

發明專利說明書

200410724

(本申請書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：92125207

※申請日期：92年09月12日

※IPC分類：A61K 9/16

壹、發明名稱：

(中) 包含滑石之潔牙組成物

(外) Dentifrice compositions comprising talc

貳、申請人：(共 1 人)

1. 姓名：(中) 寶鹼公司

(英) THE PROCTER & GAMBLE COMPANY

代表人：(中) 1. 史提芬 米勒

(英) 1. MILLER, STEVEN W.

地址：(中) 美國俄亥俄州辛辛那提寶鹼一號廣場

(英) One Procter & Gamble Plaza, Cincinnati, Ohio 45202, U.S.A.

國籍：(中英) 美國 U.S.A.

參、發明人：(共 5 人)

1. 姓名：(中) 楊理將

(英) YANG, LIJIANG

地址：(中) 中國北京昭陽區北園賈園京優原第十二大樓一八〇一號

(英) 1801, Building 12, Qingyou Yuan, Beiyuanjiayuan, Chaoyang District, Beijing, 100012, China

2. 姓名：(中) 余江

(英) YUE, JIANG

地址：(中) 中國北京尚易區龍別墅一二九號

(英) No. 129 Dragon Villas, Shunyi District, Beijing, 101300, China

3. 姓名：(中) 費顏賓

(英) FEI, YUNBIN

地址：(中) 中國北京昭陽區北園賈園京優原第三大樓一八〇七號

(英) 1807, Building 3, Qingyou Yuan, Beiyuanjiayuan, Chaoyang District, Beijing, 100012, China

4. 姓名：(中) 王晏
(英) WANG, YUN
地址：(中) 中國北京通胡區北園第十三大樓二五三號
(英) 253, Building 13, Beiyuan 135#, Tongzhou District, Beijing, 101100, China

5. 姓名：(中) 許修助
(英) XU, XIUJUN
地址：(中) 中國北京飛泰區飛關路三號院第十三大樓七〇二室
(英) Room 702, Building 13, Yard 3, Fengguan Road, Fengtai District, Beijing, 100071, China

肆、聲明事項：

◎本案申請前已向下列國家(地區)申請專利 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家(地區)；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 美國 ; 2002/09/12 ; 60/410,094 有主張優先權

4. 姓名：(中) 王晏
(英) WANG, YUN
地址：(中) 中國北京通胡區北園第十三大樓二五三號
(英) 253, Building 13, Beiyuan 135#, Tongzhou District, Beijing, 101100, China

5. 姓名：(中) 許修助
(英) XU, XIUJUN
地址：(中) 中國北京飛泰區飛關路三號院第十三大樓七〇二室
(英) Room 702, Building 13, Yard 3, Fengguan Road, Fengtai District, Beijing, 100071, China

肆、聲明事項：

◎本案申請前已向下列國家(地區)申請專利 主張國際優先權：

【格式請依：受理國家(地區)；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 美國 ; 2002/09/12 ; 60/410,094 有主張優先權

(2)

滑石業經與其他磨蝕劑例如鍛燒高嶺土，組合用於牙粉中作為磨蝕劑及配方流變性改質劑，可參看美國專利第 4,428,928 號。不過，在將滑石調配到多種含氟牙粉中之時，滑石會與氟化物反應，使可溶性氟離子的功效降低。因此，仍然需要提供包括滑石之含氟潔牙組成物，其中滑石與氟化物之間要有足夠的相容性使得在氟化物防蛀牙功效上沒有顯著的降低。

【發明內容】

本發明係有關一種潔牙組成物，其包括從約 1 重量%至約 50 重量%滑石；提供以重量計從約 1 ppm 至約 3000 ppm 氟離子之氟鹽；從約 5 重量%至約 50 重量%的磨蝕拋光物質；及從約 30 重量%至約 90 重量%的一或多種水性載體。該潔牙組成物於 25°C 下具有約 8 或以上之 pH 值。

發明說明

如本為中所用者，”包括”意為可添加不影響最終結果的其他步驟與其他成分。此詞涵蓋”由...組成”與”基本上由...組成”。

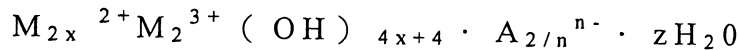
(a) 滑石

滑石，化學名為”含水矽酸鎂”，是本發明潔牙組成物的必需成分。任何種類之滑石（例如，天然滑石，合成滑

(3)

石或改質滑石) 都可用在本發明潔牙組成物之中。較佳之滑石是天然滑石，例如，USP 等級天然滑石，係價格低且可輕易取得者。

適合用於本發明之其他滑石包括，但不限於，經矽酮處理過之滑石，為 Miyoshi Kasei Inc., Saitama-city, Saitama, Japan 所提供者。可用於本發明中的其他滑石為高純度水滑石，其係層狀，混合陰離子之金屬氫氧化物，其通式為：



其中 M_{2x}^{2+} , M_2^{3+} 分別為二價與三價金屬，x 在 0.5 到 10 範圍內間隔 0.5，A 為填隙陰離子，係選自由氫氧離子與有機離子組成之群組中者，n 為該填隙陰離子之電荷，且 z 為 1 至 6 之整數。這種水滑石載於 1996 年 8 月 8 日公開之 PCT 專利公報 WO 96/23727 中，其經讓渡給 LVEDEA AG (對應於美國專利第 6,517,795; 6,514,473; 6,180,764 號；和美國公報第 20010001653A1)。

本發明潔牙組成物中的滑石含量為從約 1 重量%到約 50 重量%，較佳者，從約 5 重量%到約 25 重量%，且更佳者從約 5 重量%到約 15 重量%。

氟鹽

氟鹽也是本發明潔牙組成物的一種必需成分。氟鹽較佳地係由下列所組成之群組中選出：氟化鈉，氟化鋁，氟化亞錫，氟化鉀，氟化鋅，氟磷酸鈉及其混合物。更佳者

(4)

，氟鹽為氟化鈉。其他適合之氟鹽在 1978 年 8 月 22 日核發給 Muhler 等人的美國專利第 4,108,979 號中有敘述。

測量本發明組成物所含氟離子的方法為如下所述者（中國國家標準（China National Standard）：GB8372-2001）：製備本發明牙粉與水之均勻牙膏漿液，牙粉對水的重量比例為約 1：4，並將該漿液離心得到澄清的上澄液。將該上澄液與檸檬酸緩衝液徹底混合；對混合物施用已校準之氟離子選擇性電極（ISE）計，例如 Orion Fluoride-Specific Ion Combination Electrode（Orion Research, Inc., 500 Cummings Center, Beverly, MA, USA）測定而得氟離子濃度。於本發明中，氟鹽提供從約 1 ppm 到約 3000 ppm，較佳者從約 10 ppm 到約 1500 ppm 之氟離子。此外，本發明潔牙組成物的氟鹽含量也根據其產生氟離子之能力而選擇。離子產生能力係隨著所選氟離子的種類而變異。不過，如果用氟化鈉時，本發明潔牙組成物中氟化鈉鹽的較佳含量為從約 0.001 重量%到約 1 重量%，更佳者，從約 0.005 重量%到約 0.5 重量%。

(c) 磨蝕拋光物質

可用於本發明之磨蝕拋光物質可選自不過度磨損象牙質之任何物質。磨蝕拋光物質較佳地具有少於約 23 重量%之鈣含量。典型磨蝕拋光物質包括矽石包括凝膠與沈澱物；氧化鋁；磷酸鹽類，包括正磷酸鹽，多聚偏磷酸鹽與焦磷酸鹽；及彼等的混合物。可用於本發明的磨蝕拋光物

(5)

質之特定較佳例子包括矽石（下文會進一步說明），正磷酸二鈣二水合物，焦磷酸鈣，磷酸三鈣，多聚偏磷酸鈣，不溶性多聚偏磷酸鈉，水合氧化鋁， β -焦磷酸鈣，碳酸鈣，樹脂性磨蝕物質例如尿素與甲醛的粒狀縮合產物，磷酸二鈣，三水合氯化鋁，不溶性偏磷酸鈉），以及其他例如由 Cooley 等人於 1962 年 12 月 25 日核發的美國專利第 3,070,510 號中所揭示者。也可使用磨蝕劑的混合物。

矽石牙齒磨蝕劑為高度較佳者，因為彼等具有異常的牙齒清潔與拋光性能而不會不當磨損牙齒琺瑯或象牙質的獨特優點之故。在此所用矽石牙齒磨蝕拋光物質以及其他磨蝕劑之一般平均粒子大小為約 0.1 到約 30 微米之間，且較佳者為約 5 到約 15 微米。磨蝕劑可為沉澱矽石或矽石凝膠例如矽石乾凝膠，例如 1970 年五月 2 日核發給 Pader 等人的美國專利第 3,538,230 號和 1975 年一月 21 日核發給 DiGiulio 等人的美國專利第 3,862,307 號。較佳者為由 W.R. Grace & Company, Davison Chemical Division 以商品名 "Syloid" 銷售的矽石乾凝膠。也為較佳者為例如由 J. M. Huber Corporation 以商標品名 "eodent" 銷售的沉澱矽石物質，特別是名為 "Zeodent 119" 的矽石。在本發明潔牙組成物中之磨蝕劑一般其含量為組成物的從約 5 重量%到約 50 重量%，較佳者為口腔組成物的從約 7 重量%到約 30 重量%。

(d) 組成物之 pH 值

(6)

本發明潔牙組成物在 25° C 時之 pH 係約 8 或以上，較佳者從約 8 到約 10，更佳者從約 8.5 到約 9.5。於本發明中，在不欲受限於理論之下，威信因為具有中性或鹼性 pH 值，可為本發明潔牙組成物提供滑石與氟鹽之相容性。

以下為測量 pH 值的方法：製備本發明牙粉與水之均勻牙膏漿液，牙粉對水的重量比例為約 1：3，；對該漿液用已校準之電位測量儀器玻璃電極，例如，Orion Ross Sure-Flow combination VWR #34104-830 (Orion Research Inc., 500 Cummings Center, Beverly, MA, USA) 測量，而得到在 25° C 之 pH 值。

(e) 鉗合劑

威信加入鉗合劑可進一步改善滑石與氟化物之相容性。因此，在本發明組成物中加入鉗合劑雖然不是必要的但擁為適宜者。較佳鉗合劑係由下列所構成的群組中選出者：磷酸鹽，焦磷酸鹽，三聚磷酸鹽，檸檬酸鹽，碳酸鹽，酒石酸鹽，醋酸鹽，二醋酸鹽，植物酸，EDTA (乙二胺四乙酸二鈉)，EHDP (乙烷-1-羥基-1,1-二膦酸二鈉) 及彼等的混合物。更佳者為使用磷酸鹽，焦磷酸鹽，三聚磷酸鹽及其混合物。本發明潔牙組成物之鉗合劑添加量為從約 0.1% 到約 20%，較佳者，從約 0.5% 到約 10%。在製造時可將鉗合劑直接加入潔牙組成物中，或在加入潔牙組成物內之前先行將彼等與滑石混合。

(7)

(f) 含水載體

於製備本發明組成物之中，宜於在組成物中加入一種或多種含水載體。這些物質是技術中熟知的且容易為熟諳此藝者根據所要製備之組成物所欲之物理與美學性質而選定。含水載體典型地佔有口腔組成物的從約 30 重量%到 90 重量%，較佳者為從約 50 重量%到 85 重量%。

本發明組成物典型地包含某些增稠性物質或黏合劑以提供合宜的稠度。較佳增稠劑為羧基乙烯基聚合物，角叉菜膠，羥乙基纖維素，以及纖維素醚類的水溶性鹽例如羧甲基纖維素鈉鹽，和羥乙基纖維素鈉鹽。也可使用天然膠例如刺梧桐膠，黃原膠，亞拉伯膠，和黃蓍膠。膠狀矽酸鎂鋁或細分矽石可作為增稠劑之一部份以進一步改善質地。增稠劑之用量為潔牙組成物的從約 0.1 重量%到約 15 重量%。

本發明組成物之另一選用成分為保濕劑。保濕劑用來防止牙膏組成物因暴露於空氣中而硬化且某些保濕劑也可使牙膏組成物具有合宜的甜味。本發明所用合適濕潤劑包括：甘油，山梨醇，聚乙二醇，丙二醇，與其他可食用的多羥基醇。保濕劑通常佔有組成物的從約 0 重量%到約 70 重量%，且較佳者從約 5 重量%到約 50 重量%。

市售口腔組成物製備中所用的水較佳地應含低量離子與無有機雜質。潔牙組成物含水量為組成物的從約 5 重量%到約 70 重量%，較佳者約 20 重量%到 65 重量%。水量

(8)

包括加入之自由水以及與其他物質例如與山梨醇，矽石，界面活性劑溶液，及/或顏料溶液一起導入者。

本發明組成物也可能包括界面活性劑，也常稱為起泡劑 (sudsing agents)。合適的界面活性劑係合理穩定且在寬 pH 範圍會起泡者。界面活性劑可為陰離子，非離子，兩性的，兩性離子的，陽離子，或其混合物。可用於本發明中之陰離子界面活性劑包括水溶性烷基硫酸鹽 (烷基有 8 到 20 個碳原子，例如烷基硫酸鈉) 以及有 8 到 20 個碳原子的脂肪酸之磺酸化甘油單酯之水溶性鹽。月桂基硫酸鈉與椰子單甘油酯磺酸鈉為此類型的陰離子界面活性劑之例子。其他合適陰離子界面活性劑為肌胺酸鹽類 (sarcosinate) 例如月桂醯基肌胺酸鈉鹽，牛磺酸鈉，月桂基磺酸基乙酸鈉，月桂基環氧乙基醚羧酸鈉 (sodium laureth carboxylate)，以及十二烷基苯磺酸鈉。也可用陰離子界面活性劑之混合物。許多合適的陰離子界面活性劑係由 Agricola 等人揭示於 1976 年 5 月 25 日核發的美國專利第 3,959,458 號之中。可用於本發明組成物之非離子界面活性劑可概括定義為環氧烷基 (本質上為疏水性者) 與本質上為脂族或烷基-芳族的有機疏水性化合物縮合產生之化合物。合適的非離子界面活性劑之例子包括 poloxamer (市售商標為 Pluronic)，聚氧化乙烯，聚氧化乙烯山梨糖醇酐酯 (市售商標為 Tweens)，脂肪醇乙氧基化物，烷基酚之聚氧化乙烯濃縮物，環氧乙烷與環氧丙烷/乙二胺反應產物之縮合物所衍生的產物，脂肪族醇

(9)

之環氧乙烷的縮合物，長鏈第三胺氧化物，長鏈第三胺膦氧化物，長鏈二烷基亞碲，以及此等物質之混合物。用於本發明中之兩性界面活性劑可概括定義為脂族第二胺與第三胺的衍生物，其中脂族基可為直鏈或分枝者且其中諸脂族取代基之一包含從約 8 到約 18 個碳原子及其一含陰離子水增溶性基，例如，羧酸根，磺酸根，硫酸根，磷酸根或膦酸根。其他合適的兩性界面活性劑為甜菜鹼類，特別是可可醯胺基丙基甜菜鹼。也可用兩性界面活性劑之混合物。許多合適之非離子與兩性界面活性劑由 Gieske 等人揭示於 1977 年 9 月 27 日核發的美國專利第 4,051,234 號。本發明組成物典型地包括一或多種界面活性劑，每一種含量為組成物的從約 0.25 重量%到約 12 重量%，較佳者從約 0.5 重量%到約 8 重量%。

二氧化鈦也可加到本發明組成物中。二氧化鈦為一種白色粉末，其可增加組成物之不透明度。二氧化鈦一般佔有組成物的從約 0.25 重量%到 5 重量%。

著色劑也可加到本發明組成物中。著色劑可為水溶液的形式，較佳者為 1%之著色劑水溶液。顏色溶液一般佔有組成物的從約 0.01 重量%到 5 重量%。

香料系統也可加入組成物中。合適的香料成分包括，但不限於，冬青油，薄荷油，綠薄荷，乾丁香花苞油，薄荷腦，茴香腦，柳酸甲脂，桉油醇，桂皮，乙酸 1-薄荷酯，鼠尾草，丁香醇，荷蘭芹油，烷氧酮 (oxanone)，alpha-irisone，墨角蘭，檸檬，柳橙，propenyl guaethol

(10)

，肉桂，香草醛，乙基香草醛，天芥菜精，4-順-庚烯醇，雙乙醯基，甲基-對-第三丁基苯乙酸酯，及彼等的混合物。用在組成物中之香料系統含量一般為組成物的從約0.001重量%到約5重量%。

增甜劑可加到組成物中。此等包括糖精，葡萄糖，蔗糖，乳糖，麥芽糖，果糖，阿斯巴甜（aspartame），賽克拉美鈉（sodium cyclamate），D-色胺酸，二羥基查爾酮，acesulfame，及彼等的混合物。不同著色劑也可摻加到本發明中。增甜劑與著色劑在牙膏中之一般用量為組成物的從約0.005重量%到約5重量%。

本發明潔牙組成物因為滑石與氟化物有較好相容性而具改良之穩定性，因此提供預防蛀牙的功效。此外，本發明潔牙組成物具改良的流變性質且可將其製成比不含滑石的調配物具有較高的密度。此等較高密度之調配物可潛在地提供整體較低成本給消費者，而不包括潔牙功效之降低，特別是就氟鹽與磨蝕拋光物質而論。

【實施方式】

實施例 1 - 6

下面的潔牙組成物之實施例進一步說明與證實在本發明範圍內之具體實例。這些實施例係為示範說明目的而給出而不可視為對本發明之限制，因為可有其許多變異不遠離本發明旨意與範圍者。所有成分之含量皆為潔牙組成物的重量百分比。

(11)

成分	實施例1	實施例2	實施例3	實施例4	實施例5	實施例6
氟化鈉	0.20	0.31	0.31	0.31	0.31	0.31
滑石	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0	10.0
山梨醇溶液 (70%溶液)	45.0	30.0	30.0	30.0	10.0	10.0
沈澱矽石	15.0	20.0	15.0	20.0	10.0	10.0
硫酸烷基鈉 (27.9重量%溶液)	7.5	7.5	7.5	7.5	7.5	5.0
磷酸三鈉	1.8	2.0	1.0	1.0	1.7	1.7
羧甲基纖維素,鈉	1.0	0.6	0.6	0.6	1.5	1.5
Carbomer 956	0.3	0.2	0.2	0.2	0.4	0.4
糖精,鈉	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
二氧化鈦, 金紅石	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
香料	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9	0.9
多聚磷酸三鈉鹽	-	-	-	3.82	-	-
甜菜鹼30重量%溶液	-	-	-	-	2.0	2.0
處理過的水	17.8	27.99	33.99	25.17	55.19	57.69

(12)

以下為前述潔牙組成物實施例之製備。

將水與山梨醇於一製造容器內混合且連續攪拌直到完全分散。然後，將所有鹽與增稠劑在勻化器作用中加到容器內。接下來，將滑石與其他磨蝕劑（例如矽石）加到容器內並在真空中混合。最後，將烷基硫酸鈉與香料加到容器內且混合直到完全分散。

潔牙組成物之氟離子濃度與 pH 值可測定如下。稱 20.000 克實施例 1 之潔牙組成物並置入一約 50 毫升容量有緊密蓋子的塑膠平底容器中。以水稀釋該組成物到 100 毫升並徹底混合而得一勻質漿液。將混合物 2000 rpm 離心 30 分鐘獲得一清澈的上澄液。將 10 毫升上澄液與 5 毫升檸檬酸鹽緩衝液（含 100 克檸檬酸鹽，60 毫升醋酸，60 克氯化鈉，30 克氫氧化鈉且用水稀釋到 1000 毫升，pH 值調整為 5.0-5.5）混合，再用 Orion Fluoride-Specific Ion Combination Electrode (Cat. #9609N, Orion Research, Inc., 500 Cummings Center, Beverly, MA, USA) 測量混合物而得氟離子濃度。該氟離子濃度為約 30.5 ppm。

稱 3.998~4.002 克實施例 1 之潔牙組成物並置入一玻璃燒杯中且加入 11.998~12.002 克去離子水。然後，將混合物用攪拌棒徹底攪拌製成勻質漿液。此漿液用已校準之 Orion Combination Electrode (VWR #34104-830, Orion Research Inc., 500 Cummings Center, Beverly, MA, USA) 測其在 25°C 之 pH 值。所得之 pH 值為約 7.66 到約 10.61。

伍、中文發明摘要

發明之名稱：包含滑石之潔牙組成物

本發明係有關一種潔牙組成物，其包括從約 1 重量%至約 50 重量%滑石；提供以重量計從約 1 ppm 至約 3000 ppm 氟離子之氟鹽；從約 5 重量%至約 50 重量%的磨蝕拋光物質；及從約 30 重量%至約 90 重量%的一或多種水性載體。該潔牙組成物於 25°C 下具有約 8 或以上之 pH 值。

陸、英文發明摘要

發明之名稱：

DENTIFRICE COMPOSITIONS COMPRISING TALC

The present invention is directed to a dentifrice composition comprising from about 1% to about 50% by weight of talc; a fluoride salt that provides from about 1ppm to about 3000ppm by weight of a fluoride ion; from about 5% to about 50% by weight of an abrasive polishing material; and from about 30% to about 90% of one or more aqueous carriers. The dentifrice composition has a pH of about 8 or above at 25°C.

(1)

拾、申請專利範圍

1. 一種潔牙組成物，其包括：

(1) 一從約 1 重量%至約 50 重量%的滑石；

(2) 一提供以重量計從約 1 ppm 至約 3000 ppm 氟離子的氟鹽；

(3) 一從約 5 重量%至約 50 重量%的磨蝕拋光物質；及

(4) 一從約 30 重量%至約 90 重量%的一或多種水性載體；

其中該潔牙組成物於 25° C 下具約 8 或以上之 pH 值。

2. 如申請專利範圍第 1 項之潔牙組成物，其中該滑石係群自天然滑石，合成滑石，改質滑石，高純度水滑石，及彼等的混合物。

3. 如申請專利範圍第 2 項之潔牙組成物，其中該滑石為天然滑石。

4. 如申請專利範圍第 1 項之潔牙組成物，其進一步包括從約 0.1 重量%至約 20 重量%之鉗合劑。

5. 如申請專利範圍第 4 項之潔牙組成物，其中該鉗合劑係群自磷酸鹽，焦磷酸鹽，三聚磷酸鹽，檸檬酸鹽，碳酸鹽，酒石酸鹽，醋酸鹽，二醋酸鹽，植物酸，EDTA，EHDP 及彼等的混合物。

6. 如申請專利範圍第 1 項之潔牙組成物，其中該氟鹽係選自氟化鈉，氟化鋁，氟化亞錫，氟化鉀，氟化鋅，

(2)

氟磷酸鈉，及彼等的混合物。

7. 如申請專利範圍第 6 項之潔牙組成物，其中該氟鹽為氟化鈉。

8. 如申請專利範圍第 1 項之潔牙組成物，其中該水性載體係選自增稠劑，保濕劑，水，界面活性劑，二氧化鈦，著色劑，香料系統，增甜劑，及彼等的混合物。

9. 如申請專利範圍第 1 項之潔牙組成物，其中該磨蝕拋光物質為矽石磨蝕劑。

柒、指定代表圖：

(一) 本案指定代表圖為：第 圖

(二) 本代表圖之元件代表符號簡單說明：

無

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

無