

传明酸

传明酸（Tranexamic Acid，简称 TXA，又称凝血酸、止血环酸）是人工合成赖氨酸衍生物，最初为医用抗纤溶止血药物，后皮肤科证实其优异淡斑、抗炎褪红功效。区别于 VC、熊果素等直接抑制酪氨酸酶的美白原料，传明酸从上游阻断炎症 / 紫外线诱发的黑色素激活信号，兼顾淡斑、抗炎、褪红、修护，温和低刺激，是黄褐斑、炎症后色沉（PIH）、泛红痘印的核心功效原料，广泛应用于敏感肌美白、医美术后修护配方。

产品信息

商品	传明酸
INCI 名称	TRANEXAMIC ACID
CAS 号	1197-18-8
EC 编号	214-818-2
性状	白色结晶性粉末
纯度	≥99%
溶解度	易溶于水和冰醋酸，几乎不溶于丙酮和乙醇（96%）
使用水平和配方 pH 值	精华 / 淡斑原液：2%–5%；乳液 / 面霜 / 面膜：0.5% – 2%；防晒 / 晒后修护：0.5% – 1.5% 4.0-7.0
贮存	原始密封容器，阴凉干燥、避光、常温（10 – 25℃） 防潮储存，原包装保质期 36 个月
监管	收录《中国已使用化妆品原料目录》；欧盟 CosIng 收录；全球化妆品市场通用合规原料

人体皮肤安全性与耐受性

封闭斑贴试验：30 名健康受试者 48h 封闭斑贴，2%、3%、5% 浓度均无红斑、水肿、刺痛等刺激反应，72h 随访无迟发不适。

划痕破损皮肤刺激：破损皮肤模型测试，传明酸刺激度与生理盐水对照组无显著差异，医美术后破皮肌肤可温和使用。

光斑贴光敏测试：UVA/UVB 照射后无光敏、光毒性，白天搭配防晒使用无反黑风险。

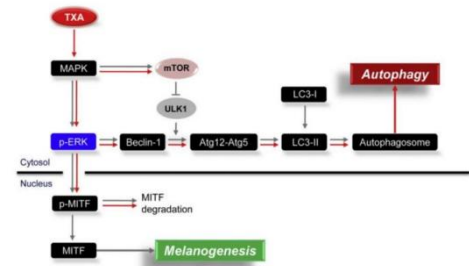
致敏性 ROAT 重复开放斑贴：无接触致敏潜力，极低致敏概率，敏感肌、屏障受损肌友好。

注意：极罕见个案仅出现在口服高剂量医用场景，外用化妆品常规浓度无过敏、刺激报道，全肤质长期使用安全。

上游阻断黑素激活信号（区别于 VC 衍生物）

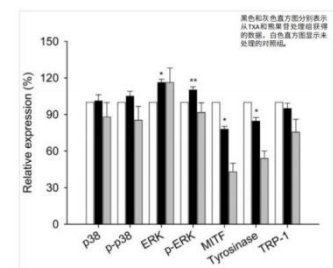
紫外线、炎症会激活角质细胞纤溶酶原→纤溶酶，释放花生四烯酸、前列腺素，刺激黑素细胞过量产黑；传明酸竞争性结合纤溶酶赖氨酸结合位点，从源头切断促黑信号链。

- TXA 抑制纤溶酶，阻断 p38/MAPK 炎症通路
- 下调 p-ERK，加速黑素主控基因 MITF 降解
- 抑制 mTOR 通路，激活细胞自噬（Beclin-1/LC3-II 上调），降解已生成黑素小体
- 同步下调酪氨酸酶、TRP-1、TRP-2 黑素合成蛋白



黑素相关蛋白表达抑制实验（B16F10 黑素细胞）

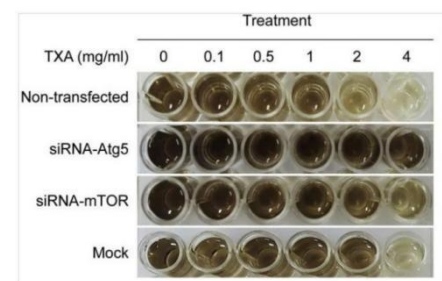
- 测试模型 – 小鼠 B16F10 黑素细胞，TXA 1mg/mL 处理
- 检测靶点 – P38、ERK、MITF、Tyrosinase、TRP-1



MITF、酪氨酸酶表达显著下调（* $p < 0.05$ ，** $p < 0.01$ ），直接削弱黑色素合成能力。TXA 降低磷酸化 p-p38 表达，轻度上调 p-ERK，p-ERK 升高介导 MITF 降解。

细胞黑色素含量抑制试验

- 梯度浓度 – 0/0.1/0.5/1/2/4 mg/mL TXA
- 对照 – Atg5 自噬基因敲除、mTOR 激活对照组



传明酸呈剂量依赖性降低细胞黑色素含量；自噬通路是其褪黑重要途径，敲除 Atg5 后美白效果大幅减弱。

人体临床功效研究

- **试验模型** -12 周黄褐斑改善临床（20 名中重度黄褐斑女性）
- **样品** -3% 传明酸美白精华，每日早晚全脸涂抹
- **检测设备** -Mexameter 黑色素指数仪、VISIA 影像分析；

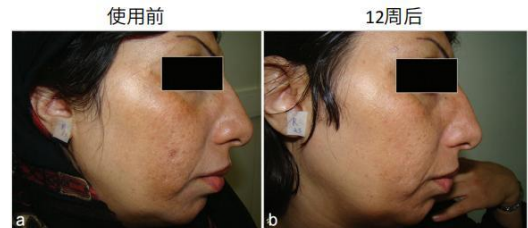


图.用氨甲环酸处理的一侧面部

4 周：色斑亮度提升，泛红减轻；
8 周：黑色素指数显著下降（ $p<0.001$ ），色斑面积缩小；
12 周：黄褐斑严重程度 MASI 评分下降 42%，肤色均匀度大幅提升，受试者满意度 91%；
无刺激、干燥、反黑等不良反应，效果与 2% 氢醌接近，安全性显著更优。

多重护肤作用完整机制

- **阻断炎症促黑通路（核心优势）**
抑制纤溶酶生成，减少前列腺素、 α -MSH 促黑素信号，针对炎症后色沉、痘印、黄褐斑（黄褐斑伴随慢性低度炎症）。
- **下调黑素合成关键蛋白**
降解 MITF 转录因子，减少酪氨酸酶、TRP-1 表达，降低黑素细胞黑色素合成总量。
- **诱导黑素细胞自噬**
上调 Beclin-1、LC3-II 自噬蛋白，通过溶酶体降解成熟黑素小体，代谢已沉积黑色素，淡化老旧色斑。
- **抗炎褪红、改善痘印（PIE）**
抑制肥大细胞脱颗粒，减少 IL-6、组胺炎症因子；抑制 VEGF 血管新生，收缩扩张毛细血管，改善泛红、红色痘印、敏感潮红。
- **抗光老化、预防 UV 色沉**
阻断紫外线诱导的纤溶酶激活，减少光损伤诱发的持续性色素沉着，搭配防晒长效预防晒斑。
- **温和修护屏障**
降低炎症对角质层的破坏，减少经皮失水，搭配神经酰胺可加速屏障修复，适合医美术后、换季敏感期。

推荐的增效剂/添加剂，用于改善皮肤美白/均匀肤色效果

增效剂/添加剂	基本原理/机制	使用级别
3-O-乙基抗坏血酸	TXA 上游阻断炎症促黑 + EAA 直接抑制酪氨酸酶、还原黑色素，双通路强效淡斑，改善黄褐斑、顽固色沉	EAA 2% - 5% + TXA 2% - 3%
烟酰胺 2%-5%	TXA 减少黑素生成信号 + 烟酰胺阻断黑素小体向角质转运，内外同步匀肤，改善痘印暗沉	烟酰胺 2% - 4% + TXA 2% - 3%
维生素 E	抗氧化循环，降低紫外线氧化应激，减少光诱发色沉，提升配方稳定	0.5% - 1%
阿魏酸	协同抗氧化，提升防晒防护力，稳定 VC 衍生物活性	0.3% - 0.8%
神经酰胺	修护皮肤屏障，降低高浓度美白原料刺激，提升敏感肌耐受度	0.1% - 0.5%
透明质酸钠	长效保湿，改善高浓度配方拔干问题，辅助提升透皮吸收	0.1% - 0.3%

稳定型抗炎抑黑多功能活性成分

安全温和型上游阻断美白修护原料

- 医用止血药物转化化妆品原料，数十年皮肤科临床应用历史，全球各国化妆品原料目录收录，无细胞毒性，氢醌、高浓度 VC 不耐受人群优选。
- 亚洲黄褐斑、炎症色沉人群多中心临床验证，医美术后修护、预防反黑专用原料，全肤质长期耐受。

皮肤保护

- 竞争性结合纤溶酶赖氨酸结合位点，抑制纤溶酶活化，减少前列腺素、花生四烯酸等炎症促黑介质释放，阻断 UV、炎症诱发氧化应激。
- 抑制 VEGF 介导毛细血管异常增生，减轻真皮微血管扩张，改善泛红、红痘印、潮红。
- 抑制肥大细胞相关炎症通路，减少 IL-6、组胺释放，舒缓氧化、医美刺激带来的皮肤灼热敏感。

抗衰老功效

- 通过降低炎症对真皮基质的破坏，间接延缓光老化导致肤色发黄粗糙。

美白匀肤

- 上游阻断炎症 / UV 促黑素信号：抑制角质细胞纤溶酶原激活，切断 p38/MAPK 炎症通路。
- 下调磷酸化 ERK，加速黑素主控转录因子 MITF 降解，间接降低酪氨酸酶、TRP-1、TRP-2 蛋白表达，不直接结合酪氨酸酶。
- 诱导黑素细胞自噬（上调 Beclin-1、LC3-II），通过溶酶体降解成熟黑素小体，代谢已沉积黑色素（细胞水平结论）。
- 无直接还原多巴醌作用，区别 VC 类衍生物；搭配 EAA、熊果苷形成「上游阻信号 + 直接抑酶」双通路协同淡斑。
- 温和低刺激，循序渐进改善黄褐斑、炎症后色沉、晒斑、肤色不均，敏感肌、医美术后可用。

主要刊物

- Jeon H, Park N, Won JG, et al. Enhanced Skin Permeation and Pigmentation Reduction Effects of a Novel Tranexamic Acid - Mandelic Acid Ion - Pairing Complex [J]. *Pharmaceutics*, 2025, 17 (12):1486. (PMC 权威实验文献, 透皮增效研究)
- Chang YF, Lee TL, Oyerinde O, et al. Efficacy and safety of topical agents in the treatment of melasma: What's evidence? A systematic review and meta-analysis. *J Cosmet Dermatol*. 2023;22(4):1168-1176.
- Chen SJ, Hseu YC, Gowrisankar YV, et al. The anti-melanogenic effects of 3-O-ethyl ascorbic acid via Nrf2-mediated α -MSH inhibition...[J]. *Free Radic Biol Med*, 2021,172:326-340. (EAA 与 TXA 复配理论基础文献)
- Maeda K. Mechanism of Action of Topical Tranexamic Acid in the Treatment of Melasma and Sun-Induced Skin Hyperpigmentation. *Cosmetics*. 2022;9(5):108.
- Ingrelens Lab. Tranexamic Acid Complete Mechanism & Formulation Guide [R]. Ingrelens Cosmetic Raw Material Whitepaper, 2026. (化妆品原料行业综述)
- Sarawiang T. Synergistic whitening effects of tranexamic acid combined with ethyl ascorbic acid [D]. Mae Fah Luang University, 2021. (VC 乙基醚 + 传明酸复配硕士研究)
- Zhu J, Ni Y, Tong X, et al. Tranexamic Acid Inhibits Angiogenesis and Melanogenesis in Vitro by Targeting VEGF Receptors. *Int J Med Sci*. 2020;17(14):2127-2136.
- Manosroi A, Podjanasoonthon K, Manosroi J. Stability and release of topical tranexamic acid liposome formulations. *J Cosmet Sci*. 2002;53:375-386.
- Ebrahimi B, Naeini FF. Topical tranexamic acid as a promising treatment for melasma. *J Res Med Sci*. 2014;19(8):753-757.
- Janney MS et al. A randomized controlled study comparing the efficacy of topical 5% tranexamic acid solution versus 3% hydroquinone cream in melasma. *J Cutan Aesthet Surg*. 2019;12:63-67.