

# Research Progress of Bakuchiol in the Field of Cosmetics

Huibin Zhu

Patent Examination Cooperation Hubei Center of the Patent Office, Wuhan Hubei  
Email: 810655486@qq.com

Received: Jun. 18<sup>th</sup>, 2019; accepted: Jun. 28<sup>th</sup>, 2019; published: Jul. 5<sup>th</sup>, 2019

---

## Abstract

Psoralen is a Chinese traditional medicine that can be used to treat a variety of diseases. Bakuchiol is an important monoterpenoid extracted from psoralen and has a wide range of pharmacological activities. At present, there are increasing reports on the related applications of bakuchiol in cosmetics at home and abroad. Bakuchiol has many activities such as whitening, anti-inflammatory, antibacterial, anti-oxidation and anti-aging, which is a promising active ingredient in cosmetic. This article gives a brief introduction to the achievements and developments of bakuchil in the field of cosmetics.

## Keywords

Cosmetics, Bukuchiol, Whitening, Anti-Inflammatory, Antibacterial, Anti-Oxidation, Anti-Aging

---

# 补骨脂酚在化妆品领域的研究进展

朱荟彬

专利审查协作湖北中心, 湖北 武汉  
Email: 810655486@qq.com

收稿日期: 2019年6月18日; 录用日期: 2019年6月28日; 发布日期: 2019年7月5日

---

## 摘要

补骨脂是一种传统的中国民间草药, 可用于治疗多种疾病, 补骨脂酚是从补骨脂中提取分离的一种重要单萜类化合物, 它具有广泛的药理活性。目前国内外关于补骨脂酚在化妆品中的相关应用的研究报道日益增多, 补骨脂酚具有美白、抗炎、抗菌、抗氧化、抗衰老等多种活性, 是一种极具潜力的化妆品活性成分。本文就补骨脂酚在化妆品领域的研究成果及发展动态作简要介绍。

## 关键词

化妆品, 补骨脂酚美白, 抗炎, 抗菌, 抗氧化, 抗衰老

Copyright © 2019 by author(s) and Hans Publishers Inc.

This work is licensed under the Creative Commons Attribution International License (CC BY).

<http://creativecommons.org/licenses/by/4.0/>



Open Access

## 1. 介绍

补骨脂是豆科植物补骨脂的成熟果实。传统医学研究表明补骨脂味辛、苦, 归肾、脾经, 具有温肾补阳、纳气、止泻之功效, 用于阳痿遗精, 遗尿尿频, 腰膝冷痛, 肾虚作喘, 五更泄泻; 外用治白癜风、斑秃。研究表明, 补骨脂的主要化学成分有香豆素类、萘酚类、黄酮类等。香豆素类化合物又可分为呋喃香豆素类化合物和拟雌内酯化合物, 前者代表药物有补骨脂素、异补骨脂素和 8-甲氧基补骨脂素, 后者代表药物有补骨脂定、异补骨脂定; 萘酚类化合物的代表药物为补骨脂酚, 其是异戊二烯基萘酚类化合物; 黄酮类化合物有多种黄酮醇、二氢黄酮、查耳酮等[1]。

补骨脂酚主要存在于植物“补骨脂”( *Psoralea corylifolia*) 的种子中, 补骨脂酚是补骨脂挥发油的主要成分, 约占 60% [2]。研究表明, 补骨脂酚具有抗炎[3]、抗菌[4]、抗氧化[5]、抗衰老[6]等作用。近几年来, 补骨脂酚的研究越来越多, 其美容护肤作用也引起广泛关注, 是一种极具潜力的具有多种功效的化妆品活性成分。

## 2. 补骨脂酚与皮肤相关的活性研究

### 2.1. 抗炎

炎症(inflammation)具有血管系统的活体组织受到损伤刺激而发生多种细胞、因子参与的防御性免疫病理反应: 以血管和血细胞反应为基础, 损伤发生时, 机体血管内液体和白细胞随循环系统运送到损伤部位, 白细胞经过黏附、渗出、趋化、吞噬和释放, 限制和杀灭损伤因子, 清除坏死组织, 发挥强大而复杂的防御保护作用。炎症引发的皮肤表现包括红、肿、热、痛和功能障碍五大特征, 严重者通常通过激素进行治疗, 而长期不规范使用激素也可能诱发多种皮肤问题, 因此寻找一种安全有效的抗炎植物成分成为化妆品领域研究热点之一。

研究表明补骨脂酚可以降低 NO (一氧化氮), PE2 (前列腺素 2), LTB4 (白三烯 B4)和 TxB2 (血栓素 B2)的产生以产生抗炎作用。S. Ma 等[3]人利用补骨脂酚的抗炎作用, 用补骨脂酚和水杨酸合成了一种新化合物 bakusylan, 这种新化合物这两种皮肤活性分子的酯化产物, 其通过抑制 IFN-STAT1 途径对细胞因子进行角质形成细胞脱敏, 表明该种新化合物的类视黄醇样抗炎潜力。而在许多皮肤疾病中这种 IFN-STAT1 途径都被激活, 因此 bakusylan 的使用不仅限于银屑病。这将使其适用于多种皮肤病和皮肤护理中。

### 2.2. 抗菌

人类皮肤上往往附着大量的细菌, 在皮肤完整、良好的情况下不会因为这些细菌的存在而发病。但是, 当皮肤受损或者人体的外环境受到破坏时, 就会引起各种细菌性皮肤病, 如毛囊炎、疖、脓疱疮等。此种皮肤病我们称之为原发性感染, 是由单一病菌发生在正常皮肤上引起的。除原发性感染外, 还有继

发性感染，它发生在已有病变的皮肤上继发细菌感染，如脚气、湿疹等。

补骨脂酚是一种潜在的抗菌物质，Sun 等人的研究表明补骨脂酚是一种抗菌化合物，通过降解 DNA 螺旋和拓扑异构酶 II 酶活性来抑制核酸合成，从而阻碍 DNA 的生物合成并最终导致细菌死亡[4]。此外，其他研究表明，BAK 可有效抑制耐甲氧西林金黄色葡萄球菌，表皮葡萄球菌，皮肤真菌和分枝杆菌[7] [8] [9]。

尤尼根公司利用补骨脂酚的抑菌作用推出了名为 Bakutrol 的抗粉刺产品，可有效减轻痤疮所留下的瘢痕，显著改善皮肤状况，并且临床试验显示，补骨脂酚不会导致皮肤刺激或干燥，可以与其他抗粉刺成分共同应用于化妆品行业。Lau KM 等[10]研究表明补骨脂酚对须毛癣菌、红色毛癣菌、宛氏拟青霉等皮肤真菌也具有抑菌活性。

Kobayashi 等[11]研究发现补骨脂酚对变形链球菌、血链球菌、唾液链球菌、表兄链球菌、粪肠球菌、屎肠球菌、嗜酸乳杆菌、干酪乳杆菌、胚芽乳杆菌、粘性放线菌和牙龈卟啉单胞菌均表现出抗微生物活性，提示补骨脂酚是一种潜在的口腔病原体杀菌剂，可以作为预防及治疗龋齿的漱口剂。

### 2.3. 抗氧化

自由基能使细胞和组织产生有害的生物学效应，其能使质膜中的不饱和脂肪酸氧化，从而使膜内酶的活性破坏、蛋白质变性、膜脆性增加、膜结构改变，因而膜的运输功能紊乱以致丧失；还能使 DNA 链断裂、交联等对 DNA 造成损伤。自由基对细胞的破坏也是个体衰老的主要原因。随着年龄的增长，结缔组织中的胶原蛋白也可以在自由基的作用下发生交联，形成巨大的不溶性分子，导致胶原长度缩短，失去膨胀能力，因此皮肤出现皱纹；脂质过氧化产生的丙二醛可与磷脂和蛋白质等结合，形成脂褐素而沉积于皮肤上而出现老年斑。因此抗氧化是化妆品领域一直关注的重点之一。

补骨脂酚是比维生素 E 更强的脂溶性抗氧化剂，研究表明补骨脂酚可以抑制 tBH·, CCl<sub>4</sub>·, D-GalN-和 NADH-诱导的脂质过氧化。还可以抑制由各种氧化自由基诱导的脂质过氧化，例如 Cl<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>, LOO·, DPPH 自由基和 OH· [10]。

### 2.4. 抗衰老

衰老是一种随着时间的推移而发生的不可避免的自发生物过程，是一种复杂但自然的现象。胶原蛋白是人体皮肤中最重要的结构蛋白之一[12]；这种蛋白质主要由成纤维细胞合成和分泌，对维持皮肤张力和改善衰老引起的皮肤收缩具有重要意义[13]。已有研究表明，补骨脂酚可以增强人皮肤成纤维细胞活性[14]，促进皮肤 TIMP-2 升高，MMP-1 降低，从而降低皮肤胶原蛋白的分解，同时还能促进皮肤胶原蛋白的合成，因此达到抗衰老的功效。于茜[14]等研究了补骨脂酚对人真皮正常成纤维细胞(ESF-1)抗衰老基因的调控机制进行了研究，表明补骨脂酚能促进 ESF-1 细胞的增殖，促进胶原蛋白和基质金属蛋白酶抑制剂 mRNA 的表达，并能抑制基质金属蛋白酶 mRNA 的表达，从而发挥抗皮肤衰老的作用。补骨脂酚也被设计为 askin 护理产品并且已经在临床中进行了测试，结果证明 BAK 显著改善了皮肤状况。

R. K. Chaudhuri 等[6]也对补骨脂酚的抗衰老活性进行了研究，该研究表明补骨脂酚在结构上虽然不类似于视黄醇，但是其可以作为视黄醇的替代品，该研究将补骨脂酚配置成化妆品并通过每天两次的皮肤涂抹实验进行临床病例观察，结果显示，经过 12 周的治疗，受试者皮肤皱纹有明显改善，且观察到色素沉着、皮肤弹性、光损伤的有效改善，且没有通常视黄醇相关的不良反应，其具有抗衰老作用。

为了进一步证实补骨脂酚是否能作为视黄醇替代品，来自美国加利福尼亚、密歇根州、佛罗里达州和宾夕法尼亚州几所大学的研究人员进行了双盲试验[15]，旨在对补骨脂酚与常用抗衰老物质“视黄醇”进行功效和副作用比较。44 名志愿者被要求在面部皮肤上每天两次涂抹 0.5%的补骨脂酚乳膏或者每天一次涂抹 0.5%的视黄醇乳膏，连续 12 周。此前的研究表明，0.5%视黄醇可有效预防和消除皮肤衰老征兆，

但会引起刺痛、起皮、发红等副作用。该研究使用面部照相和分析系统用在第 0、4、8 和 12 周拍摄并分析高分辨率照片,患者也回答了有关副作用的问题。且对色素沉着和发红体征进行了分级。本研究发现,补骨脂酚和视黄醇都会显著缩小皱纹表面积并减少色素沉着过度,两种化合物之间不存在统计学意义上的差别。但视黄醇使用者报告起皮和皮肤刺痛的频率更高。在 12 周结束后,视黄醇组皱纹严重程度降低 20%,补骨脂酚组有 59%的参加者表现出色素沉着过度问题得到改善,而视黄醇组为 44%。表明,补骨脂酚有望成为一种副作用极小的有效抗衰老疗法,但仍然需要更大规模的研究证实[15]。

Chaudhuri RK 等人[6]从细胞途径上对补骨脂酚和视黄醇进行了研究,表明补骨脂酚似乎靶向几种与视黄醇靶向相似的细胞途径,包括视黄酸受体基因的调节和胶原蛋白和细胞外基质合成酶的上调。

除此之外,紫外线也是引起皮肤衰老的重要因素。其中 UVB 可以穿透表皮。紫外线照射剂量超过皮肤承受能力,会引发皮肤炎症、老化、凋亡甚至皮肤癌[16]。孙琪等[17]研究了补骨脂酚对 UVB 诱导 HaCaT 细胞凋亡因子 p53 和 caspase-3 表达的影响及其机制,表明给与补骨脂酚治疗后,治疗组 HaCaT 细胞凋亡水平显著降低,证实补骨脂酚对 HaCaT 细胞凋亡保护作用的机制可能是通过调节 p53 及 caspase-3 相关基因的表达。提出可以将补骨脂酚应用于天然化妆品中,预防紫外线对皮肤的破坏。

## 2.5. 美白作用

酪氨酸酶是黑色素合成的关键限速酶,在治疗色素障碍性皮肤病中,酪氨酸酶抑制剂发挥着重要作用。近年来多以酪氨酸酶抑制剂作为美白剂开发的美白祛斑产品。李娜等[18]采用酶促反应动力学方法研究了补骨脂酚对酪氨酸单酚酶和二酚酶活性的影响,结果表明在补骨脂酚对酪氨酸单酚酶和二酚酶均有抑制作用,在低浓度范围内,补骨脂酚对酪氨酸酶的抑制作用较熊果苷更明显,具有成为天然酪氨酸酶抑制剂的潜力。

Ohno 等[19]发现补骨脂酚对  $\alpha$ -促黑素引发的 B16 小鼠黑素瘤细胞中黑色素的形成有潜在抑制作用且无细胞毒性,这意味着补骨脂酚有可能成为一种有效的皮肤增白剂。美国尤尼根公司对补骨脂酚进行了研究,表明其可以治疗皮肤炎症后色素过度沉积。

## 3. 小结

补骨脂酚来源于补骨脂的成熟种子,是其挥发油的主要成分。多项研究表明,补骨脂酚具有很好的抗炎、抗菌、抗氧化、抗衰老以及美白等功效,是一种极具潜力的美容护肤活性成分。尤其是,补骨脂酚克服了目前护肤品中最有效的抗衰老成分视黄醇容易导致皮肤刺激和过敏的缺点,具有良好的稳定性且副作用小,对皮肤的刺激性低,可以用作视黄醇的替代品起到抗衰老的作用。

## 参考文献

- [1] 梁建军, 徐亚莉, 田树喜. 补骨脂研究现状及前景[J]. 河北中医, 2013, 35(12): 1904-1906.
- [2] 曹金一. 补骨脂本草文献与质量研究[D]: [硕士学位论文]. 北京: 北京中医药大学, 2009: 93.
- [3] Ma, S., Gobis, K., Swindell, W.R., Chaudhuri, R., Bojanowski, R. and Bojanowski, K. (2017) Synthesis and Activity of the Salicylic Acid Ester of Bakuchiol in Psoriasis-Surrogate Keratinocytes and Skin Substitutes. *Clinical and Experimental Dermatology*, **42**, 241-366. <https://doi.org/10.1111/ced.13024>
- [4] Sun, N.J., Woo, S.H., Cassady, J.M. and Snapka, R.M. (1998) DNA Polymerase and Topoisomerase ii Inhibitors from *Psoralea corylifolia*. *Journal of Natural Products*, **61**, 362-366. <https://doi.org/10.1021/np970488q>
- [5] Adhikari, S., Joshi, R., Patro, B.S., Ghanty, T.K., Chintalwar, G.J., Sharma, A., et al. (2003) Antioxidant Activity of Bakuchiol: Experimental Evidences and Theoretical Treatments on the Possible Involvement of the Terpenoid Chain. *Chemical Research in Toxicology*, **16**, 1062-1069. <https://doi.org/10.1021/tx034082r>
- [6] Chaudhuri, R.K. and Bojanowski, K. (2014) Bakuchiol: A Retinol-Like Functional Compound Revealed by Gene Expression Profiling and Clinically Proven to Have Anti-Aging Effects. *International Journal of Cosmetic Science*, **36**,



- 221-230. <https://doi.org/10.1111/ics.12117>
- [7] Cui, Y., Taniguchi, S., Kuroda, T. and Hatano, T. (2015) Constituents of *Psoralea corylifolia* Fruits and Their Effects on Methicillin-Resistant *Staphylococcus aureus*. *Molecules*, **20**, 12500-12511. <https://doi.org/10.3390/molecules200712500>
- [8] Li, L., Chen, X., Liu, C.C., Lee, L.S., Man, C. and Cheng, S.H. (2016) Phytoestrogen Bakuchiol Exhibits *in Vitro* and *in Vivo* Anti-Breast Cancer Effects by Inducing S Phase Arrest and Apoptosis. *Frontiers in Pharmacology*, **34**, 128. <https://doi.org/10.3389/fphar.2016.00128>
- [9] Newton, S.M., Lau, C., Gurcha, S.S., Besra, G.S. and Wright, C.W. (2002) The Evaluation of Forty-Three Plant Species for *in Vitro* Antimycobacterial Activities; Isolation of Active Constituents from *Psoralea corylifolia* and *Sanguinaria canadensis*. *Journal of Ethnopharmacology*, **79**, 57-67. [https://doi.org/10.1016/S0378-8741\(01\)00350-6](https://doi.org/10.1016/S0378-8741(01)00350-6)
- [10] Lau, K.M., Fu, L.H., Cheng, L., et al. (2010) Two Antifungal Components Isolated from Fructus *Psoraleae* and Folium *Eucalypti Globuli* by Bioassay-Guided Purification. *The American Journal of Chinese Medicine*, **38**, 1005-1014. <https://doi.org/10.1142/S0192415X10008421>
- [11] Tsukiyama, R.I., Katsura, H., Tokuriki, N. and Kobayashi, M. (2002) Antibacterial Activity of Licochalcone A against Spore-Forming Bacteria. *Antimicrobial Agents and Chemotherapy*, **46**, 1226-1230. <https://doi.org/10.1128/AAC.46.5.1226-1230.2002>
- [12] Morikiri, Y., Matsuta, E. and Inoue, H. (2018) The Collagen-Derived Compound Collagen Tripeptide Induces Collagen Expression and Extends Lifespan via a Conserved p38 Mitogen-Activated Protein Kinase Cascade. *Biochemical and Biophysical Research Communications*, **505**, 1168-1173. <https://doi.org/10.1016/j.bbrc.2018.10.044>
- [13] Limtrakul, P., Yodkeeree, S., Punfa, W. and Srisomboon, J. (2016) Inhibition of the MAPK Signaling Pathway by Red Rice Extract in UVB-Irradiated Human Skin Fibroblasts. *Natural Product Communications*, **11**, 1877-1882. <https://doi.org/10.1177/1934578X1601101226>
- [14] 于茜, 邹海曼, 王帅, 徐艳明, 李建民, 张宁. 补骨脂酚对 ESF-1 细胞抗衰老基因调控机制研究[J]. 中药材, 2014, 37(4): 632-635.
- [15] Dhaliwal, S., Rybak, I., Ellis, S.R., Notay, M., Trivedi, M., Burney, W., Vaughn, A.R., Nguyen, M., Reiter, P., Bosanac, S., Yan, H., Foolad, N. and Sivamani, R.K. (2018) Prospective, Randomized, Double-Blind Assessment of Topical Bakuchiol and Retinol for Facial Photoageing. *British Journal of Dermatology*, **180**, 289-296. <https://doi.org/10.1111/bjd.16918>
- [16] 马蕊, 刘仲华, 黄建安. 绿茶和红茶提取物抑制中波紫外线诱导 HaCaT 细胞氧化损伤和凋亡的比较[J]. 湖南农业大学学报, 2013, 39(4): 377-381.
- [17] 孙琪, 朴成玉, 陈丹丹, 石晨曦, 刘永武, 穆阳, 曹玲, 张宁. 补骨脂酚对 UVB 诱导 HaCaT 细胞凋亡因子 p53 和 Caspase-3 表达的影响[J]. 中国美容医学, 2017, 26(7): 37-40.
- [18] 李娜, 王亚静, 朱光媚, 王婷婷, 周浩, 田倩瑜, 张哲. 补骨脂酚对酪氨酸酶活性的影响及动力学分析[J]. 中国实验方剂学杂志, 2017, 23(1), 30-33.
- [19] Ohno, O., Watabe, T., Nakamura, K., Kawagoshi, M., Uotsu, N., Chiba, T., Yamada, M., Yamaguchi, K., Yamada, K., Miyamoto, K. and Uemura, D. (2010) Inhibitory Effects of Bakuchiol, Bavachin, and Isobavachalcone Isolated from *Piper longum* on Melanin Production in B16 Mouse Melanoma Cells. *Bioscience Biotechnology and Biochemistry*, **74**, 1504-1506. <https://doi.org/10.1271/bbb.100221>

### 知网检索的两种方式:

1. 打开知网首页: <http://cnki.net/>, 点击页面中“外文资源总库 CNKI SCHOLAR”, 跳转至: <http://scholar.cnki.net/new>, 搜索框内直接输入文章标题, 即可查询; 或点击“高级检索”, 下拉列表框选择: [ISSN], 输入期刊 ISSN: 2160-441X, 即可查询。
2. 通过知网首页 <http://cnki.net/>顶部“旧版入口”进入知网旧版: <http://www.cnki.net/old/>, 左侧选择“国际文献总库”进入, 搜索框直接输入文章标题, 即可查询。

投稿请点击: <http://www.hanspub.org/Submission.aspx>

期刊邮箱: [pi@hanspub.org](mailto:pi@hanspub.org)