

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200810140815.4

[51] Int. Cl.

A61K 31/7048 (2006.01)

A61K 31/045 (2006.01)

A61P 27/02 (2006.01)

[43] 公开日 2008 年 12 月 17 日

[11] 公开号 CN 101322717A

[22] 申请日 2008.7.28

[21] 申请号 200810140815.4

[71] 申请人 河南太龙药业股份有限公司

地址 450001 河南省郑州市郑州高新技术产  
业开发区金梭路 8 号

[72] 发明人 邢泽田 姚 静

[74] 专利代理机构 郑州中民专利代理有限公司

代理人 郭中民

权利要求书 1 页 说明书 4 页

[54] 发明名称

一种防治眼睛疾病药物组合物

[57] 摘要

一种防治眼睛疾病药物组合物，其特征在于：  
所述药物组合物以黄芩苷，冰片为药物成分，配以  
渗透压调节剂、pH 值调节剂，其重量比为黄芩苷  
20-80g、冰片 0.1-10g、渗透压调节剂 0-4.2g、  
增稠剂 0-2.5g。本发明具有抗菌消炎、驱风清  
热、解毒退翳的功效。可用于眼科抗感染的治疗，  
主要用于结膜炎、角膜炎、沙眼、麦粒肿等，同时  
可缓解视疲劳，明目祛翳。

1. 一种防治眼睛疾病药物组合物，其特征在于：所述药物组合物以黄芩苷，冰片为药物成分，配以渗透压调节剂、PH 值调节剂，其重量比为黄芩苷 20-80 g、冰片 0.1-10 g、渗透压调节剂 0-4.2g、增稠剂 0-2.5g。

2. 根据权利要求 1 所述的药物组合物，其特征在于：所含药物成分及重量比为：黄芩苷 30-60 g、冰片 0.2-6 g、渗透压调节剂 0-4.2g、增稠剂 0-2.5g。

## 一种防治眼睛疾病药物组合物

### 技术领域

本发明属中药制药技术领域，具体涉及了一种防治眼睛疾病的药物组合物。

### 背景技术

我国常见的眼科疾病分布于青少年到中老年的各年龄层，主要有近视、沙眼、结膜炎（红眼病）以及青光眼和白内障这五大类眼病。现有治疗眼科疾病的中、西药滴眼液中，西药滴眼液以抗菌、抗病毒药物较多，且普遍存在药物毒性较大、适应范围窄、长期使用易产生耐药性、容易复发等缺陷。而中药滴眼液在长期治疗眼科疾病的临床应用中疗效显著，无明显毒副作用，在治疗眼科疾病方面有着独特的优势。

### 发明内容

本发明的目的是为患者提供一种见效快、疗程短、性能稳定、无毒副作用的中药滴眼液——即一种防治眼睛疾病的药物组合物，为临床和患者提供一种新的选择。

本发明的目的可通过下述技术措施来实现：

本发明的眼用药物组合物以黄芩苷，冰片为药物成分，配以渗透压调节剂、PH值调节剂，其重量比为黄芩苷 20-80 g、冰片 0.1-10 g、渗透压调节剂 0-4.2g、增稠剂 0-2.5g。

进一步说，本发明的眼用药物组合物的原料及重量组成为：黄芩苷 30-60 g、冰片 0.2-6 g、渗透压调节剂 0-4.2g、增稠剂 0-2.5g。

本发明的药物组合物的制备方法可采用下述步骤来实现：按重量比取黄芩苷 20-80 g，加入 2-3 倍量（重量比）注射用水，搅匀，用氢氧化钠溶液(含量 20%)调节 PH 值 8.0-9.0，使溶解，并过滤；取冰片 0.1-10 g，用 1.0-10ml 乙醇溶解，缓缓加入上述滤液中，再加入渗透压调节剂、增稠剂等滴眼液附

加剂，充分搅拌，用 PH 值调节剂调节 PH 值至 5.5-8.0，最后用溶媒调整体积至 1000ml，微孔滤膜滤过，分装，即得。

本发明利用黄芩苷抗菌、抗病毒、抗炎、解热的药理作用，配上具有开窍醒神、清热止痛、明目祛翳之功的冰片，引导药物成分易到达病灶，起到奏效迅速、增强效果的作用。

黄芩苷 (Baicalin) 是从黄芩根中提取分离出来的一种黄酮类化合物，具有显著的生物活性，主要表现在以下几个方面：1. 抗炎抗变态反应：黄芩甙对豚鼠离体气管过敏性收缩及整体动物过敏性气喘有缓解作用，并与麻黄碱有协同作用。2. 抗菌：黄芩甙为黄芩抗菌成分之一，含 3% 本品的眼药水临床用于治疗沙眼，疗效与治疗沙眼较好的药物利福平相似。3. 利尿：黄芩甙对兔有利尿作用。4. 利胆：黄芩甙可增加犬、兔胆汁排泄量。5. 解热：腹腔或静脉注射给药时，黄芩甙对疫苗或酵母致热的家兔均能解热。6. 降压：静脉注射或肌肉注射或灌胃时犬、猫及兔均可引起降压。7. 镇静：黄芩甙抑制小鼠的自发活动。8. 其它：黄芩甙可降低小鼠的士的宁中毒死亡率，10 $\mu$ g 就能提高其 LD<sub>50</sub> 约 2-5 倍。黄芩甙能降低实验大鼠肝脏的总胆固醇、游离胆固醇和甘油三酸酯的水平。

冰片为龙脑香科植物龙脑香的加工品，其成分含右旋龙脑律草烯、 $\beta$ -榄香烯、石竹烯等。味辛，性寒，具开窍醒神、清热止痛功效，有通诸窍、散郁火，消肿去翳等作用。《新修本草》：“主心腹邪气，风湿积聚，耳聋，明目，去目赤肤翳。”《本草纲目》：“疗喉痹、脑痛、鼻瘕、齿痛、伤寒舌出、小儿痘陷。通诸窍，散郁火。”

冰片局部应用对感觉神经有较微刺激，有一定的止痛及温和的防腐作用。较高浓度 (0.5%) 对葡萄球菌、链球菌、肺炎双球菌、大肠杆菌及部分致病性皮肤真菌等有抑制作用。主要 (1) 用于目赤肿痛，喉痹口疮。本品苦寒，有清热止痛、消肿之功，为五官科常用药。治疗目赤肿痛，单用点眼即效。(2) 用于疮疡肿痛，溃后不敛。本品亦有清热解毒、防腐生肌作用。近代以本品搅溶于核桃油中滴耳，治疗急、慢性化脓性中耳炎，有较好疗效。此外，本品用治冠心病心绞痛及齿痛，有一定疗效。

本发明提供含有黄芩苷和冰片局部眼用药物组合物。特别是作为滴眼剂

能有效治疗眼部炎症，具有抗菌消炎、驱风清热、解毒退翳的功效。该药物是在总结多年临床经验的基础上研制而成，目前尚无以黄芩苷和冰片为原料联合使用治疗眼部疾病的相关报道。本发明还提供了该眼用药物组合物的制备方法。

本发明具有抗菌消炎、驱风清热、解毒退翳的功效。可用于眼科抗感染的治疗，主要用于结膜炎、角膜炎、沙眼、麦粒肿等，同时可缓解视疲劳，明目祛翳。

### 具体实施方式

本发明以下将结合实施例作进一步描述，但不应将此理解为本发明的范围仅限于以下的实例。凡基于本发明上述内容所实现的技术均属于本发明的范围。

#### 实施例 1:

按重量比取黄芩苷 30 g，加入 2 倍量（重量比）注射用水，搅匀，用氢氧化钠溶液（含量 20%）调节 PH 值 8.0，使溶解，并过虑；按重量比取冰片 0.15g，用 1.0ml 乙醇溶解，缓缓加入上述滤液中，再加入渗透压调节剂氯化钠 4.2g、增稠剂透明质酸钠 1.0g，充分搅拌，用 PH 值调节剂调节 PH 值至 6.0，最后加注射用水调整体积至 1000ml，微孔滤膜滤过，分装，即得。

#### 实施例 2:

按重量比取黄芩苷 20 g，加入 2 倍量（重量比）注射用水，搅匀，用氢氧化钠溶液（含量 20%）调节 PH 值 9.0，使溶解，并过虑；按重量比取冰片 0.2g，用 1.5ml 乙醇溶解，缓缓加入上述滤液中，充分搅拌，用 PH 值调节剂调节 PH 值至 6.0，最后加注射用水调整体积至 1000ml，微孔滤膜滤过，分装，即得。

#### 实施例 3:

按重量比取黄芩苷 25 g，加入 3 倍量（重量比）注射用水，搅匀，用氢氧化钠溶液（20%）调节 PH 值 8.4，使溶解，并过虑；按重量比取冰片 0.5 g，用 5ml 乙醇溶解，缓缓加入上述滤液中，再加入渗透压调节剂葡萄糖 4.0g、增稠剂透明质酸钠 1.5g，充分搅拌，用 PH 值调节剂调节 PH 值至 5.5，最后

加注射用水调整体积至 1000ml，微孔滤膜滤过，分装，即得。

**实施例 4:**

按重量比取黄芩苷 30 g，加入 2 倍量（重量比）注射用水，搅匀，用氢氧化钠溶液（20%）调节 PH 值 9.0，使溶解，并过虑；按重量比取冰片 0.45g，用 5ml 乙醇溶解，缓缓加入上述滤液中，再加入渗透压调节剂硼酸 4.1g、增稠剂透明质酸钠 0.8g，充分搅拌，用 PH 值调节剂调节 PH 值至 6.5，最后加注射用水调整体积至 1000ml，微孔滤膜滤过，分装，即得。

**实施例 5:**

按重量比取黄芩苷 60 g，加入 2 倍量（重量比）注射用水，搅匀，用氢氧化钠溶液（20%）调节 PH 值 9.0，使溶解，并过虑；按重量比取冰片 0.15g，用 2ml 乙醇溶解，缓缓加入上述滤液中，充分搅拌，用 PH 值调节剂调节 PH 值至 6.8，最后加注射用水调整体积至 1000ml，微孔滤膜滤过，分装，即得。