



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 02825507.0

[43] 公开日 2005 年 4 月 13 日

[11] 公开号 CN 1606430A

[22] 申请日 2002.12.10 [21] 申请号 02825507.0
[30] 优先权
[32] 2001.12.18 [33] US [31] 10/022,482
[86] 国际申请 PCT/US2002/039375 2002.12.10
[87] 国际公布 WO2003/051979 英 2003.6.26
[85] 进入国家阶段日期 2004.6.18
[71] 申请人 美帝色斯医学制药集团
地址 美国亚利桑那州
[72] 发明人 乔纳·沙克奈 尤金·H·甘斯

[74] 专利代理机构 北京律盟知识产权代理有限公司
代理人 王允方 刘国伟

权利要求书 7 页 说明书 8 页

[54] 发明名称 用于高吸附皮肤材料和输送硫的组合物和方法

[57] 摘要

一种用于向皮肤输送硫并吸收皮肤中的刺激物的组合物和方法。应用一种包含非膨胀性粘土、树脂、膨胀性粘土、硅及其组合的高吸附底材。对刺激物的吸收不阻碍活性成分向皮肤的输送。

ISSN 1008-4274

1. 一种用于吸收皮肤中的刺激物并向皮肤输送硫的方法，其包含：
施用一种组合物，其中所述组合物包含一种或多种高吸附底材、硫及一种或多种硫衍生物；
用所述组合物从皮肤吸收刺激物；并且
向皮肤输送硫，其中所述皮肤包含由表皮、真皮、及角质层组成的群组中一种或多种皮肤。
2. 根据权利要求1所述的方法，其中所述高吸附底材包含由非膨胀性粘土、膨胀性粘土及硅所组成的群组中一种或多种物质。
3. 根据权利要求2所述的方法，其中所述组合物具有约 6.5 至约 8.1 的 pH 值。
4. 根据权利要求2所述的方法，其中所述组合物具有约 7.0 至约 8.1 的 pH 值。
5. 根据权利要求2所述的方法，其中所述组合物具有约 7.7 至约 8.1 的 pH 值。
6. 根据权利要求2所述的方法，其中所述组合物具有约 7.3 至约 7.7 的 pH 值。
7. 根据权利要求2所述的方法，其中所述非膨胀性粘土包含水合硅酸铝。
8. 根据权利要求2所述的方法，其中所述非膨胀性粘土包含高岭土。
9. 根据权利要求2所述的方法，其中所述非膨胀性粘土占约 18.00%。
10. 根据权利要求1所述的方法，其中所述硫衍生物包含一种或多种阳离子硫化合物。
11. 根据权利要求1、2或3中任一权利要求所述的方法，其中所述硫衍生物包含由下列各物所组成的群组中一种或多种物质：有机硫化物、无机硫化物、无机亚硫酸盐、有机硫醇、无机硫醇、阳离子硫化合物、硫化硒、硫化钾、多硫化钾、及多硫化多钙、 H_2S 、硫酸、二硫化物、二氧化硫、硫醇类、有机盐、及乙酰磺胺钠。

12. 根据权利要求 1、2 或 3 中任一权利要求所述的方法，其中所述硫衍生物包含由乙酰磺胺钠、亚硫酸盐、及硫醇所组成的群组中的一种或多种物质。
13. 根据权利要求 1、2 或 3 中任一权利要求所述的方法，其中所述硫衍生物包含乙酰磺胺钠。
14. 根据权利要求 1 所述的方法，其中所述硫衍生物占约 10%。
15. 根据权利要求 1 所述的方法，其中所述硫占约 5%。
16. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述树胶包含黄原胶。
17. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述树胶包含天然树胶。
18. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述树胶包含人造树胶。
19. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述树胶占约 0.30%。
20. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述膨胀性粘土包含由下列各物所组成的群组中一种或多种物质：蒙脱土、膨润土、斜发沸石、蛭石、马戈石、蒙脱石、合成锂皂石、贝得石、及硅酸镁铝。
21. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述膨胀性粘土包含硅酸镁铝。
22. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述膨胀性粘土占约 1.50%。
23. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述硅包含由以下各物组成的群组中一种或多种物质：氧化硅、硅溶胶、水合硅溶胶、白炭黑、硅胶、及二氧化硅。
24. 根据权利要求 2 所述的方法，其中所述硅包含二氧化硅。

25. 根据权利要求 2 所述的方法, 其中所述硅占约 5.00%。
26. 根据权利要求 2 所述的方法, 其中所述组合物进一步包含水。
27. 根据权利要求 26 所述的方法, 其中所述水占约 40-50%。
28. 根据权利要求 26 所述的方法, 其中所述水占约 41.76%。
29. 根据权利要求 26 所述的方法, 其中所述水占约 46.76%。
30. 根据权利要求 1、2 或 3 中任一权利要求所述的方法, 其中所述刺激物包含由汗液、皮脂、湿气、表皮代谢物、来自美容剂的残留物以及来自医药品的残留物所组成的群组中一种或多种物质。
31. 一种高吸附组合物, 其包含: 硫、一种或多种硫衍生物及一种或多种高吸附底材。
32. 根据权利要求 31 所述的组合物, 其中所述高吸附底材包含由非膨胀性粘土、树胶、膨胀性粘土及硅所组成的群组中一种或多种物质。
33. 根据权利要求 31 所述的组合物具有约 6.5 至约 8.1 的 pH 值。
34. 根据权利要求 31 所述的组合物具有约 7.0 至约 8.1 的 pH 值。
35. 根据权利要求 31 所述的组合物具有约 7.7 至约 8.1 的 pH 值。
36. 根据权利要求 31 所述的组合物具有约 7.3 至约 7.7 的 pH 值。
37. 根据权利要求 32 所述的组合物, 其中所述非膨胀性粘土包含水合硅酸铝。
38. 根据权利要求 32 所述的组合物, 其中所述非膨胀性粘土包含高岭土。
39. 根据权利要求 32 所述的组合物, 其中所述非膨胀性粘土占约 18.00%。

40. 根据权利要求 31 所述的组合物，其中所述硫衍生物包含一种或多种阳离子硫化合物。
41. 根据权利要求 31、32、或 33 中任一权利要求所述的组合物，其中硫衍生物包含由以下各物所组成的群组中一种或多种物质：有机硫化物、无机硫化物、无机亚硫酸盐、有机硫醇、无机硫醇、阳离子硫化合物、硫化硒、硫化钾、多硫化钾、及多硫化多钙、 H_2S 、硫酸、二硫化物、二氧化硫、硫醇类、有机盐、及乙酰磺胺钠。
42. 根据权利要求 31、32、或 33 中任一权利要求所述的组合物，其中所述硫衍生物包含由乙酰磺胺钠、亚硫酸盐及硫醇所组成的群组中一种或多种物质。
43. 根据权利要求 31、32、或 33 中任一权利要求所述的组合物，其中所述硫衍生物包含乙酰磺胺钠。
44. 根据权利要求 31 所述的组合物，其中硫衍生物占约 10%。
45. 根据权利要求 31 所述的组合物，其中所述硫占约 5%。
46. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述树胶包含黄原胶。
47. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述树胶包含天然树胶。
48. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述树胶包含人造树胶。
49. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述树胶占约 0.30%。
50. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述膨胀性粘土包含由下列各物所组成的群组中一种或多种物质：蒙脱土、膨润土、斜发沸石、蛭石、马戈石、蒙脱石、合成锂皂石、贝得石及硅酸镁铝。
51. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述膨胀性粘土包含硅酸镁铝。

-
52. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述膨胀性粘土占约 1.50%。
53. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述硅包含由下列各物所组成的群组中一种或多种物质：氧化硅、硅溶胶、水合硅溶胶、白炭黑、硅胶、及二氧化硅。
54. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述硅包含二氧化硅。
55. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述硅占约 5.00%。
56. 根据权利要求 32 所述的组合物，其中所述组合物进一步包含水。
57. 根据权利要求 56 所述的组合物，其中所述水占约 40-50%。
58. 根据权利要求 56 所述的组合物，其中所述水占约 41.76%。
59. 根据权利要求 56 所述的组合物，其中所述水占约 46.76%。
60. 根据权利要求 31、32、或 33 中任一权利要求所述的组合物，其中所述刺激物包含由汗液、皮脂、湿气、表皮代谢物、来自美容剂的残留物及来自医药品的残留物所组成的群组中一种或多种物质。
61. 一种组合物，其包含：水；黄原胶；硅酸镁铝；高岭土；二氧化硅；乙酰磺胺钠；硫代硫酸钠；甘油硬脂酸酯；PEG-100 硬脂酸酯；皂树提取物；苧醇；及硫。
62. 一种组合物，其包含：水；黄原胶；高岭土；二氧化硅；乙酰磺胺钠；硫代硫酸钠；甘油硬脂酸酯及 PEG-100 硬脂酸酯；皂树提取物；苧醇；及沉淀硫。
63. 一种用于提高硫在皮肤中的吸收的方法，其包含：
施用一种组合物，其中所述组合物包含一种或多种高吸附底材、硫及一种或多种硫衍生物；
且吸收皮肤中的硫，其中所述皮肤包含由表皮、真皮、及角质层所组成的群组中一

种或多种皮肤。

64. 据权利要求 63 所述的方法，其中所述高吸附底材包含由非膨胀性粘土、树胶、膨胀性粘土及硅所组成的群组中一种或多种物质。
65. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述组合物具有约 6.5 至约 8.1 的 pH 值。
66. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述非膨胀性粘土包含水合硅酸铝。
67. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述非膨胀性粘土包含高岭土。
68. 根据权利要求 63 所述的方法，其中所述硫衍生物包含一种或多种阳离子硫化合物。
69. 根据权利要求 63、64、或 65 中任一权利要求所述的方法，其中所述硫衍生物包含由乙酰磺胺钠、亚硫酸盐、及硫醇所组成的群组中一种或多种物质。
70. 根据权利要求 63、64、或 65 中任一权利要求所述的方法，其中所述硫衍生物包含乙酰磺胺钠。
71. 根据权利要求 63 所述的方法，其中所述硫衍生物占约 10%。
72. 根据权利要求 63 所述的方法，其中所述硫衍生物占约 5%。
73. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述树胶包含天然树胶。
74. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述树胶包含人造树胶。
75. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述膨胀性粘土包含由下列各物所组成的群组中一种或多种物质：蒙脱土、膨润土、斜发沸石、蛭石、马戈石、蒙脱石、合成锂皂石、贝得石及硅酸镁铝。
76. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述膨胀性粘土包含硅酸镁铝。

-
77. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述硅包含由下列各物所组成的群组中一种或多种物质：氧化硅、硅溶胶、水合硅溶胶、白炭黑、硅胶、及二氧化硅。
78. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述硅包含二氧化硅。
79. 根据权利要求 64 所述的方法，其中所述组合物进一步包含水。
80. 根据权利要求 79 所述的方法，其中所述水占约 40-50%。
81. 一种向皮肤输送硫且吸收皮肤中的刺激物的方法，其包含：
施用一种组合物，其中所述组合物包含一种或多种高吸附底材、硫、及一种或多种硫衍生物，其中所述组合物具有约 6.5 至约 8.1 的 pH 值，其中所述高吸附底材包含非膨胀性粘土、树胶、膨胀性粘土及硅；
用所述组合物从皮肤吸收刺激物，其中所述刺激物包含由下列各物所组成的群组中一种或多种物质：汗液、皮脂、湿气、表皮代谢物、来自美容剂的残留物及来自医药品的残留物；以及
向皮肤输送硫，其中所述皮肤包含由表皮、真皮及角质层所组成的群组中一种或多种皮肤。

用于高吸附皮肤材料和输送硫的组合物和方法

技术领域

本发明涉及用于吸收皮肤上的皮脂、汗液、及其他物质而且能够向包括（但不限于）表皮、真皮及角质层在内的皮肤输送硫的组合物和方法。

背景技术

通过包括（但不限于）皮脂（皮脂腺的脂肪分泌物）、汗液、化妆品、和污垢、以及来自施用于皮肤的美容剂和医药品的残留物在内的堆积于皮肤上的材料（统称“皮肤材料”（skin material））可使皮肤受到刺激并且使某些皮肤病恶化。用大量溶液、洗剂以及乳剂治疗患有包括（但不限于）皮脂溢、酒糟鼻及播散性痤疮的患者。然而，即使在使用这些治疗的过程中或使用之后，包括（但不限于）皮肤材料的皮肤刺激物的问题仍在持续。

发明内容

本发明提供对包括（但不限于）角质层、表皮、及真皮的皮肤输送硫和其皮肤吸收，同时也吸收皮肤刺激物（包括但不限于：皮肤材料，如汗液、皮脂、湿气、表皮代谢物、以及来自于施用在皮肤上的美容剂和医药品的残留物的成分）。在先前技术中，已经知道这两种作用相互对立，吸收作用抑制硫或硫衍生物的输送。

硫（或元素硫）为化学活性元素，除了其元素形式之外，硫形成许多化合物。适合使用于本发明中的硫形式是那些已知可用于皮肤病学组合物的元素硫形式，包括（但不限于）：胶态硫、涂层硫、夹心硫（enrobed sulfur）、圈闭硫（entrapped sulfur）、烟熏硫、沉淀硫、洗涤硫、及升华硫、硫乳、以及硫华。用于本发明中优选的元素硫形式为沉淀硫。

“硫衍生物”是指任何组合物，其含有有机或无机硫化物、无机亚硫酸盐、有机或无机硫醇，或任何其他不施用于使用者的皮肤或头发的含硫物，包括（但不限于）阳离子硫化物，如硫化硒、硫化钾、多硫化钾（poly-potassium sulfide）、多硫化多钙（poly-calcium poly-sulfide）、 H_2S 、硫酸、二硫化物、二氧化硫、硫醇类（thiol）、有机盐、乙酰磺胺钠、或其组合（最佳为乙酰磺胺钠）。

适合于与本发明有关用途的无机硫化物是那些已知为可用于皮肤病学组合物中的无机硫化物且包括（但不限于）硫化硒、硫代硫酸钠、以及那些具有下式的无机硫化物：

RS、RSH、 R_2S 、RSSR、或 RSSH，其中 R 为可用离子键或共价键与硫结合的无机元素。

适合于与本发明有关用途的有机硫化物是那些已知可用于皮肤病学组合物中的有机硫化物且包括（但不限于）具有下式的有机硫化物：RS、 R_2S 、RSH、R'SSR'、或 R'SSH，其中 R'为可用离子键或共价键与硫结合的有机化合物及其盐类。示范性有机硫化物包括（但不限于）：巯基乙酸钠（sodium thioglycolate 或 sodium mercaptoacetic acid）、和谷胱甘肽（gluathione）。

适用于本发明的无机亚硫酸盐是那些已知可用于皮肤病学组合物中的无机亚硫酸盐，包括（但不限于）：亚硫酸盐和偏亚硫酸氢盐。

活性成份（活性成份包括但不限于硫及硫衍生物）的载剂在与活性成份相容且对被试者无害的意义上必须是“皮肤病学上可接受的”。载剂包括那些适合于局部投药的载剂而且可通过所属领域中已知的方法来制备。

将皮肤定义为包括在哺乳动物、优选为人类、猫或狗身上的表皮、真皮、角质层或其组合。

本发明的一个实施例为高吸附组合物，其包含硫和一种或多种硫衍生物，及一种或多种高吸附底材。高吸附底材包含一种或多种非膨胀性粘土、一种或多种树胶、一种或多种膨胀性粘土、一种或多种硅、或其组合。该高吸附底材既允许硫和硫衍生物的渗入又允许其向皮肤的输送，而且还吸收皮肤刺激物（或刺激物），包括（但不限于）皮肤材料。

可将硫作为元素硫或作为硫衍生物用治疗上有效的方法向皮肤输送。一经输送至皮肤，硫或硫衍生物可直接作用或首先被转化为另一种含硫的化学个体。

粘土材料是吸附性矿物，其特征为低容积密度和层化晶格晶体结构。这些矿物衍生自硅酸 H_4SiO_4 的浓缩形式，其每一个硅原子被四个氧原子包围形成四面体结构。当四面体结构通过分享共用氧原子而被连接到一起时形成链或二维层片。粘土材料是由带有中心氧化铝八面体层片的所述氧化硅四面体层片所组成。非膨胀性粘土优选包含高岭土、具有近似分子式 $Al_2O_3 \cdot 2SiO_2 \cdot H_2O$ 的水合硅酸铝（如 Vancley）。已知当干燥的膨胀性粘土与水相接触时会膨胀到很大的程度，且其包括蒙脱石，例如：蒙脱土、膨润土、斜发沸石、蛭石、马戈石（magadite）、蒙脱石、合成锂皂石（laponite）、及贝得石（beidellite），较佳为硅酸镁铝，如 RT. Vanderbilt Company, Inc., Norwalk, Connecticut 的 Veegum Ultra。

树胶包含天然树胶、人造树胶或其组合，优选为黄原胶，其为通过用黄原单胞菌（*Xanthomonas campestris*）对碳水化合物进行纯系发酵来生产的高分子量杂多糖树胶，如 Calgon Corporation, Pittsburgh, PA 的 Keltrol CGF。

硅意味着任何含有氧化硅、硅溶胶、胶状水合氧化硅、白炭黑、或硅胶的组合物，其包括（但不限于）二氧化硅。

另一个实施例包括一种组合物，其包含：水、黄原胶、硅酸镁铝、高岭土、二氧化硅、乙酰磺胺钠、硫代硫酸钠、甘油硬脂酸酯、PEG-100 硬脂酸酯、皂树提取物、苜蓿醇、及硫。

具体实施方式

本发明不局限于具体说明中所描述的任何机制，因为本发明通过权利要求来界定。

本发明的一个实施例是一种组合物，其包含：硫，一种或多种诸如乙酰磺胺钠、亚硫酸盐、硫醇或其组合（优选为乙酰磺胺钠）的硫衍生物，及包含高吸附底材的医药上可接受的载剂。当该组合物沉积在动物皮肤（较佳为人类皮肤）上时，硫和硫衍生物可通过诸如皮脂、湿气及汗液组分的皮肤材料在皮肤表层内或者既在皮肤表层内又在其上转化成硫衍生物。这些硫衍生物可具有抗微生物、抗真菌、抗寄生物的好处或其混合。该组合物吸收如皮肤材料的刺激物。

在另一个实施例中，高吸附底材包含：一种或多种非膨胀性粘土（包括但不限于高岭土）、一种或多种膨胀性粘土（包括但不限于蒙脱粘土，优选为硅酸镁铝、膨润土、锂蒙脱石（如 Rheox, Inc., Hightstown, New Jersey 的 Bentone® 38，其为锂蒙脱石二甲基二硬脂酰铵（dimethyldistearyl ammonium hectorite），是一种悬浮剂/非表面活性剂和溶剂/粘度还原剂，且是表面活性蒙脱土）、包括但不限于锂蒙脱石硬脂基二甲苄基铵（stearalkonium hectorite）、一种或多种天然树胶（包括但不限于：黄原胶、瓜尔胶、阿拉伯树胶、角叉胶及 肌酸盐）、一种或多种非离子表面活性剂（包括但不限于：硬脂酸酯、棕榈硬脂酸酯（palmitostearate）、甘油酯、山梨醇酐酯、聚氧乙烯、聚氧乙烯乙二醇酯（polyoxyethylene glycol ester）、C₂₀-C₂₄ 甘油基以及乳化蜡）以及一种或多种亲水性溶剂（包括但不限于：水、甘油、丙二醇及聚乙二醇）。

本发明的一个实施例包含一种用于从皮肤吸收刺激物并向皮肤输送硫的方法。向受影响的皮肤局部施用硫、一种或多种硫衍生物（诸如乙酰磺胺钠、亚硫酸盐、硫醇或其组合，最佳为乙酰磺胺钠）、及高吸附底材的 pH 为约 6.5 到约 8.1 的组合物。所述高吸附底材包含非膨胀性粘土、树胶、膨胀性粘土、硅或其组合。非膨胀性粘土较佳占约 15-20%，更佳占约 18.00%（所有百分比为重量百分比）。膨胀性粘土较佳占约 1.00-2.00%，更佳占约 1.50%。硅较佳占约 0.00-10.00%，更佳占约 5.00%。该组合物施用于皮肤，从皮肤吸收刺激物，并向皮肤输送硫。被输送的硫可能来自硫、硫衍生物或其组合。

另一个实施例包括一种组合物，其包含：水、黄原胶、硅酸镁铝、高岭土、二氧化硅、乙酰磺酸钠、硫代硫酸钠、甘油硬脂酸酯、PEG-100 硬脂酸酯、皂树提取物（如 Gattefosse S.A., Saint Priest Cedex, France 的 Vegetal® Bois de Panama 或 Quillaia Vegetol® GR038 Hydro，前者为丙二醇和水的混合物）、苧醇、及硫。甘油硬脂酸酯和 PEG-100 硬脂酸酯（如 Lipo Chemicals, Inc. Paterson, New Jersey 的 Lipomulse® 165）具有软化、乳化及表面活性剂的性质。本发明中的高吸附底材促进刺激物的吸附但不抑制向皮肤输送活性成分、硫衍生物。

本发明的另一个实施例是一种用于提高皮肤中硫的吸附的方法。向受影响的皮肤局部施用硫，较佳为乙酰磺胺钠、亚硫酸盐、硫醇或其组合的一种或多种硫衍生物（最佳为乙酰磺胺钠），及高吸附底材的 pH 为约 6.5 到约 8.1 的组合物。硫衍生物较佳占以重量计约 10%-15%。硫可被吸收进皮肤中；而且可能来自硫、硫衍生物或其组合。

本发明的另一个实施例是一种向皮肤输送硫（来自组合物中的硫、硫衍生物、或其组合）并吸收来自人体的面部皮肤的包括（但不限于）皮肤材料的刺激物的方法。向受影响的皮肤局部施用硫、较佳为乙酰磺酸钠、亚硫酸盐、硫醇或其组合的一种或多种硫衍生物（最佳为乙酰磺酸钠）、及高吸附底材的 pH 为约 6.5 到约 8.1 的组合物。硫较佳占以重量计约 5%且额外硫衍生物较佳占约 10%。

实例 1

本发明的一个实施例是以下较佳的组合物。

CTFA 名称	百分比w/w
A相	
纯净水	41.76
黄原胶 NF	0.30
B相	
高岭土USP	18.00
二氧化硅NF	5.00
乙酰磺胺钠USP	11.29
硫代硫酸钠	0.10
C相	
甘油硬脂酸酯和 PEG-100硬脂酸酯	10.00
皂树提取物	1.00
苧醇NP	1.00

D相	
沉淀硫USP	5.00
E相	
金缕梅纯露(14% 醇)	5.00
香料27160	0.05

实例 2

向固定 (mount) 于透皮细胞中湿的离体人皮肤表面施用实际使用水平的根据本发明的组合物, 其除了乙酰磺胺钠外还含有 5% (经放射性同位素标记的) 硫。12 小时后, 漂洗并揩干皮肤, 并且接着施用第二剂量再经 12 小时。然后测定下列位置中经放射性同位素标记的硫: (a)角质层表面和内部; (b)表皮内和表皮内; 以及(c) 皮肤下部的储液囊 (储液囊是用来模仿皮肤下的血液循环) 内, 其代表穿过皮肤的量。

在另一个实施例中如关于储液囊的数据所证明, 本发明可用于在真皮和表皮下且系统地输送硫。

下表显示来自这个实例的结果:

沉积硫的显微照片

角质层表面上	角质层内	表皮内	真皮内	储液囊
1344	295	117	27	26

超过 25%施用剂量的硫被吸收到角质层的表面以下。这些是临界面积, 因为病变和炎症发生在角质层、表皮和真皮中, 而且该组合物可用于治疗和预防病变和炎症。

实例 3

向固定于透皮细胞中湿的离体人皮肤表面施用实际使用水平的四种高吸附治疗调配物, 其含有除乙酰磺胺钠以外如下列表中所设定的经放射性同位素标记的硫 (S^{35})。每一次治疗在经漂洗并揩干之前在皮肤上保留 20 分钟。12 小时后, 接着施用第二剂量的每一种调配物再经 20 分钟, 然后经一次漂洗并揩干。

24 小时后, 从每个细胞中移除皮肤并测定下列位置中的经放射性同位素标记的硫: (a)角质层表面和内部; (b)表皮内和表皮内; 以及(c)皮肤下部的储液囊内, 其代表穿过皮肤的量。

配方 A

CTFA名称	百分比 w/w
纯净水	41.76
黄原胶NF	0.30

硅酸镁铝	1.50
高岭土USP	18.00
二氧化硅NF	5.00
乙酰磺胺钠USP	11.29
硫代硫酸钠	0.10
甘油硬脂酸酯和 PEG-100硬脂酸酯	10.00
皂树提取物	1.00
苾醇NF	1.00
沉淀硫USP	5.00
金缕梅纯露(14% 醇)	5.00
香料27160	0.05

配方B

CTFA	百分比w/w
蒸馏水	41.76
黄原胶NF	0.30
硅酸镁铝	1.50
甘油硬脂酸酯和 PEG 100硬脂酸酯	10.00
皂树皮提取物	1.00
苾醇	1.00
高岭土USP	18.00
二氧化硅	2.00
乙酰磺胺钠USP	11.29
硫代硫酸钠	0.10
沉淀硫USP	5.00
二氧化硅	3.00
金缕梅纯露(14% 醇)	5.00
香料27160	0.05

配方C

CTFA	百分比w/w
蒸馏水	46.76
黄原胶NF	0.30

硅酸镁铝	1.50
甘油硬脂酸酯和PEG 100硬脂酸酯	10.00
皂树提取物(如Vegetol® Bois de Panama)	1.00
苾醇NF	1.00
高岭土USP	18.00
乙酰磺胺钠USP	11.29
硫代硫酸钠	0.10
沉淀硫	5.00
金缕梅纯露(14% 醇)	5.00
香料27160	0.50

配方D

CTFA	百分比w/w
蒸馏水	46.76
黄原胶NF	0.30
硅酸镁铝	1.50
甘油硬脂酸酯和PEG 100硬脂酸酯	10.00
皂树提取物(如Vegetal® Bois de Panama)	1.00
苾醇NF	1.00
高岭土USP	16.00
锂蒙脱石（如Bentone® 38）	2.00
乙酰磺胺钠USP	11.29
硫代硫酸钠	0.10
沉淀硫	5.00
金缕梅纯露(14% 醇)	5.00
香料27160	0.05

下表展示出通过四种高吸附调配物输送到皮肤的硫的显微照片中的数据。

	在角质层表面上	在角质层内	在表皮中	在真皮中	在储液囊中
A	9.6	14.4	22.0	5.7	5.5

B	21.5	14.6	13.2	4.5	5.0
C	24.2	10.4	21.0	4.9	5.6
D	9.7	13.3	13.0	3.7	4.5

通过每一种调配物释放出的硫是相当大的并且很容易测量。

最终，除去留在角质层表面未被吸收或不可生物利用的硫量以外，配方 A、及配方 B、C 及 D 之间几乎没有差别。因此，高吸收性调配物没有削弱硫的皮肤生物利用率。

应理解虽然本发明已经结合其具体说明加以描述，但是上述说明旨在阐明本发明而非限制其范围，本发明受所附权利要求范围所界定。其他的方面、优势、及修改从上述权利要求中变得显而易见。