

超果酸精准控释技术在皮肤学中的应用研究进展

何辉明

(新加坡国立皮肤中心)

摘要：皮肤功效成分纳米载体具有治疗皮肤病和护肤美容等功效，在经皮给药和化妆品领域具有良好的应用前景。该文介绍了应用于皮肤功效成分纳米载体的性能特点，并着重介绍了超果酸精准控释技术在皮肤学中的应用研究进展。

关键词：超果酸；控释；载体技术；研究进展

广义的经皮给药系统包括皮肤局部药物递送系统 (dermal drug delivery systems) 和透皮药物递送系统 (transdermal drug delivery systems)^[1]，前者作用于皮肤或皮下组织，后者是药物通过皮肤吸收入入循环系统从而发挥全身治疗作用。皮肤功效成分作用于皮肤组织可起到治疗皮肤病或护肤美容的作用，如神经酰胺作用于角质层对过敏性皮炎、特应性皮肤瘙痒症、银屑病等有辅助治疗作用^[2]，熊果苷作用于基底层可阻止黑色素生成达到皮肤美白效果^[3]，表皮生长因子作用于真皮层可起到加快创面修复速度、促进受损皮肤再生等作用^[4]。对于皮肤功效成分，在增强其皮肤渗透时，还需要有效提高其皮肤滞留量，才能更好发挥其功效。纳米载体是以粒径 10-1000 nm 纳米颗粒作为药物载体，将功效成分以包埋、分散、吸附、耦联等方式成为分

散体。

近年来研究表明，纳米载体可有效促进皮肤功效成分透过角质层，并显著增加功效成分皮肤滞留，同时，纳米载体能够有效改善难溶活性成分的水分散性，提高活性成分的稳定性，在皮肤疾病治疗和护肤美容等领域显示良好的应用前景^[5]。本文介绍了应用于皮肤功效成分纳米载体的性能特点，并着重介绍了超果酸精准控释技术在皮肤学中的应用研究进展。

1 新型载体技术

1.1 微海绵

微海绵是一种近些年来发展起来的新型给药载体，通常由交联聚合物构成，内部含有非常多囊泡状微孔结构，球体表面布满了细小孔道的开口，如图 1。

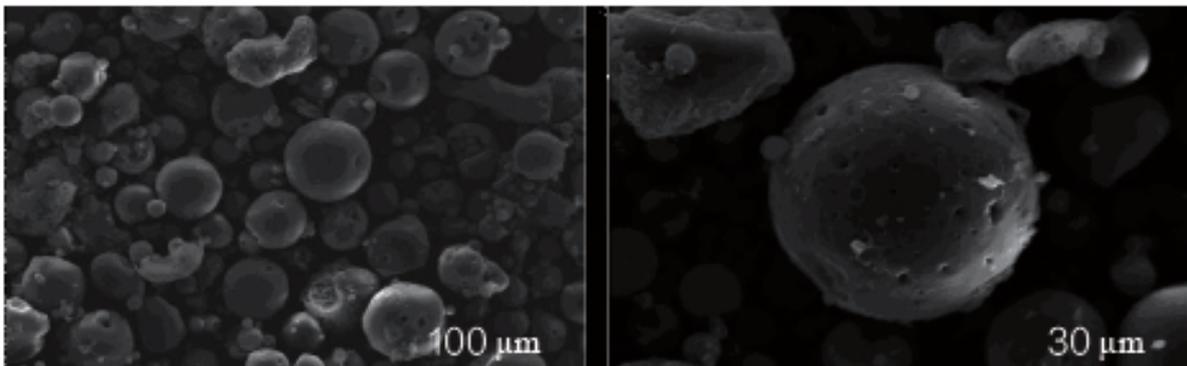


图 1 微海绵结构图

这种聚合物体系像海绵一样有着很高的内部容积，微球粒径范围为 5-300 μm，可吸附包裹多种活性物，载药量可高达 50%~60%，并且可加入不同的配方中，例如凝胶、乳液膏霜、液体或粉末等，以增强配方灵活性。微海绵可有效增强被包裹活性物的稳定性，控制活性物释放，避免局部浓度过高，提高活性物安全性，其主要的释药机理为扩散，不同于一般微球的突释，被包裹的活性成分会缓慢而持久地从聚合物的空隙中慢慢扩散出来，持续释放药物时间可达到 24h，能提高局部生物利用度，影响药物释放的因素主要有药物、聚合物的比例、孔隙容积、表面积和孔隙率等。此外，还受到压力、温度、湿度、

摩擦力以及 pH 等因素的影响。微海绵自身物理稳定性和化学稳定性较好，无毒、无刺激性、无致敏性以及致畸性，安全性非常高，并且微海绵的平均孔径较小，可防止细菌渗透，因此无需灭菌或添加防腐剂。由于微海绵的结构特性，涂抹于皮肤上时，能够提供额外的吸油作用，在非干燥状态下，可吸收 6 倍自身质量的油脂，达到控油的效果，保持皮肤干爽。

1.2 超果酸精准控释技术

超果酸精准控释技术作为果酸专研新型载体技术，能够有效降低果酸刺激性，具有舒缓抗敏的效果，同时提高皮肤对于活性物质的吸收效果。超果酸精准控释技术在触肤瞬间根据皮

肤 PH 值智能自组装, 分解成一个个包裹着果酸的纳米级超果酸分子, 层层缓释、精准渗透到肌底层, 实现超果酸分子高效吸收且无刺激性。如图 4 所示, 当 pH=7.4, 聚集体粒径为 10-30

μm 。当 pH=6.6, 聚集体粒径小于 $10\mu\text{m}$ 。当 pH=5.8 时, 结构发生自组装, 粒径显著变小, 自动分解成无数个纳米级超分子, 钻进毛孔, 令果酸焕肤更加高效温和。

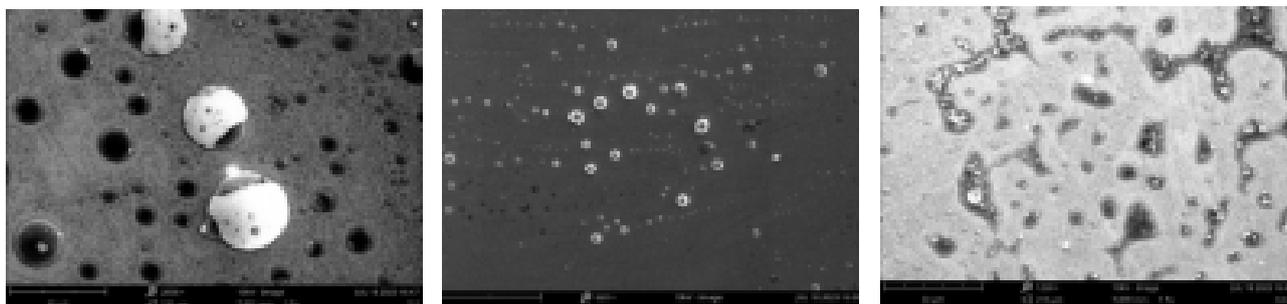


图 4 纳米超分子微米级组装体, 不同 pH 值下的粒径变化

2 超果酸精准控释技术特点

超果酸精准控释技术运用超分子自组装技术, 将果酸包裹缓释, 隔绝刺激, 触肤瞬间, 能靶向识别皮肤 PH 环境进行自组装, 智能粒径变小, 自动分解成无数个纳米级超分子, 钻进毛孔, 令果酸焕肤更加高效温和。

2.1 缓释能力, 温和亲肤

对比传统果酸产品, 超果酸精准控释技术具备的缓释能力, 稳控深入肌肤, 增加了果酸的作用时长, 从而减少对皮肤的刺激。

2.2 包裹属性, 避免局部裸露刺激

超果酸精准控释技术带包裹载酸属性, 把一个个果酸分子包裹起来, 通过智能识别皮肤 PH 环境, 靶向层层释放适合肌肤浓度, 隔绝果酸局部浓度过高带来的刺激。

2.3 纳米级超分子, 高效渗透

超果酸精准控释技术在触肤瞬间自动分解成无数个包裹着果酸的纳米级超分子, 钻进毛孔, 渗透性更强, 令果酸焕肤更加高效。

3 总结与展望

中国消费者对于皮肤美容的需求日益旺盛, 带动了化妆品行业蓬勃发展, 人们对护肤的需求不再停留在简单的清洁和保湿, 更加追求美白、抗衰等功效型产品。研制功效型产品时, 选择合适的活性成分并采用科学的配方技术得到安全、稳定和有效的产品成为许多开发人员面临的问题。目前研究发现, 应用了超果酸精准控释技术的超果酸能在不刺激皮肤情况下加速皮肤角质代谢, 因而可作为促渗剂。后续搭配功效型产品使用

能促进产品成分渗透吸收, 增强功效, 可与烟酰胺、维 A 醇、维 C 等成分搭配。

未来超果酸精准控释技术将继续在皮肤学领域发挥重要的作用, 但是仍然需要进一步对其开展基础研究, 例如和皮肤之间的相互作用机理、对皮肤的安全隐患以及如何影响活性物质的功效等, 才能更加科学高效地发挥其经济价值。

参考文献:

- [1] ROBERT L. Transdermal drug delivery: past progress, current status, and future prospects[J]. *Adv Drug Deliv Rev*, 2004, 56(5): 557—558.
- [2] MOJUMDAR E H, GOORIS G S, BARLOW D J, et al. Skinlipids: localization of ceramide and fatty acid in the unit cell of the long periodicity phase[J]. *Biophysical J*, 2015, 108(11): 2670—2679.
- [3] SEO D H, JUNG J H, LEE J E, et al. Biotechnological production of arbutins (d- and 3-arbutins), skin-lightening agents, and their derivatives[J]. *Appl Microbiol Biotechnol*, 2012, 95(6): 1417—1425.
- [4] CHOI J K, JANG J H, JANG W H, et al. The effect of epidermal growth factor (EGF) conjugated with low-molecular-weight protamine (LMWP) on wound healing of the skin[J]. *Biomaterials*, 2012, 33(33): 8579—8590.
- [5] GANESAN P, CHOI D. Current application of phytochemical-based nanocosmeceuticals for beauty and skin therapy[J]. *Int J Nanomedicine*, 2016, 11: 1987—2007.