

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：97115866

※申請日期：97. 4. 30

※IPC 分類：

A61L12/14 (2006.01)

A61K33/02 (2006.01)

A61K31/185 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

N-鹵化胺基酸調配物及用於清潔及消毒的方法

N-HALOGENATED AMINO ACID FORMULATIONS AND METHODS FOR CLEANING AND
DISINFECTION

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

愛爾康研究有限公司 / ALCON RESEARCH, LTD.

代表人：(中文/英文)

小巴斯特拉納 雅曼多 / PASTRANA, JR., ARMANDO

住居所或營業所地址：(中文/英文)

美國德州福特渥斯·南自由道 6201 號

6201 South Freeway, Fort Worth, TX 76134, U.S.A.

國 籍：(中文/英文)

美國 / U.S.A.

三、發明人：(共 5 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 邱漢 瑪蘇德 A. / CHOWHAN, MASOOD A.

2. 韓維新 / HAN, WESLEY WEHSIN

3. 史朵曼 大衛 W. / STROMAN, DAVID W.

4. 史全艾德 L. 維尼 / SCHNEIDER, L. WAYNE

5. 達沙納亞克 尼聖克 L. / DASSANAYAKE, NISSANKE LAKSHMAN

國 籍：(中文/英文)

1. ~5. 美國 / U.S.A.

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其事實發生日期為：。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 美國、 2007/09/07、 60/970,634
2. 美國、 2007/05/01、 60/915,291

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

本申請案依據 35 U.S.C. §119 主張於 2007 年 9 月 7 日提申之 U.S. 臨時專利申請案 No. 60/970,634 以及於 2007 年 5 月 1 日提申之 U.S. 臨時專利申請案 No. 5 60/915,291 之優先權，該兩案之全部在此被併入作為參考資料。

【發明所屬之技術領域】

發明領域

本發明係關於使用 N-鹵化胺基酸來清潔以及消毒隱形眼鏡之方法。本發明進一步關於用於隱形眼鏡清潔及消毒之包含有 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑之調配物。

【先前技術】

發明背景

在正常配戴下眼用隱形眼鏡被暴露於廣大範圍之微生物及非感染性污染物下。鏡片之清潔及消毒係需要的以避免感染性及非感染性污染物在隱形眼鏡表面上的增長。每日之清潔及消毒，特別係親水性（軟式）隱形眼鏡，係必要的。未徹底清潔及消毒鏡片會在鏡片配戴時會造成從眼睛刺激到嚴重感染的後果。由特別地致病性微生物，諸如 20 綠膿桿菌（*P. aeruginosa*），造成之眼部感染若未治療或若在治療開始前達到後期階段會導致視力喪失。

有一對於經改良之 1)容易使用 2)具有有效抗菌活性以及 3)係無毒（亦即，不會由於黏附在鏡片材料上而造成眼睛刺激）之隱形眼鏡清潔及消毒系統不間斷的需求。已

知之消毒及清潔隱形眼鏡之技術包含加熱法，期需要消耗時間的加熱步驟。然而，因為其方便性，化學消毒方法被較為廣泛地使用於現今實務中。

在現今已知化學殺菌及清潔方法中，隱形眼鏡被浸沒於一液體調配物中一段足以消毒及清潔該鏡片的時間。為了使該隱形眼鏡之化學及光學性質維持不變且為了確保隱形眼鏡使用者副作用之低發生率，隱形眼鏡使用一液體藥劑被消毒，其中一相對低濃度之消毒劑被包含於其中。不幸地，儘管具有低濃度消毒劑化合物之調配物的使用通常幫助降低非所欲影響之可能，這樣的實施增加該調配物可能沒有達到所需消毒活性水準之風險。另外，若消毒化合物沒有以足夠濃度被使用，微生物的抗藥性可能形成。因此，經改良之用於隱形眼鏡消毒之調配劑，其使用經降低濃度之抗菌化合物成份但維持足夠消毒活性、減少非所欲副作用及微生物抗藥性之發生及風險係所欲的。

也有一對於保存藥學組成物使其免於微生物污染之方法的需求。此需求特別盛行於眼用及耳用組成物之領域中。被使用來保存水狀眼用及耳用組成物之抗菌劑，當其被以一對於眼及耳組織係無毒時之濃度來使用時，必須有效防止該組成物受微生物污染。

一些抗菌組成物係含氯的，藉由其本身或其於化合物形式被用於消毒之應用中，諸如水供應的處理。具有抗菌活性之氯化合物包括 N-氯醯胺及醯亞胺、氯氰酸 (chlorocynauric acid) 及其鹽類、氯胺 T、1,3-二氯尿

- 囊素以及 N-氯烷基胺。許多這些化合物具有有限的穩定性。限制任何包括其等化合物之調配物的耐儲時間。其它含氯抗菌組成物亦被研究，諸如氯胺。威依爾 (Weil) 及莫里斯 (Morris) 研究次氯酸鹽及甲基胺及二甲基胺之反應且討論形成該氯胺之方法。

【發明內容】

發明概要

- 本發明之一特定具體例係關於經改良之用於消毒及清潔隱形眼鏡的方法以及調配物。如同在此所敘述，該改良係經由使用包含有 N-鹵化胺基酸以及一相間轉移劑之調配物被達成。政府之規定要球用於消毒隱形眼鏡之調配物要不需其它組成物(例如，清潔組成物或經保存之含鹽淋洗溶液)之協助而可達到消毒。這些規定已造成對於具有足夠較佳抗菌活性之調配物的需求。本發明之許多具體例提供具有足以滿足此標準之抗菌活性的隱形眼鏡消毒調配物。結合一 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑增加本發明之調配物的生物殺滅功效以及允許 N-鹵化胺基酸之濃度降低。因此，本發明之調配物造成眼睛刺激的可能被降低。再者，雖然不希望被理論所囿限，所相信的是本發明之調配物已經增加書水性藉此增其生物殺滅活性以及增加隱形眼鏡之攝入。

本發明之某些具體例包含不含有如檸檬酸鹽之 α 羥基化合物之調配物，該化合物普遍被結合於消毒溶液中用於蛋白質之移除。檸檬酸鹽於這些調配物中之某種可被諸

如醋酸鹽、己二酸鹽、琥珀酸鹽以及/或順丁烯二酸鹽所取代，特別係那些具有多個羧基基團者。

本發明之一具體例係一用於消毒以及/或清潔一隱形眼鏡之方法，其包含使一隱形眼鏡與一包含一 N-鹵化胺基酸以及一相間轉移劑之調配物接觸一段足以消毒及/或清潔該隱形眼鏡之時間。

本發明之另一具體例係一用於消毒一隱形眼鏡之含有 N-鹵化胺基酸以及一相間轉移劑之調配物。又另一具體例係一藥學組成物，其包含足夠量以保存該藥學組成物之 N-鹵化胺基酸及相間轉移劑。

前述簡短的摘要廣泛地敘述了本發明某些具體例之特徵及技術優點。額外之特徵及技術優點將會於敘述於下面本發明之詳細敘述中。據信為本發明特有之新穎特徵將由本發明之詳細敘述中被更清楚了解。

15 **【實施方式】**

I. 定義

除非有其它界定，在此被使用之技術及科學用語具有如同該領域中具有通常知識者所普遍了解的意義。

當被使用於此，「清潔(clean)」或「清潔(cleaning)」一詞意旨使脫落或移除隱形眼鏡沉積物以及隱形眼鏡表面及下表面之污染物

當被使用於此，「消毒(disinfect)」、「消毒(disinfecting)」及「消毒(disinfection)」意指殺死或抑制微生物(包括但不限制為細菌、病毒、酵母菌、真

菌、孢子、原生動物、寄生蟲等)之生長。

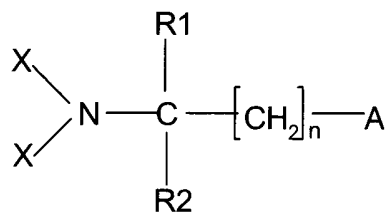
當被使用於此，「消毒劑」及「抗菌劑」一詞意指一具有殺死微生物(包括但不限於細菌、病毒、酵母菌、真菌、孢子、原生動物、寄生蟲等)或抑制微生物生長之能力的化合物。

當被使用於此，「離子配對劑」一詞意指在一溶液中與一 N-鹵化胺基酸形成一離子配對的任何化合物。

當被使用於此，「相間轉移劑」一詞意指任何於有機溶液中增加 N-鹵化胺基酸溶解度之化合物。相間轉移劑包括，但不限制為離子配對劑。相間轉移劑增加 N-鹵化胺基酸之視導磁率 (apparent permeability) 當於溶液中被調配在一起時。

II. 方法及調配物

本發明之 N-鹵化胺基酸具有下列通式：



其中 X 係一或多個鹵素且 R1 及 R2 係任何非極性、不帶電荷極性及帶電荷極性胺基酸及熟悉此藝者已知之胺基酸衍生物側鏈。A 代表一酸，諸如一羧酸、磺酸、磷酸、硼酸或其它熟習此藝者已知的酸。可有一或多個碳原子於該胺及酸之間，且各個碳可包含一或多個 R 取代基。

本發明較佳之 N-鹵化胺基酸具有下面結構：鹵胺基-

安定基-連接基-酸，其中 (a) 該「鹵胺基」係 N-鹵素或 N,N-二鹵素（例如， $-\text{NHC1}$ 或 $-\text{NC1}_2$ ）；(b) 該「安定基」包含連接至鄰接於該鹵胺基基團之碳的側鏈（例如，氫、 $-\text{CH}_3$ 、低烷基、基團 $-\text{COOH}$ 或 C_{3-6} 環烷基環）；(3) 該“連接基”係烷基或環烷基；以及 (d) 該「酸」係下列一者： COOH 、 $-\text{SO}_3\text{H}$ 、 $-\text{P}(=\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $-\text{B}(\text{OH})_2$ 或氫，且所有這些酸普遍被熟習此藝者知曉的藥學上可接受之鹽類，包括但不限於鈉、鉀、鈣等。

最佳的 N-鹵化胺基酸係 2, 2-二甲基-N,N-二氯牛磺酸、由將磺酸基團以羧酸、磷酸、硼酸等取代所形成之 2, 2-二甲基-N,N-二氯牛磺酸類似物。2, 2-二烷基-N,N-二氯牛磺酸，以及 2, 2-R-N,N-二氯牛磺酸，其中 R 係脂肪族或芳香族側鏈。N-鹵化胺基酸之甲基基團可被烷基、芳香基、苯甲基或其它碳氫化合物環或非環基團所取代。額外之 N-鹵化胺基酸被揭露於 U.S. 臨時專利申請案 No. 60/915,291，其提申於 filed May 1, 2007 年 5 月 1 日，題為“N-鹵化胺基酸配方”，其全部內容被併入作為參考。

通常，本發明之相間轉移劑具有一具一頭基團以及一親脂性烷基鏈或芳香基取代基之基本結構。大多數這些相間轉移劑係由自然構成嵌段（natural building block）諸如脂肪酸及醇類所形成。全部的親脂性烷基及芳香基取代基一般含有共約 4-8 至約 30 個碳。最佳的烷基及芳香基取代基之總碳數係從約 15 至 20 個碳。

本發明較佳之相間轉移劑係四級胺化合物且包括但不

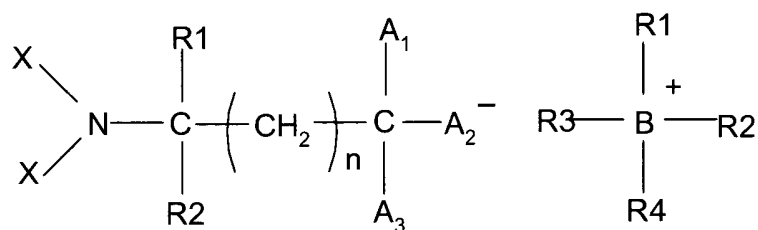
限於氫氧化四丁基銨(TBAH)、氫氧化四丙基銨(TPAH)、氫
氧化十六烷基三甲基銨、氫氧化十二烷基三乙基銨、氯化
四丁基鎂(TBPC)及其組合物。也被包括的係被熟悉此藝者
熟知的各種四級胺化合物之鹽類。其包括但不限制為氯化
5 物、溴化物、硫酸鹽、磷酸鹽以及醋酸鹽。

其他可被使用於本發明之具體例中的相間轉移劑包括
羥基氯苯胺(BAC)以及其同系物以及變化碳鏈長度之類似
物。這樣 BAC-類似化合物包括，但不限於羥基氯苯胺、苄
索氯銨(benzathonium chloride)、西他氯銨(cetalkonium
10 chlorid)、西曲溴銨(cetrimonium bromide)、氯化十六
烷基吡啶(cetylpyridinium chloride)、司拉氯銨
(stearalkonium chloride)以及這些化合物之同系物及
類似物，包括各種鏈長之親脂性部份。一具有 4 至 10 個碳
之親脂性鏈的 BAC 同系物可與 2,2-二甲基-N,N-二氯牛磺
15 酸形成一離子對於水性溶液中而具有增加的分隔在親脂相
中。這些 BAC 同系物及類似物係特別令人感興趣因為其可
具有較低微生物活性且可較少刺激生物組織，諸如角膜及
結膜組織。通常，具有多於 10 個碳之烷基的 BAC 同系物及
類似物與 N-鹵化胺基酸形成一疏水性複合物，其油於水性
20 溶液外且因此可被使用作為用於油中水型以及水中油型乳
液，諸如乳膏及洗劑，之防腐劑。

其他可被用於本發明之具體例的相間轉移劑包括但不
限為磷脂膽鹼諸如二莖蔻酰磷脂醯膽鹼
(dimyristoylphosphatidylcholine (DMPC))。

磷離子相間轉移劑包括但不限於從 1 至 22 個碳之各種烷基鏈長度的四烷基磷鹽，該烷基包括習知技藝者所知之未飽和及芳香族烷基取代基。鹽包括但不限於氯化物、溴化物、硫酸鹽、磷酸鹽、硼酸鹽以及醋酸鹽。實施例係氯化四丁基磷(TBPC)以及氯化苯甲基癸基二甲基磷。

較佳的 N-鹵化胺基酸及相間轉移劑之組合物形成下列通式結構之離子對：



10

其中針對該離子對之負電荷之部份：

X 係氯、溴及/或碘；

R1 係氫或烷基，C1-C6；

R2 係氫或烷基，C1-C6；

15 R1 及 R2 與其所接附之碳一起形成一 C3-C6 環烷基環；

n 係 0 或一來自 1-6 之整數；

A₁ 係氫或烷基；

A₂ 係 COO⁻、SO₃⁻、PO₃⁻或其他的酸；

A₃ 係氫或烷基；

20 且其中針對該離子對之帶負電荷之部份：

B 係氮或含磷的；

R1 至 R4 係各被選自於烷基酯、醇類、羥基、酮、酸、含硫及芳香族酯、羥基以及含硫酸，且 R1 至 R4 不係氫。又，R1 至 R4 應具有一直接連接至氮形成一正電荷的碳原子。此正電荷與該 N-鹵化胺基酸之帶負電荷酸部份形成一離子對。

III. 應用

某些在此所敘述之調配物可根據熟習此藝者已知之方法被使用以消毒及/或清潔隱形眼鏡。於一特定應用中，隱形眼鏡從一患者之眼睛中被取出且接著將隱形眼鏡浸於於此所敘述之調配物中一段足夠消毒該鏡片之時間。消毒以及/或清潔典型需要浸泡該鏡片於調配物中至少 4 至 6 小時。

本發明之具體例可與許多種類之隱形眼鏡一起使用，包括但不限於水凝膠軟式鏡片、HEMA 鏡片、高含水水凝膠 HEMA 鏡片以及硬式透氣(RGP)鏡片。

接觸溫度較佳地係於約 15°C 至約 37°C 範圍內之室溫中，但典型地被欲被清潔或消毒之隱形眼鏡材料所能容忍之溫度以及/或該消毒劑或其他賦形劑於調配物中被升高之溫度中之穩定性所限。

雖然不必要，含有一隱形眼鏡之溶液可被攪動，例如藉由搖動含有該調配物以及隱形眼鏡之容器以至少幫助從該鏡片上移除沈澱物質。一隱形眼鏡選擇性地可用手以鹽水或一實質上等張溶液被摩擦以從該鏡片進一步移除沈澱物質。清潔及消毒亦可包括在將鏡片放回一配戴者之眼睛

前淋洗該鏡片。

隱形眼鏡之原位(*In situ*)消毒以及/或清潔亦可被使用於本發明之某些具體例中。於這些具體例中，一含有 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑之調配物被徐徐滴入一隱形眼鏡配戴者之眼睛裡。該調配物係被週期地施用以確保可接受之隱形眼鏡消毒及/或清潔。該配戴者可選擇性地眨眼或輕輕摩擦一閉起的眼皮以完全清潔及消毒之程序。本發明之該原位方法較佳地係於軟式隱形眼鏡應用上至少每日進行。

10 IV. 調配物

除了 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑，本發明之調配物可選擇性地包含一或多個額外的成份。此種成分包括但不限制為張力劑、防腐劑、螯合劑、緩衝劑、表面活性劑、共溶劑及抗氧化劑。於某些具體例中之其他成份係助溶劑、安定劑、舒適促進劑(*comfort-enhancing agents*)、聚合物、軟化劑、pH-調節劑以及/或潤滑劑。可被使用於本發明之某些調配物中的成份包括水、諸如 C1-C7-烷醇的水及水-互溶溶劑之混合物，包含由 0.5 至 5%無毒性水溶性聚合物之植物油或礦物油，諸如褐藻酸酯、粘膠質、膠黃著樹膠、刺梧桐樹膠、三仙膠、鹿角菜膠、瓊脂及阿拉伯樹膠之天然產物、諸如醋酸澱粉及羥丙澱粉之澱粉衍生物以及其他合成產物，諸如聚乙烯醇、聚乙烯基甲基醚、聚乙烯氧化物，較佳地係交聯聚丙烯酸，及這些產物之混合物。該成份之濃度典型地係由 1 至 100,000 倍 N-鹵化胺基

酸之濃度。於較佳之具體例中，成份係基於其對於該 N-鹵化胺基酸及/或該相間轉移劑之惰性而被選擇。

除了一 N-鹵化胺基酸，本發明之調配物可包含額外抗菌劑。適合之抗菌劑包括，但不限於，那些通常被使用於
5 隱形眼鏡保養溶液或其他眼用溶液者，諸如聚夸特寧-1 (polyquaternium-1，)，其係一聚合四銨化合物、過氧化氫以及碘化鉀。

適合之抗氧化劑包括，但不限於亞硫酸鹽、抗壞血酸鹽、丁基羥基甲氧苯(BHA)以及二丁基羥基甲苯(BHT)。

10 使用於本發明之調配物中的表面活性可係陽離子性、陰離子性、非離子性或兩性的。較佳之表面活性劑係中性或非離子性表面活性劑，其可存在以至多 5 w/v%之量。可被使用於本發明之某些具體例之表面活性劑包括，但不限於，聚乙二醇醚或脂肪酸之醚，以及聚氧丙烯-聚氧乙烯乙
15 二醇非離子性嵌段共聚物（例如泊洛沙姆（poloxamers），諸如普盧蘭尼克(Pluronic) F-127 及 F-68)。

於本發明某些具體例中，適合之共溶劑包括甘油、丙二醇以及聚乙二醇。

可被併入本發明之調配物的緩衝劑包括，但不限於，鹼
20 金屬鹽類，諸如碳酸鉀或鈉、醋酸鉀或鈉、硼酸鉀或鈉、磷酸鉀或鈉，以及弱酸，諸如醋酸及硼酸。較佳的緩衝劑係鹼金屬硼酸鹽，諸如硼酸鈉或硼酸鉀。其他 pH 調整劑，諸如無機酸及鹼，也可被使用。例如，氫氯酸或氫氧化鈉

可被以適合眼用組成物之濃度被使用。上面所屬之緩出劑通常以由約 0.1 至約 2.5 w/v%-量存在，較佳地由約 0.5 至約 1.5 % w/v%。

本發明之調配物較佳地係等張的或稍微低張的，且一般
5 具有一 210-320 mOsm/kg 之範圍的滲透壓，且較佳地具有一範圍 235-300 mOsm/kg 之滲透壓。如此可能需要一張力劑以將該調配物之滲透壓帶至所欲之水準。張力調整劑包括，但不限為，氯化鈉、甘油、花楸醇或甘露糖醇。

在此所提出之調配物可包含一或多個防腐劑。防腐劑之
10 例子包括對羥苯甲酸酯、四級銨化合物諸如，例如，聚季銨鹽-1 (polyquaternium-1)，過硼酸鈉、亞氯酸鈉、對羥苯甲酸酯，諸如，例如羥苯甲酸甲酯或羥苯甲酸丙酯，醇類，諸如，例如氯丁醇、苯甲醇或苯乙醇。於某些具體例中，該調配物可係自我防腐的，其不需要防腐劑。

15 為了有效消毒隱形眼鏡以及為了將任何副作用降到最小，迫切地係該調配物之消毒活性應最大化以使得一最小量之活性成份被使用。為常識的係這些種類之抗菌劑的活性係由該劑本身所造成；該調配物除了 N-鹵化胺基酸外之成份通常造成小的作用。為達到所欲消毒活性所需之 N-鹵
20 化胺基酸的量可由熟習此藝者所決定。為達到作為一消毒劑所欲活性所需且保留可接受之安全性及毒性特性之濃度在此被稱為「一有效量」。一有效量將具有足以符合通常被接受對於活性之標準的抗菌活性，諸如用於隱形眼鏡之衛生管理的 EN ISO 14729:2001 眼用光學-隱形眼鏡保養產品

-用於產品及療法的微生物要求及測試方法。

亦被考慮到的係含有本發明之調配物之成份的濃度可變化。於沒有限制的方面，百分比可以全部配方之重量或體積被計算。一熟習此藝者可了解的係該濃度可依據成份於特定調配物中之成份的添加、取代以及/或減少而變化。該等調配物之 pH 可係於一眼睛可接受之 6.7 至 8.0 之範圍中。據此，較佳的調配物係使用一緩衝系統被製備，該緩衝系統維持該調配物於，約 pH 6.7 至 pH8.0。

於一特定具體例中，調配物係適合應用於哺乳類之眼睛以於活體中消毒隱形眼鏡。例如，用於眼睛投藥，該調配物可係一溶液、懸浮液、凝膠、油包水及水包油乳劑或藥膏。較佳的用於眼睛投藥的調配物係滴劑形式之水狀溶液。「水狀」一詞典型係表示一水狀配方其中該賦形劑係 >50%，較佳係 >75% 且尤其係 >90% 之水重。

這些滴劑可被從一可較佳地經滅菌的單一劑量之安瓿中被傳送且因此使得該調配物之抑制細菌的成份為不必要的。可擇地，該等滴劑可從一多劑量瓶中被傳送，該多劑量瓶可較佳地包含一當調配劑被傳送時從該調配劑抽取出防腐劑之裝置，這樣的裝置係該技藝中已知的。額外之投予本發明之眼用調配劑之方法包括，但不限於，包含一 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑之插入物的使用，該插入物被置於眼瞼之下。

於用於活體消毒之某些具體例中，該 N-鹵化胺基酸以及一相間轉移劑可被調配於一調配物中，該調配物包含一

或多個眼淚替代物。各種眼淚替代物係習知技藝，其包括但不限於：單體多元醇，諸如甘油、丙二醇以及乙二醇；聚合多元醇，諸如聚乙二醇；纖維素酯，諸如羥丙基甲基纖維素、羥甲基纖維素鈉以及羥丙基纖維素；類糊精，諸如類糊精 70；乙烯聚合物，諸如聚乙烯醇；以及卡波姆 (carbomer)，諸如卡波姆 934P、卡波姆 941、卡波姆 940 及卡波姆 974P。用於活體消毒之眼用調配物具有 0.5-100 cps 之黏度，較佳係 0.5-50 cps，且更佳係 1-20 cp。此相對低之黏度確保該產物係使人舒服的，不會造成模糊，且在製造、傳送以及填充操作過程中係容易處理的。

於本發明之某些具體例中，一消毒調配物可係一二部分系統，例如，一 N-鹵化胺基酸可存在於一容器中且其餘調配物成份，諸如一相間轉移劑，係被分離於一被分隔的容器或相同容器之不同部分直到使用者準備好使用該調配物來消毒。當需要時，該二部份可被使用者混合且使用於消毒一隱形眼鏡。該二部份系統於。中調配物之一或多個成分當被結合時具有穩定性問題之例子中係有用的。一或多個成分也可具有泡騰性質，其可，例如，加速該二部分系統之故體部分的碎裂及溶解。這樣的性質可促進清潔隱形眼鏡表面，造成某些調配物兼具有清潔及消毒活性。泡騰系統係習知技藝中已知的且可包含，例如，重碳酸鈉加上一酸，諸如己二酸、順丁烯二酸或琥珀酸。

包含除了 N-鹵化胺基酸所提供之抗菌以及/或清潔活性之外的清潔活性之本發明調配物可選擇性的包含一或多

個經設計以從隱形眼鏡表面移除蛋白質或其他非所欲沉澱物的藥劑。這些藥劑可係氧化劑，諸如亞氯酸鈉，或非-氧化劑，諸如酵素、清潔劑或蛋白質-複合物形成劑，諸如幾丁質或其衍生物。

5 較佳實施例之詳細說明

V. 實施例

下列實施例被呈現以進一步說明本發明之經選擇的實施例。

實施例 1—調配物

10

成份	% w/v
2,2-二甲基-N,N-二氯牛磺酸鈉 (Sodium 2,2-dimethyl-N,N-dichlorotaurine)	0.1
苯甲基癸基二甲基氯化銨 (Benzyldecyldimethylammonium Chloride (C10 BAC))	0.125
硼酸	0.6
丙二醇	1.0
普盧蘭尼克(Pluronic) F-68	0.05
氯化鈉	0.01
氫氧化鈉/鹽酸	pH 調整至 7.0*
純水	QS

*滲透壓可隨需要以非離子滲透壓增進劑，諸如丙二醇

(propylene glucol)或甘露糖醇，或以離子性滲透壓增進劑，諸如氯化鈉，被調整成於 210 及 300 mOsm/kg 間。

實施例 2—調配物

成份	% w/v
2,2-二甲基-N,N-二氯牛磺酸鈉	0.1
氯化四丁基鎂(TBPC)	0.125
硼酸	0.2
丙二酸*	1.0
普盧蘭尼克(Pluronic) P85**	0.1
氯化鈉	0.01
氫氧化鈉/鹽酸	pH 調整至 7.0***
純水	QS

*其他酸如己二酸可被取代為丙二酸，其不具有 α 羥基存在。這樣的酸之濃度可根據其溶解酵素之移除能力被調整。這樣的分子可被單獨使用或與其他酸結合或與適合的表面性劑結合使用。

**普盧蘭尼克(pluronic)係含有聚乙烯氧化物及聚丙烯氧化物

5 之嵌段聚合物。用量及嵌段之種類可被改變以達到最大功效。這些可由其他相容的表面活性劑所取代。

***滲透壓可隨需要被調整至 210 及 300 mOsm/kg 之間。

實施例 3—抗菌試驗

包含 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑之調配物的試驗試樣被製備為 0.001%之標的濃度於媒液中且藉由殺菌時間 (time-kill) 方法對於抗菌活性篩選。該等試驗試樣經以白色念珠菌 (*Candida albicans*), 茄形镰胞菌 (*Fusarium solani*), 綠膿桿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*), 黏質色拉雷菌 (*Serratia marcescens*) and 金黃色葡萄球菌 (*Staphylococcus aureus*) 之標準化的懸浮液挑戰且存活微生物之數目於 6 及 24 小時被決定。

- 10 本發明及其具體例已經被詳細敘述。然而，本發明之範圍係不意圖被限制為在發明說明書中所敘述之任何製程、製品、物質的組成物、化合物、手段、方法以及/或步驟之特定具體例。許多改質、取代以及變化可在不背離本發明之精神以及/或本質下被施用於被揭露之物質上。據此，一
- 15 熟習此藝者將可容易地從揭露內容中了解到執行實質上相同功能或達到實質上相同結果之晚期改質、取代以及/或變化根據本發明這樣相關的具體例可被使用，如同在此所述之具體例。因此，下列申請專利範圍係意圖包含其對於揭露於此之製程、製品、物質的組成物、化合物、手段、方法
- 20 法以及/或步驟之改質、取代以及變化於其範圍中。

【圖式簡單說明】

(無)

【主要元件符號說明】

(無)

五、中文發明摘要：

本發明係關於用於消毒或清潔一隱形眼鏡之方法，包含使該隱形眼鏡接觸一含有 N-鹵化胺基酸以及一相間轉移劑之調配物一段足以消毒或清潔該等鏡片之時間。此發明說明書進一步揭露一用於消毒隱形眼鏡之含有 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑之調配物。

六、英文發明摘要：

The present invention relates to methods for disinfecting or cleaning a contact lens comprising contacting a contact lens with a formulation comprising a N-halogenated amino acid and a phase transfer agent for a time sufficient to disinfect or clean the lens. This specification further discloses a formulation for disinfecting a contact lens comprising an N-halogenated amino acid and a phase transfer agent.

十、申請專利範圍：

1. 一種用於消毒及/或清潔一隱形眼睛之方法，包含使一隱形眼鏡與一含有一 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑之調配物接觸一段足以消毒及/或清潔該隱形眼鏡之時間。
- 5 2. 如申請專利範圍第 1 項之方法，其中該相間轉移劑係選自於由下列所構成之組群：四級胺、氫氧化四丁基銨 (TBAH)、氫氧化四丙基銨 (TPAH)、氫氧化十六烷基三甲基銨、氫氧化十二烷基三乙基銨、氯化四丁基鎂 (TBPC)、鎂離子相間轉移劑以及其組合物。
- 10 3. 如申請專利範圍第 1 項之方法，其中該調配物係一二部份調配物。
4. 如申請專利範圍第 1 項之方法，其中該 N-鹵化胺基酸係一氯牛磺酸。
5. 如申請專利範圍第 4 項之方法，其中該氯牛磺酸係 2,2-
15 二甲基-N,N-二氯牛磺酸鈉。
6. 如申請專利範圍第 1 項之方法，其中該調配物係不含有 α 羥基化合物。
7. 一種用於消毒隱形眼鏡之調配物，其包含：
一 N-鹵化胺基酸及一相間轉移劑。
- 20 8. 如申請專利範圍第 7 項之調配物，其中該相間轉移劑係選自於下列所構成之組群：四級胺、氫氧化四丁基銨 (TBAH)、氫氧化四丙基銨 (TPAH)、氫氧化十六烷基三甲基銨、氫氧化十二烷基三乙基銨、氯化四丁基鎂 (TBPC)、鎂離子相間轉移劑以及其組合物。

9. 如申請專利範圍第 7 項之調配物，其中該調配物係一二部份調配物。
10. 如申請專利範圍第 7 項之調配物，其中該 N-鹵化胺基酸係氯牛磺酸。
- 5 11. 如申請專利範圍第 10 項之調配物，其中該氯牛磺酸係 2,2-二甲基-N,N-二氯牛磺酸鈉。
12. 如申請專利範圍第 7 項之調配物，其中該調配物係不具羥基化合物。
13. 一種藥學組成物，其包含：
- 10 一足夠保存該組成物之 N-鹵化胺基酸及相間轉移劑。
14. 一種用於消毒或清潔表面之方法，包含：
- 使一欲被消毒或清潔之表面與一含有 N-鹵化胺基酸及相間轉移劑之表面接觸。
15. 如申請專利範圍第 14 項之方法，其中該欲被消毒之表面係一組織。
- 15 16. 如申請專利範圍第 14 項之方法，其中該調配物係不具有 α 羥基化合物。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第()圖。(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

(無)

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

(無)