

抗坏血酸乙基醚

抗坏血酸乙基醚（3-O-EthylAscorbicAcid，简称 EAA或 VC乙基醚）是维生素 C 的醚化衍生物，通过在抗坏血酸 C3位羟基引入乙基基团，显著提升了化合物的稳定性与透皮吸收能力。作为新一代稳定型维生素 C衍生物，EAA 兼具亲水性与亲脂性（两亲性），能够高效穿透皮肤角质层直达真皮层，在皮肤内转化为活性维生素 C发挥作用。

EAA具备优异的热稳定性与光稳定性，在常规配方体系中不易氧化变色，解决了原型维生素 C易氧化、不稳定、透皮差的三大难题。多项体外与临床研究证实，EAA 具有抑制酪氨酸酶活性、减少黑色素合成、清除自由基、促进胶原蛋白合成等多重功效，是当前功效护肤领域广泛应用的高端美白活性原料。

与抗坏血酸磷酸酯镁（MAP）等经典 VC衍生物相比，抗坏血酸乙基醚凭借其独特的两亲性结构，在透皮吸收效率和生物利用度上表现更优，已成为高端美白、抗衰护肤品中的核心活性成分之一。

产品信息

商品	抗坏血酸乙基醚
INCI 名称	3-O-ETHYL ASCORBIC ACID
CAS 号	86404-04-8
EC 编号	617-849-3
性状	白色至淡黄色结晶粉末
纯度	≥99%（高纯化妆品级）
溶解度	溶于水和甘油
使用水平和配方 pH 值	1%-5%；3.0-6.0
贮存	在阴凉干燥环境下储存在原始密封容器中；避光、避热、防潮
监管	全球主要市场认可，收录于中国已使用化妆品原料目录

人体皮肤耐受性

基于多项人体安全性测试的综合评估：

人体斑贴试验：30 名健康受试者进行 48 小时封闭斑贴试验，2%、5%、10%浓度均未出现皮肤刺激反应，2 小时及 72 小时观察均无红斑、水肿等不良反应。

光斑贴试验：UVA 照射后无光敏反应，证明 EAA 无光毒性与光刺激性。

皮肤刺激性：腔室划痕试验显示，即使在破损皮肤上，EAA 刺激性极低，与生理盐水对照组无显著差异。

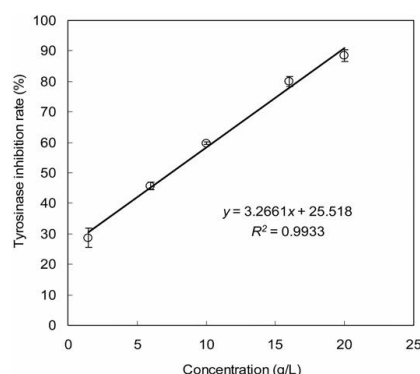
皮肤致敏性：人体重复开放斑贴试验（ROAT）证实 EAA 为非致敏物，正常使用浓度下无接触致敏风险。

临床安全性：8周人体使用试验中，2%-10%浓度均表现出良好的皮肤耐受性，未观察到明显刺激、泛红或干燥等不适反应。

注意：文献报道 1 例 72 岁免疫抑制患者（类风湿关节炎使用甲氨蝶呤与依那西普治疗）出现 EAA 过敏性接触性皮炎，属极罕见个案。正常健康人群使用安全性良好，敏感肌建议从低浓度开始建立耐受。

体外酪氨酸酶抑制活性

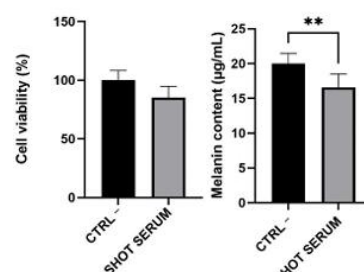
- 酶 - 蘑菇酪氨酸酶
- 底物 - L-DOPA（左旋多巴）
- 测试物质 - 梯度浓度 EAA
(1.5/6.0/10.0/16.0/20.0 g/L)、
曲酸（阳性对照）
- 孵育 - 25℃恒温反应 25 min, 475nm 分光光度法检测多巴色素吸光度定量酶活性



4- 丁基间苯二酚是受试品类中最强效人酪氨酸酶抑制剂，抑酶活性排序：4- 丁基间苯二酚 > 己基间苯二酚 > 苯乙基间苯二酚 > 氢醌 > 曲酸 > 熊果苷。

体外黑色素抑制活性

- 细胞模型 - SkinEthic RHPE 重组人色素化三维表皮（含角质细胞 + 黑素细胞）
- 孵育时间 - 连续 4 天每日重复给药处理
- 测试物质 - 含 30% EAA + 乳酸复配精华、空白缓冲液阴性对照
- 检测方法 - 组织裂解后 500nm 分光光度法定量表皮总黑色素含量

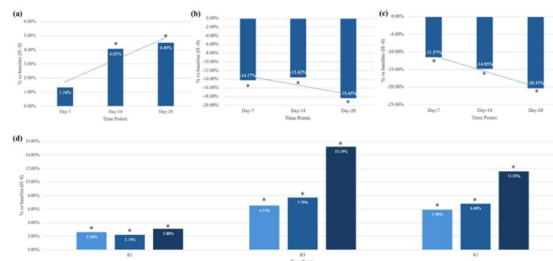


Sample	Melanin Content (µg/mL)	Melanin Content (%)	Reduction (%)
Ctrl -	20.02 ± 1.43	100.00 ± 8.03	-
C-SHOT SERUM	16.60 ± 1.92	82.89 ± 9.57	-17.10

连续 4 天外用处理后，三维表皮黑色素含量较对照组显著下降，黑素降低幅度 17.10%，统计学差异显著（ $p < 0.01$ ）；同时无细胞毒性，模型细胞活力 > 80%。

10%EAA 精华 28 天人体临床研究

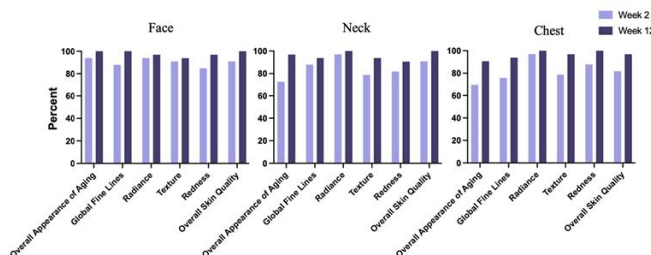
- 志愿者人数 - 39 名女性
- 人群 - 25 - 42 岁, Fitzpatrick II - IV 型, 存在暗沉、细纹、肤色不均问题
- 研究周期 - 28 天 (4 周)
- 测试样品 - 含 10% EAA 稳定精华
- 使用方法 - 每日早晚洁面后全脸均匀涂抹
- 检测仪器 - Mexameter® MX18 黑色素检测仪、Cutometer® MPA580 皮肤弹性仪、Visia 图像分析仪
- 评价指标 - 黑色素指数、皮肤亮度 L*、皮肤弹性 R7、细纹面积、肤色均匀度



28 天随访对比基线, 面部黑色素指数平均下降 4.25% ($p < 0.05$), 皮肤亮度 L* 显著提升 4.49% 弹性参数 R7 提升 11.55, 皮肤紧致度统计学显著改善 ($p < 0.01$) 面部细纹总面积减少 13.71%, 整体肤色均匀度肉眼评分显著提升

色素沉着过度控制临床研究

- 志愿者人数 - 32 名完成试验女性 (筛选 34 人, 脱落 2 人)
- 人群 - 35 - 60 岁, Fitzpatrick I - VI 全肤色, 存在光老化细纹、肤色暗沉、轻度色斑, 50% 受试者为敏感肌
- 研究周期 - 12 周
- 测试样品 - 含 EAA + 四己基癸醇抗坏血酸 + 虾青素 + 发酵姜黄素 + VE 复配抗氧化精华
- 使用方法 - 每日早晚洁面后涂抹面部、颈部、胸口
- 检测仪器 - 标准化专家视觉 10 分分级、VISIA 影像分析仪、受试者 26 项主观问卷
- 评价指标 - 细纹严重程度、肤色均匀度、色斑面积、皮肤光泽、皮肤弹性、使用耐受性



连续使用 12 周, 100% 受试者细纹分级较基线改善 ($p < 0.001$), 面部、颈胸部光老化暗沉均显著改善 81% 受试者皮肤弹性 / 紧致度评分显著提升, 89% 自评肤色提亮、皮肤光泽改善老化带来的大面积肤色暗沉、手背老年斑点。

作用机制

• 间接调控酪氨酸酶活性

EAA 分子自身可直接弱抑制酪氨酸酶：渗透进入黑素细胞后，经胞内酯酶水解脱乙基转化为活性 VC，活性 VC 可还原酪氨酸酶活性中心 Cu^{2+} 为 Cu^{+} ，削弱酶催化能力，阻断酪氨酸向多巴、多巴醌转化，从源头减少黑素前体生成。对比氢醌具有黑素细胞毒性，EAA 仅可逆调节酶活，不会损伤黑素细胞，使用安全性更高。

• 还原黑色素中间体

EAA 水解生成的活性 VC 具备强还原性，可将氧化产物多巴醌还原为无色左旋多巴，打断「酪氨酸→多巴→多巴醌→多巴色素→黑色素」完整黑素合成氧化链，减少色素中间体堆积，降低皮肤着色潜力。

• 抗氧化清除自由基

EAA 可中和 UVA/UVB 照射产生的 ROS 活性氧自由基，减轻氧化应激对黑素细胞的异常刺激，减少光损伤、炎症诱发的继发性色素沉着。DPPH 体外抗氧化试验测得 EAA 自由基清除 $\text{IC}_{50}=0.032 \text{ g/L}$ ，抗氧化性能稳定。

• Nrf2 通路激活与 α -MSH 抑制

EAA 通过 p38/PKC/ROS 通路促进 Nrf2 蛋白核转位，上调 HO-1、 γ -GCLC、NQO-1 内源抗氧化酶表达；同时抑制角质细胞 p53/POMC 信号通路，减少 α -MSH 促黑素因子分泌，间接减弱黑素细胞的色素合成刺激信号。

• 自噬诱导降解黑素小体

EAA 可上调黑素细胞 LC3-II、Beclin-1 自噬标记蛋白，下调 p62 蛋白，启动自噬 - 溶酶体通路包裹、分解已形成的黑素小体；透射电镜下可清晰观测到自噬体结合黑素小体的形态变化，从细胞代谢端降低黑色素蓄积。

• 促进胶原蛋白合成

EAA 在细胞内水解生成活性 VC，作为脯氨酸、赖氨酸羟化酶必需辅酶，上调成纤维细胞 COL1A1、COL3A1 胶原基因表达，促进 I、III 型真皮胶原生成，改善皮肤松弛细纹。

推荐的增效剂/添加剂

增效成分	协同原理	推荐使用级别
烟酰胺 (VB3) INCI: NIACINAMIDE	EAA 抑制黑素生成 + 烟酰胺阻断黑素小体向角质细胞转运，双通路协同淡斑匀肤	2%-5%
维生素 E (生育酚) INCI: TOCOPHEROL	VC 与 VE 抗氧化循环再生，EAA 还原氧化态 VE，延长抗氧化作用时间	0.5%-1%
阿魏酸 INCI: FERULIC ACID	复合使用提升紫外线防护效果，SPF 增效，同时稳定 VC 活性	0.5%-1%
传明酸 (凝血酸) INCI: TRANEXAMIC ACID	EAA 抑制黑素合成 + 传明酸抑制炎症色素通路，协同改善黄褐斑、炎症后色沉	2%-3%
透明质酸钠 INCI: SODIUM HYALURONATE	保湿修护，优化肤感，缓解高浓度 VC 可能带来的干燥感	0.1%-0.3%
神经酰胺 INCI: CERAMIDE	屏障修护，提升皮肤耐受度，研究显示可提升屏障修复效率 40%	0.1%-0.5%
多肽类 (如五肽-3、六肽-12) INCI: PENTAPEPTIDE-3、HEXAPEPTIDE-12	协同抗衰，EAA 促胶原合成 + 多肽信号刺激，双重紧致抗皱	0.01%-0.1%

抗坏血酸乙基醚 (EAA) ——真正的多功能亮肤抗衰活性成分

安全稳定型维 C 衍生物 亮肤活性原料

- EAA 分子本身具备直接抗氧化、弱酪氨酸酶抑制活性；透皮入胞后经酶解生成活性 VC，强效阻断黑素合成通路；体外酪氨酸酶抑制活性优异，多通路阻断黑色素生成。
- 三维重组人色素表皮体外模型证实，连续作用可显著降低表皮黑色素含量，淡化色素沉着。
- 人体临床验证：可显著降低皮肤黑色素指数、提升皮肤 L* 亮度，改善暗沉、肤色不均，适配全 Fitzpatrick 肤色人群。

皮肤保护

- 强效 DPPH 自由基清除能力，高效中和 UV 诱导活性氧，减轻氧化应激 DNA 损伤。
- 抑制氧化应激介导 NFκB 通路活化，下调炎症因子，舒缓泛红、炎症后色沉。
- 提升细胞内抗氧化储备，协同减少蛋白质糖化损伤，维持皮肤结构完整。
- 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

- 作为胶原合成关键辅酶，显著促进人真皮成纤维细胞 I/III 型胶原蛋白生成，提升皮肤弹性参数。
- 人体 12 周复配临床、28 天原临床证实，可改善细纹、松弛、肤色暗沉等多重光老化迹象。
- 抑制基质金属蛋白酶，减少胶原降解，长期使用提升皮肤紧致度与光泽度。

主要刊物

- .Liao WC, Huang YT, Lu LP, Huang WY. Antioxidant Ability and Stability Studies of 3-O-Ethyl Ascorbic Acid, a Cosmetic Tyrosinase Inhibitor. *J Cosmet Sci.* 2018;69(4):233-243.
- Chen SJ, Hseu YC, Gowrisankar YV, et al. The anti-melanogenic effects of 3-O-ethyl ascorbic acid via Nrf2-mediated α -MSH inhibition in UVA-irradiated keratinocytes and autophagy induction in melanocytes. *Free Radic Biol Med.* 2021;173:326–340.
- Zerbiniati N, Sommati S, Maccario C, et al. The Anti-Ageing and Whitening Potential of a Cosmetic Serum Containing 3-O-ethyl-L-ascorbic Acid. *Life.* 2021;11(6):519.
- Sarawiang T. The Effect of Glyceryl Octyl Ascorbate and 3-O-Ethyl Ascorbic Acid on Skin Whitening and Skin Elasticity. Master's Thesis, Mae Fah Luang University, 2021
- Stamford NP J. Stability, transdermal penetration, and cutaneous effects of ascorbic acid and its derivatives. *J Cosmet Dermatol.* 2012;11(4):310-319.
- Hsu J. Formulating 3-O-Ethyl Ascorbic Acid: A Stable, Vitamin C-Derived Agent for Skin Whitening. *Cosmetics & Toiletries*, 2013.
- Hamanaka M, Kanto H, Mikai H, et al. A rare case of allergic contact dermatitis caused by 3-O-ethyl-L-ascorbic acid in skin-whitening cosmetics identified under immunosuppressive therapy. *Contact Dermatitis.* 2020;83(6):520–521.