

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成17年10月20日(2005.10.20)

【公開番号】特開2001-187731(P2001-187731A)

【公開日】平成13年7月10日(2001.7.10)

【出願番号】特願平11-377145

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/19

A 6 1 P 27/04

【F I】

A 6 1 K 31/19

A 6 1 P 27/04

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月16日(2005.6.16)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【書類名】 明細書

【発明の名称】 ソフトコンタクトレンズ用装着液組成物

【特許請求の範囲】

【請求項1】 (A) 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) ヒドロキシプロピルメチルセルロース

(C) ソルビン酸及び/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

を含有することを特徴とするソフトコンタクトレンズ用装着液組成物。

【請求項2】 (D) 成分の含有量が0.001~0.05g/100mlである請求項1記載のソフトコンタクトレンズ用装着液組成物。

【請求項3】 (A) 成分の重量平均分子量が10000~300000であり、(B) 成分の重量平均分子量が10000~100000である請求項1又は2記載のソフトコンタクトレンズ用装着液組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、ソフトコンタクトレンズ用装着液に関する。

【0002】

【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、コンタクトレンズ用装着液が開発されている。例えば、セルロース系高分子化合物、ポリビニル系高分子化合物等の高分子化合物を含有したコンタクトレンズ用装着液が知られている。しかし、これら従来のコンタクトレンズ用装着液は、ソフトコンタクトレンズへの防腐剤等の吸着が懸念されることから、ハードコンタクトレンズへの使用に限られていた。また、前記装着液をソフトコンタクトレンズ装着液として使用すると、べたつき感など、装着時の使用感が劣るという問題があった。したがって、装着時、装用時の使用感が優れたソフトコンタクトレンズ用の装着液の開発が望まれていた。

【0003】

**【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、使用感に優れたソフトコンタクトレンズ用装着液組成物を提供するものである。

**【0004】****【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銳意検討を行った結果、(A) 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) ヒドロキシプロピルメチルセルロース、(C) ソルビン酸及び/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見出し、本発明を完成するに至った。

**【0005】**

即ち、本発明は、(A) 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) ヒドロキシプロピルメチルセルロース  
(C) ソルビン酸及び/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  
を含有するソフトコンタクトレンズ用装着液組成物を提供する。以下、本発明を詳細に説明する。

**【0006】**

本発明のコンタクトレンズ用眼科組成物における第一の必須成分は、高分子化合物である。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。

**【0007】**

上記高分子化合物の好ましい分子量は、重量平均分子量 5000 ~ 2000000 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 10000 ~ 300000、特に好ましくは 20000 ~ 150000 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 10000 ~ 1000000 が好ましい。

**【0008】**

本発明のソフトコンタクトレンズ用装着液組成物における高分子化合物の含有量は、好ましくは 0.2 ~ 10 g / 100 ml、特に好ましくは 0.3 ~ 5 g / 100 ml、さらに好ましくは 0.5 ~ 4 g / 100 ml である。この範囲で、ソフトコンタクトレンズ装着時に適当な溶液粘度とレンズへの濡れ性が得られるため、装着性が特に良好である。

**【0009】**

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。本発明は、(A) ポリビニルアルコール及び/又はポリビニルピロリドンと、(B) ヒドロキシプロピルメチルセルロースとを含有する。好ましい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の含有比(質量比)は、ポリビニル系高分子化合物 / セルロース系高分子化合物 = 99 / 1 ~ 10 / 90、特に好ましくは 90 / 10 ~ 20 / 80 である。

**【0010】**

本発明のソフトコンタクトレンズ用装着液における第二の必須成分は、(C) ソルビン酸及び/又はその塩である。ソルビン酸塩としては、カリウム塩、ナトリウム塩等のアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩等のアルカリ土類金属塩、有機アミン塩等が

あげられる。好ましくは、アルカリ金属塩である。これらは、1種で用いても良いし、2種以上を組み合わせて用いても良い。

#### 【0011】

本発明の組成物中に含有されるソルビン酸及び/又はその塩の量は、好ましくは0.05~0.5g/100ml、特に好ましくは0.01~0.3g/100ml、最も好ましくは0.05~0.2g/100mlである。この範囲で、べたつきが抑制された良好な使用感が得られ、しかもソフトコンタクトレンズへの吸着や眼刺激がない良好な装着液が得られる。

#### 【0012】

本発明のコンタクトレンズ用眼科組成物の粘度は、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の使用感が得られる。

#### 【0013】

本発明のコンタクトレンズ用眼科組成物には、さらに良好な装用感を持続させる目的で、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く、本発明は(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を含有する。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。

#### 【0014】

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。

#### 【0015】

本発明の組成物に含有される前記テルペノイド類の量は、好ましくは0.0001~0.5g/100ml、特に好ましくは0.0005~0.2g/100ml、さらに好ましくは0.001~0.05g/100mlである。

#### 【0016】

さらに、本発明のコンタクトレンズ用眼科組成物は、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B2、ビタミンB6、ビタミンB12、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、L-アスパラギン酸カリウム、アミノエチルスルホン酸、コンドロイチン硫酸ナトリウム等のアミノ酸、塩酸ジフェンヒドラミン、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。

#### 【0017】

その他、通常の眼科組成物に含有される添加剤として、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。

#### 【0018】

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。

#### 【0019】

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。

#### 【0020】

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(20)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。

#### 【0021】

本発明におけるコンタクトレンズ用眼科組成物の製造は、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(pH5~8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。

#### 【0022】

#### 【発明の効果】

本発明によれば、(A)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)ヒドロキシプロピルメチルセルロース、(C)ソルビン酸及び/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を配合することにより、べたつきがなく使用感に優れたソフトコンタクトレンズ用装着液が得られる。

#### 【0023】

#### 【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。

#### 【0024】

表1~3に示すソフトコンタクトレンズ用装着液組成物を調製し、各々10名のパネラーにより下記の基準でソフトコンタクトレンズ装着液の使用感の評価を行った。結果を表1~3に示した。

#### <べたつき感>

- 5: べたつきがない
- 4: べたつきがほとんどない
- 3: べたつきがややある
- 2: べたつきがある
- 1: 非常にべたつきがある

#### <装着感: 装着作業時及び直後の異物感>

- 5: 非常に装着感が良い
- 4: 装着感が良い
- 3: 装着感はどちらともいえない
- 2: 装着感が悪い
- 1: 装着感が悪い

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。

#### 【0025】

#### 【表1】

	参考例	
	1	
	a	b
ソルビン酸カリウム		0.1
ポリビニルアルコール <sup>*1</sup>	2	2
ヒドロキシプロピルメチルセルロース <sup>*4</sup>	0.5	0.5
滅菌精製水	残部	
べたつき	×	◎
装着感	○	○

ポリビニルアルコール<sup>\*1</sup>:コーセノール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<sup>\*2</sup>:コリドンK-25(BASF Japan株製;分子量30000)

ヒドロキシプロピルメチルセルロース<sup>\*4</sup>:メトロース<sup>®</sup> 65SH50(信越化学工業株製;分子量100000)

#### 【0026】

参考例1a, bの各組成において、ポリビニルアルコールとしてコ<sup>®</sup> -セノールEG-25、コ<sup>®</sup> -セノールEG-40(日本合成化学工業(株)製);ヒト<sup>®</sup> ロキシフ<sup>®</sup> ロヒ<sup>®</sup> ルメチルセルロースとしてメトロース<sup>®</sup> 65SH1500、65SH4000(信越化学工業(株)製)を用いて組成物を調製し評価した結果、いずれもソルビン酸カリウムによるべたつき感の抑制が確認された。また、組成物中のソルビン酸(塩)のソフトコンタクトレンズへの吸着はなく、ソフトコンタクトレンズへの使用に対して問題は認められなかった。

#### 【0027】

(参考例2~4、実施例1, 2)

表2~3に記載した組成のソフトコンタクトレンズ用装着液を調製し、参考例1と同様に使用感を評価した。

#### 【0028】

#### 【表2】

	参考例	参考例	参考例
	2	3	4
ソルビン酸カリウム	0.2	0.2	0.1
ポリビニルアルコール <sup>*1</sup>			2
ポリビニルピロリドン <sup>*2</sup>	0.1	0.4	
ヒドロキシプロピルメチルセルロース <sup>*4</sup>			0.5
滅菌精製水	残部	残部	残部
べたつき	◎	◎	◎
装着感	△	○	○

#### 【0029】

#### 【表3】

	実施例	
	1	2
ソルビン酸カリウム	0.1	0.1
ポリビニルアルコール <sup>*1</sup>	2	
ポリビニルビロリドン <sup>*2</sup>		3
ヒドロキシプロピルメチルセルロース <sup>*4</sup>	0.25	1
塩化ナトリウム	0.5	0.7
アスパラギン酸		0.25
コンドロイチン硫酸	0.5	0.25
エデト酸ナトリウム	0.01	0.05
プロピレングリコール	0.1	
グリセリン		0.1
メントール	0.003	0.003
カンフル	0.003	0.003
滅菌精製水	残部	残部
べたつき	◎	◎
装着感	◎	◎

実施例1, 2は、装着直後のみならず、装用中も異物感抑制が持続し、良好な使用感が認められた。また、実施例の組成物中のソルビン酸（塩）のソフトコンタクトレンズへの吸着はなく、ソフトコンタクトレンズへの使用に対して問題は認められなかった。