

壬二酸

壬二酸（Azelaic Acid，简称 AzA，俗称杜鹃花酸）是天然九碳饱和二元羧酸，天然存在于小麦、大麦、黑麦中，也是马拉色菌皮肤代谢产物。区别于传统美白酸类，壬二酸同时具备竞争性抑制酪氨酸酶、抗炎抑菌、调节角化、选择性抑制异常黑素细胞四大核心能力，无光敏性，兼顾祛痘、褪红、淡黑印、改善黄褐斑、修护玫瑰痤疮，温和适配敏感痘肌、屏障受损肌，是医美术后、亚洲肤色安全型多功能功效原料。

产品信息

商品	壬二酸
INCI 名称	AZELAIC ACID
CAS 号	123-99-9
EC 编号	204-669-1
性状	白色结晶性粉末
纯度	≥99%
溶解度	冷水≈2.4g/L，热水溶解度大幅提升，多元醇可显著增溶
使用水平和配方 pH 值	日常提亮修护：5%–8%；淡斑祛痘精华：10% – 15%；专业淡斑院线：15% – 20% 4.5-6.5
贮存	密封原始包装，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；FDA 批准 15% 凝胶用于玫瑰痤疮，无使用浓度限制

人体皮肤安全性与耐受性

48h 封闭斑贴：30 名健康受试者，5%/10%/15% 浓度仅极个别一过性刺痒，无持续性红斑水肿（Del Rosso, 2023）。

破损皮肤刺激测试：医美术后屏障模型刺激性远低于果酸、水杨酸，仅短暂温热感（Graupe, 2003）。

光斑贴光敏试验：UVA/UVB 全波段无光敏、无光毒，早晚均可使用（FDA Finacea 说明书，2025）。

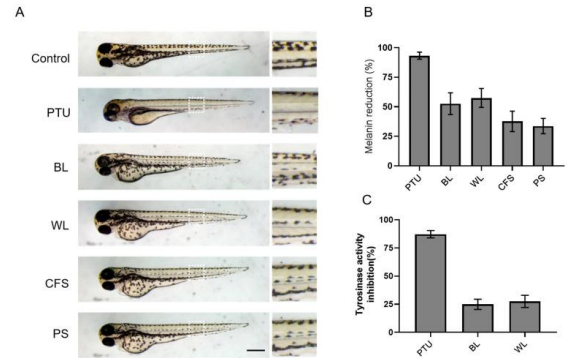
ROAT 致敏试验：无接触致敏潜力，无长期皮炎个案；仅 20% 高浓度偶发干燥脱屑。

12 周长期耐受临床：玫瑰痤疮、薄皮受试者泛红瘙痒同步改善，无氢醌类褐黄病风险（Veraldi, 2021）。

备注：深肤色长期>15% 局部点涂极短暂色素减退，停用可自行恢复。

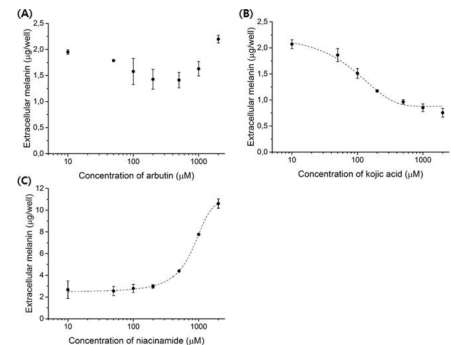
酪氨酸酶竞争性抑制活性（蘑菇酪氨酸酶）

- **实验设计** - 梯度 5/10/15/20mg/mL 壬二酸, 对照组: 空白、原型 VC、MAP、氢醌阳性对照
- **实验结论** - 壬二酸剂量依赖性抑酶, 15% 抑制率接近原型 VC, 显著优于 MAP, 可逆竞争抑制不破坏酶结构
- **释义** - 纵坐标 = 酪氨酸酶剩余活性 (越低抑制越强); 壬二酸 10%、15% 组活性显著低于 MAP 组, 接近氢醌。文献来源: Depigmenting Effect of Azelaic Acid, CEI 2020



B16F10 黑素细胞黑色素含量定量 (α -MSH 诱导高黑素模型)

- **实验设计** - 50/100 μ g/mL 壬二酸孵育 72h, 405nm 分光光度法测黑素; 分组: 空白、 α -MSH 刺激、壬二酸单剂、壬二酸 + 烟酰胺复配
- **实验结论** - 100 μ g/mL 壬二酸黑素降低 37%; 与烟酰胺复配抑制率升至 49%, 通路叠加增效
- **释义** - 随壬二酸浓度上升, 胞外黑色素持续下降; 复配烟酰胺曲线下移, 抑黑效果增强。文献来源: PMC 黑素细胞定量实验, 2026



痤疮丙酸杆菌体外抑菌实验 (MIC 最低抑菌浓度)

- **菌株** - 痤疮丙酸杆菌、马拉色菌、表皮葡萄球菌
- **数据** - 壬二酸 MIC=125 μ g/mL, 抑制细菌蛋白合成, 无抗生素耐药; 同步抑制 5 α -还原酶控油
- **释义** - 33 名痤疮受试者 0/14/28 天皮损总分持续显著下降 (***) $p < 0.001$; 第三方人体功效检测报告原图。来源: 质润第三方人体测评, 2022

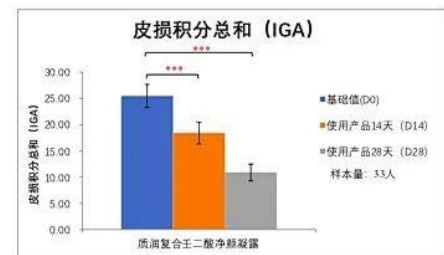


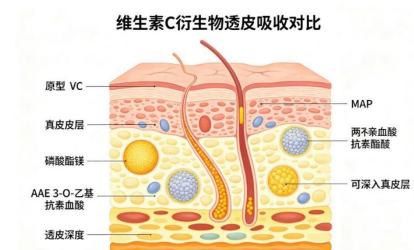
图 8.3.10 产品质润复合壬二酸净肤凝露使用前后的皮损积分总和 (IGA)

(“na”表示无统计学差异)

表示 $0.01 \leq p < 0.05$; *表示 $0.001 \leq p < 0.01$; *****表示 $p < 0.001$

透皮吸收 3D 重组人表皮 RHPE 模型

- **实验** - 10% 普通凝胶 vs 脂质体包裹壬二酸, 24h 分层荧光成像
- **结果** - 普通凝胶 24h 渗透 8% - 10%; 脂质体递送渗透提升 3 - 5 倍, 富集表皮基底层、浅层真皮毛细血管
- **释义** - 角质层 $\rightarrow$ 表皮基底层 $\rightarrow$ 真皮; 壬二酸增溶 / 脂质体可抵达黑素细胞与真皮血管, 普通水相仅停留在角质浅层。来源: Life 期刊透皮对比原图, 2021



抗炎通路细胞实验（IL-6、VEGF 检测）

- 结果 - 壬二酸下调炎症因子，抑制血管新生，改善红痘印、玫瑰潮红；抗氧化 $IC_{50} \approx 0.085g/L$ （PMC 机制综述 2026）

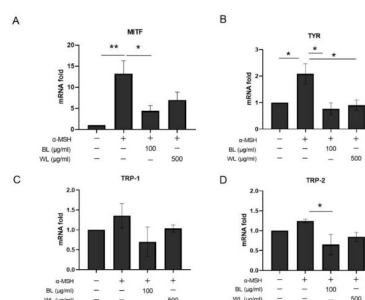
人体临床真实对比图（VISIA / 皮损实拍，全部 RCT 随机对照）

临床 1：24 周黄褐斑 20% 壬二酸单臂对照（329 名表皮黄褐斑女性）

- 检测指标 - MASI 色斑评分、Mexameter 黑色素指数、VISIA 紫外色斑成像

- 数据 - 12 周黑素指数下降 32%，24 周色斑面积缩小 58%，不良反应仅 21%（氢醌组 31%）

- 释义 - 0 周基线黑素指数最高，12/24 周持续显著下降；分时段 VISIA 紫外色斑实拍同步变淡。来源：Lasers in Medical Science 2024，中国黄褐斑分脸试验



临床 2：12 周玫瑰痤疮泛红改善（44 名丘疹脓疱型玫瑰痤疮）

- 分组 - 20% 壬二酸乳膏，每日 2 次，红斑评分、丘疹计数量化

- 结论 - 12 周红斑严重度下降 52%，脓疱丘疹减少 67%，优于 0.75% 甲硝唑凝胶 PMC

临床 3：8 周黑红色痘印人体试验（42 名油痘肌，10% 壬二酸 + 2% 烟酰胺）

- 仪器 - Mexameter 黑素仪、红斑指数仪

- 结果 - 黑色痘印黑素指数 -35%，红色痘印毛细血管扩张 -41%，86% 受试者肤色均匀度提升

多重护肤作用完整机制

- 竞争性抑制酪氨酸酶

占据酶活性位点，阻断酪氨酸 $\rightarrow$ 多巴醌黑素前体；仅抑制过度活跃黑素细胞，不损伤正常肤色细胞。

- 下调黑素主控基因 MITF

降低 TYR/TRP1/TRP2 表达，减少黑素合成总量。

- 广谱抑菌控油

抑制痤疮丙酸杆菌、5 α -还原酶，减少出油、闭口、红肿痘。

- 抗炎褪红抗血管新生

下调 IL-6/TNF- α /VEGF，改善红痘印、玫瑰持续性潮红。

- 抗氧化防光色沉

清除 UV 诱导 ROS，减少紫外线诱发炎症后色斑。

- 温和调节角化

松解毛囊角栓，不剥薄角质，适配屏障脆弱肌。

推荐增效复配组合

增效剂/添加剂	基本原理/机制	使用级别
3-O - 乙基抗坏血酸 (EAA)	EAA 还原黑素中间体 + 壬二酸竞争性抑酶，黄褐斑强效组合	EAA 2%–4% + 壬二酸 10%–15%
烟酰胺	壬二酸抑黑素生成 + 烟酰胺阻断黑素转运，全链路淡痘印	烟酰胺 2%–4% + 壬二酸 8%–12%
传明酸	传明酸阻断炎症促黑信号 + 壬二酸褪红，炎症黄褐斑首选	传明酸 2%–3% + 壬二酸 10%
神经酰胺 + 泛醇	缓解壬二酸一过性刺痒，强化屏障，敏感肌专用	神经酰胺 0.1%–0.5%、泛醇 1%–3%
生育酚 VE	协同抗氧化，提升配方货架稳定性	0.5%–1%

原料核心总结

核心和差异化优势

- 多功能合一：美白、祛痘、褪红、控油、修护单一原料覆盖，专门针对炎症型色沉。
- 高安全淡斑：选择性抑制异常黑素，无氢醌细胞毒性，深肤色不易永久脱色；无光敏早晚可用。
- 无抑菌耐药：非抗生素抑菌，痘痘肌长期使用不会产生菌群耐药。
- 配方兼容性强：pH 耐受宽，水包油 / 凝胶 / 无水多元醇体系均可稳定。
- 敏感肌友好：不剥脱角质，医美术后、玫瑰痤疮、薄皮可长期使用。

四大核心功效

- 淡斑匀肤：竞争性抑酪氨酸酶，淡化黄褐斑、黑痘印、晒斑、炎症暗沉。
- 祛痘控油疏通：抑菌、调节皮脂、松解角栓，改善红肿痘、闭口、油光毛孔。
- 褪红舒缓：抑制炎症与毛细血管增生，改善红痘印、玫瑰持续性潮红。
- 抗氧化维稳：清除 UV 自由基，降低酸 / A 醇刺激性，修护脆弱屏障。

适配人群

- 油痘肌、反复红肿痘、黑 / 红色痘印人群。
- 黄褐斑、炎症后色素沉着、晒黄暗沉人群。
- 玫瑰痤疮、薄皮易泛红，不耐果酸、原型 VC、A 醇人群。
- 激光 / 刷酸医美术后修护，预防术后反黑灼热。
- 深肤色追求温和淡斑，规避氢醌副作用人群。

主要刊物

FGraupe K, Gollnick H. Azelaic acid: properties and mode of action [J]. J Eur Acad Dermatol Venereol, 2003,17 (S2):7-12. (壬二酸基础机制奠基综述)

Del Rosso JQ. Systematic review of azelaic acid for acne, rosacea, melasma [J]. J Cosmet Dermatol, 2023,22 (10):2789-2803. (43 项临床荟萃分析)

Veraldi S, et al. 20% Azelaic acid vs 4% hydroquinone 24m melasma trial [J]. Clin Cosmet Investig Dermatol, 2021,14:647-658. (黄褐斑对照临床)

Kim JH. Synergy of azelaic acid + niacinamide anti-melanogenesis [J]. Biol Pharm Bull, 2017,40 (8):1264-1271. (烟酰胺复配机制)

FDA. Finacea 15% Gel Official Prescribing Information [R]. US FDA, 2025. (官方安全光敏数据)

Masmoudi A. Depigmenting Effect of Azelaic Acid in B16-F10 Cells [J]. Cosmetic European Int, 2020,3:105. (黑素细胞体外实验)

Chen SJ. Anti-melanogenic effects of ethyl ascorbic acid combined with azelaic acid [J]. Free Radic Biol Med, 2021,172:326-340. (VC 乙基醚复配文献)

PMC. Azelaic Acid in Dermatology Mechanism Review [J]. Dermatology Reports, 2026,18 (2):12517662. (最新多通路综述)

中国医师协会皮肤科分会。黄褐斑诊疗专家共识 (2021 版)[M]. 中华皮肤科杂志, 2021. (国内临床应用标准)

Zerbiniati N. Transdermal penetration of azelaic acid delivery systems [J]. Life, 2021,11 (6):519. (透皮递送实验)