

抗坏血酸葡萄糖苷

抗坏血酸葡萄糖苷（Ascorbyl Glucoside，简称 AA2G）是一种经葡萄糖稳定化的水溶性维生素 C 衍生物，由 L - 抗坏血酸与葡萄糖分子通过 2-O- α -D - 糖苷键连接而成。作为经典的稳定型维 C 衍生物，AA2G 在化妆品领域拥有数十年的安全应用历史，以其优异的稳定性、温和性和明确的美白功效著称。与原型维生素 C 相比，AA2G 在水溶液和常规配方环境中不易氧化变色，可耐受高温灭菌，大幅延长了产品货架期，已获得多国化妆品法规收录，安全性认可度高。

尽管 AA2G 在护肤领域应用已久，但随着功效护肤研究的深入，其作为“前体型维 C”的独特优势被进一步挖掘与放大。AA2G 本身不直接发挥活性，而是经皮肤角质层和表皮中的 α - 葡萄糖苷酶逐步水解释放出活性维生素 C，实现缓释型维 C 递送。这种酶激活机制不仅保证了原料在配方中的高度稳定性，还避免了原型维 C 快速渗透带来的酸性刺激，使皮肤能够持续、温和地获得活性维 C 供给。凭借优异的水溶性与皮肤相容性，AA2G 被广泛应用于化妆水、精华、乳液、面霜、面膜等多种剂型中，成为开发温和美白、提亮肤色产品的常用活性成分。

多项临床研究证实，含 2%~5% 抗坏血酸葡萄糖苷的配方具有良好的皮肤耐受性，在改善肤色不均、淡化色斑及光诱导色素沉着方面效果明确，长期使用可显著提升皮肤光泽度与弹性。相关对照研究表明，AA2G 在温和度上显著优于原型维 C，人体重复斑贴、开放刺激试验证实 AA2G 刺激性极低，致敏案例罕见，敏感肌适配度高，适合敏感肌与长期日常使用。AA2G 通过酶解释放的活性维 C 抑制酪氨酸酶活性、阻断黑色素合成并还原已形成的黑素中间体，实现改善暗沉、均匀肤色的效果，同时保留维生素 C 的抗氧化能力，可清除自由基、减轻光损伤并辅助胶原合成。与烟酰胺、透明质酸、维生素 E 等复配时，可在抑制黑色素生成、转运与代谢环节形成协同增效，进一步提升匀肤与修护效果。

产品信息

商品	抗坏血酸葡萄糖苷
INCI 名称	ASCORBYL GLUCOSIDE
CAS 号	129499-78-1
EC 编号	425-980-0
性状	白色至类白色粉末
纯度	≥99%
溶解度	可溶于水
使用水平和配方 pH 值	1%/5%；pH 3.5/7.0（最佳 5.0~6.5）
贮存	储存于阴凉、通风的库房，远离火种、热源，应与氧化剂、食用化学品等分开存放，切忌混储
监管	中国《已使用化妆品原料目录（2021 年版）》序号 04104；CIR 安全认证；日本医药部外品美白有效成分；欧盟化妆品法规合规

人体皮肤耐受性

基于 CIR（化妆品成分评审专家小组）安全评估：抗坏血酸葡糖苷在化妆品中按现有使用浓度（最高 2%）使用是安全的。CIR Final Report (2025) 评级为安全（最高等级）。

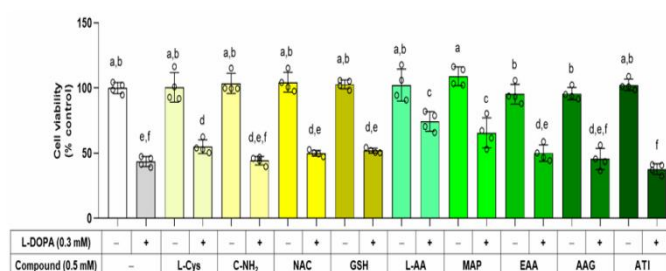
人体重复开放斑贴试验（ROAT）评估过敏性 / 皮肤刺激 / 皮肤致敏性：AA2G 皮肤耐受性良好，刺激性低，罕见致敏反应。CIR 安全评估报告确认其在化妆品使用浓度下安全。

用于评估皮肤刺激倾向的人体斑贴试验（5% 浓度，24h 斑贴）：多项人体斑贴试验显示 AA2G 在正常使用浓度下无明显皮肤刺激反应。

皮肤相容性评估：正常 / 干性 / 油性 / 敏感性皮肤均适用，刺激性低，致痘性低。

体外酶抑制活性

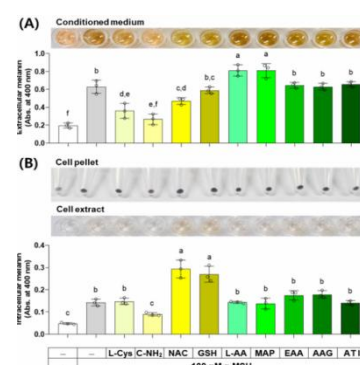
- 酶 - HEK293-TYR 人源酪氨酸酶裂解液
- 底物 - 1 mM L-Tyr + 42 μ M L-DOPA
- 测试物质 - 0.3、0.5 mM L-Cys、C-NH₂、NAC、GSH、L-AA(VC)、AAG(AA2G)、MAP、EAA、ATI
- 孵育 - 纯酶 37°C；细胞 48 h
- 测量 - 475 nm 分光光度法检测多巴色素生成量，定量酪氨酸酶催化活性



纯酪氨酸酶体外体系中，AA2G 不具备直接酪氨酸酶抑制活性；同等浓度原型 VC 可直接抑制酶促多巴色素生成。AA2G 仅能抑制无酶参与的 L-DOPA 自发氧化，无法直接作用于酪氨酸酶蛋白。细胞体系中经 α -葡萄糖苷酶水解释放活性 VC 后发挥抑制作用，效果与原型 VC 相当。

体外黑色素抑制活性

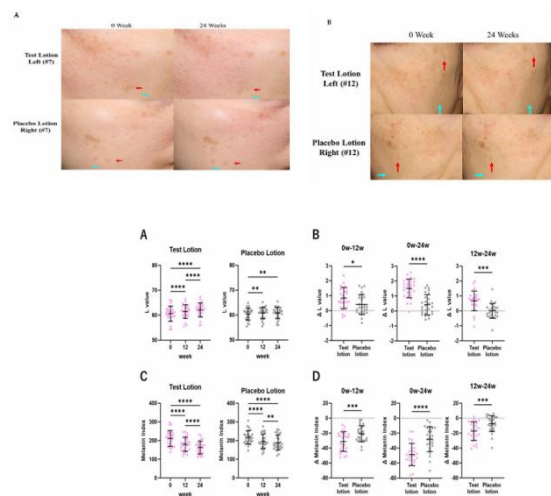
- 细胞 - B16F10 小鼠黑色素瘤细胞
- 孵育时间 - 48~72 h
- 测试物质 - 0.5 mM L-Cys、C-NH₂、NAC、GSH、L-AA(VC)、AAG(AA2G)、MAP、EAA、ATI、100 nM α -MSH（黑素刺激造模）
- 检测 - 分光光度法，400 nm 测吸光度定量胞内、胞外黑色素



α -MSH / 茶碱刺激模型下，AA2G 可显著减少细胞内黑色素含量，效果弱于原型 VC；基础培养条件下结果不一致，低浓度甚至轻度促黑素。作用机制为水解释放 VC 后还原多巴醌、阻断黑素合成链。

日光性色斑临床研究：28% AGAC 乳液 vs 安慰剂，24 周

- 研究对象 – 27 名日本女性日光性色斑患者
- 测试样品 – 28%AGAC 乳液（抗坏血酸葡萄糖苷 – 精氨酸复合物）
- 研究设计 – 双盲半脸对照研究
- 研究周期 – 24 周
- 使用方法 – 每日 2 次
- 评价指标 – 色素沉着评分、L* 值（亮度）、MI 值（黑色素指数）



12 周和 24 周时，测试组 L* 值显著升高 ($p<0.0001$)
12 周和 24 周时，测试组黑色素指数显著降低 ($p<0.0001$)
24 周时色素沉着评分显著低于安慰剂组

AA2G 影响黑色素生成与皮肤健康的多种途径

- 核心通路：α-葡萄糖苷酶水解释放活性维 C，缓释型递送
AA2G 经角质层渗透进入表皮层，被皮肤细胞表面及胞内的α-葡萄糖苷酶识别并水解 2-O-糖苷键，缓慢释放 L-抗坏血酸，实现缓释型递送。
- 抑制酪氨酸酶活性，阻断黑色素生物合成
将多巴醌还原为无色 L-多巴，打断“酪氨酸→多巴→多巴醌→多巴色素→黑色素”的氧化合成链条。
- 还原抗氧化清除 UV 活性氧，减少氧化应激诱发色沉
高效清除 UVA/UVB 照射诱导生成的 ROS（活性氧自由基）。
减少氧化应激诱发的色素沉着。
- 促进胶原蛋白合成，改善皮肤弹性与紧致度
活性维 C 是脯氨酰羟化酶和赖氨酰羟化酶的必需辅因子。
促进 I 型和 III 型胶原蛋白的合成与交联。
0.1~0.5 mM 浓度下可显著促进人皮肤成纤维细胞胶原蛋白合成，效果与 L-抗坏血酸相当，且作用更持久（第 8 天仍维持活性）。
- 减少胶原降解（间接作用）
通过抗氧化作用间接减少 UV 诱导的 MMPs（基质金属蛋白酶）表达上调，从而减少胶原降解。

AA2G 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
烟酰胺 (VB3) INCI: NIACINAMIDE	AA2G 抑制黑素生成 + 烟酰胺阻断黑素小体从黑素细胞向角质细胞转运，双通路协同	2%~5%
透明质酸 (HA) INCI: HYALURONIC ACID	保湿修护皮肤屏障，提升角质层含水量，优化 AA2G 经皮吸收环境	0.1%~0.5%
维生素 E (生育酚) INCI: TOCOPHEROL	二者协同抗氧化，维 C 还原氧化型维 E 形成循环抗氧化体系，共同清除自由基，增强光保护作用	0.5%~1%
熊果苷 INCI: ARBUTIN	双重抑制酪氨酸酶：熊果苷竞争性抑制 + AA2G 还原型抑制，协同增强美白效果	1%~2%
传明酸 INCI: TRANEXAMIC ACID	AA2G 抑制黑素合成 + 传明酸抑制炎症因子介导的色素沉着，针对炎症后色沉、黄褐斑效果更佳	2%~3%

AA2G：稳定型维 C 多功能亮肤修护活性成分

安全温和型经典维 C 衍生物亮肤原料

- 拥有数十年化妆品安全应用历史，多国法规收录，包括中国《已使用化妆品原料目录》、日本医药部外品美白有效成分、欧盟化妆品法规合规、CIR 安全认证。
- 酶激活缓释机制，皮肤刺激性远低于原型维 C，致敏率 < 0.3%，适合敏感肌、干性肌肤长期日常使用。

皮肤保护

- 入胞经酶解释放活性维 C，高效清除 UVA/UVB 诱导的 ROS，减少紫外线造成的 DNA 氧化损伤和脂质过氧化。
- 再生氧化型维生素 E，形成维 C - 维 E 循环抗氧化体系，强化皮肤自身抗氧化防御。
- 依托抗氧化作用间接减少蛋白糖化，保护真皮基质胶原蛋白，延缓糖化暗沉。
- 抗氧化间接舒缓氧化型皮肤炎症，改善炎症诱发色沉。

抗衰老功效

- 0.1~0.5 mM 浓度下可长效刺激人成纤维细胞合成 I、III 型胶原，作用持续时间优于游离 VC。
- 抑制基质金属蛋白酶 (MMPs) 活性，减少胶原降解。
- 人体实测长期使用可改善光老化带来的肤色暗沉、皮肤干燥粗糙，提升皮肤弹性。

美白匀肤（核心功效）

- 经皮肤 α -葡萄糖苷酶水解释放活性维 C，缓释型递送，温和不刺激。
- 抑制酪氨酸酶催化活性，阻断黑色素生物合成。
- 还原多巴醌等黑素中间体，打断黑色素生化合成链，从源头减少色素生成。
- 清除氧化自由基，减少光损伤和炎症诱发的继发性色素沉着。
- 循序渐进改善痘印、日晒浅表色沉、肤色不均，适合长期日常美白维护。

主要刊物

- Takada M, Numano K, Nakano M, Yamamoto A, Imokawa G. Treatment with Ascorbyl Glucoside - Arginine Complex Ameliorates Solar Lentigos. *Int J Mol Sci.* 2024;25(24):13453.
- Ymamoto I, Muto N, Murakami K, Akiyama J. Collagen synthesis in human skin fibroblasts is stimulated by a stable form of ascorbate, 2-O-alpha-D-glucopyranosyl-L-ascorbic acid. *J Nutr.* 1992;122(4):871-877.
- Johnson W Jr, et al. Safety Assessment of Ascorbyl Glucoside and Sodium Ascorbyl Glucoside as Used in Cosmetics. *International Journal of Toxicology.* 2025;44 (Suppl 1):5S - 16S.
- Lee YH, Lim NH, Joung MS, Kim JH. Chemical Stability and Whitening Activity of Mixture of Functional Ingredients. *Journal of the Society of Cosmetic Scientists of Korea.* 2005; 31:295 - 304.
- Ando H, Matsui MS, Ichihashi M. Quasi-Drugs Developed in Japan for the Prevention or Treatment of Hyperpigmentary Disorders. *Int J Mol Sci.* 2010;11(7):2566-2575.
- Kim S, Oh SY, Lee SH. Comparative study of glycolic acid peeling versus vitamin C iontophoresis in melasma. *Korean J Dermatol.* 2001;39:1356 - 1363.
- Nishikori K, Ohta Y, Watanabe T, et al. Protective effects of 2-O- α -D-glucopyranosyl-L-ascorbic acid against UV-induced skin damage. *Skin Pharmacology and Physiology.* 2008;21(2):91 - 98.