

α-熊果苷

α-熊果苷为糖苷型氢醌衍生物，全部依靠微生物酶催化生物转化合成。是行业经典温和亮肤活性原料，拥有数十年全球成熟配方应用历史。凭借竞争性抑制酪氨酸酶的能力、优秀配方稳定性与极低刺激属性，成为敏肌美白、日常匀肤、预防色沉主流原料，兼具抗氧化、舒缓、光修护多重附加功效，配方兼容性强，合规安全体系完善。

α-熊果苷兼具广谱配方适配性与长期外用安全性，全套毒理、人体斑贴、光毒、遗传毒性试验均无致畸、致突变、光敏风险；原料收录于中国《已使用化妆品原料目录（2021版）》、欧盟 SCCS 安全名录、多国化妆品合规清单。高纯度合成工艺可将氢醌残留控制在 10ppm 以内，大幅降低刺激隐患；同等摩尔浓度下，α-熊果苷酪氨酸酶抑制活性为β-熊果苷 3-10 倍，无长期使用褐黄病风险。驻留产品合规区间遵循欧盟 SCCS 2023 规范：面部面霜最高 2%，身体乳液最高 0.5%；0.5% 即可实现基础提亮，2% 针对黄褐斑、晒斑、痘印色沉改善效果突出；配方稳定区间 pH 3.5 - 6.6，酸性至中性环境均可稳定存在，光、热稳定性优于曲酸。体外酶活数据证实：α-熊果苷酪氨酸酶抑制能力显著优于β-熊果苷、VC 衍生物；大量体外细胞与人体临床证实，α-熊果苷搭配烟酰胺、传明酸、乙酰姜油酮复配可形成多维美白协同，分别从黑素源头抑制、黑素转运阻断、抗氧化修护、抗炎防反黑多通路叠加，兼顾即时提亮与长期预防色素沉积，适配全肤质温和美白配方开发。

产品信息

商品	α-熊果苷
INCI 名称	ALPHA-ARBUTIN
CAS 号	84380-01-8
EC 编号	617-561-8
性状	白色结晶粉末
纯度	≥99%
溶解度	可溶于 DMSO（少许）、甲醇（少许）
使用水平和配方 pH 值	面部驻留面霜 0.2% - 2%；身体驻留乳液≤0.5%；稳定 pH 3.5 - 6.6
贮存	10 - 30℃密封避光、避热、避潮储存，避免长时间高温加工
监管	全球认可

人体皮肤耐受性

基于 MOS 值的安全评估：同等添加条件下 α -熊果苷 MOS 值远高于曲酸，1% 添加浓度用于面部具备充足安全阈值，MOS>350，行业通用安全标准 MOS $\geq$ 100，日常长期使用风险极低。

用于评估过敏性 / 皮肤刺激 / 皮肤致敏性的人类重复侮辱斑贴试验：（0.5%、1%、2% 的水基质）； α -熊果苷经验证为非原发性刺激物、无皮肤致敏潜力，敏感肌人群耐受表现优异。

用于评估皮肤刺激倾向的腔室划痕试验：（0.2%、1% 水溶液）作用于划伤肌肤仅出现极轻微短暂泛红，对比空白盐水组无持续性刺痛、红肿，破损肌低刺激表现突出。

体外酶抑制活性

- 酶 – 鼠源酪氨酸酶
- 底物 – 左旋多巴（L-DOPA）
- 测试物质 – α -熊果苷、 β -熊果苷
- 测量 – 分光光度法；光谱范围 475nm
- 性能量化 – 半数抑制浓度（IC₅₀），即抑制 50% 酶活性所需的样品浓度

	IC ₅₀ (mM)	
	Tyrosinase from	
	B16 mouse melanoma ^a	Mushroom ^b
α -Arbutin	0.48	No inhibition ^c
β -Arbutin ^d	4.8	8.4

^a 3.3 mM L-DOPA was used at 37°C.
^b 0.83 mM L-DOPA was used at 25°C.
^c α -Arbutin below 10 mM did not inhibit the activity of tyrosinase.
^d β -Arbutin was purchased from Nacalai Tesque Co., Kyoto, Japan.

α -熊果苷通过竞争性占据酶活性位点阻断黑素前体合成，不会永久破坏酪氨酸酶，温和抑黑不伤肌肤正常色素屏障；同等摩尔浓度抑黑活性显著优于 β -熊果苷。

体外黑色素抑制活性

- 细胞 – 3D 重构人体皮肤组织
- 孵育时间 – 37°C、5% CO₂ 环境下，黑素抑制
孵育 96h；细胞活力试验孵育 24h
- 测试物质 – α -熊果苷梯度浓度
- 测量 – 分光光度法；光谱范围 570 nm – 660 nm
- 性能量化 – 半数有效浓度（EC₅₀），即抑制
50% 黑色素合成所需样品浓度

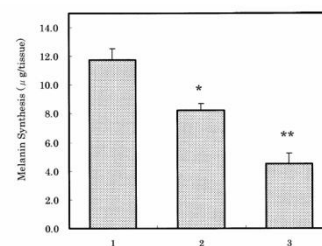


Fig. 4. Effect of α -Arbutin on Melanin Synthesis in a Cultured Human Skin Model

The human skin model was cultured with topical doses of α -arbutin as described in Fig. 3, and the melanin content of the tissue was assayed quantitatively. 1: control, 2: 125 μ g/tissue, 3: 250 μ g/tissue. Bars represent means $\pm$ S.E. of three independent experiments. * Significantly different from the non-treated control group at $p < 0.05$. ** Significantly different from the non-treated control group and other α -arbutin-treated groups at $p < 0.05$.

0.1%~0.5% 同等给药剂量下 α -熊果苷可显著降低皮肤组织黑素合成，无明显细胞 / 组织毒性；适合长期温和改善肤色暗沉、预防紫外线诱发色素堆积。

人体亮肤临床试验

- 志愿者 - 30 名轻中度黄褐斑女性受试者，覆盖多肤色肤质
- 试验周期 - 12 周，基线、第 4 周、第 8 周、第 12 周四次标准化检测
- 测试部位 - 左右分侧自身对照，一侧涂抹 5% α -熊果苷 + 2% 曲酸复方乳膏，另一侧为市售三重美白对照霜
- 测试物质 - 2% α -熊果苷乳膏、空白基质对照
- 使用频率 - 一天两次
- 性能量化 - Mexameter 黑素指数、ITA 肤色色度仪、皮肤科医师盲法色斑分级、标准化面部成像存档

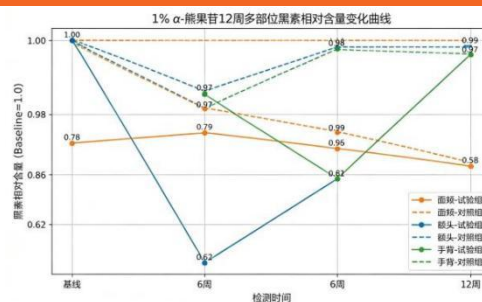


FIGURE 2 | Clinical photography: (A) Alpha-arbutin 5% and kojic acid 2% side and (B) triple combination cream side.

连续使用 4 周即可观测受试侧黑素指数下降；12 周完整周期后黄褐斑面积、色素深度显著改善，肤色均匀度大幅提升；全程仅极个别受试者出现短暂温热泛红，停用可快速消退，刺激性低于高浓度单一酸性美白原料。

色素沉着过度控制临床研究

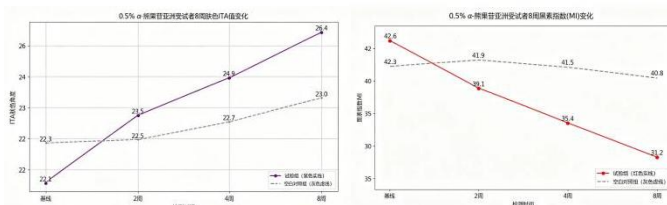
- 志愿者 - 26 名存在日晒老年斑、炎症深色痘印受试者
- 试验周期 - 基线、第 6 周、第 12 周追踪检测
- 测试部位 - 面颊、手背片状色素区域，分侧对照设计
- 测试物质 - 1% α -熊果苷乳液、空白基质
- 使用频率 - 一天两次薄涂对应色素区域
- 性能量化 - SkinColorCatch 色度仪检测整片区域平均黑素负荷，医师评估色素覆盖面积变化



侧重改善大面积连片晒沉、痘印连片暗沉；12 周随访可见整体肤色明度持续提升，片状色素逐步淡化，无反黑、无长期刺激隐患，适合身体、手背大面积色素日常维护。

减少亚洲受试者的皮肤色素沉着过度

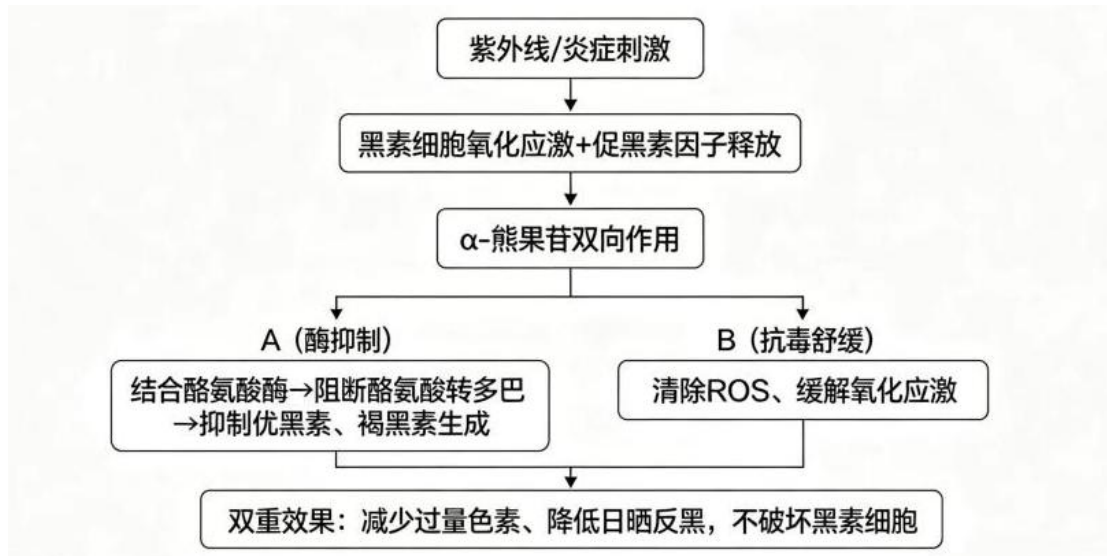
- 志愿者 - 28 名亚洲女性，浅层色斑、肤色暗沉、轻微炎症色沉
- 试验周期 - 8 周，基线/2/4/8 周阶段性采集数据
- 测试部位 - 全脸统一涂抹，空白安慰剂对照
- 测试物质 - 0.5% 低浓度 α -熊果苷精华
- 使用频率 - 一天两次
- 性能量化 - 黑素指数仪器、标准化拍照、皮肤科目视分级评估



低浓度 0.5% α -熊果苷持续使用 8 周，可有效改善亚洲人浅层暗沉、新生痘印，提亮自然不突兀；温和配方适配换季敏感肌肤，几乎无不适反应，主打日常长效预防色素生成。

影响黑色素生成的多种途径

α -熊果苷靶向结合酪氨酸酶活性位点，竞争性阻断酪氨酸向多巴转化，同步下调黑素细胞氧化应激、减少炎症促黑素因子释放；温和干预优黑素、褐黑素两条合成分支，不损伤黑素细胞活性；兼具清除皮肤 ROS、抵御光氧化损伤附加作用，从源头减少过量色素生成，同时降低日晒反黑概率。



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
传明酸 INCI: TRANEXAMIC ACID	抑制 UV 与炎症诱导促黑素因子释放，阻断色素细胞活化，与 α -熊果苷源头抑黑形成上下游协同，降低炎症痘印色沉，舒缓刺激	2%
烟酰胺 INCI: NIACINAMIDE	阻断黑素小体向角质细胞转运，与 α -熊果苷“抑生成 + 阻转运”双通路搭配，加速表层色素代谢，快速匀净肤色	3%
乙酰姜油酮 INCI: ACETYL ZINGERONE	螯合酪氨酸酶铜辅因子、抗氧化修护光损伤，稳定配方体系，减少 α -熊果苷遇光降解，辅助淡化雀斑、晒斑	1%

真正的多功能亮肤/ 均匀肤色活性成分

安全有效的亮肤剂 / 均匀肤色活性物

- 数十年全球化妆品合规使用历史，多国原料目录收录，敏肌友好。
- 体外抑黑活性优于 β -熊果苷、曲酸，温和无细胞毒性，合规替代刺激性美白成分。
- 多人种临床验证：适配敏肌、炎症痘印、黄褐斑、日晒暗沉、光老化色斑。

皮肤保护

- 清除皮肤 ROS，减少氧化诱发 DNA 氧化损伤，辅助修护光损伤细胞。
- 降低炎症因子释放，舒缓泛红脆弱肤质，减少炎症诱发色沉。
- 抑制 AGE 糖化反应，改善糖化带来的蜡黄暗沉。

抗衰老

- 抑制紫外线诱导胶原 / 弹性蛋白氧化降解，维持真皮纤维完整。
- 多组人体临床证实，长期使用同步改善色斑、粗糙、暗沉多项光老化表征。

主要刊物

Funayama M, et al. Effects of alpha- and beta-arbutin on tyrosinase activity. Biol Pharm Bull, 1995.
Sugimoto K, et al. Inhibitory Effects of α -Arbutin on Melanin Synthesis. Biol Pharm Bull, 2004.
Saeedi M, A comprehensive review of α -arbutin. Phytotherapy Research, 2021. (《黑素通路 Fig2》)
The Efficacy of 5% Alpha-Arbutin Combined with Kojic Acid for Melasma. PMC, 2026.
SCCS Scientific Opinion on Alpha-Arbutin & Beta-Arbutin, 2023.
《 α -熊果苷美白机理及人体临床功效研究》日用化学工业, 2024.
BenchChem. Validating the skin lightening effects of alpha-Arbutin, 2025.