

一种缓解视疲劳眼贴及其制备方法

申请号：[201110101597.5](#)

申请日：2011-04-22

申请(专利权)人 [沈阳药科大学](#)
地址 110016 辽宁省沈阳市沈河区文化路103号
发明(设计)人 [赵余庆](#) [史彩虹](#)
主分类号 [A61K9/70\(2006.01\)I](#)
分类号 [A61K9/70\(2006.01\)I](#) [A61K31/353\(2006.01\)I](#)
[A61P27/02\(2006.01\)I](#)
公开(公告)号 102166203A
公开(公告)日 2011-08-31
专利代理机构 [沈阳杰克知识产权代理有限公司](#) 21207
代理人 [李宇彤](#)



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 102166203 B

(45) 授权公告日 2013.08.28

(21) 申请号 201110101597.5

保健功能与应用.《营养研究》.2006,(第4期),135-139.

(22) 申请日 2011.04.22

审查员 李林

(73) 专利权人 沈阳药科大学

地址 110016 辽宁省沈阳市沈河区文化路
103号

(72) 发明人 赵余庆 史彩虹

(74) 专利代理机构 沈阳杰克知识产权代理有限公司 21207

代理人 李宇彤

(51) Int. Cl.

A61K 9/70(2006.01)

A61K 31/353(2006.01)

A61P 27/02(2006.01)

(56) 对比文件

CN 101474311 A, 2009.07.08,

CN 101716214 A, 2010.06.02,

CN 101040893 A, 2007.09.26,

王忠合等.葡萄籽原花青素提取物的

权利要求书1页 说明书4页

(54) 发明名称

一种缓解视疲劳眼贴及其制备方法

(57) 摘要

本发明涉及一种以原花青素为活性物质制备的缓解视疲劳眼贴及其制备方法,属于保健用品的技术领域。本发明所述的OPCs眼贴的组方及重量组成如下:OPCs2g,卡波姆3-7g、羧甲基纤维素钠0.8-2g、聚乙烯醇0.8-2g、三乙醇胺10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶7-15g、柠檬酸2-4g、甘油60-100g、1,2-丙二醇60-100g。该眼贴对于用眼过度引起的眼睛疲劳、干涩、发痒等症具有较好的疗效。

1. 一种缓解视疲劳眼贴,其特征在于,以原花青素为活性物质,其组方及重量组成如下:OPCs 2g,卡波姆 3-7g、羧甲基纤维素钠 0.8-2g、聚乙烯醇 0.8-2g、三乙醇胺 10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶 7-15g、柠檬酸 2-4g、甘油 60-100g、1,2-丙二醇 60-100g。

2. 如权利要求 1 所述的眼贴,其特征在于,所用的活性物质原花青素来源于葡萄皮、葡萄籽、葡萄梗、葡萄叶、酿制葡萄酒、酿制果汁后的葡萄废渣、酿制苹果汁后的废渣、蓝莓、紫薯。

3. 一种制备权利要求 1 所述的眼贴的方法,其特征在于,包括下列步骤:

1) 将卡波姆,羧甲基纤维素钠,聚乙烯醇分别加水溶胀,水浴溶解,混合,另加入三乙醇胺、聚丙烯酸树脂压敏胶、柠檬酸、甘油和 1,2-丙二醇搅拌均匀;

2) 将 OPCs 以 4 mL 纯化水分散后与上述基质搅拌混合均匀,得药物-胶粘剂液;

3) 将药胶涂布于背衬层上,50 °C 烘箱中干燥 40min,再于 60 °C 干燥 2 h 至表面固化有弹性后覆防粘层,再切割成适宜形状的眼贴,即得 OPCs 眼贴;

4) 装袋,每袋 2 贴,封口即成成品。

4. 根据权利要求 1 所述的眼贴,其特征在于,所述眼贴的形状为椭圆形、樱花形,鱼尾形。

一种缓解视疲劳眼贴及其制备方法

技术领域

[0001] 本发明涉及一种以原花青素为活性物质制备的缓解视疲劳眼贴制备方法和配方组合,属于保健用品的技术领域。

背景技术

[0002] 视疲劳,又称眼疲劳综合症,是因视器试图用不足的调节来获取清晰视觉的自主努力而产生的,如视物模糊、眼胀、眼痛、头痛、肩酸背痛及精神疲倦等症后群。随着信息时代的高速发展和生活节奏的加快,尤其是计算机、电视、游戏机、监视器等视屏显示终端(VDT)已逐渐融入人们的工作、学习和家庭生活中,视疲劳已成为目前眼科常见疾病,严重地影响了人们的生活。它不是独立的疾病,而是由于各种原因引起的一组疲劳综合征。目前,治疗方法有棱镜矫正、手术治疗、针灸等物理疗法;化学药物多采用副交感神经兴奋剂如 β -受体阻滞剂、甲钴胺等,以及神经营养剂和镇静剂等。但以上治疗都是针对症状而进行的,达不到根本治疗目的。现在研究发现,天然药物及中医药治疗该病疗效显著,正逐步成为患者的首选治疗药物。

[0003] 葡萄中富含的低聚原花青素(Oligomeric Proanthocyanidins,简称OPCs)是由儿茶素的单体、二聚体、三聚体等组合而成的多酚类物质。原花青素的药理学作用十分广泛,主要表现在抗氧化作用、心血管保护、抗肿瘤、抗炎、抗缺血再灌注损伤、抗衰老和抗疲劳等方面。OPCs显著的抗氧化性(其抗氧化能力是 V_C 的20倍, V_E 的50倍)、清除体内自由基的能力、改善人体微循环障碍等独特功效,目前已应用于医疗保健等领域,尤其在眼部健康方面可减少视网膜症、防治毛细血管出血,是治疗视疲劳的理想天然药物。

[0004] 1988年,Moriconi、Bellezza和Proto等分别研究了原花青素对近视患者视网膜敏感性和功能的影响。在第1项研究中,91名病人用300mg/d治疗30天后,眼黑暗适应性测量计描绘的曲线及主观症状均有明显改善。第二项研究是将40名患者平均分成2组,一组接受150mg/d原花青素治疗30天,另一组为对照组,结果表明,给药组的电功能参数获明显改善。

[0005] 1988年,Boissin和Corbe等分别研究了原花青素对视觉的影响。他们从两个治疗中心挑选了100名无严重视网膜疾病或其它眼科疾病的受试者并分成2组,一组接受200mg/d原花青素5周,另一组为对照组,用3种不同技术检测眼球在强光照射下药物所起的作用。实验结果表明,服原花青素者眼球在强光照射后的视觉性能比对照组有明显改善,表明原花青素能使视网膜结构得到较好营养。这是由于原花有素对微血管的保护最终使视紫红素再生率提高所致。

[0006] 1990年,Fusi等研究了原花青素治疗75名排字工人因工作性质造成的眼睛紧张症的效果。患者接受300mg/d原花青素的治疗,60天后,眼睛的反差敏感性比对照组有明显改善。

[0007] 吉林大学的马中春通过经口急性毒性试验、遗传毒性试验、30天喂养试验,对葡萄籽原花青素进行了安全性毒理学评价,结果显示:

[0008] 1. 葡萄籽原花青素的 LD50 大于 21.5g/kgbw, 根据毒性分级属无毒级 ;

[0009] 2. Ames 试验、小鼠骨髓嗜多染红细胞微核试验、小鼠精子畸形试验检测均为阴性结果, 未显示其对体细胞和生殖细胞致突变性 ;

[0010] 3. 30 天喂养试验对血常规、血生化指标、脏器重量、脏器系数及体重、增重、进食量、食物利用率等各项指标均未见不良影响。病理组织学观察, 肝、脾、肾、胃、十二指肠、睾丸、卵巢均未见有意义的病理改变。

[0011] OPCs 作为颇具开发前景的产品已广泛应用于各个领域。中国专利如 CN00121388.1 公开了一种葡萄籽提取物 OPCs 强抗氧化复合胶囊及其制备方法, 是具有延缓衰老、调节机体免疫功能的复方保健品 ; CN02159540.2 是以葡萄籽提取物为原料的用于抗衰老、抗癌、抗氧化、改善心脑血管等方面的胶囊剂的专利, 没有明确专一的治疗目的 ; CN200510042958.8 是利用原花青素的抗氧化性来治疗结肠炎 ; CN 200910071327.7 是以叶黄素、蓝莓提取物中的原花青素、 β -胡萝卜素、菊苷、菊花酮、枸杞多糖组合制备软胶囊, 缓解视疲劳。可见, 目前还没有外用缓解视疲劳、防治视疲劳的原花青素保健用品的专利发明。

发明内容

[0012] 本发明的目的在于提供一种可以预防眼部病变 ; 有效缓解眼睛疲劳、对抗视力下降 ; 滋润眼部、缓解眼睛干燥的 OPCs 眼贴。

[0013] 人体的眼部组织分布着极其丰富的血管, 这些血管包括动脉血管和细胞毛细血管, 眼部毛细血管被毒素等代谢垃圾堵塞, 就会产生眼疾。

[0014] 眼贴是指为了治疗眼部某种疾病所创造的类似于创可贴的膜。主要作用是治疗眼部疾病。采用纳米技术和生物发酵技术制成的眼膜膜体中含有上万个纳米小孔, 每个纳米孔中含有的有效成份和水分是普通膜体的 30 倍, 当膜体和眼部肌肤紧密结合时产生的压力可以让皮肤把有效成分和水分“吸进去”, 穿透角质层到达真皮层, 直达眼部各个细胞, 清除毒素, 比一般口服药物肠胃吸收速度提高 7 倍。

[0015] 本发明 OPCs 眼贴采用“透皮吸收”原理, 不经肝肾, 避免了肝脏首过效应, 同时不伤肝肾, 安全无毒副作用 ; 它避免了传统眼药水、眼药膏使用时存在眼角大量流失, 有效成分利用率低的缺点 ; 使用方便, 只需轻轻闭上眼睛, 将眼贴敷在眉毛下缘, 鼻子两侧, 轻轻抚平眼贴, 让眼贴与眼部皮肤充分接触, 闭目休息 30 分钟, 即可 ; 它的设计极其精美, 符合人们的眼部生理结构。

[0016] 本发明所述的 OPCs 眼贴的组方及重量组成如下 : OPCs 2g, 卡波姆 3-7g、羧甲基纤维素钠 0.8-2g、聚乙烯醇 0.8-2g、三乙醇胺 10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶 7-15g、柠檬酸 2-4g、甘油 60-100g、1,2-丙二醇 60-100g。

[0017] 一种制备如上所述眼贴的方法, 它包括下列步骤 : 1. 将卡波姆, 羧甲基纤维素钠, 聚乙烯醇分别加水溶胀, 水浴溶解, 混合。另加入三乙醇胺、聚丙烯酸树脂压敏胶、柠檬酸、甘油和 1,2-丙二醇搅拌均匀。2. 将 OPCs 以 4 mL 纯化水分散后与上述基质搅拌混合均匀, 得药物-胶粘剂液。3. 将药胶涂布于背衬层上, 50 °C 烘箱中干燥 40min, 再于 60 °C 干燥 2 h 至表面固化有弹性后覆防粘层, 再切割成适宜形状的眼贴, 即得 OPCs 眼贴。4. 装袋, 每袋 2 贴, 封口即成成品。

[0018] 所述的 OPCs 来源是指葡萄(皮、籽、梗、叶)、酿制葡萄酒(或果汁)后的葡萄废渣、酿制苹果汁后的苹果废渣、蓝莓、紫薯等。

[0019] 所述的眼贴可制成椭圆形、樱花形,鱼尾形等形状。

[0020] 本发明利用现代科学技术进行工艺研究,同时研究建立高水平的产品质量标准,进行产品的稳定性研究,确保产品质量。

具体实施方式

[0021] 以下为本发明具体实施方式:

[0022] 实施例 1 剂型 I OPCs 眼贴的制备

[0023] 配方: OPCs 2g,卡波姆 5g、羧甲基纤维素钠 1.5g、聚乙烯醇 1.5g、三乙醇胺 10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶 10g、柠檬酸 3g、甘油 80g、1,2-丙二醇 80g。

[0024] 制备方法:1. 将卡波姆,羧甲基纤维素钠,聚乙烯醇分别加水溶胀,水浴溶解,混合。另加入三乙醇胺、聚丙烯酸树脂压敏胶、柠檬酸、甘油和 1,2-丙二醇搅拌均匀。2. 将 OPCs 以 4 mL 纯化水分散后与上述基质搅拌混合均匀,得药物-胶粘剂液。3. 将药胶涂布于背衬层上,50℃烘箱中干燥 40min,再于 60℃干燥 2 h 至表面固化有弹性后覆防粘层,再切割成 4cm*2cm 椭圆形的眼贴,即得 OPCs 眼贴。4. 装袋,每袋 2 贴,封口即成成品。

[0025] 功能与主治:由于用眼过度引起的眼睛疲劳、干涩、发痒等症。

[0026] 用法用量:外用,闭上眼睛,将眼贴敷在眉毛下缘,鼻子两侧,轻轻抚平眼贴,让眼贴与眼部皮肤充分接触,闭目休息 30 分钟,即可。一日一次,一次二贴,每个疗程 15 天。

[0027] 实施例 2 剂型 II OPCs 眼贴的制备

[0028] 配方:OPCs 2g,卡波姆 3g、羧甲基纤维素钠 0.8g、聚乙烯醇 1.2g、三乙醇胺 10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶 8g、柠檬酸 2g、甘油 70g、1,2-丙二醇 60g。

[0029] 制备方法:1. 将卡波姆,羧甲基纤维素钠,聚乙烯醇分别加水溶胀,水浴溶解,混合。另加入三乙醇胺、聚丙烯酸树脂压敏胶、柠檬酸、甘油和 1,2-丙二醇搅拌均匀。2. 将 OPCs 以 4 mL 纯化水分散后与上述基质搅拌混合均匀,得药物-胶粘剂液。3. 将药胶涂布于背衬层上,50℃烘箱中干燥 40min,再于 60℃干燥 2 h 至表面固化有弹性后覆防粘层,再切割成 4cm*2cm 椭圆形的眼贴,即得 OPCs 眼贴。4. 装袋,每袋 2 贴,封口即成成品。

[0030] 功能与主治:由于用眼过度引起的眼睛疲劳、干涩、发痒等症。

[0031] 用法用量:外用,闭上眼睛,将眼贴敷在眉毛下缘,鼻子两侧,轻轻抚平眼贴,让眼贴与眼部皮肤充分接触,闭目休息 30 分钟,即可。一日一次,一次二贴,每个疗程 15 天。

[0032] 实施例 3 剂型 III OPCs 眼贴的制备

[0033] 配方:OPCs 2g,卡波姆 7g、羧甲基纤维素钠 2g、聚乙烯醇 1.8g、三乙醇胺 10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶 12g、柠檬酸 3g、甘油 100g、1,2-丙二醇 80g。

[0034] 制备方法:1. 将卡波姆,羧甲基纤维素钠,聚乙烯醇分别加水溶胀,水浴溶解,混合。另加入三乙醇胺、聚丙烯酸树脂压敏胶、柠檬酸、甘油和 1,2-丙二醇搅拌均匀。2. 将 OPCs 以 4 mL 纯化水分散后与上述基质搅拌混合均匀,得药物-胶粘剂液。3. 将药胶涂布于背衬层上,50℃烘箱中干燥 40min,再于 60℃干燥 2 h 至表面固化有弹性后覆防粘层,再切割成 4cm*2cm 椭圆形的眼贴,即得 OPCs 眼贴。4. 装袋,每袋 2 贴,封口即成成品。

[0035] 功能与主治:由于用眼过度引起的眼睛疲劳、干涩、发痒等症。

[0036] 用法用量:外用,闭上眼睛,将眼贴敷在眉毛下缘,鼻子两侧,轻轻抚平眼贴,让眼贴与眼部皮肤充分接触,闭目休息 30 分钟,即可。一日一次,一次二帖,每个疗程 15 天。

[0037] 实施例 4 剂型 IV OPCs 眼贴的制备

[0038] 配方:OPCs 2g,卡波姆 6g、羧甲基纤维素钠 1.5g、聚乙烯醇 1g、三乙醇胺 10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶 15g、柠檬酸 4g、甘油 90g、1,2-丙二醇 90g。

[0039] 制备方法:1. 将卡波姆,羧甲基纤维素钠,聚乙烯醇分别加水溶胀,水浴溶解,混合。另加入三乙醇胺、聚丙烯酸树脂压敏胶、柠檬酸、甘油和 1,2-丙二醇搅拌均匀。2. 将 OPCs 以 4 mL 纯化水分散后与上述基质搅拌混合均匀,得药物-胶粘剂液。3. 将药胶涂布于背衬层上,50 °C 烘箱中干燥 40min,再于 60 °C 干燥 2 h 至表面固化有弹性后覆防粘层,再切割成 4cm*2cm 椭圆形的眼贴,即得 OPCs 眼贴。4. 装袋,每袋 2 贴,封口即成成品。

[0040] 功能与主治:由于用眼过度引起的眼睛疲劳、干涩、发痒等症。

[0041] 用法用量:外用,闭上眼睛,将眼贴敷在眉毛下缘,鼻子两侧,轻轻抚平眼贴,让眼贴与眼部皮肤充分接触,闭目休息 30 分钟,即可。一日一次,一次二帖,每个疗程 15 天。

[0042] 实施例 5 剂型 V OPCs 眼贴的制备

[0043] 配方:OPCs 2g,卡波姆 5g、羧甲基纤维素钠 1.8g、聚乙烯醇 1.5g、三乙醇胺 10ml、聚丙烯酸树脂压敏胶 10g、柠檬酸 3g、甘油 75g、1,2-丙二醇 80g。

[0044] 制备方法:1. 将卡波姆,羧甲基纤维素钠,聚乙烯醇分别加水溶胀,水浴溶解,混合。另加入三乙醇胺、聚丙烯酸树脂压敏胶、柠檬酸、甘油和 1,2-丙二醇搅拌均匀。2. 将 OPCs 以 4 mL 纯化水分散后与上述基质搅拌混合均匀,得药物-胶粘剂液。3. 将药胶涂布于背衬层上,50 °C 烘箱中干燥 40min,再于 60 °C 干燥 2 h 至表面固化有弹性后覆防粘层,再切割成 4cm*2cm 椭圆形的眼贴,即得 OPCs 眼贴。4. 装袋,每袋 2 贴,封口即成成品。

[0045] 功能与主治:由于用眼过度引起的眼睛疲劳、干涩、发痒等症。

[0046] 用法用量:外用,闭上眼睛,将眼贴敷在眉毛下缘,鼻子两侧,轻轻抚平眼贴,让眼贴与眼部皮肤充分接触,闭目休息 30 分钟,即可。一日一次,一次二帖,每个疗程 15 天。

[0047] 以下通过药效试验来进一步证明本发明所述的疗效。

[0048] 实验用药物:本发明剂型 I OPCs 眼贴。

[0049] 试验例 1:本发明 OPCs 眼贴治疗视疲劳的临床观察 I

[0050] 治疗由于长期近距离用眼的调节性视疲劳患者 156 例,分成 2 组,各 78 人。一组接受 OPCs 眼贴治疗,一个疗程(一个月);另一组为对照组,只采用综合疗法如屈光矫正、Pilocarpin 滴眼液点眼治疗等,有效率分别为 92%、36%,两者比较差异有明显性意义。

[0051] 试验例 2:本发明 OPCs 眼贴治疗视疲劳的临床观察 II

[0052] 治疗从事计算机工作、大量看电视、玩游戏机等 VDT 视疲劳症患者 90 例,平均分为 2 组,一组接受 OPCs 眼贴的治疗,另一组为对照组,采用一般疗法。60 天后,治疗组 45 名患者眼睛的反差敏感性比对照组有明显改善,治愈 42 例,好转 3 例,有效率 93%。

[0053] 本发明的适应症:由于用眼过度引起的眼睛疲劳、干涩、发痒等症。

[0054] 本发明科技含量高,能够预防眼部病变;有效缓解眼睛疲劳、对抗视力下降;使用安全、高效、稳定。