之組合物。

【先前技術】

發明背景

【0001】 美白劑例如過氧化氫(H_2O_2)於漱口水中提供美白效益，惟過氧化物系口腔清洗液常與苦澀味相關聯。於漱口水中常見作為甜味劑用之糖精，在含 H_2O_2 之調配物中，可能具有尤其顯著之殘留強苦味。此外， H_2O_2 於高 pH 特別容易降解，為了盡量減少過氧化物降解，具有 H_2O_2 之漱口水配方通常調配於 pH 5.5 以下，此 pH 常藉由添加酸予以調整，會帶來令人不愉悅之酸味。

【0002】 業界對於提供美白效益，惟亦適口且具愉悅味道之漱口水有所需求。

【發明內容】

發明概述

【0003】 本發明提供具有改良味道，結合良好美白功效之漱口水調配物，其包含有效量之美白劑例如過氧化氫連同第一種酸例如檸檬酸與第二種酸例如磷酸之組合物。舉例而言，磷酸降低漱口水調配物之 pH，檸檬酸用來提供於 pH 4 至 5.5 之強緩衝力。 pK_a 為 2.1、7.2 與 12.4 之磷酸非所需 pH 之良好緩

衝劑，而 pK_a 為 4.74 之檸檬酸則提供所需 pH 之較佳緩衝劑。相對於磷酸，檸檬酸具較強之酸性口味(note)；而相較於分開使用兩種酸，此二酸之組合於最終調配物中提供更容易接受之酸味。於進一步具體實例中，相較於證明具強烈苦後味之單獨使用糖精之調配物，本發明提供使用蔗糖素與糖精組合物以提供帶最小苦味之甜味之用途。於進一步具體實例中，漱口水可包含酸性聚合物，例如選自聚羧酸酯聚合物與聚乙基甲基醚/順丁烯二酸酐(PVME/MA)共聚物之聚合物，發現其進一步增進漱口水之適口性以及黏性並提高過氧化物之穩定性，漱口水進一步包含一或多種抗牙垢劑，例如，鹼性焦磷酸鹽，且可含調味劑/冷卻劑，例如包含薄荷醇與水楊酸甲酯之組合物。

【0004】 本發明應用性之進一步領域由下文提供之詳細說明將顯而易見。應理解的是，該等詳細說明與明確實施例，雖指示本發明之較佳具體實例，惟僅係供說明用途，而不擬對本發明之範圍構成侷限。

詳細說明

【0005】 下述較佳具體實例之說明僅供本質上之例示，決不擬對本發明、其應用、或用途構成侷限。

【0006】 於一具體實例中，本發明提供包含潔白牙齒有效量之美白劑，連同由 pK_a 為 4 至 5 之第一種酸構成之緩衝系之漱口水。

【0007】 此具體實例之一態樣為包含至少一種過氧化合物美白劑，視需要連同一或多種附加之美白劑例如二氧化氯、亞氯酸鹽與次氯酸鹽(例如，鹼金屬與鹼土金屬例如鋰、鉀、鈉、鎂、鈣與鋇之亞氯酸鹽與次氯酸鹽)之美白組成物。適當之過氧化合物包括過氧化氫、鹼金屬與鹼土金屬之過氧化物、有機過氧化合物與過氧酸及其鹽；遞送過羥基($OOH \leftrightarrow$)離子之任何口服可接受

之化合物均有用。過氧化合物可視需要呈聚合物-過氧化物複合物(例如聚乙烯基吡咯烷酮-過氧化氫複合物)之形式存在。

【0008】 鹼金屬與鹼土金屬之過氧化物包括過氧化鋰、過氧化鉀、鈉過氧化物、過氧化鎂、過氧化鈣與過氧化鋇。

【0009】 有機過氧化合物包括，例如，過氧化脲(亦為所謂尿素過氧化氫)、甘油基過氧化氫、烷基過氧化氫類、二烷基過氧化物、烷基過氧酸、過氧酯類、二醯基過氧化物、過氧化苯甲醯、單過氧鄰苯二甲酸酯等。

【0010】 過氧酸及其鹽包括有機過氧酸例如烷基過氧酸與單過氧鄰苯二甲酸鹽、以及無機過氧酸鹽包括鹼金屬與鹼土金屬例如鋰、鉀、鈉、鎂、鈣與鋇之過硫酸鹽、二過硫酸鹽、過碳酸鹽、過磷酸鹽、過硼酸鹽與過矽酸鹽。另一有用之過氧化合物為過氧焦磷酸鈉(pyrophosphate peroxyhydrate)。

【0011】 此具體實例之一態樣為，第一種酸係選自包括乙酸($pK_a = 4.76$)、抗壞血酸($pK_a = 4.10$)、苯甲酸($pK_a = 4.2$)、檸檬酸($pK_a = 4.74$)、對甲氧苯甲酸($pK_a = 4.47$)與丙酸($pK_a = 4.87$)之組群，第二種酸係選自包括氯酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、與亞硫酸之組群。於此具體實例之另一態樣中，第一種酸為檸檬酸，第二種酸為磷酸。

【0012】 於此具體實例之另一態樣中，第二種酸具有 1.5 至 2.5 間之第一個 pK_a 及 6.5 至 7.5 間之第二個 pK_a ，例如磷酸($pK_{a1} = 2.1$ ； $pK_{a2} = 7.2$)或亞硫酸($pK_{a1} = 1.8$ ； $pK_{a2} = 6.9$)。

【0013】 於一具體實例中，本發明提供一種漱口水，其包含美白牙齒有效量之過氧化氫，連同其量足以提供 3 至 6 之 pH (一具體實例之 pH 為 4 至 5.5) 之檸檬酸與磷酸之組合物。舉例而言，本發明提供

- 1.1. 漱口水 1，其中過氧化氫以 0.01 至 5%，例如，1 至 3%，例如，約 2% 之量存在；
- 1.2. 前述任一項之漱口水，其中磷酸與檸檬酸以 1:1 至 10:1 之比率存在；
- 1.3. 前述任一項之漱口水，其中磷酸之量為 0.01 至 1.5%，例如，0.5 至 1%，例如，約 0.7%；
- 1.4. 前述任一項之漱口水，其中檸檬磷酸之量為 0.01 至 0.5%，例如，0.1 至 0.3%，例如，約 2%；
- 1.5. 前述任一項之漱口水，其進一步包含酸性聚合物，例如，選自聚羧酸酯聚合物與聚乙基甲基醚/順丁烯二酸酐(PVME/MA)共聚物之聚合物；
- 1.6. 前述任一項之漱口水，其進一步包含舉例而言，總量為 0.5 至 5%，例如，1 至 3%之抗牙垢有效量之一或多種焦磷酸鹽，例如，選自二或四鹼金屬焦磷酸鹽，例如 $\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$ (焦磷酸四鈉或 TSPP)、 $\text{K}_4\text{P}_2\text{O}_7$ (焦磷酸四鉀或 TKPP)、 $\text{Na}_2\text{K}_2\text{P}_2\text{O}_7$ 、 $\text{Na}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$ 與 $\text{K}_2\text{H}_2\text{P}_2\text{O}_7$ 及其組合物；
- 1.7. 前述任一項之漱口水，其包含，例如，總量為 1 至 3%，例如，比率為 1:1 至 1:5 之 TSPP 與 TKPP 之組合物；舉例而言，於一具體實例中包含約 0.3 至 0.6%，例如，0.4 至 0.5%之 TSPP 及 1.2 至 1.5%，例如 1.3 至 1.4%之 TKPP；
- 1.8. 前述任一項之漱口水，其包含例如，總量為 1 至 40%之例如，選自甘油、丙二醇、山梨糖醇、及其二或多種之組合物之一或多種保濕劑；
- 1.9. 前述任一項之漱口水，其包含非醣類甜味劑及/或醣類甜味劑，例如，比率為選自包括 1:1 至 20:1 與 10:1 至 15:1 之組群之甜化量之糖精與蔗糖素之組合物，例如，約 0.025% 糖精鈉與約 0.002%蔗糖素；

- 1.10. 前述任一項之漱口水，其包含一或多種調味劑或冷卻劑，例如，包含例如，比率為約 0.5:1 至 1.5:1，例如總量為 0.1 至 1%之薄荷醇與水楊酸甲酯之組合物；
- 1.11. 前述任一項之漱口水，其包含一或多種界面活性劑，例如，一或多種非離子性界面活性劑，例如，包含一或多種泊洛沙姆類(poloxamers)及/或聚山梨醇酯類，例如聚山梨醇酯 20；
- 1.12. 前述任一項之漱口水，其包含抗微生物有效量之抗細菌劑，例如，選自三氯沙與氯化十六烷基吡啶；
- 1.13. 前述任一項之漱口水，其包含有效量之氟化物；
- 1.14. 前述任一項之漱口水，其包含有效量之鹼性胺基酸，例如，呈游離或口服可接受鹽型之精胺酸；
- 1.15. 前述任一項之漱口水，其為水性溶液；
- 1.16. 前述任一項之漱口水，其包含下述量之下述成分之一或多種或全部：

水	60 至 80%
聚磷酸鹽	1.1 至 3%，例如約 1.8%
非醣類甜味劑	0.01 至 0.05%，例如，約 0.025%
醣類甜味劑	0.001 至 0.005%，例如，約 0.002%
有機酸	0.6 至 2.0%，例如，約 0.9%
多元醇(保濕劑)	7 至 45%，例如，約 20%
界面活性劑	0.5 至 2%，例如，約 1%
美白劑	0.5 至 5%，例如約 2%
調味劑	0.2 至 2%，例如，約 0.22%

漱口水之一具體實例包含：

水	60 至 80%，例如，約 70%
TSPP	0.1 至 1%，例如，約 0.45%
TKPP	1 至 2%，例如，約 1.35%
糖精鈉	0.01 至 0.05%，例如，約 0.025%

蔗糖素	0.001 至 0.005，例如，約 0.002%
磷酸	0.5 至 1.5%，例如，約 0.7%
檸檬酸	0.1 至 0.5%，例如，約 0.2%
保濕劑	0.1 至 0.5%，例如，約 0.2%
界面活性劑	0.1 至 0.5%，例如，約 0.2%
過氧化氫	0.5 至 5%，例如約 2%
香料	0.02 至 2%，例如，約 0.22%
PVME/MA (例如 Gantrez®)	1 至 2%，例如，約 1.5%

【0014】 本發明之若干具體實例提供一種美白牙齒之方法，該方法包括投與有其需要之對象之口腔本文所述之任何漱口水，例如，漱口水 1 起。於若干具體實例中，該投與包括清洗約 15 至約 60 秒；於若干具體實例中，該投與包括清洗約 30 秒。本發明進一步提供如本文所述之漱口水，例如，用於美白牙齒方法中之漱口水 1 起。

【0015】 本發明進一步提供使用磷酸與檸檬酸之組合物製造包含過氧化氫之漱口水(例如，製造本文所述之例如漱口水 1 起之任何漱口水)之用途。

【0016】 於若干具體實例中，存在提供約 90 至約 500 ppm 氟化物有效量之氟化物來源；於其他具體實例中，存在提供約 225 ppm 氟化物有效量之氟化物來源。於若干具體實例中，氟化物來源係選自氟化亞錫、氟化鈉、氟化鉀、單氟磷酸鈉、氟矽酸鈉、氟矽酸銨、胺氟化物(例如，N'-十八烷基三亞甲基二胺-N,N,N'-參(2-乙醇)-二氫氟化物)、氟化銨、氟化鈦、六氟硫酸鹽、及其二或多種之組合物。於若干具體實例中，氟化物來源係選自氟化鈉；單氟磷酸鈉；及其組合物；於其他具體實例中，氟化物來源包含氟化鈉。於若干具體實例中，氟化物來源以組成物重量計約 0.02%至約 0.2%之量存在；於若干具體實例中，氟化物來源以重量計約 0.03%至約 0.08%之量存在；其他具體實例提供其中氟化物來源以組成物重量計約 0.05%之量存在之組成物；於若干具體實例中，氟

化物來源以組成物重量計 0.5%之量存在。

【0017】 於若干具體實例中，存在鹼性胺基酸，例如，包含呈游離或口服可接受鹽型之 L-精胺酸。於若干具體實例中，鹼性胺基酸係選自精胺酸游離鹼、精胺酸鹽酸鹽、精胺酸磷酸鹽、精胺酸碳酸氫鹽、及其組合物。於若干具體實例中，包含以調配物重量計之 0.05 至 2%之有效量之呈游離或口服可接受鹽型之鹼性胺基酸(以口服可接受鹽型中之游離鹼當量重測得)。

【0018】 若干具體實例進一步包含緩衝劑。於若干具體實例中，緩衝劑為磷酸鈉緩衝劑(例如，磷酸二氫鈉與磷酸氫二鈉)。

【0019】 其他具體實例進一步包含保濕劑，例如，選自甘油、山梨糖醇、丙二醇、及其二或多種之組合物之多元醇。本文中有用之保濕劑包括多元醇例如甘油、山梨糖醇、木糖醇或低分子量 PEGs、烯烴二醇例如聚乙二醇或丙二醇。於各種具體實例中，保濕劑用以防止糊劑或凝膠組成物暴露於空氣後硬化。於各具體實例中，保濕劑亦具甜味劑之功能。於若干具體實例中，保濕劑各以約 1 至約 40 重量%之量存在。於若干具體實例中，保濕劑為山梨糖醇；於若干具體實例中，山梨糖醇以約 5 至約 25 重量%之濃度存在；於若干具體實例中，山梨糖醇以約 5 至約 15 重量%之濃度存在；於若干具體實例中，山梨糖醇以約 7 至 10 重量%之濃度存在；本文中提及之山梨糖醇係調整為有關此物質之乾重，惟其通常呈市售可得之 70%水溶液。於若干具體實例中，保濕劑總濃度為約 1 至約 60 重量%。於若干具體實例中，保濕劑為甘油；於若干具體實例中，甘油以約 5 至約 15 重量%之濃度存在；於若干具體實例中，甘油以約 7.5 重量%之濃度存在。於若干具體實例中，保濕劑為丙二醇；於若干具體實例中，丙二醇以約 5 至約 15 重量%之濃度存在；於若干具體實例中，丙二

醇以約 7 重量%之濃度存在。

【0020】 又一些具體實例進一步包含抗細菌劑，例如，三氯沙或氯化十六烷基吡啶。漱口水調配物中此類製劑之抗細菌有效量為約 0.01 至 0.1%，例如，約 0.03%之三氯沙或約 0.07%之氯化十六烷基吡啶。

【0021】 酸性聚合物，例如聚丙烯酸酯凝膠類，可呈其游離酸或部分或完全中和之水溶性鹼金屬(例如，鉀與鈉)或銨鹽之形式提供。特定具體實例包括順丁烯二酸酐或酸與另一可聚合之乙烯性不飽和單體[例如，分子量(M.W.)為約 30,000 至約 1,000,000 之甲基乙烯基醚(甲氧乙烯)]之約 1:4 至約 4:1 共聚物。市售可得之該等共聚物為例如 GAF Chemicals Corporation 之 Gantrez AN 139 (M.W. 500,000)、AN 119 (M.W. 250,000)與 S-97 Pharmaceutical Grade (M.W. 70,000)。其他有效聚合物包括例如順丁烯二酸酐與丙烯酸乙酯、甲基丙烯酸羥乙酯、N-乙烯基-2-吡咯烷酮、或乙烯之 1:1 共聚物，市售可得者為例如 Monsanto EMA No. 1103 (M.W. 10,000)與 EMA Grade 61，及丙烯酸與甲基丙烯酸甲酯或羥乙酯、丙烯酸甲酯或乙酯、異丁基乙烯基醚或 N-乙烯基-2-吡咯烷酮之 1:1 共聚物。一般適當者為含有活化之碳-碳烯屬雙鍵及至少一個羧基之聚合烯屬或乙烯性不飽和羧酸，亦即，含有由於其於單體分子中係存在相對於羧基之 α - β 位置或為終端亞甲基之一部分而於聚合反應中容易作用之烯屬雙鍵之酸。此類酸之實例為丙烯酸、甲基丙烯酸、乙基丙烯酸、 α -氯丙烯酸、巴豆酸、 β -丙醯氧丙酸、山梨酸、 α -氯山梨酸、肉桂酸、 β -苯乙基丙烯酸、黏康酸、伊康酸、檸康酸、中康酸、戊烯二酸、烏頭酸、 α -苯基丙烯酸、2-苄基丙烯酸、2-環己基丙烯酸、白芷酸、繖形酸、反丁烯二酸、順丁烯二酸及酸酐類。可與此類羧酸單體共聚合之其他各種烯屬單體包括乙酸乙烯酯、氯乙烯、順丁烯二酸二甲

酯等。共聚物可含足夠之水溶性羧酸鹽基團。酸性聚合物或共聚物可以 0.1 至 5% 之含量存在，例如，1 至 2% 之 PVME/MA。

【0022】 本發明之組成物意欲供口腔局部用途，因此用於本發明之任何鹽必須口服可接受，亦即，所提供之量及濃度於供口腔局部使用時很安全。適當之鹽包括此項技藝中已知為醫藥上可接受、一般被認為其量及濃度於供此用途時為口服可接受之鹽。口服可接受之鹽包括衍生自醫藥上可接受之無機或有機酸或鹼者，例如由形成生理上可接受之陰離子之酸形成之酸加成鹽，如，鹽酸鹽，及由形成生理上可接受之陽離子之鹼形成之鹼加成鹽，例如衍生自鹼金屬例如鉀與鈉或鹼土金屬例如鈣與鎂者。生理上可接受之鹽使用此項技藝中已知之標準程序製得，舉例而言，藉由使足夠鹼性之化合物例如胺與適當酸反應，得到生理上可接受之陰離子。

【0023】 於若干具體實例中，組成物進一步包含選自氟離子來源；牙垢控制劑；緩衝劑；研磨劑；及其二或多種之組合物之一或多種成分。於若干具體實例中，該一或多種成分之至少一者係選自於下之氟離子來源：氟化亞錫、氟化鈉、氟化鉀、單氟磷酸鈉、氟矽酸鈉、氟矽酸銨、胺氟化物、氟化銨、及其二或多種之組合物。

【0024】 雖然過氧化物通常可有效控制微生物，惟於若干具體實例中，存在附加之防腐劑。於若干具體實例中，防腐劑係選自對羥苯甲酸酯類、山梨酸鉀、苧醇、苯氧乙醇、聚胺苯基雙胍、辛酸、苯甲酸鈉與氯化十六烷基吡啶。於若干具體實例中，防腐劑以約 0.0001 至約 1 重量%之濃度存在；於若干具體實例中，防腐劑以約 0.01 至約 1 重量%之濃度存在；於若干具體實例中，防腐劑以約 0.5 重量%之濃度存在。

【0025】 著色劑例如染料可為目前於食品藥物&化妝品法(Food Drug & Cosmetic Act)下用於食品及攝取藥物之食品顏色添加劑，包括染料例如 FD&C Red No. 3 (四碘氟螢光素之鈉鹽)、Food Red 17、6-羥基-5-[(2-甲氧基-5-甲基-4-磺苯基)偶氮]-2-萘磺酸之二鈉鹽、Food Yellow 13、喹啉黃之單與二磺酸混合物之鈉鹽或 2-(2-喹啉基)茚烷二酮、FD&C Yellow No. 5 (4-對磺苯基偶氮-1-對磺苯基-5-羥吡唑-3-羧酸之鈉鹽)、FD&C Yellow No. 6 (對磺苯基偶氮-B-萘酚-6-單磺酸酯之鈉鹽)、FD&C Green No. 3 (4-[[4-(N-乙基-對磺苄胺基)-苯基]-(4-羥基-2-巯苯基)-亞甲基]-[1-(N-乙基-N-對磺苄基)- δ -3,5-環己二烯亞胺之二鈉鹽]、FD&C Blue No. 1 (二苄基二乙基-二胺基-三苯基甲醇三磺酸酐之二鈉鹽)、FD&C Blue No. 2 (靛藍之二磺酸之鈉鹽)及呈各種比例之其混合物。通常，若包含著色劑，則以非常少量存在。

【0026】 調味劑為已知之例如天然及人工香料；彼等調味劑可選自合成香料油與調味芳香劑、及/或油類、油性樹脂及得自植株、樹葉、花、果實等之萃取物、及其組合物。代表性香料油包括：留蘭香油、肉桂油、薄荷油、丁香油、香葉油、百里香精油、雪松葉油、肉荳蔻油、鼠尾草油、與苦杏仁油。彼等調味劑可單獨或呈摻合物使用。常用之香料，無論單獨或呈摻合物使用，包括薄荷例如薄荷油、人造香草、肉桂衍生物、及各種水果香料。一般而言，可使用任何調味劑或食品添加劑，例如見述於 *Chemicals Used in Food Processing*, publication 1274 by the National Academy of Sciences，第 63-258 頁中者。通常，若包含調味劑，則以 0.01 至 1 重量%之量存在。於若干具體實例中，調味劑可以約 0.2 重量%之量存在。

【0027】 甜味劑包括天然及人工甜味劑二者。適當之甜味劑包括，惟不

限於水溶性醣類甜味劑例如單醣類、雙醣類及多醣類例如木糖、核糖、葡萄糖(右旋糖)、甘露糖、半乳糖、果糖(左旋糖)、蔗糖(糖)、麥芽糖、及水溶性人工非醣類甜味劑例如可溶性糖精鹽、亦即，鈉或鈣糖精鹽、環己胺磺酸鹽二肽系甜味劑、L-天冬胺酸衍生之甜味劑例如 L-天冬胺醯基-L-苯丙胺酸甲酯(阿斯巴甜)。一般而言，視選用之甜味劑而定，使用有效量之甜味劑以提供特定組成物所需之甜度；此量通常為組成物重之約0.001%至約5%。於若干具體實例中，以組成物重量計，甜味劑為以 0.001 至 0.003%存在之蔗糖素和以約 0.01 至 0.03%存在之糖精鈉之組合物。

【0028】 可提供視需要之口腔清新劑；可使用口服可接受之任何口腔清新劑，包括而不限於鋅鹽例如葡萄糖酸鋅、檸檬酸鋅與亞氯酸鋅、 α -紫羅酮及其混合物。一或多種口腔清新劑視需要以口腔清新有效總量存在。

【0029】 視需要，組成物可包含牙垢控制(抗牙垢)劑；本文中有用之牙垢控制劑包括磷酸鹽與聚磷酸鹽(例如焦磷酸鹽)、多胺基丙磺酸(AMPS)、聚烯烴磺酸酯類、聚烯烴磷酸酯類、二膦酸酯類例如吡環鏈烷-2,2-二膦酸酯類(例如，吡環庚烷-2,2-二膦酸)、N-甲基吡環戊烷-2,3-二膦酸、乙烷-1-羥基-1,1-二膦酸(EHDP)與乙烷-1-胺基-1,1-二膦酸酯、膦醯鏈烷羧酸及任何彼等製劑之鹽，例如其鹼金屬與銨鹽。有用之無機磷酸鹽與聚磷酸鹽包括磷酸二氫鈉、磷酸氫二鈉與磷酸鈉、三聚磷酸鈉、四聚磷酸鹽、焦磷酸一鈉、焦磷酸二鈉、焦磷酸三鈉與焦磷酸四鈉、三偏磷酸鈉、六偏磷酸鈉及其混合物，其中鈉可視需要以鉀或銨置換。

【0030】 於特定具體實例中，漱口水包含用於實施本發明之具抗牙垢效力之焦磷酸鹽，包括水溶性鹽例如焦磷酸二鹼或四鹼金屬鹽例如 $\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7$

(TSPP)、 $K_4P_2O_7$ (TKPP)、 $Na_2K_2P_2O_7$ 、 $Na_2H_2P_2O_7$ 與 $K_2H_2P_2O_7$ 。聚磷酸鹽包括水溶性三聚磷酸鹼金屬鹽類例如三聚磷酸鈉與三聚磷酸鉀。焦磷酸鹽以約 0.5 至約 2 重量%，較佳為約 1.5 至約 2 重量%之濃度併入本發明牙膏組成物中；聚磷酸鹽以約 1 至約 7 重量%之濃度併入本發明牙膏組成物中。於若干具體實例中，牙垢控制劑以約 0.01 至 10 重量%之濃度存在；於若干具體實例中，牙垢控制劑以約 1 重量%之濃度存在。於若干具體實例中，牙垢控制劑亦具緩衝劑之作用。舉例而言，於磷酸鹽緩衝系中，磷酸二氫鈉以約 0.01 至約 5 重量%之濃度存在，磷酸氫二鈉以約 0.01 至約 5 重量%之濃度存在，其精確比率視調配物中之其他賦形劑及所需 pH 而定。

【0031】 抗氧化劑為另一類視需要之添加劑；可使用口服可接受之任何抗氧化劑，包括丁羥基甲氧苯(BHA)、丁基羥基甲苯(BHT)、維生素 A、類胡蘿蔔素、維生素 E、類黃酮、多酚類、抗壞血酸、草本抗氧化劑、葉綠素、褪黑激素、及其混合物。

【0032】 視需要亦可包含用於例如改善口乾之唾液刺激劑；可使用口服可接受之任何唾液刺激劑，包括而不限於食物酸例如檸檬酸、乳酸、蘋果酸、琥珀酸、抗壞血酸、己二酸、反丁烯二酸、與酒石酸、及其混合物。一或多種唾液刺激劑視需要以唾液刺激有效總量存在。

【0033】 視需要，可包含抗牙菌斑(例如，牙斑瓦解)劑；可使用口服可接受之任何抗牙菌斑劑，包括而不限於亞錫、銅、鎂與鋇鹽、二甲基矽氧烷共聚醇類例如鯨蠟基二甲基矽氧烷共聚醇、木瓜酶、葡萄糖澱粉酶、葡萄糖氧化酶、尿素、乳酸鈣、甘油磷酸鈣、聚丙烯酸鋇類及其混合物。

【0034】 視需要之抗敏感劑包括檸檬酸鉀、氯化鉀、酒石酸鉀、碳酸氫

鉀、草酸鉀、硝酸鉀、鋁鹽、及其混合物。於若干具體實例中，可使用局部或全身性鎮痛劑例如阿司匹靈、可待因、乙醯胺酚、水楊酸鈉或三乙醇胺水楊酸鹽。

【0035】 於全文中，使用簡化形式之範圍敘述該範圍內之每一個值；可選定該範圍內之任何值作為該範圍之終點。此外，本文引用之所有參考文獻，其全部內容均併入本文以資參考。於本發明揭示內容與所引用參考文獻之界定衝突之情況下，由本發明揭示內容主控。

【0036】 除非另行指明，否則本文所示之所有百分比與量應被理解為係指重量百分比；所示量係根據該物質之活性重量。

【圖式簡單說明】

無

【實施方式】

實施例

實例 1 – 漱口水調配物

【0037】 表 1 (下文)敘述包含酸與過氧化氫之各種組合之漱口水調配物。

表 1				
	組成物 1	組成物 2	組成物 3	組成物 4
水	73.95	73.95	73.95	73.95
TSPP	0.45	0.45	0.45	0.45
TKPP	1.35	1.35	1.35	1.35
糖精鈉	0.025	0.025	0.025	0.025
蔗糖素	0	0	0	0.002
磷酸	1.00	0	0.80	0.80
檸檬酸	0	1.00	0.20	0.20

保濕劑	20	20	20	20
界面活性劑	1.00	1.00	1.00	1.00
過氧化氫	2.00	2.00	2.00	2.00
香料	0.22	0.22	0.22	0.22

實例 2 –專家感官評估

【0038】 由感官專家評估組成物 1 至 4 之調配物，針對酸味及苦後味各進行 1 至 5 之評分，1 分為完全不酸/苦及 5 分為極度酸/苦。任一參數為 4 或 5 分，或二參數均為 3 分者視為不可接受。

表 2

1	2% H ₂ O ₂ /TSPP/TKPP/磷酸/糖精	酸味(3)/苦後味(3)
2	2% H ₂ O ₂ /TSPP/TKPP/檸檬酸/糖精	酸味(4)/苦後味(3)
3	2% H ₂ O ₂ /TSPP/TKPP/檸檬酸/磷酸/糖精	酸味(2)/苦後味(3)
4	2% H ₂ O ₂ /TSPP/TKPP/磷酸/檸檬酸/糖精/ 蔗糖素	酸味(2)/苦後味(2)

【0039】 根據此研究，發現組成物 1 與 2 不可接受；組成物 4 由於酸味較少及具有較少之苦後味而較佳。

實例 3 –消費者試驗

【0040】 添加 1.5% Gantrez® (聚甲基乙基醚與順丁烯二酸酐之共聚物)進一步修飾組成物 4，於消費者試驗規程中測試有及無 Gantrez®之調配物。共計 120 位習慣性漱口水使用者參與該漱口水之單一家庭使用試驗。每一參與者經指導使用該產品 5 天。使用期結束時，參與者被要求針對該漱口水之整體喜好進行 1 至 9 之評分，1 分為“非常不喜歡”，9 分為“非常喜歡”。記述整體喜好評分為 7 至 9 的參與者之合計百分比。此試驗配方及結果列於下文表 3。

表 3

	組成物 4	組成物 5
水	73.95	72.45
TSPP	0.45	0.45



TKPP	1.35	1.35
Gantrez®	0	1.51
糖精鈉	0.025	0.025
蔗糖素	0.002	0.002
磷酸	0.8	0.8
檸檬酸	0.2	0.2
保濕劑	20	20
界面活性劑	1	1
過氧化氫	2	2
香料	0.22	0.22
消費者試驗結果(整體 喜好)	23.8%	29.5%

【0041】 發現組成物 5 較為適口且為消費者所喜好，顯示整體喜好增加 24% $(29.5 - 23.8)/(23.8) \times 100\%$ 。

【0042】 經如此詳細敘述本發明具體實例後，應理解的是，由上文諸段落界定之本發明不擬受上文說明中提出之特定細節所侷限，因在不偏離本發明精神或範圍下，其許多顯見之變化均屬可能。

【符號說明】

無

專利申請案第 103146439 號
ROC Patent Appln. No. 103146439
修正後無劃線之申請專利範圍中文本－附件(二)
Amended Claims in Chinese—Encl.(II)
(民國 104 年 11 月 26 日送呈)
(Submitted on November 26, 2015)

104 年 11 月 26 日

申請專利範圍

1. 一種漱口水，其包含美白牙齒有效量之美白劑，其中該美白劑為至少一種過氧化合物，視需要連同一或多種附加之美白劑，及第一種酸與第二種酸之組合物，其中第一種酸係選自由乙酸、抗壞血酸、苯甲酸、檸檬酸、對甲氧苯甲酸與丙酸組成之群組且第二種酸係選自由氯酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸與亞硫酸組成之群組，
其中該至少一種過氧化合物係選自由過氧化氫、鹼金屬與鹼土金屬之過氧化物、有機過氧化合物與過氧酸及其鹽所構成之群組。
2. 根據申請專利範圍第 1 項之漱口水，其中美白劑為過氧化氫且以 0.01 至 5%之量存在。
3. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之漱口水，其中第一種酸與第二種酸各以 0.6 至 2%之量存在。
4. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之漱口水，進一步包含抗牙垢有效量之選自二鹼或四鹼金屬焦磷酸鹽之一或多種焦磷酸鹽。
5. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之漱口水，進一步包含甜化量之糖精與蔗糖素的組合物。
6. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之漱口水，進一步包含薄荷醇與水楊酸甲酯的組合物。
7. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之漱口水，進一步包含抗微生物有效量之選自三氯沙與氯化十六烷基吡啶之抗細菌劑。
8. 根據申請專利範圍第 1 項之漱口水，其包含下述量之下述成分之一或多種

104 年 11 月 26 日

或全部：

聚磷酸鹽	1.1-3%
非醣類甜味劑	0.01-0.05%
醣類甜味劑	0.001-0.005%
多元醇(保濕劑)	7-45%
界面活性劑	0.5-2%
調味劑	0.2-2%。

9. 一種根據申請專利範圍第 1 至 8 項中任一項之漱口水的用途，係用於製造美白牙齒的藥劑。