

小蓟的研究进展

杨炳友, 杨春丽, 刘 艳, 匡海学*

黑龙江中医药大学 北药基础与应用研究教育部重点实验室, 黑龙江 哈尔滨 150040

摘要: 小蓟作为药食两用的植物资源, 已有数千年的悠久历史。目前研究发现, 小蓟主要含黄酮类、萜类、苯丙素类、苯乙醇苷类、生物碱类、植物甾醇类等多种化学成分, 具有止血、凝血、对心血管系统的作用、抗菌、抗炎等多种药理活性。查阅近 30 年国内外文献, 对小蓟的化学成分和药理作用等方面进行综述, 以期对小蓟的深入研究和开发利用提供参考。

关键词: 小蓟; 菊科; 黄酮类; 止血; 凝血; 抗菌; 抗炎

中图分类号: R282.71 **文献标志码:** A **文章编号:** 0253-2670(2017)23-5039-10

DOI: 10.7501/j.issn.0253-2670.2017.23.033

Research progress on *Cirsium setosum*

YANG Bing-you, YANG Chun-li, LIU Yan, KUANG Hai-xue

Key Laboratory of Chinese Materia Medica Ministry of Education, Heilongjiang University of Chinese Medicine, Harbin 150040, China

Abstract: *Cirsium setosum* is used as both food and medicine for thousands of years. Recently, it is reported that the chemical constituents of *C. setosum* mainly contain flavonoids, terpenoids, phenylpropanoids, phenylethylglycosides, alkaloids, and phytosterols, which have the pharmacological activities of hemostasis, clotting, cardiovascular, anti-oxidation, anti-bacterial, anti-inflammatory and so on. This paper reviews the researches on the chemical constituents and pharmacological activities of *C. setosum* in the past 30 years at home and abroad to provide reference for further study on the development and utilization of *C. setosum*.

Key words: *Cirsium setosum* (Willd.) MB.; Compositae; flavonoids; hemostasis; clotting; anti-bacterial; anti-inflammatory

小蓟 *Cirsium setosum* (Willd.) MB. 为菊科 (Compositae) 蓟属 *Cirsium* Mill. emend. Scop. 植物, 干燥地上部分均可入药, 为常用中药^[1-3], 俗称为刺角芽, 又名刺儿菜, 生于山坡、河旁或荒地、田间^[4], 其分布于我国大部分地区, 在东亚和欧洲等地区亦有广泛分布^[5-6], 在民间常做野菜食用^[7-8]。其性凉, 味甘、苦, 归心、肝经^[1], 具有凉血止血、散瘀解毒消痈之功效。用于治疗衄血、吐血、尿血、血淋、便血、崩漏、外伤出血、痈肿疮毒^[9-10], 为历代中医临床的常用药之一。现代药理研究表明, 小蓟具有止血、凝血、抗菌、抗炎以及对心血管系统的作用等多种药理活性^[11-17]。本文对小蓟化学成分和药理作用的研究进展进行综述, 为其进一步研究开发提供科学依据。

1 化学成分

目前从小蓟中分离得到的化合物已超过 100 个, 包括黄酮类、萜类、苯丙素类、苯乙醇苷类、

生物碱以及植物甾醇类等多种类型, 其中黄酮类化合物为其特征性化学成分。

1.1 黄酮类

小蓟全草中总黄酮量一般可达 3% 以上, 个别地区高达 16%^[18], 为小蓟中报道最多的一类化学成分。迄今为止已从小蓟中分离得到 38 种黄酮类化合物, 其母核结构见图 1, 化合物名称及部分化合物结构见表 1 和图 2。

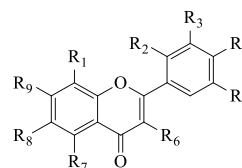


图 1 小蓟中黄酮类化合物的母核结构

Fig. 1 Structural skeletons of flavonoids from *C. setosum*

收稿日期: 2017-05-21

基金项目: 黑龙江省普通高等学校长江学者后备支持计划项目 (2013CJHB006)

作者简介: 杨炳友(1970—), 男, 博士生导师, 教授, 研究方向为中药及复方药效物质基础研究。Tel: (0451)87267038 E-mail: ybywater@163.com

*通信作者 匡海学(1955—), 男, 博士生导师, 教授, 研究方向为中药及复方药效物质基础研究。Tel: (0451)82193001 E-mail: hxkuang@hotmail.com

表 1 小蓟中黄酮类化合物

Table 1 Flavonoids from *C. setosum*

编号	化合物名称	取代基	文献
1	刺槐素	R ₇ =R ₉ =OH, R ₄ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	19
2	蒙花苷	R ₇ =OH, R ₄ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H, R ₉ =OGlc-Rha (6→1)	19
3	芹菜素-7- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖醛酸丁酯	R ₄ =R ₇ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H, R ₉ =OGlc-COO-C ₄ H ₉	19
4	5,7-二羟基黄酮	R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₄ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	20
5	黄芩苷	R ₇ =R ₈ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₄ =R ₅ =R ₆ =H, R ₉ =OGlc-COOH	20
6	芦丁	R ₃ =R ₄ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₈ =H, R ₆ =OGlc-Rha (6→1)	20
7	苜蓿素	R ₄ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₃ =R ₅ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₆ =R ₈ =H	20
8	芹菜素	R ₄ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	21
9	苜蓿素-7- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖苷	R ₄ =R ₉ =OH, R ₃ =R ₅ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₆ =R ₈ =H, R ₇ =OGlc	21
10	异山柰素-7- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖苷	R ₄ =R ₇ =OH, R ₆ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₈ =H, R ₉ =OGlc	22
11	槲皮素-3- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖苷	R ₃ =R ₄ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₈ =R ₉ =H, R ₆ =OGlc	22
12	柳穿鱼苷	R ₇ =OH, R ₄ =R ₈ =OCH ₃ , R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =R ₉ =H, R ₁ =OGlc-Rha (6→1)	22
13	5-羟基-6,4'-二甲氧基黄酮-7- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖苷	R ₇ =OH, R ₄ =R ₈ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =H, R ₉ =OGlc	23
14	槲皮素	R ₁ =R ₃ =R ₄ =R ₆ =R ₇ =OH, R ₂ =R ₅ =R ₈ =R ₉ =H	24
15	异山柰甲黄素	R ₁ =R ₄ =R ₇ =OH, R ₆ =OCH ₃ , R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₈ =R ₉ =H	24
16	5,8,4'-三羟基黄酮-7- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖苷	R ₁ =R ₄ =R ₇ =OH, R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H, R ₉ =OGlc	25
17	7-羟基-3',4',5'-三甲氧基黄酮	R ₉ =OH, R ₃ =R ₄ =R ₇ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	7
18	4',5'-二羟基-2',3',7,8-四甲氧基黄酮	R ₄ =R ₇ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₉ =OCH ₃ , R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	7
19	山柰酚-7- <i>O</i> -α- <i>L</i> -鼠李糖苷	R ₄ =R ₆ =R ₇ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₈ =H, R ₉ =ORha	7
20	山柰酚	R ₄ =R ₆ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₈ =H	7
21	槲皮素-3- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖-7- <i>O</i> -α- <i>L</i> -鼠李糖苷	R ₃ =R ₄ =R ₇ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₈ =H, R ₆ =OGlc, R ₉ =ORha	7
22	myricetin	R ₃ =R ₄ =R ₅ =R ₆ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₈ =H	7
23	myricetin-3- <i>O</i> -β- <i>D</i> -glucopyranoside	R ₃ =R ₄ =R ₅ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₈ =H, R ₆ =OGlc	7
24	5,7-二羟基-3',4'-二甲氧基黄酮	R ₇ =R ₉ =OH, R ₃ =R ₄ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	7
25	4',5,6-三羟基-7-甲氧基黄酮	R ₄ =R ₇ =R ₈ =OH, R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =H	7
26	4',5'-二羟基-7,8-二甲氧基黄酮	R ₄ =R ₇ =OH, R ₁ =R ₉ =OCH ₃ , R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	7
27	sorbifolin-6- <i>O</i> -β-glucopyranoside	R ₄ =R ₇ =OH, R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =H, R ₈ =OGlc	7
28	3',4',5'-三羟基-3,7-二甲氧基黄酮	R ₃ =R ₄ =R ₇ =OH, R ₆ =R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₈ =H	7
29	3',3,4',5-四羟基-7-甲氧基黄酮	R ₃ =R ₄ =R ₆ =R ₇ =OH, R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₈ =H	7
30	3'-羟基-4',5,7-三甲氧基黄酮	R ₃ =OH, R ₄ =R ₇ =R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	7
31	5-羟基-2',3',7,8-四甲氧基黄酮	R ₃ =OH, R ₄ =R ₇ =R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	7
32	岳华素	R ₃ =OH, R ₄ =R ₇ =R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	26
33	木犀草素	R ₃ =R ₄ =R ₇ =R ₉ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₅ =R ₆ =R ₈ =H	26
34	高车前苷	R ₄ =R ₇ =OH, R ₆ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₈ =H, R ₉ =ORha	26
35	刺槐苷	R ₄ =R ₇ =OH, R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₈ =H, R ₆ =OGlc-Rha (6→1), R ₉ =ORha	23
36	5-羟基-6,7-二甲氧基黄酮-4'- <i>O</i> -β- <i>D</i> -葡萄糖苷	R ₇ =OH, R ₈ =R ₉ =OCH ₃ , R ₁ =R ₂ =R ₃ =R ₅ =R ₆ =H, R ₄ =OGlc	23
37	芹菜素-7- <i>O</i> -(6"-反式-对-香豆酰基)-β- <i>D</i> -半乳糖苷		24
38	5'-甲氧基大风子素 D		27

1.2 蒽类化合物

小蓟中的蒽类化合物主要为倍半蒽和三蒽，其中三蒽皂苷的量可达 1.44%^[23]。

1.2.1 倍半蒽类 目前从小蓟中只分离得到 3 个倍半蒽类化合物，即 citroside A (39)、(7*E*,9*R*)-9-hydroxy-5,7-megastigmadien-4-one-9-*O*-α-*L*-arabino-

pyranosyl-(1→6)-β-*D*-glucopyranoside (40)、(6*R*,7*E*,9*R*)-9-hydroxy-4,7-megastigmadien-3-one-9-*O*-α-*L*-arabinopyranosyl-(1→6)-β-*D*-glucopyranoside (41)^[28]。结构见图 3。

1.2.2 三蒽类 小蓟中共分离得到 22 个五环三蒽类化合物。化合物名称和结构见表 2 和图 4。

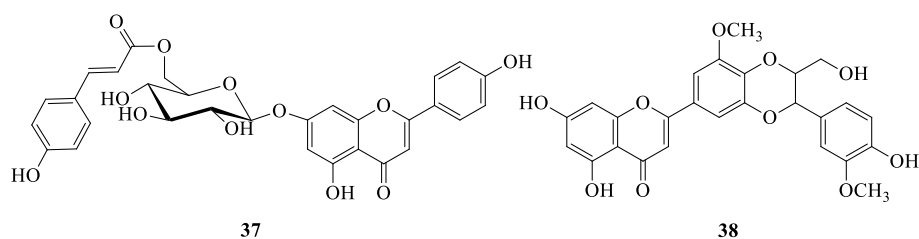


图 2 化合物 37 和 38 的结构
Fig. 2 Structures of compounds 37 and 38

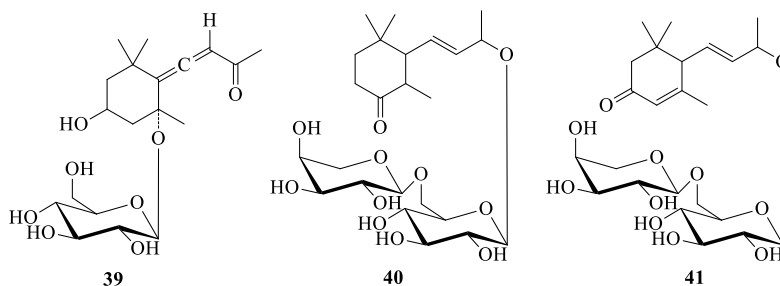


图 3 小蓟中倍半萜类化合物结构
Fig. 3 Structures of sesquiterpenes from *C. setosum*

表 2 小蓟中三萜类化合物
Table 2 Triterpenes from *C. setosum*

序号	化合物名称	文献	序号	化合物名称	文献
42	羽扇豆醇乙酸酯	29	53	蒲公英甾醇乙酸酯	29
43	羽扇豆醇	29	54	蒲公英甾酮	29
44	羽扇豆酮	29	55	蒲公英甾醇	30
45	β -香树酯醇	29	56	marsformoxide B	29
46	α -香树酯醇	29	57	11 α ,12 α -氧化蒲公英甾酮	31
47	β -香树酯醇	29	58	11 α ,12 α -氧化蒲公英甾醇	31
48	齐墩果酸	20	59	11 α ,12 α -氧化蒲公英甾醇棕榈酸酯	31
49	乌苏甲酯	20	60	3 β ,22 α -dihydroxy-20-taraxasten-30-oic acid	32
50	伪蒲公英甾醇	29	61	3 β -hydroxy-22-oxo-20-taraxasten-30-oic acid	32
51	伪蒲公英甾醇乙酸酯	29	62	3-oxo-22 α -hydroxy-20-taraxasten-30-oic acid	32
52	伪蒲公英甾酮	29	63	3 β ,19 β -dihydroxy-20-taraxasten-30-oic acid	32

1.3 苯丙素类

迄今已从小蓟中分离出多种苯丙素类化合物,包括咖啡酸(64)、银槭醇-9-*O*-反式-对-香豆酰基-4-*O*- β -*D*-葡萄糖苷(65)、绿原酸(66)、反式对香豆酸二十六醇酯(67)、反式对香豆酸葵酯(68) [5,21,24-26]、(7*S*,8*R*)-dihydrodehydrodiconiferyl alcohol-9-*O*- β -*D*-glucopyranoside (69)、(7*R*,8*S*)-dehydroconiferyl alcohol-8,5'-dehydroconiferly aldehyde-9-*O*- β -*D*-glucopyranoside(70) [8,28,33]、urolignoside(71)、

(7*S*,8*R*)-dihydrodehydrodiconiferyl-alcohol-4-*O*- β -*D*-gluco-pyranoside (72)、(7*R*,8*S*)-dihydrodehydrodiconiferyl-alcohol-4-*O*- β -*D*-glucopyranoside(73)、(7*S*,8*S*)-4,9,9'-trihydroxy-3,3'-dimethoxy-8-*O*-4'-neolignan-7-*O*- β -*D*-glucopyranoside (74) [28,34]。结构见图 5。

1.4 苯乙醇苷类

不少研究者对小蓟的醇提取物进行研究,从中分离和鉴定了 10 个苯乙醇苷类化合物。化合物名称和结构见表 3 和图 6。

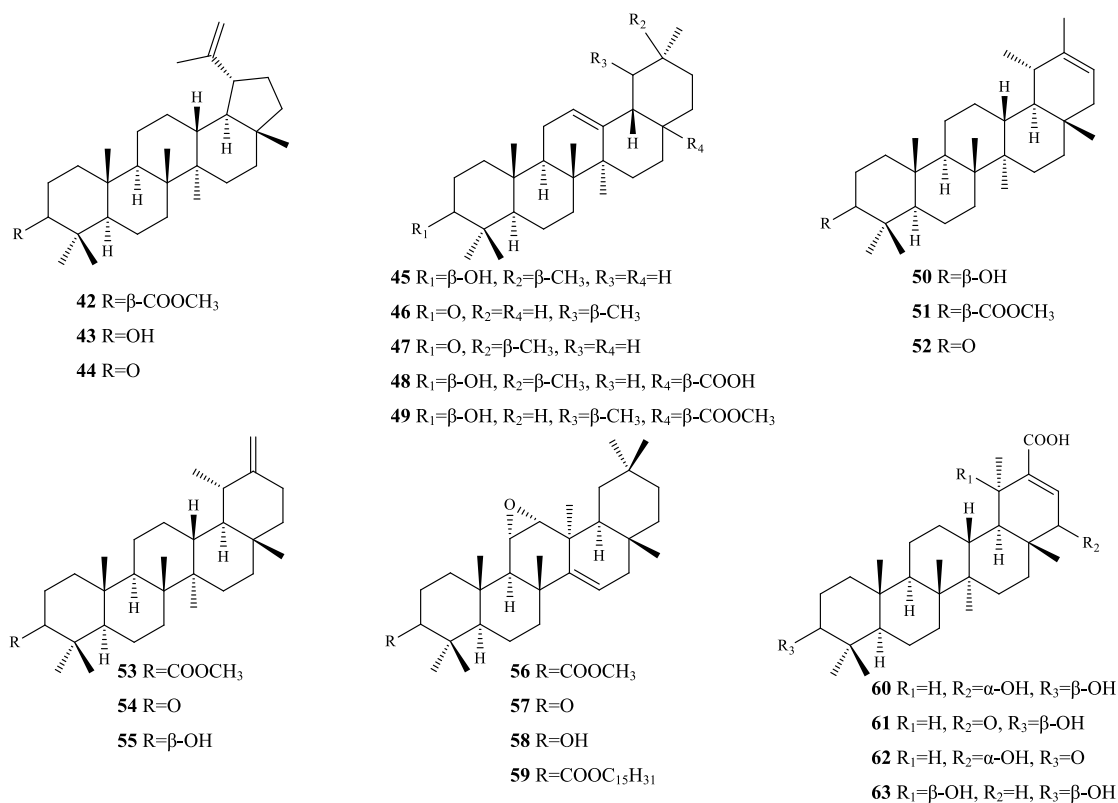


图 4 小蓟中三萜类化合物结构

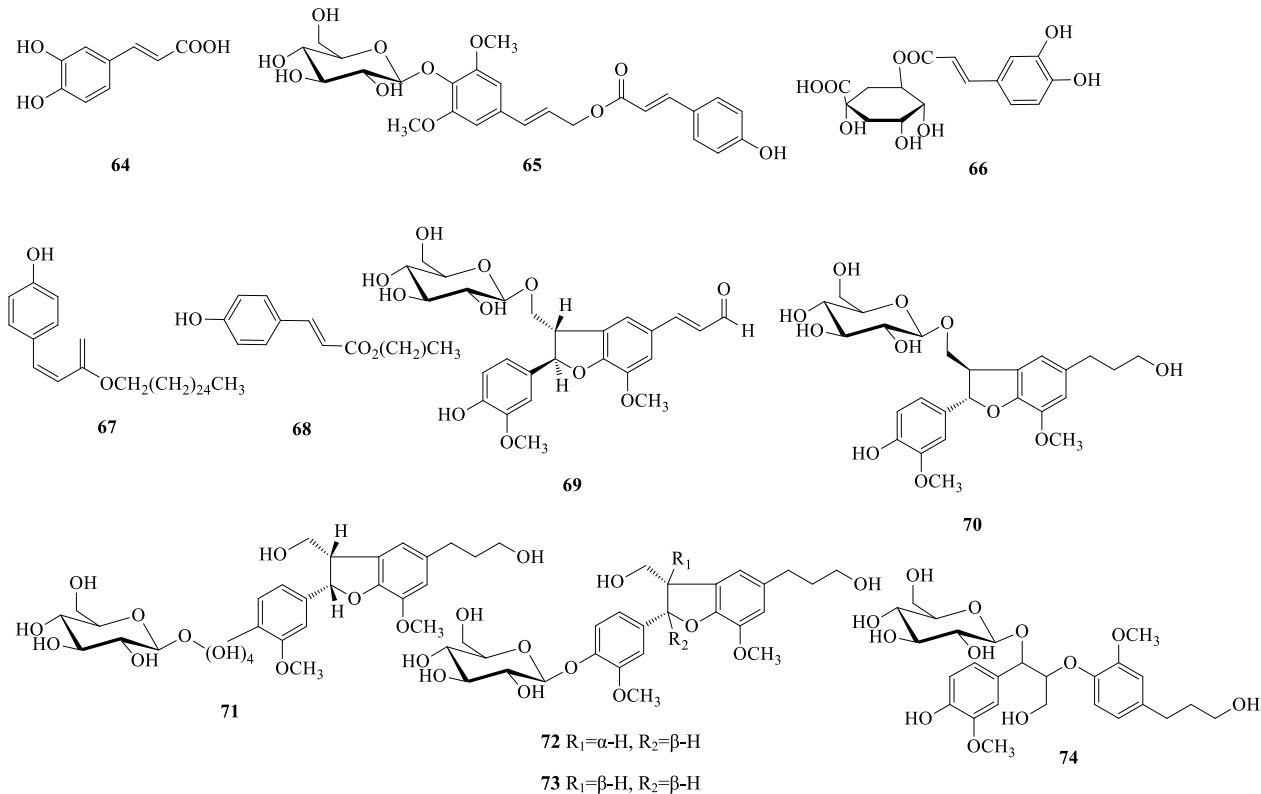
Fig. 4 Structures of triterpenes from *C. setosum*

图 5 小蓟中苯丙素类化合物结构

Fig. 5 Structures of phenylpropanoids from *C. setosum*

表 3 小蓟中苯乙醇苷类化合物

Table 3 Phenylethylglycosides from *C. setosum*

序号	化合物名称	文献
75	红景天苷	34
76	苯甲醇- <i>O</i> - β -D-吡喃葡萄糖苷	27
77	β -D-glucopyranoside, 1''- <i>O</i> -(7 <i>S</i>)-7-(3-methoxyl-4-hydroxyphenyl)-7-methoxyethyl-3''- α -L-rhamnopyranosyl-4''-[(8 <i>E</i>)-7-(3-methoxyl-4-hydroxyphenyl)-8-propenoate]	35
78	β -D-glucopyranoside, 1''- <i>O</i> -(7 <i>S</i>)-7-(3-methoxyl-4-hydroxyphenyl)-7-methoxyethyl-3''- α -L-rhamnopyranosyl-4''-[(8 <i>E</i>)-7-(4-hydroxyphenyl)-8-propenoate]	35
79	cistanoside D	35
80	acteoside	35
81	β -D-glucopyranoside-1''- <i>O</i> -7-(4-hydroxyphenyl)-7-ethyl-6''-[(8 <i>E</i>)-7-(3,4-dihydroxyphenyl)-8-propenoate]	35
82	calceolarioside B	35
83	dunalioside C	35
84	dunalioside D	35

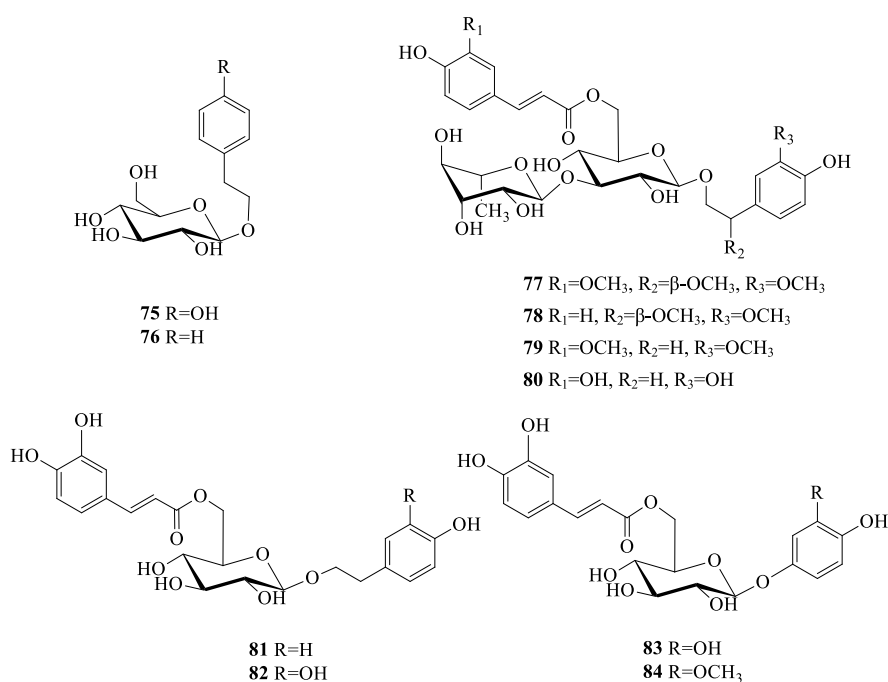


图 6 小蓟中苯乙醇苷类化合物结构

Fig. 6 Structures of phenylethylglycosides from *C. setosum*

1.5 生物碱类

小蓟中含 0.05% 的生物碱类成分^[36], 其中包括乙酸橙酰胺 (85)^[19]、lycoperodine-1 (86)^[24]、马齿苋酰胺 (87)^[26]、adenosine (88)^[28]、尿嘧啶 (89)^[27]、酪胺 (90)、1-(3',4'-二羟基肉桂酰)-环戊-2,3-二酚 (91)^[37]。结构见图 7。

1.6 植物甾醇类

植物甾醇为甾体母核 C₁₇ 位侧链是 8~10 个碳原子链状侧链的甾体衍生物。从小蓟中分离得到 β -谷甾醇 (92)、胆甾醇 (93)、豆甾醇 (94)、豆甾

醇 3-*O*- β -D-葡萄糖苷 (95)、 β -胡萝卜苷 (96)、麦角甾-4,24(28)-二烯-3-酮 (97)、豆甾-4-烯-3-酮 (98)^[5-6,19,23,33-34,38-39]。化合物结构见图 8。

1.7 其他类

从小蓟中还分离得到丁二酸 (99)、对羟基苯甲酸 (100)、香草酸 (101)、sucrose (102)、香豆酸 (103)、邻二苯酚 (104)、原儿茶醛 (105)、原儿茶酸 (106)、5-*O*-咖啡酰基-奎宁酸 (107)、a-tocospiro A (108)、a-tocospiro B (109)、a-tocospiro C (110)^[21-22,26,37,40]。化合物结构见图 9。

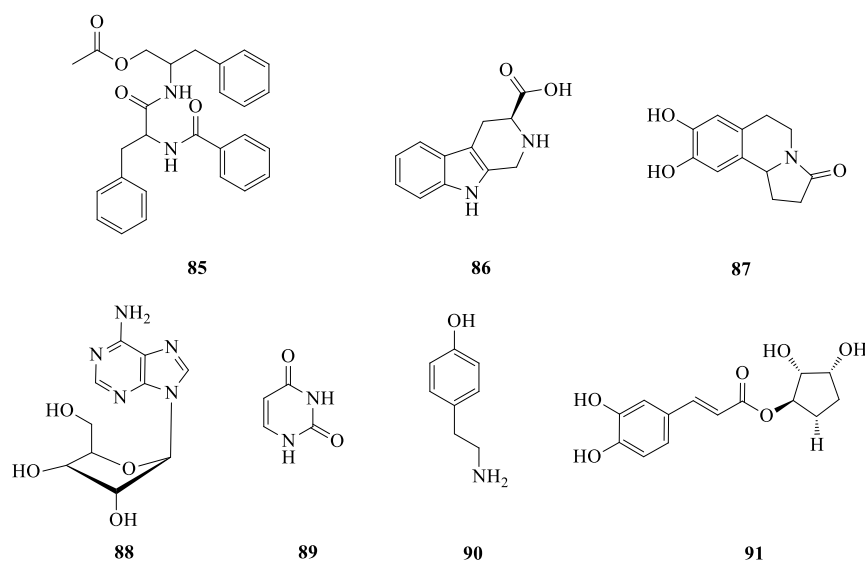


图7 小蓟中生物碱类化合物结构

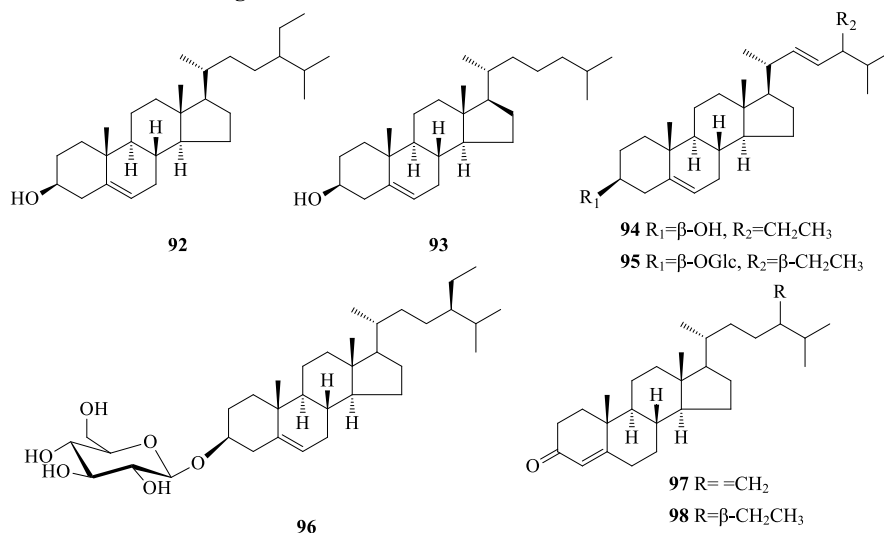
Fig. 7 Structures of alkaloids from *C. setosum*

图8 小蓟中甾醇类化合物结构

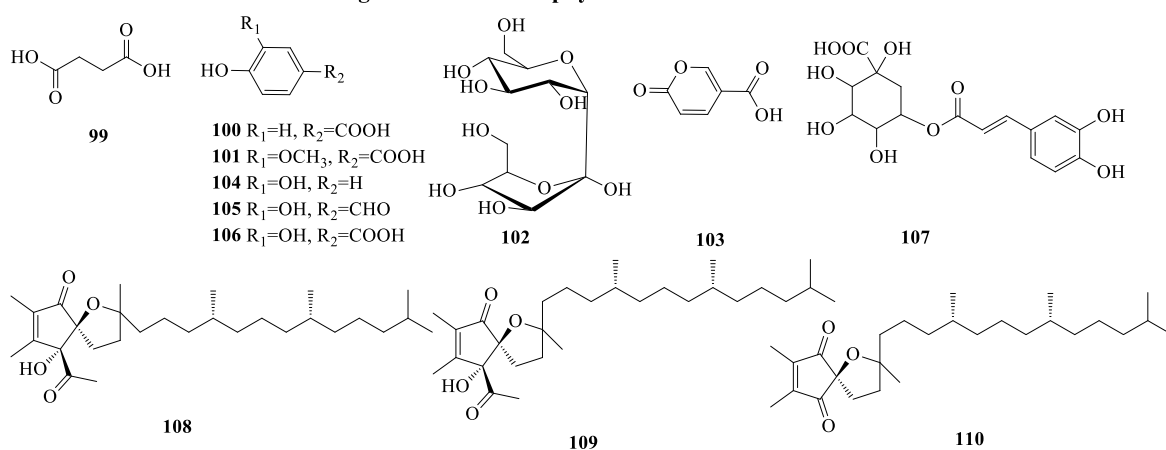
Fig. 8 Structures of phytosterols from *C. setosum*

图9 小蓟中其他类化合物结构

Fig. 9 Structures of other compounds from *C. setosum*

2 药理活性

小蓟具有止血、凝血、抗菌、抗炎以及对心血管系统的作用等多种药理活性,能够治疗衄血、吐血、尿血、血淋、便血、崩漏、外伤出血和痈肿疮毒等传统疾病。

2.1 止血、凝血作用

小蓟广泛应用于衄血、吐血、尿血、血淋等病症的治疗,与其具有显著的止血、凝血作用紧密相连^[41-42]。周文序等^[43]发现小蓟中的止血有效成分为芦丁(6)和柳穿鱼苷(12),其主要通过使局部血管收缩,抑制纤维蛋白溶解而发挥作用。张来新^[30,44]研究发现黄酮类化合物蒙花苷(2)和芦丁(6)有促进凝血作用,其也从小蓟中提取得到简单苯丙素咖啡酸(64),其具有缩短凝血及出血时间的作用,并可代替凝血酶作血浆纤维蛋白质平板法纤溶实验,为小蓟止血的有效成分之一。李德华^[12]发现小蓟中的绿原酸(41)可以缩短血凝及出血时间。

2.2 对心血管系统的作用

国内曾有实验研究认为小蓟水煎剂有使心脏兴奋的作用^[36,45],汪丽燕等^[46]通过小蓟对肾上腺素能受体激动效应的初步实验加以证实。魏彦等^[47]研究了小蓟水煎液和乙醇提取物对离体兔心、豚鼠心房肌的作用,结果显示其对肾上腺素能受体有激动作用,有效成分酪胺(80)对大鼠有显著的升压作用。

梁军等^[48]研究了宁夏野生小蓟水提取物对家兔动脉血压和心率的影响,结果表明一定剂量小蓟水提取物对家兔有明显降压和减慢心率的作用。高血压患者存在明显的内皮细胞损伤、高凝状态和纤溶功能改变情况,即所谓体内促凝和抗凝机制平衡失调的血栓前状态^[49],小蓟中富含约1.44%的皂苷类化合物,皂苷分子中羟基与有机酸缩合成的酯皂苷(estersaponins)有溶血作用^[50],因此,小蓟发挥降压作用可能是通过抗凝、降低血液黏稠度、改善患者血管内皮损伤^[51]实现。

2.3 抗菌、抗炎作用

小蓟粗提物具有明显的抗菌、抗炎活性^[52-53]。研究表明小蓟水煎剂在试管内对溶血性链球菌、肺炎球菌及白喉杆菌有一定的抑制作用^[54];对金黄色葡萄球菌、绿脓杆菌、变形杆菌、大肠杆菌、伤寒杆菌、副伤寒杆菌及福氏痢疾杆菌均有抑制作用^[55]。小蓟的乙醇浸剂(1:30 000)对人结核菌有抑制作用,而水煎剂对结核菌的抑制浓度为乙醇浸剂的300倍^[53]。乔建荣等^[56]研究发现小蓟醇提物能降低

败血症大鼠血浆、腹主动脉和心脏的中介素(IMD)水平,发挥其抗菌消炎的能力,其机制可能与抑制一氧化氮/一氧化氮合酶(NO/NOS)通路有关。小蓟对大鼠甲醛性“关节炎”有一定消炎作用,但作用效果不及考地松;对小鼠有镇静作用,但无镇痛作用^[57]。

2.4 脂质代谢调节、抗衰老、抗疲劳作用

多糖、黄酮类成分具有一定的脂质代谢调节、抗衰老、抗疲劳作用^[58],其中,黄酮类是小蓟发挥降糖作用的主要活性成分^[59]。张欣^[60]通过动物实验研究表明小蓟粗多糖对小鼠的脂质代谢具有明显的调节作用、对D-半乳糖导致的小鼠衰老具有一定的缓解作用,同时能有效减轻过度运动对小鼠机体造成的伤害。梁倩倩等^[61]也发现不同溶剂的小蓟提取物具有羟自由基和超氧阴离子自由基清除作用,也证明了小蓟有明显的抗衰老作用。王倩^[59]研究了小蓟总黄酮提取物对大、小鼠糖尿病模型的治疗作用,表明小蓟总黄酮可减轻高血糖症状,并抑制糖原的分解,促进肝糖原的合成,降低血糖值;可以提高超氧化物歧化酶(SOD)、过氧化氢酶、谷胱甘肽过氧化物酶活力,增强机体清除自由基的能力,减少过氧化氢、丙二醛、活性氧(ROS)的量,降低Bax和升高Bcl-2的表达水平以减少细胞凋亡;对脂代谢、胰岛素抵抗、胰岛素升高等均有改善作用。马勤阁等^[5]运用蛋白酪氨酸磷酸酶1B(PTP1B)抑制剂高通量筛选模型对小蓟中的黄酮类化合物进行活性筛选,结果表明化合物4',5-二羟基-2',3',7,8-四甲氧基黄酮(18)、4',5-二羟基-7,8-二甲氧基黄酮(26)、3'-羟基-4',5,7-三甲氧基黄酮(30)具有较强的PTP1B抑制活性,提示小蓟可能具有降血糖作用。

2.5 抗癌作用

小蓟药源广泛、价廉、无毒副作用,具有一定的抗癌作用^[62-66]。李煜等^[67-68]研究小蓟提取液对癌细胞生长的抑制作用,结果表明其具有抑制人白血病K562细胞、肝癌HepG2细胞、宫颈癌HeLa细胞、胃癌BGC823细胞生长的活性,有确切的抑癌作用。李桂凤等^[69]研究刺儿菜提取物对肿瘤细胞生长的抑制作用,结果表明刺儿菜提取物对肝癌BEL-7402细胞生长有抑制作用。院珍珍等^[31]对小蓟乙醇提取物石油醚层中分离得到的化合物进行体外细胞毒性活性筛选,其中11 α ,12 α -氧化蒲公英赛酮(68)、11 α ,12 α -氧化蒲公英赛醇(69)、11 α ,12 α -氧化蒲公英赛醇棕榈酸酯(70)对人结肠癌HCT-8

细胞、肝癌 Bel-7402 细胞、胃癌 BGC-823 细胞、肺癌 A549 细胞和卵巢癌 A2780 细胞均显示一定的抑制活性。王斌等^[70]研究发现在 50 mg/L 的质量浓度下, 麦角甾-4,24(28)-二烯-3-酮 (85) 和豆甾-4-烯-3-酮 (86) 对 A549 细胞显示较强的细胞毒活性。张硕等^[71]应用基因芯片技术研究豆甾醇 (81) 对人肝癌 SMMC-7721 细胞生长的作用, 发现豆甾醇对 SMMC-7721 细胞具有体外抑制作用, 且呈剂量和时间依赖性。另有学者研究发现^[72], β -谷甾醇 (80) 对乳腺癌 MDA-MB-231 细胞以及人结肠癌 HT116 细胞均具有诱导凋亡的作用。柳穿鱼苷 (12) 不仅能抑制肿瘤细胞生长作用, 还能改善免疫反应, 是一种潜在的抗肿瘤药物^[73-74]。

2.6 其他作用

20%浓度的小蓟水煎剂对肠平滑肌有抑制作用, 也可收缩支气管平滑肌; 小蓟煎剂或配剂对家兔离体、在体及慢性痙管的子宫都有兴奋作用, 但对猫的在体子宫、大鼠离体子宫及家兔离体子宫则均有抑制作用, 和儿茶酚胺类物质的作用相似^[23,75]。

3 结语与展望

小蓟作为药食两用的植物资源有着悠久的历史, 主要用于治疗各种出血病症。现有的研究表明小蓟在止血、凝血、抗炎等方面具有很强的生物活性。总体来讲, 目前对小蓟的研究还相对薄弱, 有待进一步地深入, 主要体现在以下 2 方面: (1) 目前对小蓟药理作用的研究仅局限于粗提物, 而对其单体成分的研究不透彻, 今后需着重整合化合物母核 (如黄酮类成分) 结构, 进行结构修饰优化, 为后续药物开发提供较好的思路。(2) 小蓟在临床应用广泛, 以小蓟饮子为代表的相关产品及产业化具有更广阔的发展空间, 但其有效部位不明晰, 作用机制不明确, 特别是止血、凝血的传统活性的研究中, 仅能探明其止血、凝血活性, 而对作用机制的研究较少; 且现有研究主要为体外活性实验, 其体内代谢研究很少, 所以加强体内代谢的研究显得尤为重要。因此, 如何在临床治疗实践及民间验方的基础上, 确切地阐明小蓟的活性成分及其作用机制是亟待解决的问题, 从而更好地开发这一丰富的药用资源, 并为小蓟同源药材的研究提供借鉴。

参考文献

[1] 中国药典 [S]. 一部. 2015.
[2] 金延明, 李胜华, 楼之岑. 中药大蓟和小蓟植物资源调查 [J]. 中国中药杂志, 1994, 19(12): 710-711.

[3] 王本祥. 现代中药药理学 [M]. 天津: 天津科学技术出版社, 1997.
[4] 倪晓霓. 大蓟与小蓟的研究现状及展望 [J]. 时珍国医国药, 2005, 16(6): 548-549.
[5] 冯子明, 杨桢楠, 姜建双, 等. 小蓟的化学成分研究 [J]. 中国实验方剂学杂志, 2012, 18(6): 87-89.
[6] 鄢本厚, 尹祖棠, 陈虎彪. 华北蓟属植物的化学分类初探 [J]. 植物研究, 1996, 16(2): 185-189.
[7] 马勤阁, 魏荣锐, 柳文敏, 等. 小蓟中黄酮类化学成分的研究 [J]. 中国中药杂志, 2016, 41(5): 868-873.
[8] 李桂凤, 董淑敏, 李兴福, 等. 野生刺儿菜营养成分分析 [J]. 营养学报, 1999, 21(4): 478-479.
[9] 王振平. 大蓟、小蓟水煎剂治口高血压的比较研究 [D]. 济南: 山东大学, 2006.
[10] 宋立人, 洪 询, 丁绪亮, 等. 现代中药学大词典 [M]. 北京: 人民卫生出版社, 2001.
[11] 楼之岑, 秦 波. 常用中药材品种整理和质量研究 [M]. 北京: 北京医科大学中国协和医科大学联合出版社, 1995.
[12] 李德华. 小蓟的止血作用研究 [J]. 山东医学院学报, 1959(7): 42.
[13] 宋善俊, 王辨明, 沈 迪, 等. 17 种止血中草药的实验研究 [J]. 新医药, 1978, 9(2): 55-58.
[14] 杨星昊, 崔敬浩, 丁安伟. 小蓟提取物对凝血、出血及实验性炎症的影响 [J]. 四川中医, 2006, 24(1): 17-18.
[15] 侯爱画, 阎雪洁, 谭 松. 孙敏主任医师应用鲜小蓟治疗血证经验 [J]. 中国中医急症, 2007, 16(5): 566-567.
[16] 姜海英, 王晓光. 单味小蓟治疗胃切除术后近期出血 11 例体会 [J]. 浙江中医杂志, 2001, 36(7): 285.
[17] Sun Q, Chang L, Ren Y, et al. Simultaneous analysis of 11 main active components in *Cirsium setosum* based on HPLC-ESI-MS/MS and combined with statistical methods [J]. *J Sep Sci*, 2012, 35(21): 2897-2907.
[18] 倪晓霓, 赵宏阳, 杭太俊. 大蓟、小蓟中黄酮类成分的不同提取方法及含量测定 [J]. 江苏药学与临床研究, 2005, 13(1): 33-35.
[19] 潘 珂, 尹永芹, 孔令义. 小蓟化学成分的研究 [J]. 中国现代中药, 2006, 8(4): 7-9.
[20] 周 清, 陈 玲, 刘志鹏, 等. 小蓟的化学成分研究 [J]. 中药材, 2007, 30(1): 45-47.
[21] 韩百翠, 李 宁, 李 铎. 小蓟化学成分的分离与鉴定 [J]. 沈阳药科大学学报, 2008, 25(10): 793-795.
[22] 孟永海, 王秋红, 杨炳友, 等. 小蓟化学成分研究 [J]. 中药材, 2009, 32(1): 58-61.
[23] 刘 学. 小蓟的化学成分研究 [D]. 长春: 长春中医药大学, 2007.
[24] 柯 睿, 朱恩圆, 俞桂新. 小蓟中一个新的苯丙素苷类

- 化合物 [J]. 药学报, 2010, 45(7): 879-882.
- [25] 曹 琴, 陈建涛. 小蓟的化学成分研究 [J]. 药学实践杂志, 2010, 28(4): 271-273.
- [26] 杨泰然, 徐广涛, 许 枏, 等. 小蓟化学成分的分离与鉴定 [J]. 沈阳药科大学学报, 2015, 32(6): 419-423.
- [27] 韩百翠. 中药小蓟的化学成分的研究 [D]. 沈阳: 沈阳药科大学, 2009.
- [28] Jiang H, Meng Y H, Kuang H X, *et al.* A new megastigmane glycoside from the aerial parts of *Cirsium setosum* [J]. *Chin J Nat Med*, 2013, 11(5): 534-537.
- [29] 李泠鸽, 孙 珍, 尚小雅, 等. 小蓟三萜类化合物成分的研究 [J]. 中国中药杂志, 2012, 37(7): 951-955.
- [30] 张来新. 从小蓟中提取止血药成分咖啡酸 [J]. 中成药, 2002, 24(10): 807-808.
- [31] 院珍珍, 吴春彦, 尚小雅, 等. 小蓟中氧化蒲公英赛酮和醇的分离鉴定和细胞毒活性测试 [J]. 中国食品学报, 2014, 14(3): 196-204.
- [32] Luan N, Wei W D, Shang X Y, *et al.* Four new taraxastane-type triterpenoid acids from *Cirsium setosum* [J]. *J Asian Nat Prod Res*, 2016, doi: 10.1080/10286020.2016.1217519.
- [33] 孟永海. 小蓟的化学成分研究 [D]. 哈尔滨: 黑龙江中医药大学, 2007.
- [34] 姜 海. 小蓟抗炎、止血有效部位的化学成分研究 [D]. 哈尔滨: 黑龙江中医药大学, 2008.
- [35] Ma Q G, Guo Y M, Luo B M, *et al.* Hepatoprotective phenylethanoid glycosides from *Cirsium setosum* [J]. *Nat Prod Res*, 2016, 30(16): 1824-1829.
- [36] 陈 毓, 杨星昊, 张 丽, 等. 小蓟化学成分药理作用及临床应用研究进展 [J]. 中医学杂志, 2005, 23(4): 614-615.
- [37] 姚乾元, 赵渤年, 吴保杰, 等. 小蓟升压成分的化学研究 [J]. 中草药, 1992, 23(10): 517.
- [38] 顾玉诚, 屠呦呦. 小蓟化学成分研究 [J]. 中国中药杂志, 1992, 17(9): 547-548.
- [39] 孙 珍, 李泠鸽, 院珍珍, 等. 小蓟中甾体类化合物的分离及结构鉴定 [J]. 食品科学, 2012, 33(19): 124-127.
- [40] Yuan Z Z, Duan H M, Shang X Y, *et al.* A-Tocospino C, a novel cytotoxic A-tocopheroid from *Cirsium setosum* [J]. *Phytochem Lett*, 2014, 8(1): 116-120.
- [41] 钟麟生. 中药学 [M]. 北京: 中国中医药出版, 2012.
- [42] 李清华. 小蓟止血成分研究 [J]. 中草药, 1982, 13(9): 9.
- [43] 周文序, 田 珍. 中药大、小蓟中柳穿鱼苷和芦丁的薄层扫描法定量分析 [J]. 北京医科大学学报, 1994, 26(4): 309.
- [44] 张来新. 小蓟中提取分离黄酮类化合物的实验研究 [J]. 中成药, 2004, 26(6): 503-504.
- [45] 吴葆杰. 小蓟的药理研究 [A] // 中华生理科学会学术会议论文摘要汇编 [C]. 郑州: 河南出版社, 1964.
- [46] 汪丽燕, 倪光玉. 小蓟对肾上腺素能受体激动效应的初步实验 [J]. 安徽医学, 1984, 5(2): 39-40.
- [47] 魏 彦, 邱乃英, 欧阳青. 大蓟、小蓟的鉴别与临床应用 [J]. 北京中医杂志, 2002, 21(5): 296-297.
- [48] 梁 军, 张志宁, 叶 莉. 小蓟水提物对家兔心血管活动的影响 [J]. 山西中医, 2011, 27(6): 50-51.
- [49] 陈曙光, 唐海沁. 原发性高血压患者血栓前状态分子标志物的变化 [J]. 安徽医学, 2003, 24(5): 7-9.
- [50] 林启寿. 中草药成分化学 [M]. 北京: 科学出版社, 1977.
- [51] 张 京. 小蓟的降压作用及其机制分析 [J]. 中医药临床杂志, 2005, 17(4): 344.
- [52] 陶海南, 刘 辉, 薛喜文, 等. 紫其多糖抗菌活性初步研究 [J]. 南开大学学报, 1996, 20(4): 305-308.
- [53] 中国医学科学院药物研究所抗菌工作组. 545 种中药的抗菌作用筛选 [J]. 药学通报, 1960, 8(2): 59-63.
- [54] 孟永海, 王秋红, 匡海学, 等. 黑龙江产小蓟的药理作用研究 [J]. 中医药信息, 2011, 28(2): 17-18.
- [55] 中国医学科学院药用植物资源开发研究所等. 中药志 (第4册)第2版 [M]. 北京: 人民卫生出版社, 1985.
- [56] 乔建荣, 梁 颖, 姜怡邓, 等. 小蓟醇提物对败血症休克大鼠血浆 Intermedin 的影响 [J]. 时珍国医国药, 2015, 26(1): 62-64.
- [57] 李 达. 医学科学情报资料 (第12辑) [M]. 武汉: 中国科学院湖北分院, 1962.
- [58] 左绍远. 螺旋藻多糖对 D-半乳糖所致衰老小鼠的作用 [J]. 中国生化药物杂志, 1998, 19(1): 15-18.
- [59] 王 倩. 小蓟总黄酮对大、小鼠糖尿病模型的影响 [D]. 郑州: 河南中医学院, 2015.
- [60] 张 欣. 小蓟多糖的分离纯化及生物学作用研究 [D]. 西安: 陕西师范大学, 2006.
- [61] 梁倩倩, 丁玲强, 李彩霞, 等. 小蓟抗氧化作用研究 [J]. 河西学院学报, 2008, 24(5): 45-47.
- [62] 许新琳. 甲状腺癌瘤淋巴结胶囊: 中国, 03148840.4 [P]. 2004-03-31.
- [63] 郝来勤, 赵 明, 郝玉成. 1 种治疗肺癌及其他各种癌症的强效中药: 中国, 200710106868.X [P]. 2007-10-10.
- [64] 王 峰. 一种治疗脑干肿瘤的外用中药组合物及其制备方法: 中国, 201010300434.5 [P]. 2010-06-09.
- [65] 李 虹. 小蓟饮子加减治疗膀胱癌的体会 [J]. 中国中医药信息杂志, 2001, 8(9): 80.
- [66] 尚小雅, 李金杰, 李泠鸽. 从小蓟中提取抗肿瘤活性物质的方法以及小蓟抗肿瘤药物: 中国, ZL200910085297.5 [P]. 2009-10-28.
- [67] 李 煜, 王振飞, 贾瑞贞. 小蓟提取液对四种癌细胞生长抑制作用的研究 [J]. 中医药学报, 2007, 35(5): 12-14.
- [68] 李 煜, 王振飞, 贾瑞贞. 小蓟水提液对 4 种癌细胞生

- 长抑制作用的研究 [J]. 中华中医药学刊, 2008, 26(2): 274-275.
- [69] 李桂凤, 马吉祥, 李传胜, 等. 刺儿菜提取物抗 BEL-7402 肿瘤细胞活性的研究 [J]. 营养学报, 2008, 30(2): 174-176.
- [70] 王 斌, 任舒文, 李国强, 等. 柞柳抗肿瘤甙体和黄酮类化合物研究 [J]. 中国药学杂志, 2009, 44(8): 576-580.
- [71] 张 硕, 王宏韬, 石振艳, 等. 应用基因芯片技术研究白花蛇舌草豆甾醇抑制人肝癌细胞体外生长的靶基因调控 [J]. 现代生物医学进展, 2007, 7(8): 1181-1183.
- [72] 宋冬雪, 汲晨锋, 季宇彬. 植物甾醇抗肿瘤作用研究进展 [J]. 牡丹江医学院学报, 2011, 32(4): 79-81.
- [73] Liu S J, Luo X, Li D X, *et al.* Tumor inhibition and improved immunity in mice treated with flavone from *Cirsium japonicum* DC. [J]. *Int Immunopharmacol*, 2006, 6(9): 1387-1393.
- [74] Liu S J, Zhang J, Li D X, *et al.* Anticancer activity and quantitative analysis of flavone of *Cirsium japonicum* DC. [J]. *Nat Prod Res*, 2007, 21(10): 915-922.
- [75] 秦华珍, 夏新华, 李钟文. 黄花倒水莲多糖的抗应激作用 [J]. 广西中医药, 1996, 14(3): 52-54.