

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3846537号
(P3846537)

(45) 発行日 平成18年11月15日(2006.11.15)

(24) 登録日 平成18年9月1日(2006.9.1)

(51) Int. Cl.

F I

A 6 1 K 31/045 (2006.01)

A 6 1 K 31/045

A 6 1 K 31/125 (2006.01)

A 6 1 K 31/125

A 6 1 K 31/717 (2006.01)

A 6 1 K 31/717

A 6 1 K 31/737 (2006.01)

A 6 1 K 31/737

A 6 1 K 31/77 (2006.01)

A 6 1 K 31/77

請求項の数 3 (全 7 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平11-377144
 (22) 出願日 平成11年12月28日(1999.12.28)
 (65) 公開番号 特開2001-187733(P2001-187733A)
 (43) 公開日 平成13年7月10日(2001.7.10)
 審査請求日 平成17年6月16日(2005.6.16)

早期審査対象出願

(73) 特許権者 000006769
 ライオン株式会社
 東京都墨田区本所1丁目3番7号
 (74) 代理人 100079304
 弁理士 小島 隆司
 (74) 代理人 100114513
 弁理士 重松 沙織
 (74) 代理人 100120721
 弁理士 小林 克成
 (74) 代理人 100124590
 弁理士 石川 武史
 (72) 発明者 田淵 照人
 東京都墨田区本所1丁目3番7号 ライオン株式会社内

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 コンタクトレンズ用装着液

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

(A) 重量平均分子量10000～300000であるポリビニルアルコール及び/又はポリビニルピロリドン

(B) 重量平均分子量10000～1000000であるヒドロキシプロピルメチルセルロース

(C) コンドロイチン硫酸及び/又はその塩

(D) モノテルペノイド化合物及び/又はセスキテルペノイド化合物0.001～0.05g/100ml

を含有し、35における粘度(E型粘度計による測定値)が1～30mPa・sであることを特徴とするコンタクトレンズ用装着液。 10

【請求項2】

コンタクトレンズが、ハードコンタクトレンズ、酸素透過性ハードコンタクトレンズ、又はソフトコンタクトレンズである請求項1記載のコンタクトレンズ用装着液。

【請求項3】

ソフトコンタクトレンズ用である請求項1記載のコンタクトレンズ用装着液。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、コンタクトレンズ装用者に適用されるコンタクトレンズ用装着液に関する。 20

【 0 0 0 2 】

【従来の技術】

コンタクトレンズの装用は、異物を眼に挿入するという観点から、装着時または装用時に異物感を感じる等、様々な問題がある。これらの問題を解決するために、様々なコンタクトレンズ用点眼剤（点眼液、装着液等）が開発されている。その中で、高分子化合物を配合して組成物の粘度を上げ、装着感、装用感を改善する点眼剤が知られているが、高分子化合物特有のべたつきを生じるため、使用感は満足できるものではなかった。したがって、装着時、装用時の使用感が優れたコンタクトレンズ用装着液の開発が望まれていた。

【 0 0 0 3 】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は、装着時、装用時のべたつきが抑制され、使用感に優れたコンタクトレンズ用装着液を提供するものである。本発明は、さらに、コンタクトレンズ用装着液に適した、べたつきが抑制された増粘技術を提供するものである。

【 0 0 0 4 】

【課題を解決するための手段及び発明の実施の形態】

本発明者らは、上記課題を解決するために鋭意検討を行った結果、（ A ）重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 3 0 0 0 0 0 であるポリビニルアルコール及び / 又はポリビニルピロリドン、（ B ）重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 1 0 0 0 0 0 0 であるヒドロキシプロピルメチルセルロース、（ C ）コンドロイチン硫酸及び / 又はその塩、及び（ D ）モノテルペノイド化合物及び / 又はセスキテルペノイド化合物 0 . 0 0 1 ~ 0 . 0 5 g / 1 0 0 m l を配合することにより、高分子化合物特有のべたつきが抑制された水性液が得られることを知見した。さらに、高分子水溶液にコンドロイチン硫酸及び / 又はその塩を添加することにより粘度が増し、しかもべたつきが低減されることを見出し、本発明を完成するに至った。

【 0 0 0 5 】

即ち、本発明は、（ A ）重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 3 0 0 0 0 0 であるポリビニルアルコール及び / 又はポリビニルピロリドン、（ B ）重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 1 0 0 0 0 0 0 であるヒドロキシプロピルメチルセルロース、（ C ）コンドロイチン硫酸及び / 又はその塩、及び（ D ）モノテルペノイド化合物及び / 又はセスキテルペノイド化合物 0 . 0 0 1 ~ 0 . 0 5 g / 1 0 0 m l を含有し、35 における粘度（ E 型粘度計による測定値）が 1 ~ 3 0 m P a ・ s であるコンタクトレンズ用装着液を提供する。また、高分子化合物並びにコンドロイチン硫酸及び / 又はその塩を増粘剤として含有することを特徴とするコンタクトレンズ用装着液を提供する。以下、本発明を詳細に説明する。

【 0 0 0 6 】

本発明のコンタクトレンズ用装着液に用いられる高分子化合物としては、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、ポリビニルメチルエーテル等のポリビニル系高分子化合物；メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシエチルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロース、カルボキシメチルセルロース等のセルロース系高分子化合物；ブドウ糖；ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール等のポリアルキレングリコール等があげられる。好ましくはポリビニル系高分子化合物とセルロース系高分子化合物であり、特に好ましくは、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースである。

【 0 0 0 7 】

上記高分子化合物の好ましい分子量は、重量平均分子量 5 0 0 0 ~ 2 0 0 0 0 0 0 である。さらに好ましくは、ポリビニル系高分子化合物の場合、重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 3 0 0 0 0 0 、特に好ましくは 2 0 0 0 0 ~ 1 5 0 0 0 0 である。セルロース系高分子化合物の場合は、重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 1 0 0 0 0 0 0 が好ましい。

【 0 0 0 8 】

本発明の組成物には、上記高分子化合物を 1 種または 2 種以上を用いられるが、2 種以

10

20

30

40

50

上とすると、使用感がよくなるため、好ましい。好ましくは、ポリビニル系高分子化合物とセルロース系高分子化合物を組み合わせる。

本発明のコンタクトレンズ用装着液には、(A)重量平均分子量10000~300000であるポリビニルアルコール及び/又はポリビニルピロリドン、(B)重量平均分子量10000~1000000であるヒドロキシプロピルメチルセルロースを組み合わせる。

【0009】

本発明のコンタクトレンズ用装着液における高分子化合物の含有量は、好ましくは0.01~10g/100ml、特に好ましくは0.05~5g/100ml、さらに好ましくは0.1~4g/100mlである。この範囲で、特に良好な使用感と溶液の安定性が得られる。

10

【0010】

本発明のコンタクトレンズ用装着液は、(C)コンドロイチン硫酸及び/又はその塩を含有する。

本発明に用いられる任意のアミノ酸類としては、グリシン、リシン、アスパラギン酸、グルタミン酸、アミノエチルスルホン酸があげられる。これらは、1種を使用しても良いし、2種以上の組み合わせとしても良い。

【0011】

本発明のコンタクトレンズ用装着液におけるコンドロイチン硫酸及び/又はその塩の含有量は、好ましくは0.005~10g/100ml、特に好ましくは0.001~5g/ml、さらに好ましくは0.05~3g/100mlである。この範囲で、特に良好な使用感や増粘効果が得られ、しかも眼への刺激がない優れた組成物が得られる。

20

【0012】

本発明のコンタクトレンズ用装着液の粘度は、35における粘度が1~30mPa・s、好ましくは1~20mPa・sである。この範囲で、特に良好なコンタクトレンズ装着感を得られる。また、装着液の場合は装着作業性等の点から1~20mPa・sが好ましい。組成物の粘度は、高分子化合物とコンドロイチン硫酸及び/又はその塩の量により、調整することができる。なお、本発明の組成物の粘度は、E型粘度計で測定することができる。

【0013】

本発明のコンタクトレンズ用装着液において、コンドロイチン硫酸及び/又はその塩は、使用感の向上(べたつき抑制)の他に、高分子化合物を含有する水性液に対する増粘剤としての効果を有する。したがって、本発明によれば、所定の粘度を得るための高分子化合物量を低減させることが可能である。高分子化合物に対するコンドロイチン硫酸及び/又はその塩の増粘効果は知られておらず、この知見を応用したコンタクトレンズ用装着液は新規のものである。

30

【0014】

本発明のコンタクトレンズ用装着液には、さらに使用感を向上させるために、モノテルペノイド化合物、セスキテルペノイド化合物、及びそれらの誘導体(以下テルペノイド類)から選ばれる1種または2種以上を含有することが好ましい。モノテルペノイド化合物としては、メントール、カンフル、ボルネオール、ゲラニオール、シネオール、リモネン、オイゲノール等があげられる。セスキテルペノイド化合物としては、ファルネソール、ネロリドール等があげられる。誘導体としては、前記テルペノイド化合物のアルキルまたはアルケニルエステルやエーテルをあげることができる。

40

【0015】

前記テルペノイド類は、1種または2種以上の混合物として含有することができる。これらは、精製された成分を配合しても良いし、前記テルペノイド類を含有する植物精油を配合しても良い。植物精油としては、ローズマリー油、ラベンダー油、ペパーミント油、スペアミント油、ユーカリ油、ベルガモット油、ハッカ油、ウイキョウ油等があげられる。

50

【 0 0 1 6 】

本発明のコンタクトレンズ用装着液に含有される前記テルペノイド類の量は、好ましくは 0 . 0 0 0 1 ~ 0 . 5 g / 1 0 0 m l、特に好ましくは 0 . 0 0 0 5 ~ 0 . 2 g / 1 0 0 m l、さらに好ましくは 0 . 0 0 1 ~ 0 . 0 5 g / 1 0 0 m l である。好ましくは 0 . 0 0 1 ~ 0 . 0 5 g / 1 0 0 m l である。本発明のコンタクトレンズ用装着液は、(D) モノテルペノイド化合物及び / 又はセスキテルペノイド化合物 0 . 0 0 1 ~ 0 . 0 5 g / 1 0 0 m l を含有する。

【 0 0 1 7 】

さらに、本発明のコンタクトレンズ用装着液は、各種有効成分を含有することができる。有効成分としては、例えばグリチルレチン酸二カリウム、イプシロンアミノカプロン酸、アラントイン、塩化ベルベリン、アズレンスルホン酸ナトリウム、硫酸亜鉛、塩化リゾチーム等の抗炎症剤、ビタミン B 2、ビタミン B 6、ビタミン B 1 2、ビタミン E アセテート、パンテノール、パントテン酸カルシウム、パントテン酸ナトリウム、ビタミン A パルミテート等のビタミン類、塩酸ジフエンヒドラミン、マレイン酸クロルフェニラミン等の抗ヒスタミン剤、塩酸エピネフリン、塩酸ナファゾリン、塩酸テトラヒドロゾリン等の充血除去成分、メチル硫酸ネオスチグミン等その他の有効成分があげられる。

10

【 0 0 1 8 】

さらに、通常の眼科組成物に含有される各種添加剤として、例えば防腐剤、等張化剤、緩衝剤、安定化剤、香料等を、本発明の効果を損ねない範囲で添加することができる。

【 0 0 1 9 】

防腐剤としては、塩化ベンザルコニウム、グルコン酸クロルヘキシジン、ソルビン酸、クロロブタノール、パラオキシ安息香酸エステル等があげられる。

20

【 0 0 2 0 】

等張化剤としては、塩化カリウム、塩化ナトリウム、塩化カルシウム、硫酸マグネシウム、プロピレングリコール、グリセリン等があげられる。

【 0 0 2 1 】

緩衝剤としては、クエン酸、ホウ酸、リン酸、リン酸水素ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、氷酢酸等があげられる。

【 0 0 2 2 】

安定化剤としては、エデト酸ナトリウム、ポリオキシエチレン (2 0) ソルビタンモノオレート、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油等があげられる。

30

【 0 0 2 3 】

本発明におけるコンタクトレンズ用装着液の製造は、特に制限されるものではなく、各成分を滅菌精製水、イオン交換水等の水や水とエタノール等の低級アルコールとの混合溶媒等に溶解させた後、pH 調整剤 (pH 5 ~ 8 が好ましい)、等張化剤 (浸透圧比 0 . 8 ~ 2 が好ましい) により適宜調整して得ることができる。

【 0 0 2 4 】

【 発明の効果 】

本発明によれば、(A) 重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 3 0 0 0 0 0 であるポリビニルアルコール及び / 又はポリビニルピロリドン、(B) 重量平均分子量 1 0 0 0 0 ~ 1 0 0 0 0 0 であるヒドロキシプロピルメチルセルロース、(C) コンドロイチン硫酸及び / 又はその塩、及び (D) モノテルペノイド化合物及び / 又はセスキテルペノイド化合物 0 . 0 0 1 ~ 0 . 0 5 g / 1 0 0 m l を配合することにより、べたつきがなく適度な粘度を有する、使用感に優れたコンタクトレンズ用装着液が得られる。

40

【 0 0 2 5 】

【 実施例 】

次に、本発明を実施例によりさらに詳細に説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。

【 0 0 2 6 】

(参考例 1 ~ 3)

50

表 1 に示すコンタクトレンズ用眼科組成物を調製し、35 における粘度を E 型粘度計（東京計器株式会社製）を用いて測定し、結果を表 1 に示した。

【0027】

【表 1】

参考例	1		2		3	
	a	b	a	b	a	b
アスパラギン酸K						1
コンドロイチン硫酸Na		0.1		2		0.5
ポリビニルアルコール	0.4	0.4	1	1		
ポリビニルピロリドン	2	2				
メチルセルロース					0.01	0.01
ヒドロキシエチルセルロース			1	1		
滅菌精製水	残部					
粘度(mPa・s)	2.3	3.2	8.2	13.4	0.9	2.7

10

ポリビニルアルコール:コーセーノールEG-05(日本合成化学工業(株)製;分子量30000)

ポリビニルピロリドン:コリト[®]K-25(BASF Japan(株)製;分子量30000)

メチルセルロース:メトロース[®] SM15(信越化学工業(株)製;分子量70000)

ヒドロキシプロピルメチルセルロース:メトロース[®] 65SH50(信越化学工業(株)製;分子量100000)

ヒドロキシエチルセルロース:フジゲルCF-G(住友精化(株)製;分子量320000)

【0028】

20

参考例 1 ~ 3 の各組成において、ポリビニルアルコールとしてコーセーノールEG-25、コーセーノールEG-40(日本合成化学工業(株)製);ポリビニルピロリドンとしてコリト[®]ンK-15、コリト[®]ンK-60(BASF Japan(株)製);メチルセルロースとしてメトロース[®] SM25、メトロース[®] SM4000(信越化学工業(株)製);ヒドロキシプロピルメチルセルロースとしてメトロース[®] 65SH1500、65SH4000(信越化学工業(株)製)を用いて、同様に粘度を測定した結果、いずれもコンドロイチン硫酸ナトリウムによる増粘が確認された。

【0029】

(実施例 1, 2, 比較例 1)

表 2 ~ 4 に記載した組成のコンタクトレンズ用装着液を調製し、35 における粘度と使用感を評価した。なお、表 2 ~ 4 の高分子化合物は、各々表 1 で用いた高分子化合物と同じものを使用した。

30

【0030】

<使用感の評価>

装着液;被検者 9 名に、表 2 ~ 4 の装着液を使用してコンタクトレンズ(ハードコンタクトレンズ 3 名、酸素透過性ハードコンタクトレンズ 3 名、ソフトコンタクトレンズ 3 名)を装着させ、装着時および装着後の使用感評価を行った。装着感の評価を以下の基準で行った。

- 5:べたつきがなく、非常に使用感が良い
- 4:べたつきがほとんどなく、使用感が良い
- 3:べたつきがややあり、使用感はやや悪い
- 2:べたつきがあり、使用感が悪い
- 1:べたつきがひどく、非常に使用感が悪い

40

5段階評価の平均点が4以上を、3以上4未満を、2以上3未満を、2未満を×とした。

【0031】

【表 2】

(コンタクトレンズ装着液)	実施例
	1
アミノエチルスルホン酸	0.05
コンドロイチン硫酸Na	2
ポリビニルピロリドン	2.5
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	0.05
塩化ナトリウム	0.7
α -シクロデキストリン	0.1
ホウ酸	1.5
ホウ砂	0.05
エデト酸ナトリウム	0.05
塩化ベンザルコニウム(10%)	0.05
グリセリン	0.1
l-メントール	0.003
dl-カンフル	0.003
滅菌精製水	残部
使用感	◎
粘度(mPa・s)	12.3

10

【 0 0 3 2 】

【 表 3 】

	比較例
	1
ポリビニルアルコール	2
メチルセルロース	0.1
塩化ナトリウム	0.3
α -シクロデキストリン	0.5
エデト酸ナトリウム	0.01
塩化ベンザルコニウム(10%)	0.1
プロピレングリコール	0.1
l-メントール	0.003
dl-カンフル	0.003
滅菌精製水	残部
使用感	△
粘度(mPa・s)	2.2

20

30

【 0 0 3 3 】

【 表 4 】

(コンタクトレンズ装着液)	実施例
	2
アミノエチルスルホン酸	0.05
コンドロイチン硫酸Na	2
ポリビニルピロリドン	2.5
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	2
ヒドロキシエチルセルロース	0.05
塩化ナトリウム	0.7
α -シクロデキストリン	0.1
エデト酸ナトリウム	0.05
塩化ベンザルコニウム(10%)	0.05
プロピレングリコール	0.1
l-メントール	0.003
dl-カンフル	0.003
滅菌精製水	残部
装着感	◎
粘度(mPa・s)	16.2

40

フロントページの続き

(51) Int.Cl. F I
A 6 1 K 31/79 (2006.01) A 6 1 K 31/79
A 6 1 P 27/02 (2006.01) A 6 1 P 27/02

(72)発明者 有村 秋子
東京都墨田区本所1丁目3番7号 ライオン株式会社内

審査官 大宅 郁治

(56)参考文献 特開平11-292793(JP, A)
米国特許第05591426(US, A)
仏国特許出願公開第02697753(FR, A1)
特公昭48-37910(JP, B1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A61K 31/00-80

A61K 47/00-48

G02C 13/00