

發明專利說明書

PD1083763

(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：97111157

※申請日期：97-7-28

※IPC 分類：

A61K 31/577 (2006.01)

A61K 9/10 (2006.01)

A61K 47/37 (2006.01)

A61P 27/02 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑

SUSPENDED TYPE EYE DROP COMPRISING FLUOROMETHOLONE

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

參天製藥股份有限公司(參天製藥株式会社)

SANTEN PHARMACEUTICAL CO., LTD.

代表人：(中文/英文)

黑川明(黒川明)/KUROKAWA, AKIRA

住居所或營業所地址：(中文/英文)

日本國大阪市東淀川區下新庄3丁目9番19號

9-19, Shimoshinjo 3-chome, Higashiyodogawa-ku, Osaka-shi, Osaka
Japan

國籍：(中文/英文)

日本/Japan

三、發明人：(共 2 人)

姓名：(中文/英文)

1. 淺田博之(淺田博之)/ASADA, HIROYUKI

2. 杉原由起子/SUGIHARA, YUKIKO

國籍：(中文/英文)

1.~2. 日本/Japan

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： 年 月 日。

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：

日本 2007/3/29 特願 2007-087779

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：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於一種點眼劑，其為含有氟甲松龍 (fluorometholone) 之懸浮型點眼劑，該點眼劑中含有 0.0001 ~ 0.01% (W/V) 之聚氧乙烯硬化蓖麻油或含有 0.0001 ~ 0.01% (W/V) 之聚氧乙烯蓖麻油，以及關於抑制懸浮型點眼劑中含有的氟甲松龍黏著於容器之方法。

【先前技術】

氟甲松龍為作為抗炎症性類固醇而供給於醫療的藥物，特別以點眼劑之形態被廣泛使用。因氟甲松龍為難溶於水之藥物，實際使用以懸浮液劑之形態供應。

懸浮液劑因藥物不溶解，使用時必須震盪點眼容器，使沉澱・凝集的藥物均一地再分散而使用，於氟甲松龍之懸浮型點眼劑中亦有相同情形。因此，為了提升氟甲松龍之再分散性已進行各種手段。例如，專利文獻1記載藉由配合非離子性界面活性劑與纖維素系高分子，於再分散性優異且幾乎無凝集塊形成之氟甲松龍懸浮型點眼劑。又，專利文獻2記載含有由液劑之表面張力開始降低的濃度到表面張力之降低停止的濃度範圍內之水溶性纖維素衍生物，而改善氟甲松龍分散粒子之再分散性的水性懸浮液劑。

另一方面，於氟甲松龍之懸浮型點眼劑，因保存狀態(保存姿勢或保存溫度等)之變化，有懸浮型點眼劑中之氟甲松龍黏著於容器內面之情形。作為氟甲松龍黏著容器之一例，認為於靜置保存下沉澱的懸浮型點眼劑中之氟甲松龍，因所

謂容器的橫置之保存姿勢的變化，而曝露於容器的空隙，乾燥後會黏著於容器內面。如此之氟甲松龍對容器之黏著，若容器為直立狀態則不易發生，惟考量流通過程及使用狀況，認為會發生氟甲松龍黏著於容器。又，依容器的保存狀態，不僅於容器的空隙部位，於容器的溶液接觸部位亦有發生氟甲松龍黏著的情形。如此，一旦氟甲松龍黏著於容器，為使氟甲松龍均勻地分散，需長時間的震盪。

因此，期待於流通過程或儲存過程中，懸浮型點眼劑中的氟甲松龍難黏著於容器，亦即抑制黏著於容器之氟甲松龍之懸浮型點眼劑。

專利文獻3中記載著藉由配合羥基丙基甲基纖維素、甲基纖維素等之纖維素系高分子於懸浮液劑中，可使黏著於容器的吡諾克辛（pirenoxine）容易分散於溶液中。又，專利文獻4中記載著含有氯替潑諾（loteprednol etabonate）之水性懸浮液劑中，經由配合選自山梨酸或其鹽及對羥基苯甲酸酯組成之群之至少1種，抑制經沉澱的氯替潑諾粒子對容器之黏著及團塊形成。

然而，專利文獻3及4中未記載抑制氟甲松龍對容器之黏著。

專利文獻1：特開平11-279052號公報

專利文獻2：特開平11-029463號公報

專利文獻3：國際公開2006/030851號小冊

專利文獻4：國際公開2005/053708號小冊

【發明內容】

發明之揭示

發明欲解決之課題

因此，本發明之目的係提供一種點眼劑，係含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑，其抑制該點眼劑中之氟甲松龍向容器之黏著。

解決課題之手段

於是，本發明者等致力研究之結果，發現即使是一般使用的點眼劑之添加劑中，藉由含有聚氧乙烯硬化蓖麻油或聚氧乙烯蓖麻油，可抑制氟甲松龍黏著於容器。

即，本發明為一種點眼劑，為含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑，該點眼劑含有 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯硬化蓖麻油或 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯蓖麻油。

又，本發明之另一態樣為一種點眼劑，為含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑，該點眼劑含有 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯硬化蓖麻油或 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯蓖麻油，且，又含有選自甲基纖維素、聚乙烯吡咯烷酮及聚乙烯醇組成之群之至少 1 種。

又，本發明之另一態樣為於含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑中經由配合 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯硬化蓖麻油或 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯蓖麻油而抑制該點眼劑中所含氟甲松龍對容器之黏著之方法。

又，本發明之另一態樣為含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑，經由配合 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯硬化蓖麻油或 0.0001~0.01% (W/V) 之聚氧乙烯蓖麻油，且又配合

甲基纖維素、聚乙烯吡咯烷酮及聚乙烯醇組成之群之至少1種，而抑制該點眼劑中所含氟甲松龍對容器之黏著之方法。

使用於本發明的聚氧乙烯氫化蓖麻油之例，可列舉如聚氧乙烯硬化蓖麻油5、聚氧乙烯硬化蓖麻油10、聚氧乙烯硬化蓖麻油20、聚氧乙烯硬化蓖麻油40、聚氧乙烯硬化蓖麻油50、聚氧乙烯硬化蓖麻油60、聚氧乙烯硬化蓖麻油100等。聚氧乙烯硬化蓖麻油之濃度係具有抑制點眼劑中的氟甲松龍黏著於容器的效果即可，無特別的限制，較佳為0.0001~0.01% (W/V)，更佳為0.001~0.01% (W/V)，再更佳為0.001~0.0075% (W/V)，最佳為0.001~0.005% (W/V)。

使用於本發明的聚氧乙烯蓖麻油之例，可列舉如聚氧乙烯蓖麻油5、聚氧乙烯蓖麻油9、聚氧乙烯蓖麻油15、聚氧乙烯蓖麻油35、聚氧乙烯蓖麻油40、聚氧乙烯蓖麻油60等。聚氧乙烯蓖麻油之濃度係具有抑制點眼劑中的氟甲松龍黏著於容器的效果即可，無特別的限制，較佳為0.0001~0.01% (W/V)，更佳為0.001~0.01% (W/V)，再更佳為0.001~0.0075% (W/V)，最佳為0.0001~0.005% (W/V)。

使用於本發明的氟甲松龍之含有量只要可發揮治療效果即可無特別限制，較佳為0.005~0.5% (W/V)，更佳為0.02~0.1% (W/V)。現在用於治療之濃度為100ml中0.02g或0.1g。

用於本發明之甲基纖維素之濃度，認為只要有抑制點眼劑中之氟甲松龍黏著於容器之效果之濃度即可無特別限制，較佳為0.00001~0.1% (W/V)，更佳為0.00005~0.05

% (W/V)，再更佳為 0.0001 ~ 0.01% (W/V)，最佳為 0.0001 ~ 0.001% (W/V)。

用於本發明之聚乙烯醇之濃度，認為只要有抑制點眼劑中之氟甲松龍黏著於容器之效果的濃度即可無特別限制，較佳為 0.00001 ~ 0.1% (W/V)，更佳為 0.00005 ~ 0.05% (W/V)，再更佳為 0.0001 ~ 0.01% (W/V)，最佳為 0.0001 ~ 0.001% (W/V)。又，聚乙烯醇可為完全鹼化物或部分鹼化物。

作為用於本發明之聚乙烯吡咯烷酮之例可列舉如聚乙烯吡咯烷酮 K25、聚乙烯吡咯烷酮 K30、聚乙烯吡咯烷酮 K90 等。聚乙烯吡咯烷酮之濃度，認為只要有抑制點眼劑中之氟甲松龍黏著於容器之效果的濃度即可無特別限制，較佳為 0.00001 ~ 0.1% (W/V)，更佳為 0.00005 ~ 0.05% (W/V)，再更佳為 0.0001 ~ 0.01% (W/V)，最佳為 0.0001 ~ 0.001% (W/V)。

保存本發明的點眼劑的容器之材質，係一般點眼劑容器使用之材質即可，例如聚丙烯、丙烯-乙烯共聚物、聚乙烯、聚對苯二甲酸乙二醇酯、聚氯乙烯、丙烯酸樹脂、聚苯乙烯等。

本發明之點眼劑可依據市售之氟甲松龍懸浮型點眼劑之製造方法調製，視需要可添加等張劑、防腐劑、pH調節劑、緩衝劑、安定劑等。作為本發明點眼劑之製造方法的代表例，例如下述之方法。首先，於滅菌純水中視需要添加慣用於點眼劑的添加劑之等張劑、防腐劑、pH調節劑、緩衝劑、

安定劑等並溶解之。添加氟甲松龍至該溶液後，使用各種均質機、混合機、磨碾機或超音波等，使其懸浮化。視需要添加 pH 調節劑來調節 pH。又，本發明點眼劑之 pH 只要為點眼劑通常使用的範圍即可無特別限制，但以 4~8 之範圍為較佳。

作為等張劑，可列舉例如甘油、丙二醇、聚乙二醇、三棉實糖、蔗糖、山梨糖醇、甘露糖醇、氯化鈉、氯化鉀、氯化鈣、氯化鎂等。

作為防腐劑，可列舉例如氯化苄烷銨、對羥基苯甲酸甲酯、對羥基苯甲酸乙酯、對羥基苯甲酸丙酯、對羥基苯甲酸丁酯、氯丁醇等。

作為 pH 調節劑，可列舉例如鹽酸、檸檬酸、磷酸、醋酸、氫氧化鈉、氫氧化鉀、碳酸鈉、碳酸氫鈉等。

作為緩衝劑，可列舉例如磷酸、磷酸鹽、硼酸、硼砂、檸檬酸、醋酸、 ϵ -胺基己酸、氨丁三醇 (trometamol) 等。

作為安定化劑，可列舉例如伊地酸 (edetic acid)、伊地酸鈉等。

發明之效果

於後述的實施例各項中詳細地說明，實施例之試驗中顯示，於含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑，藉由含有聚氧乙烯硬化蓖麻油，可抑制氟甲松龍對容器之黏著。即，本發明提供一種點眼劑，為含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑，該點眼劑含有聚氧乙烯硬化蓖麻油或聚氧乙烯蓖麻油。又，本發明提供一種點眼劑，含有聚氧乙烯硬化蓖麻油或聚氧乙烯蓖麻油，

且，含有選自甲基纖維素、聚乙烯吡咯烷酮及聚乙烯醇組成之群之至少1種。

【實施方式】

實施發明用之最佳形態

實施例1

經由配合各種界面活性劑，調查懸浮型點眼劑中之氟甲松龍對容器之黏著的影響。

(試驗液劑之調製)

作為試驗液劑，調製表1~3所示處方之懸浮型點眼劑。處方中，為使說明簡單，僅顯示比較判定本發明之效果上的必要成分，但配合其他添加物，為氯化苳烷銨、磷酸氫鈉、磷酸二氫鈉、氯化鈉、伊地酸鈉。又，聚氧乙烯硬化蓖麻油60係使用日本界面活性劑(Surfacant)工業公司製，甲基纖維素係使用信越化學工業公司製、聚乙烯醇係使用Kuraray公司製，聚乙烯吡咯烷酮係使用BASF公司製者。

又，表中之縮寫如以下所示者。

FML：氟甲松龍

HCO60：聚氧乙烯硬化蓖麻油60

MC：甲基纖維素

PVP：聚乙烯吡咯烷酮

PVA：聚乙烯醇

Tw80：聚山梨酸酯80

MYS：聚氧40硬脂酸酯(Polyoxyl 40 Stearate)

表 1：聚氧乙炔硬化蓖麻油 60

| | 配合量% (W/V) | | | | | | |
|-------|------------|-------|-------|--------|-------|-------|--------|
| | 處方1 | 處方2 | 處方3 | 處方4 | 處方5 | 處方6 | 處方7 |
| FML | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 |
| HCO60 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 |
| MC | 0.0001 | 0.001 | 0.01 | — | — | — | — |
| PVP | — | — | — | 0.0001 | 0.001 | 0.01 | — |
| PVA | — | — | — | — | — | — | 0.0001 |

表 2：聚山梨酸酯 80

| | 配合量% (W/V) | | | | | | |
|------|------------|-------|-------|--------|-------|-------|--------|
| | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 |
| | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 6 | 7 |
| FML | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 |
| Tw80 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 |
| MC | 0.0001 | 0.001 | 0.01 | — | — | — | — |
| PVP | — | — | — | 0.0001 | 0.001 | 0.01 | — |
| PVA | — | — | — | — | — | — | 0.0001 |

表 3：聚氧 40 硬脂酸酯

| | 配合量% (W/V) | | | | | |
|-----|------------|-------|-------|--------|-------|-------|
| | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 | 比較處方 |
| | 8 | 9 | 10 | 11 | 12 | 13 |
| FML | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 |
| MYS | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 | 0.005 |
| MC | 0.0001 | 0.001 | 0.01 | — | — | — |
| PVP | — | — | — | 0.0001 | 0.001 | 0.01 |

表 1~3 中之試驗液劑之調製依據以下之方法進行。

將含氟甲松龍之濃厚懸浮液 (1%) 經攪拌機攪拌約 1 小

時而調製，進而經高速回轉式攪拌機攪拌約30分鐘。此濃厚懸浮液以氟甲松龍之濃度為所定濃度的方式稀釋於基劑（由上述處方去除氟甲松龍者）。

（效果判定方法）

將依據上述而調製的處方1~7及比較處方1~13的試驗液劑填充至5ml的點眼容器（聚乙烯樹脂製）各10瓶。使該容器直立，於25℃/40% RH的條件下保存1週後，慢慢地使容器倒立，再於相同條件下保存2週。保存結束後，檢查各處方對抑制氟甲松龍黏著於容器底部之效果。

依據效果判定方法（正立；1週→倒立；2週），處方1~7之結果如表4所示。

依據效果判定方法（正立；1週→倒立；2週），比較處方1~7之結果如表5所示。

依據效果判定方法（正立；1週→倒立；2週），比較處方8~13之結果如表6所示。

表4：處方1~7之結果

| 處方1 | 處方2 | 處方3 | 處方4 | 處方5 | 處方6 | 處方7 |
|--------|--------|--------|--------|--------|--------|--------|
| 3 / 10 | 2 / 10 | 2 / 10 | 5 / 10 | 5 / 10 | 5 / 10 | 0 / 10 |

表5：比較處方1~7之結果

| 比較處方1 | 比較處方2 | 比較處方3 | 比較處方4 | 比較處方5 | 比較處方6 | 比較處方7 |
|---------|--------|--------|---------|---------|---------|---------|
| 10 / 10 | 9 / 10 | 9 / 10 | 10 / 10 | 10 / 10 | 10 / 10 | 10 / 10 |

表 6：比較處方 8～13 之結果

| 比較處方 8 | 比較處方 9 | 比較處方 10 | 比較處方 11 | 比較處方 12 | 比較處方 13 |
|--------|--------|---------|---------|---------|---------|
| 10/10 | 10/10 | 9/10 | 10/10 | 10/10 | 10/10 |

表 4～6 中的數字係表示相對於試驗個數 10 個，使容器旋轉 20 回後，進而以手震盪容器 100 回後，氟甲松龍黏著於容器底部之樣品數。所謂氟甲松龍黏著的樣品，係表示氟甲松龍為粒子而可以肉眼觀察的狀態的樣品。

由表 4～6 清楚可知，含有為界面活性劑之聚氧乙烯硬化蓖麻油之處方 1～7，相較於含有其他界面活性劑之比較處方 1～13，氟甲松龍黏著於容器底部之樣品數皆變少。即，即使一般使用的點眼劑之界面活性劑中，藉由含有聚氧乙烯硬化蓖麻油，顯示抑制氟甲松龍對容器之黏著。

又，由表 4～6 清楚可知，含有甲基纖維素之處方 1～3，及含有聚乙烯醇之處方 7，相較於含有聚乙烯吡咯烷酮之處方 4～6，氟甲松龍黏著於容器底部之樣品數變少。即，含有聚氧乙烯硬化蓖麻油之點眼劑中，含有甲基纖維素或聚乙烯醇之一方，顯示更抑制氟甲松龍對容器之黏著效果。

實施例 2

依據聚氧乙烯硬化蓖麻油之配合濃度，調查氟甲松龍對容器之黏著。

（試驗液劑之調製）

作為試驗液劑，調製表 7～8 所示處方之懸浮型點眼劑。處方中，為使說明簡單，僅顯示比較判定本發明之效果上的必要成分，但配合其他添加物之氯化苄烷銨、磷酸氫鈉、磷

酸二氫鈉、氯化鈉、伊地酸鈉。又，表中之縮寫與表1~3相同。又，聚氧乙烯硬化蓖麻油60係使用日本界面活性劑工業公司製，甲基纖維素係使用信越化學工業公司製，聚乙烯醇係使用Kuraray公司製，聚乙烯吡咯烷酮係使用BASF公司製者。

表7：0.1% (W/V) FML

| | 配合量% (W/V) | | | | |
|-------|------------|--------|--------|--------|--------|
| | 處方8 | 處方9 | 處方10 | 處方11 | 處方12 |
| FML | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 | 0.1 |
| HCO60 | 0.0025 | 0.0025 | 0.0025 | 0.0075 | 0.0075 |
| MC | 0.0001 | 0.001 | — | 0.001 | 0.01 |
| PVA | — | — | 0.0001 | — | — |

表8：0.02% (W/V) FML

| | 配合量% (W/V) | | | | |
|-------|------------|--------|--------|--------|-------|
| | 處方13 | 處方14 | 處方15 | 處方16 | 處方17 |
| FML | 0.02 | 0.02 | 0.02 | 0.02 | 0.02 |
| HCO60 | 0.0025 | 0.0025 | 0.0025 | 0.0025 | 0.005 |
| MC | 0.0001 | 0.001 | 0.01 | — | 0.01 |
| PVP | — | — | — | 0.001 | — |

表7~8中之試驗液劑之調製依據以下之方法進行。

將含氟甲松龍之濃厚懸浮液(1%)經攪拌機攪拌約1小時而調製，進而經高速回轉式攪拌機攪拌約30分鐘。此濃厚懸浮液以氟甲松龍之濃度為所定濃度的方式稀釋於基劑(由

上述處方去除氟甲松龍者)。又，視氟甲松龍之分散性，適宜添加聚氧乙烯硬化蓖麻油60於上述濃厚懸浮液。

(效果判定方法)

將依據上述而調製的處方8~17的試驗液劑填充至5ml的點眼容器(聚乙烯樹脂製)各10瓶。使該容器直立，於25℃/40% RH的條件下保存1週後，慢慢地使容器倒立，再於相同條件下保存2週。保存結束後，檢查各處方對抑制氟甲松龍黏著於容器底部之效果。

依據效果判定方法(正立; 1週→倒立; 2週)，處方8~12之結果如表9所示。

依據效果判定方法(正立; 1週→倒立; 2週)，處方13~17之結果如表10所示。

表9：處方8~12之結果

| 處方8 | 處方9 | 處方10 | 處方11 | 處方12 |
|--------|--------|--------|--------|--------|
| 2 / 10 | 1 / 10 | 0 / 10 | 7 / 10 | 7 / 10 |

表10：處方13~17之結果

| 處方13 | 處方14 | 處方15 | 處方16 | 處方17 |
|--------|--------|--------|--------|--------|
| 2 / 10 | 1 / 10 | 2 / 10 | 4 / 10 | 5 / 10 |

表9~10中的數字係表示相對於試驗個數10個，使容器旋轉20回後，進而以手震盪容器100回後，氟甲松龍黏著於容器底部之樣品數。所謂氟甲松龍黏著的樣品，係表示氟甲松龍為粒子而可以肉眼觀察的狀態的樣品。

由表 9~10 清楚可知，處方 8~17，與比較處方 1~13 相較，氟甲松龍黏著於容器底部之樣品數皆減少，此次試驗的聚氧乙烯硬化蓖麻油任一者之濃度中亦認為有氟甲松龍之容器黏著抑制效果。抑制效果以配合濃度為 0.0025% (W/V) 之處方為最高。

實施例 3

(製劑例)

依據實施例 1 的調製法製得下述之製劑。又，下述製劑例中，各成份的配合量係 100ml 中之含量。

製劑例 1

| 成分 | 含量 |
|--------------|---------|
| 氟甲松龍 | 0.1g |
| 聚氧乙烯硬化蓖麻油 60 | 0.0025g |
| 甲基纖維素 | 0.0001g |
| 氯化苳烷鉍 | 0.005g |
| 伊地酸鈉 | 適量 |
| 磷酸氫鈉 | 適量 |
| 磷酸二氫鈉 | 適量 |
| 氯化鈉 | 適量 |
| 滅菌純水 | 適量 |

上述處方中，將氟甲松龍之配合量變更為 0.02g，聚氧乙烯硬化蓖麻油 60 之配合量變更為 0.001、0.005、0.0075 或 0.01g。又，甲基纖維素之配合量變更為 0.00001、0.00005、0.00005、0.0001、0.0005 或 0.01g，可製得和製劑例 1 相同之製劑。

製劑例 2

| 成分 | 含量 |
|--------------|---------|
| 氟甲松龍 | 0.1g |
| 聚氧乙炔硬化蓖麻油 60 | 0.0025g |
| 聚乙烯醇 | 0.0001g |
| 氯化苄烷鈦 | 0.005g |
| 伊地酸鈉 | 適量 |
| 磷酸氫鈉 | 適量 |
| 磷酸二氫鈉 | 適量 |
| 氯化鈉 | 適量 |
| 滅菌純水 | 適量 |

上述處方中，氟甲松龍之配合量變更爲 0.02g，聚氧乙炔硬化蓖麻油 60 之配合量變更爲 0.001、0.005、0.0075 或 0.01g，又，聚乙烯醇之配合量變更爲 0.00001、0.00005、0.0005、0.001、0.005 或 0.01g，亦可獲得相同於製劑例 2 之製劑。

產業上之利用領域

本發明提供一種點眼劑，係含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑，該點眼劑含有聚氧乙炔硬化蓖麻油或聚氧乙炔蓖麻油。又，本發明提供一種點眼劑，係含有聚氧乙炔硬化蓖麻油或聚氧乙炔蓖麻油，且含有選自甲基纖維素、聚乙烯吡咯烷酮及聚乙烯醇組成之群之至少一種者。

【圖式簡單說明】

無。

【元件符號說明】

無。

五、中文發明摘要：

本發明係以抑制懸浮型點眼劑中之氟甲松龍黏著於容器作為課題。藉由懸浮型點眼劑中含有聚氧乙烯硬化蓖麻油或聚氧乙烯蓖麻油，可抑制氟甲松龍黏著於容器。

六、英文發明摘要：

The object of the present invention relates to a suspended type eye drop comprising fluorometholone, which inhibits fluorometholone from adhering to the container. The suspended type eye drop can inhibit the fluorometholone from adhering to the container by comprising polyoxyethylene hardened castor oil or polyoxyethylene castor oil therein.

十、申請專利範圍：

1. 一種點眼劑，其係含有氟甲松龍（fluorometholone）之懸浮型點眼劑，該點眼劑含有0.0001~0.01%（W/V）之聚氧乙烯硬化蓖麻油或0.0001~0.01%（W/V）之聚氧乙烯蓖麻油。
2. 如申請專利範圍第1項之點眼劑，其進一步含有甲基纖維素、聚乙烯吡咯烷酮及聚乙烯醇組成之群之至少1種。
3. 如申請專利範圍第1項之點眼劑，其進一步含有甲基纖維素及聚乙烯醇組成之群之至少1種。
4. 如申請專利範圍第2項之點眼劑，其中甲基纖維素之濃度為0.00001~0.1%（W/V）。
5. 如申請專利範圍第2項之點眼劑，其中聚乙烯醇之濃度為0.00001~0.1%（W/V）。
6. 如申請專利範圍第2項之點眼劑，其中聚乙烯吡咯烷酮之濃度為0.00001~0.1%（W/V）。
7. 如申請專利範圍第2項之點眼劑，其中甲基纖維素之濃度為0.0001~0.01%（W/V）。
8. 如申請專利範圍第2項之點眼劑，其中聚乙烯醇之濃度為0.0001~0.01%（W/V）。
9. 如申請專利範圍第1至8項中任一項之點眼劑，其中氟甲松龍之濃度為0.02~0.1%（W/V）。
10. 一種抑制點眼劑含有之氟甲松龍黏著於容器之方法，其係為於含有氟甲松龍之懸浮型點眼劑中，藉由配合0.0001~0.01%（W/V）之聚氧乙烯硬化蓖麻油或0.0001

~ 0.01% (W/V) 之聚氧乙炔蓖麻油，而抑制該點眼劑中含有之氟甲松龍黏著於容器之方法。

11. 如申請專利範圍第 10 項之方法，其進一步配合甲基纖維素、聚乙炔吡咯烷酮及聚乙炔醇組成之群之至少 1 種。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：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。