DOI:10.13193/j.issn.1673-7717.2026.02.008

皂角刺化学成分、生物活性研究进展及其质量标志物预测分析

查钦[1,2],邹涛[2],邹鹏[2],张旭[3],洪鹏升[3],熊厚溪[1],张翔宇[2],赵欣黔[3]
(1. 毕节医学高等专科学校,毕节市健康产业重点实验室,贵州 毕节 551700;
2. 毕节市中药研究所,贵州 毕节 551700;3. 浙江省人民医院毕节医院,贵州 毕节 551700)

摘要:皂角刺为豆科植物皂荚 *Gleditsia sinensis* Lam. 的干燥棘刺,具有消肿托毒、排脓、杀虫的功效。现代研究表明,皂角刺主要化学成分有多酚类、黄酮类、萜类、甾醇类等,具有抗肿瘤、抗菌、抗凝血、免疫调节等多种生物活性,在治疗红热肿块、癌症等方面临床应用广泛。但现行《中华人民共和国药典》收载的皂角刺质量控制缺乏指标成分,系统阐释其量效之间的关系无标准依据。对皂角刺的化学成分、生物活性进行了系统总结概括,并根据中药质量标志物(quality marker,Q-Marker)概念,从植物亲缘、化学成分特有性、成分与功效相关性、传统药性、复方配伍和化学成分可测性等对皂角刺的Q-Marker进行预测分析,为皂角刺质量评价研究和合理开发利用提供参考。

关键词:皂角刺;质量标志物;化学成分;生物活性;抗肿瘤
中图分类号:R284.1 **文献标志码**:A **文章编号**:1673-7717(2026)02-0034-13

Research Progress on Chemical Composition and Biological Activity of Zaojiaoci (Gleditsiae Spina) and Prediction Analysis of Quality Marker

ZHA Qin[1,2],ZOU Tao[2],ZOU Peng[2],ZHANG Xu[3],HONG Pengsheng[3],XIONG Houxi[1],ZHANG Xiangyu[2],ZHAO Xinqian[3]
(1. The Key Laboratory for Health Industry of Bijie,Bijie Medical College,Bijie 551700,Guizhou,China;
2. Bijie Institute of Chinese Materia Medica,Bijie 551700,Guizhou,China;
3. Bijie Hospital,Zhejiang Provincial People's Hospital, Bijie 551700,Guizhou,China)

Abstract:Zaojiaoci(Gleditsiae Spina) is a dry thorn of the leguminous plant *Zaojia*(*Gleditsia sinensis* Lam),which has the function of reducing swelling and supporting poison,expelling pus and killing insects. The main chemical components include polyphenols,flavonoids,terpenoids,sterols,etc. Modern pharmacology indicates that Zaojiaoci(Gleditsiae Spina) has various pharmacological effects such as anti-tumor,anti-bacterial,anti-coagulation,immune regulation and anti-allergy effects. However,there is no index component for quality control in recorded of Zaojiaoci(Gleditsiae Spina) in *Chinese Pharmacopoeia*. Furthermore,there is no systematical standard basis for interpreting the relationship between its "composition" and "quality". Therefore,the chemical constituents and pharmacological effects of Zaojiaoci(Gleditsiae Spina) were summarized. According to the concept of quality marker(Q-Marker),the Q-Markers of Zaojiaoci(Gleditsiae Spina) were predicted from the aspects of plant relatives,chemical composition specificity,composition and efficacy correlation,traditional medicinal properties,compound compatibility and chemical measurement of chemical composition,which provided the basis for the quality evaluation and rational development and utilization of Gleditsiae Spina.

Keywords: Zaojiaoci (Gleditsiae Spina); quality marker (Q-Markers); chemical composition; biological activity; anti-tumor

皂角刺(Gleditsiae Spina)为豆科植物皂荚 *Gleditsia sinensis* Lam. 的干燥棘刺,别名皂刺、天丁、皂荚刺等,我国主产于四川、山东、河南、湖北等地。皂角刺性温味辛,归肝、胃经,具有消肿托毒、排脓、杀虫的功效,用于痈疽初起或脓成不溃、外治疥癣麻风等[1-2]。临床含皂角刺的中成药主要有消肿散结、止痛功效的乳癖康片、乳安片、泽桂癃爽片、齿痛宁等。因皂角刺具有消肿托毒、排脓等功效,其在抗肿瘤领域受到广泛关注。2020版《中华人民共和国药典》一部收载的皂角刺未明确指标性成分,无"浸出物""含量"项的检测,对皂角刺质量的综合评价受到限制,因此建立更加全面、完善的皂角刺质量评价标准尤为重要。故本文在对皂角刺化学成分、生物活性研究进展分析概括的基础上,结合中药质量标志物(quality marker,Q-Marker)的研究思路,从植物亲缘和化学成分特有性、成分与功效相关性、传统药性、复方配伍和化学成分可测性等方面对皂角刺的Q-Marker进行分析与预测,为其Q-Marker的选择、

基金项目:国家科技支撑计划项目(2015BAI05B03);贵州省科技计划项目(ZSYS〔2025〕016);广州市科技计划重点研发计划项目(202206010181);毕节医学高等专科学校团队建设项目(BJYZXT202406);毕节市科技人才培养项目(毕科人才合〔2025〕3号);毕节市科技计划项目(毕科合〔2023〕66号);中共毕节市委人才团队建设项目(毕委人领办通〔2023〕16号);毕节市科技创新平台及人才团队项目(毕科合〔2023〕66号)
作者简介:查钦(1985-),男,贵州毕节人,副研究员,硕士,研究方向:中药资源开发与利用。
通讯作者:张翔宇(1986-),男(仡佬族),贵州遵义人,研究员,硕士,研究方向:药用植物资源工程。E-mail:304626335@qq.com。
赵欣黔(1972-),男(白族),贵州毕节人,主任医师,硕士研究生导师,学士,研究方向:儿童重症医学。E-mail:919299950@qq.com。

质量标准的提升和合理开发利用提供理论依据。

1 化学成分

皂角刺含有多种化学成分，包括多酚类、黄酮类、三萜类、甾醇类及其他类成分，其中多酚类和黄酮类的化学成分丰富，含量较高。

1.1 多酚类化合物

皂角刺中含有丰富的多酚类化合物，分离并鉴定出 50 余种多酚类化合物，如没食子酸乙酯(3)、二氢阿魏酸(27)、香草酸(30)和(E)－肉桂酸(49)等，具体化合物信息及结构式见表 1、图 1。

1.2 黄酮类化合物

黄酮类化合物是一种由 3 个碳原子互相连接两个苯环的化合物，广泛存在于植物中。目前已从皂角刺中分离鉴定出 40 余种黄酮类化合物，根据化合物的结构式主要分为黄酮类、黄酮醇类、二氢黄酮类和黄烷醇类等化合物，如槲皮素(56)、二氢槲皮素(73)、花旗松素(90)、黄颜木素(84)和(－)－epicatechin(82)等。具体化合物信息及结构式见表 2、图 2。

1.3 三萜类及甾醇类化合物

目前已从皂角刺中分离鉴定出 19 种萜类及甾醇类，如刺囊酸(101)、β－谷甾醇(109)和豆甾醇(110)等化合物。具体化合物信息及结构式见表 3、图 3。

1.4 香豆素类及木脂素类化合物

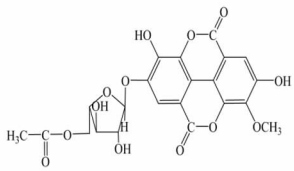
目前已从皂角刺中分离鉴定出 10 种香豆素类和 8 种木脂素类，其中香豆素类主要有东莨菪内酯(125)、滨蒿内酯(132)等，木脂素类主要有(＋)－丁香脂素(120)、蛇菰宁(124)等。具体化合物信息及结构式见表 4、图 4。

1.5 挥发性成分及其他类化合物

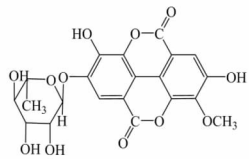
皂角刺挥发油中共鉴定出 65 个成分，占挥发油成分的 64.85%，其中含量较高的 10 种成分占挥发油总含量的 41.34%，分别为棕榈酸、亚油酸、芳樟醇、正己醛、2－正戊基呋喃、正十四烷、糠醛、反油酸、植酮、苯乙醛[27]。除以上挥发成分外，研究者还从皂角刺中分离鉴定出直链脂肪酸类、吲哚类等其他类化合物，具体化合物信息及结构式见表 5、图 5。

表 1 皂角刺中多酚类成分

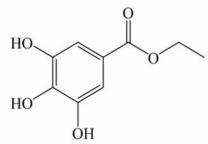
编号	化合物	化学式	文献	编号	化合物	化学式	文献
1	3－O－methylellagic acid－4′－(5″－acetyl)－α－L－arabino-furanoside	$C_{22}H_{18}O_{13}$	[3]	28	对羟基苯甲酸	$C_7H_6O_3$	[8]
2	3－O－methylellagic acid－4′－O－α－L－rhamnopyranoside	$C_{21}H_{18}O_{12}$	[3]	29	异香草酸	$C_8H_8O_4$	[9]
3	没食子酸乙酯	$C_9H_{10}O_5$	[4]	30	香草酸	$C_8H_8O_4$	[9]
4	caffeic acid	$C_9H_8O_4$	[4]	31	原儿茶酸	$C_7H_6O_4$	[9]
5	2(R)－12－{[(2E)－3－(4－hydroxy－3－methoxyphenyl)－1－oxo－2－propen－1－yl]oxy}－2,3－dihydroxypropyl ester	$C_{25}H_{38}O_8$	[5]	32	原儿茶酸甲酯	$C_8H_8O_4$	[8]
6	2(R)－23－{[(2E)－3－(4－hydroxy－3－methoxyphenyl)－1－oxo－2－propen－1－yl]oxy}－2,3－dihydroxypropyl ester	$C_{36}H_{60}O_8$	[5]	33	原儿茶醛	$C_7H_6O_3$	[8]
7	2(R)－26－{[(2E)－3－(4－hydroxy－3－methoxyphenyl)－1－oxo－2－propen－1－yl]oxy}－2,3－dihydroxypropyl ester	$C_{39}H_{66}O_8$	[5]	34	丁香酸	$C_9H_{10}O_5$	[8]
8	ethyl 24－O－feruloyl－oxytetracosanate	$C_{36}H_{60}O_6$	[5]	35	(－)－(7R, 8S)－赤式－愈创木基甘油	$C_{10}H_{14}O_5$	[8]
9	n－hexacosanylferulate	$C_{35}H_{60}O_4$	[5]	36	(－)－(7R, 8R)－苏式－愈创木基甘油	$C_{10}H_{14}O_5$	[8]
10	(E)－3,3′－dimethoxy－4,4′－dihydroxystilbene	$C_{16}H_{16}O_4$	[5]	37	3－(4－hydroxyl－3－methoxyphenyl)－propan－1,2－diol	$C_{10}H_{14}O_4$	[8]
11	trans－coniferyl aldehyde	$C_{10}H_{10}O_3$	[5]	38	C－藜芦酰乙二醇	$C_{10}H_{12}O_5$	[8]
12	Sinapaldehyde	$C_{11}H_{12}O_4$	[5]	39	3,4－二羟基苯丙酮	$C_9H_{10}O_3$	[8]
13	p－hydroxyl cinnamicaldehyde	$C_9H_8O_2$	[5]	40	2－guaiacylpropane－1,3－diol	$C_{10}H_{14}O_4$	[8]
14	methyl syringate	$C_{10}H_{12}O_5$	[5]	41	(2R*,3R*,4S*)－2,3－二脲基－4－羟基四氢呋喃	$C_{18}H_{20}O_6$	[8]
15	tricin	$C_{17}H_{14}O_7$	[6]	42	juglanin D	$C_9H_{10}O_4$	[8]
16	紫铆查耳酮	$C_{15}H_{12}O_5$	[6]	43	4－[6－O－(4－hydroxy－3,5－dimethoxybenzoyl)－b－D－glucopyranosyloxy]－ferulic acid	$C_{26}H_{30}O_{12}$	[9]
17	5－(3″－acetoxypropyl)－2－(4′－hydroxy－3′－methoxyphenyl)－7－methoxy－3－methylbenzofuran	$C_{22}H_{24}O_6$	[7]	44	Glensin A	$C_{21}H_{26}O_7$	[9]
18	dihydrodehydroiconiferyl alcohol	$C_{20}H_{24}O_6$	[7]	45	(7S,8R)－D－苏式－1′－[3′－羟基－7－(4－羟基－3－甲氧苯基)－8－甲氧基－7,8－二氢香豆酮丁丙烯醛	$C_{19}H_{22}O_6$	[9]
19	(－)－trans－3,4－divanillyltetranhydrofuran	$C_{20}H_{24}O_5$	[7]	46	(7R,8S)－去氢双松柏醇	$C_{20}H_{22}O_6$	[9]
20	isoshonanin	$C_{20}H_{22}O_5$	[7]	47	(－)－开环异落叶松脂素	$C_{20}H_{26}O_6$	[9]
21	(＋)－isolariciresinol	$C_{20}H_{24}O_6$	[7]	48	(＋)－松脂素	$C_{20}H_{22}O_6$	[9]
22	yunnanensin A	$C_{24}H_{28}O_8$	[7]	49	(E)－肉桂酸	$C_9H_8O_2$	[10]
23	isolariciresinol－9－acetate	$C_{22}H_{26}O_7$	[7]	50	4－hydroxy－3－methoxybenzamide	$C_8H_9NO_3$	[10]
24	(＋)－syringaresinol	$C_{22}H_{26}O_8$	[7]	51	5,7－二羟基色原酮	$C_9H_6O_4$	[10]
25	(－)－episyringaresinol	$C_{22}H_{26}O_8$	[7]	52	3－O－咖啡酰奎宁酸甲酯	$C_{17}H_{20}O_9$	[10]
26	(＋)－lirioresinol－A	$C_{22}H_{26}O_8$	[7]	53	3－O－咖啡酰奎宁酸乙酯	$C_{18}H_{22}O_9$	[10]
27	二氢阿魏酸	$C_{10}H_{12}O_4$	[8]				



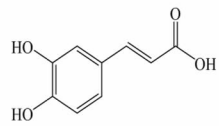
1



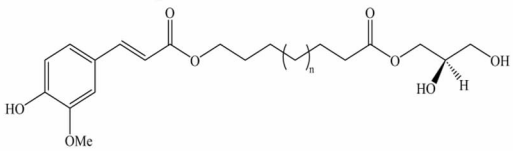
2



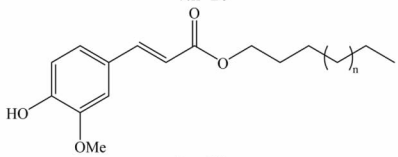
3



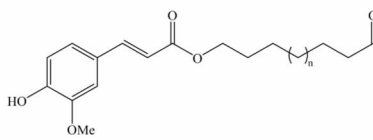
4



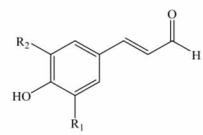
5.n=6
6.n=17
7.n=20



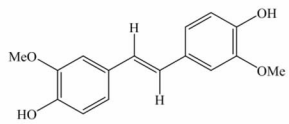
9.n=20



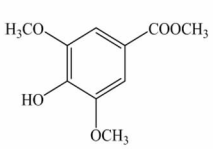
8.n=18



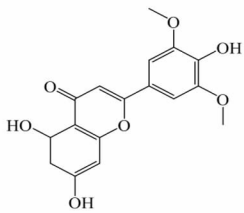
11.R_1=OMe, R_2=H
12.R_1=OMe, R_2=OMe
13.R_1=H, R_2=H



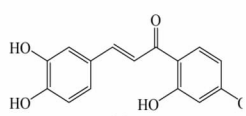
10



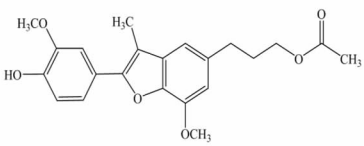
14



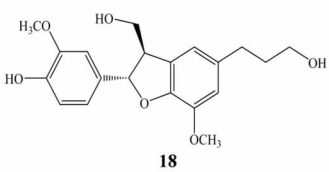
15



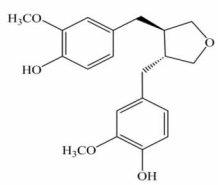
16



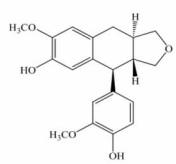
17



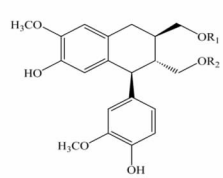
18



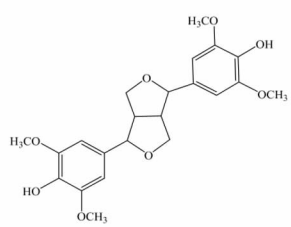
19



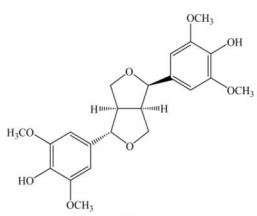
20



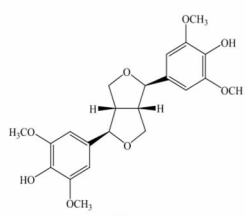
21.R_1=H, R_2=H
22.R_1=$COCH_3$, R_2=$COCH_3$
23.R_1=$COCH_3$, R_2=H



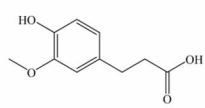
24



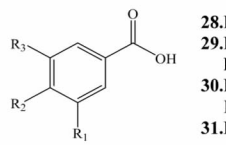
25



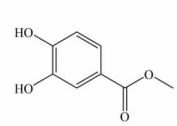
26



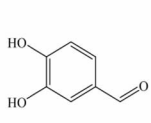
27



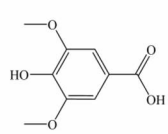
28.R_1=R_3=H, R_2=OH
29.R_1=H,R_2=OCH3, R_3=OH
30.R_1=H,R_2=OH, R_3=OCH_3
31.R_1=H, R_2=R_3=OH



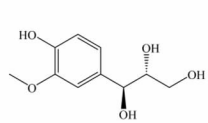
32



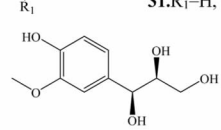
33



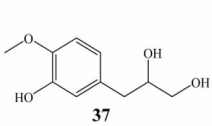
34



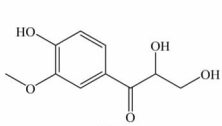
35



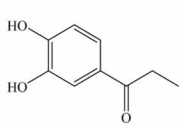
36



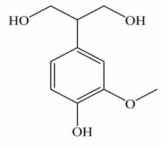
37



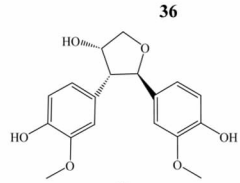
38



39



40



41

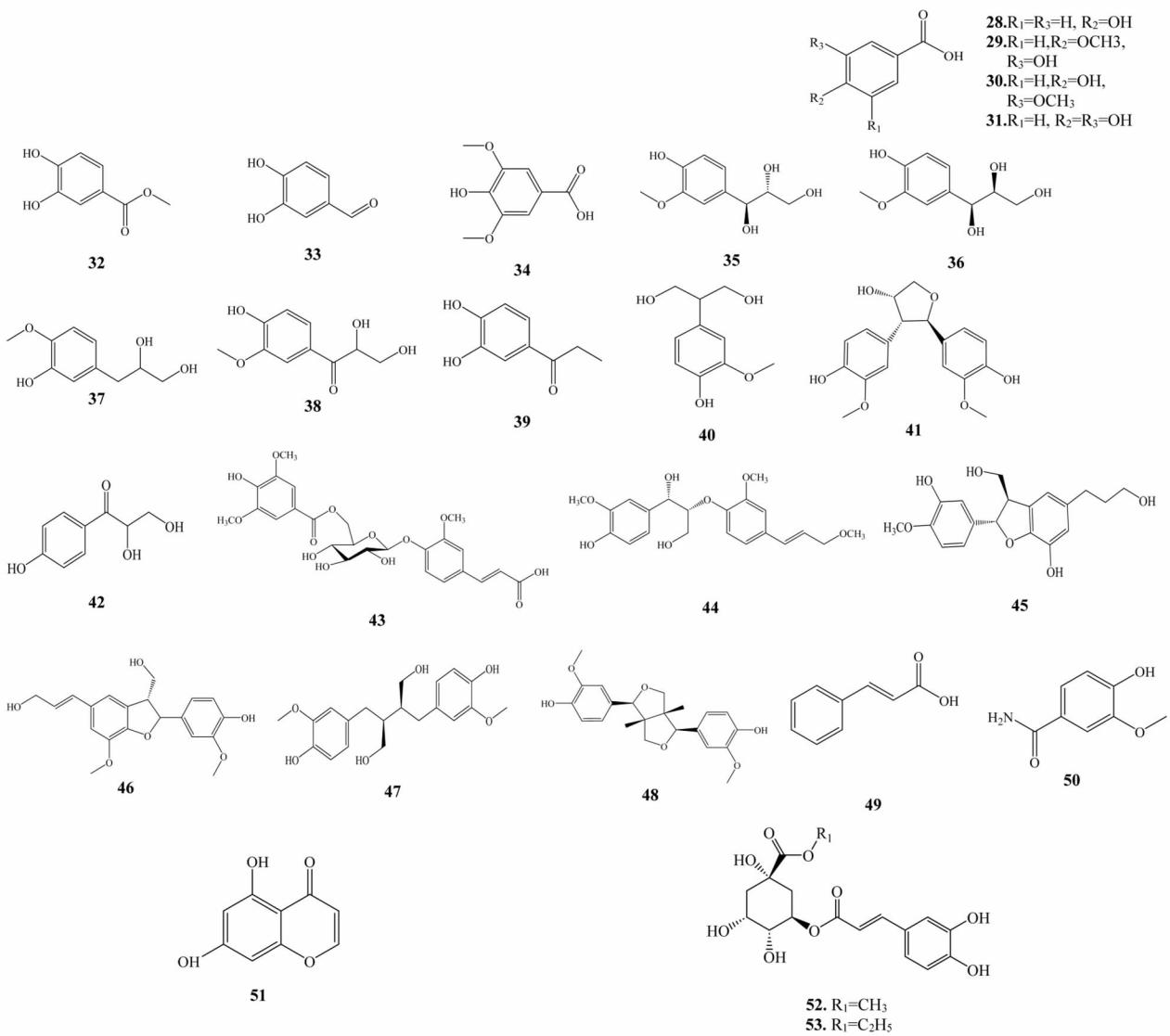


图1 皂角刺中多酚类化合物的结构式

2 生物活性

对1995—2023年发表在中国知网(CNKI)、维普网(VIP)、万方数据、PubMed、X-Mol等不同数据库上皂角刺生物活性的文献进行统计分析,其作用涉及抗肿瘤、抗菌、抗炎及抗凝血等方面。现代药理学研究主要热点是皂角刺提取物、总黄酮及其单体化合物在抗肿瘤方面的药效及机理,其次是抗菌剂抗炎活性的研究。皂角刺各类化合物生物活性:黄酮类具有多种生物活性,在抗癌、抑菌、抗氧化等方面广泛应用,主要集中于抗癌活性的筛选研究;多酚类有良好的抗氧化活性和一定的抗菌活性,对多种癌细胞具有明显的抑制作用;萜类及甾醇类化合物对肿瘤细胞均有一定的增殖抑制活性;香豆素类化合物具有较好的体外抗肝癌细胞毒性作用。

2.1 抗肿瘤作用

2.1.1 *皂角刺提取物抗癌活性研究* 皂角刺乙醇提取物抗肿瘤机制可能与抑制PCNA和突变型p53蛋白的表达有关[29],对人乳腺癌MCF7细胞有毒活性[30],抑制SNU-5人胃癌细胞的生长[31];在体外对HUVEC细胞具有剂量依赖性的抗增殖作用,是一种潜在的靶向肿瘤血管生成的抗癌药物[32]。皂角刺醇提物还对Bel-7402、Hela和KB等肿瘤细胞株的生长增殖具有良好的抑制作用[33];可显著恢复大鼠肝细胞癌的肝脏形态,并诱导细胞凋亡[34]。皂角刺水提物能显著抑制PC-3细胞移植瘤的大小[35],呈剂量依赖性抑制小鼠Lewis肺癌细胞生长[36],可通过AGE-RAGE信号通路诱导胰腺癌细胞凋亡[37],还能抑制鼻咽癌细胞CNE-2增殖[38]。皂角刺皂苷对PC-3细胞有显著抑制增殖和诱导凋亡的作用[39]。综上,皂角刺提取物主要对人乳腺癌MCF7细胞、胃癌SNU-5细胞、前列腺癌PC-3细胞和肝癌Bel-7402细胞等多种人体癌细胞具有良好的抑制作用。

2.1.2 *皂角刺总黄酮及其单体化合物抗癌活性研究* 皂角刺总黄酮较小的剂量则可显著降低Lewis肺癌细胞黏附及抑制其增殖,剂量相关地促进Lewis肺癌细胞间连接通讯[40-41]。此外,可诱导体外培养的人结肠癌HCT116细胞凋亡,具有较强的抗肿瘤作用[42]。

槲皮素可在基因水平上通过影响基因扩增和表达,进一步诱导人体乳腺、肺、结肠等多种器官肿瘤细胞的凋亡[43],皂角刺的黄酮类和香豆素类成分均具有较好的体外抗肺癌和肝癌细胞毒性作用[44],如异牡荆素,5-甲基氧-3,′4′,7-三羟基二氢黄酮醇,滨蒿内酯、异东莨菪内酯对肿瘤细胞A549和

表 2 皂角刺中黄酮类化合物

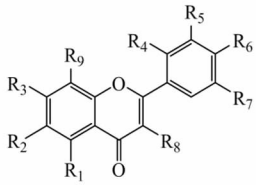
编号	化合物	化学式	文献	编号	化合物	化学式	文献
54	7,4′-二羟基黄酮醇	$C_{15}H_{10}O_4$	[6]	76	5-羟基-7-甲氧基-黄酮醇	$C_{16}H_{14}O_4$	[9]
55	7,3′,5′-三羟基-5 甲氧基黄酮醇	$C_{15}H_{12}O_6$	[6]	77	3,3′,5′,5,7-pentahydroflavanone	$C_{15}H_{11}O_7$	[4]
56	槲皮素	$C_{15}H_{10}O_7$	[11]	78	eriodictyol	$C_{15}H_{12}O_6$	[4]
57	8-C-吡喃葡萄糖基-3,4′,7-三羟基黄酮	$C_{15}H_{18}NO_5$	[12]	79	dihydrokaempferol	$C_{15}H_{12}O_6$	[4]
58	非瑟酮	$C_{15}H_{10}O_6$	[13]	80	5-甲氧基-3′,4′,7-三羟基二氢黄酮醇	$C_{16}H_{14}O_6$	[17]
59	荭草苷	$C_{21}H_{20}O_{11}$	[14]	81	5,7,2′,4′- 四羟基-3α-二氢黄烷酮醇	$C_{15}H_{12}O_7$	[17]
60	牡荆素	$C_{21}H_{20}O_{10}$	[14]	82	(-)-epicatechin	$C_{15}H_{14}O_6$	[4]
61	异槲皮苷	$C_{21}H_{20}O_{12}$	[14]	83	甘草素	$C_{15}H_{12}O_4$	[6]
62	木犀草苷	$C_{21}H_{20}O_{11}$	[14]	84	黄颜木素	$C_{15}H_{12}O_6$	[11]
63	槲皮苷	$C_{21}H_{20}O_{11}$	[14]	85	(2S)-2-(3′,4′-dihydroxypheny)-3,4-tetrahydro-8-hydroxy-2H,8H-benzo[1,2-b;3,4-b]dipyran-2-one	$C_{18}H_{14}O_6$	[15]
64	芹菜素	$C_{15}H_{10}O_5$	[14]	86	isoliquiritigenin	$C_{15}H_{12}O_4$	[15]
65	鹰嘴豆醇	$C_{15}H_{12}O_5$	[6]	87	catechin	$C_{15}H_{14}O_6$	[18]
66	(+)-反-2R,3R-3′,4′,5,7-四羟基黄酮醇	$C_{15}H_{11}O_7$	[12]	88	2,7-二甲基-氧杂蒽酮	$C_{15}H_{12}O_2$	[16]
67	(2R,3R)-7,3′5,′-三羟基黄酮醇	$C_{15}H_{10}O_6$	[15]	89	芦丁	$C_{27}H_{30}O_{16}$	[13]
68	丁公藤素 D	$C_{16}H_{14}O_6$	[15]	90	花旗松素	$C_{15}H_{12}O_7$	[14]
69	padmatin	$C_{16}H_{14}O_7$	[15]	91	染料木苷	$C_{21}H_{20}O_{10}$	[14]
70	(2R,3R)-5,3′,4′-三甲氧基-7-羟基二氢黄酮	$C_{18}H_{18}O_7$	[16]	92	vicenin-I	$C_{26}H_{28}O_{14}$	[19]
71	(2R,3R)-7,3′,5′-三羟基-二氢黄酮醇	$C_{15}H_{12}O_6$	[16]	93	isovitexin	$C_{21}H_{20}O_{10}$	[19]
72	(2R,3R)-5,7,3′-三羟基-4′-甲氧基-二氢黄酮醇	$C_{16}H_{14}O_7$	[16]	94	isoorientin	$C_{21}H_{20}O_{11}$	[19]
73	二氢槲皮素	$C_{15}H_{12}O_7$	[13]	95	luteolin-7-O-β-glucopyranoside	$C_{21}H_{20}O_{11}$	[19]
74	7, 3′,5′-三羟基二氢黄酮	$C_{15}H_{12}O_5$	[6]	96	luteolin-7-O-β-galactopyranoside	$C_{22}H_{22}O_9$	[19]
75	4′-O-甲基二氢槲皮素	$C_{16}H_{14}O_6$	[9]	97	apigenin-7-O-β-glucopy ranoside	$C_{22}H_{22}O_{10}$	[19]

表 3 三萜类及甾醇类化合物

编号	化合物	化学式	文献	编号	化合物	化学式	文献
98	软木三萜酮	$C_{30}H_{50}O$	[9]	108	2-hydroxypyracrenic acid	$C_{46}H_{74}O_7$	[23]
99	羽扇烯酮	$C_{30}H_{48}O$	[9]	109	β-谷甾醇	$C_{29}H_{50}O$	[17]
100	白桦脂醇	$C_{30}H_{50}O_2$	[9]	110	豆甾醇	$C_{29}H_{48}O$	[17]
101	刺囊酸	$C_{30}H_{48}O_4$	[20-21]	111	20-羟-24-β-乙烷基-甾-5,22-二烯-3β-[4′α-O-D-吡喃葡萄糖]胆甾醇苷	$C_{37}H_{62}O_7$	[17]
102	皂荚皂苷 C	$C_{70}H_{115}O_{34}$	[22]	112	20-羟-甾-5-烯-3β-[1′β-O-D-吡喃葡萄糖]胆甾醇苷	$C_{34}H_{58}O_7$	[17]
103	2β-carboxyl,3β-hydroxyl-norlupA(1)-20(29)-en-28-oic acid	$C_{30}H_{46}O_5$	[23]	113	20-羟-甾-5,22-二烯-3β-[1′β-O-D-吡喃葡萄糖]胆甾醇苷	$C_{36}H_{60}O_7$	[17]
104	zizyberanalic acid	$C_{30}H_{46}O_4$	[23]	114	C-friedours-7-en-3-one	$C_{30}H_{48}O$	[24]
105	betulic acid	$C_{30}H_{48}O_3$	[23]	115	stigmast-4-ene-3,6-dione	$C_{29}H_{46}O_2$	[24]
106	alphitolic acid	$C_{30}H_{48}O_4$	[23]	116	stigmastane-3,6-dione	$C_{29}H_{48}O_2$	[24]
107	3-O-trans-p-coumaroyl alphitolic acid	$C_{45}H_{71}O_6$	[23]				

表 4 木脂素及香豆素类化合物

编号	化合物	化学式	文献	编号	化合物	化学式	文献
117	2-甲氧基-4-羟基-4′-5′-并氢化吡喃-二苯基四氢呋喃并二四氢呋喃类木脂素	$C_{24}H_{28}O_7$	[17]	126	(2S)-2-(3′,4′-二羟基苯基)-8-羟基-苯并二吡喃二酮	$C_{18}H_{12}O_7$	[15]
118	3-甲氧基-4,4′,9,9′-四羟基-四氢呋喃木脂素	$C_{22}H_{26}O_7$	[17]	127	2′-甲基-8-甲氧基呋喃香豆素	$C_{13}H_{10}O_4$	[17]
119	(7R,8S,7′E,7″S,8″R)-buddlenol P	$C_{29}H_{30}O_9$	[25]	128	2′-羟基-8-甲氧基呋喃香豆素	$C_{12}H_8O_5$	[17]
120	(+)-丁香脂素	$C_{22}H_{26}O_8$	[25]	129	2,7-二甲基酮	$C_{15}H_{12}O_2$	[17]
121	(7S,8R)-cedrusin	$C_{19}H_{22}O_6$	[25]	130	3,7-二甲氧基-4-羟甲基-2-氢化吡喃香豆素	$C_{12}H_{14}O_4$	[17]
122	(7S,8R)-4,9,9′-三羟基-3,3′-二甲氧基-7,8-二氢苯骈呋喃-1′-丙基新木脂素	$C_{20}H_{24}O_6$	[25]	131	5-甲氧基-2,3-四氢化-4-氨基苯骈香豆素	$C_{10}H_{13}O_2$	[17]
123	3′,4-O-dimethylcedrusin	$C_{21}H_{26}O_6$	[25]	132	滨蒿内酯	$C_{11}H_{10}O_4$	[26]
124	蛇菰宁	$C_{20}H_{20}O_6$	[25]	133	异东莨菪内酯	$C_{10}H_8O_4$	[26]
125	东莨菪内酯	$C_{10}H_8O_4$	[8]	134	6-氨基-7-甲氧基香豆素	$C_{10}H_9NO_3$	[26]



54. R_3=R_6=OH, R_1=R_2=R_4=R_5=R_7=R_8=R_9=H

55. R_3=R_5=R_7=OH, R_2=R_4=R_6=R_8=R_9=H, R_1=OCH_3

56. R_1=R_3=R_6=R_7=R_8=OH, R_2=R_4=R_5=R_9=H

57. R_1=R_3=R_6=OH, R_2=R_4=R_5=R_7=R_8=H, R_9=O-Glu

58. R_3=R_6=R_7=R_8=OH, R_1=R_2=R_4=R_5=R_9=H

59. R_1=R_3=R_6=R_7=OH, R_2=R_4=R_5=R_8=H, R_9=Glc

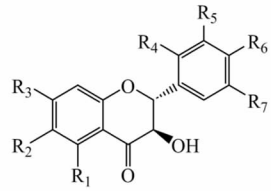
60. R_1=R_3=R_6=OH, R_2=R_4=R_5=R_7=R_8=H, R_9=Glc

61. R_1=R_3=R_5=R_6=OH, R_2=R_4=R_7=R_9=H, R_8=O-Glc

62. R_1=R_5=R_6=OH, R_2=R_4=R_7=R_8=R_9=H, R_3=O-Glc

63. R_1=R_3=R_5=R_6=OH, R_2=R_4=R_7=R_9=H, R_8=O-Rha

64. R_1=R_3=R_6=OH, R_2=R_4=R_5=R_7=R_8=R_9=H



65. R_3=R_6=OH, R_1=R_3=R_4=R_5=R_7=H

66. R_1=R_3=R_5=R_6=OH, R_2=R_4=R_7=H

67. R_3=R_5=R_7=OH, R_1=R_2=R_4=R_6=H

68. R_3=R_6=OH, R_1=R_2=R_4=R_7=H, R_5=OCH_3

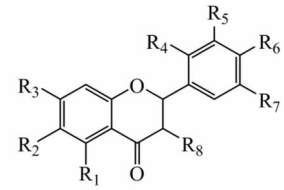
69. R_1=R_6=R_7=OH, R_2=R_4=R_5=H, R_3=OMe

70. R_1=R_5=R_6=OCH_3, R_2=R_4=R_7=H, R_3=OH

71. R_2=R_5=R_7=OH, R_1=R_3=R_4=R_6=H

72. R_1=R_3=R_5=OH, R_2=R_4=R_7=H, R_6=OCH_3

73. R_1=R_3=R_6=R_7=OH, R_2=R_4=R_5=H



74. R_3=R_5=R_7=OH, R_1=R_2=R_4=R_6=R_8=H

75. R_1=R_3=R_5=OH, R_2=R_4=R_7=R_8=H, R_6=OCH_3

76. R_2=R_4=R_5=R_6=R_7=R_8=H, R_1=OH, R_3=OCH_3

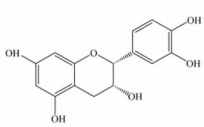
77. R_1=R_3=R_5=R_7=R_8=OH, R_2=R_4=R_6=H

78. R_1=R_3=R_5=R_6=OH, R_2=R_4=R_7=R_8=H

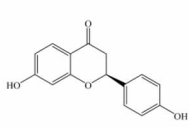
79. R_1=R_3=R_6=R_8=OH, R_2=R_4=R_5=R_7=H

80. R_3=R_5=R_6=R_8=OH, R_2=R_4=R_7=H, R_1=OCH_3

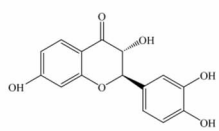
81. R_1=R_3=R_4=R_6=R_8=OH, R_2=R_5=R_7=H



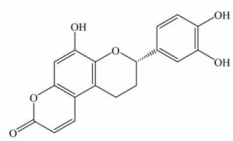
82



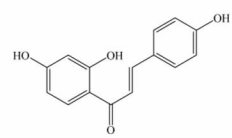
83



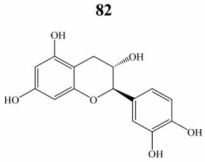
84



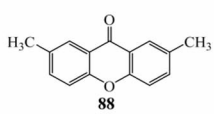
85



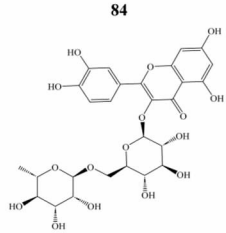
86



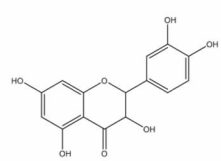
87



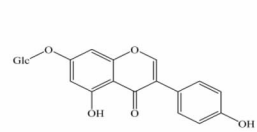
88



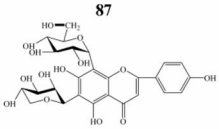
89



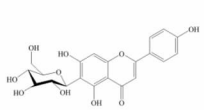
90



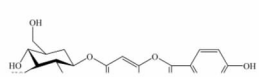
91



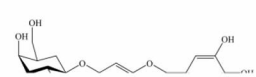
92



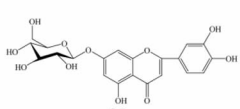
93



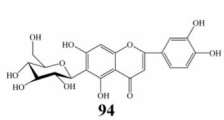
96



97



95



94

图 2 皂角刺中黄酮类化合物

表 5 皂角刺中挥发成分及其他类化合物

编号	化合物	化学式	文献	编号	化合物	化学式	文献
135	糠醛	$C_5H_4O_2$	[27]	143	正十四烷	$C_{14}H_{30}$	[27]
136	反油酸	$C_{18}H_{34}O_2$	[27]	144	苯乙醛	C_8H_8O	[27]
137	植酮	$C_{18}H_{36}O$	[27]	145	indole－3－carboxaldehyde	C_9H_7NO	[5]
138	棕榈酸	$C_{16}H_{32}O_2$	[27]	146	3－(2－羰基－丙基)－3－羟－吲哚啉－2－酮	$C_{11}H_{11}NO_3$	[8]
139	亚油酸	$C_{18}H_{32}O_2$	[27]	147	indazole	$C_7H_6N_2$	[9]
140	芳樟醇	$C_{10}H_{18}O$	[27]	148	2－氨基咪唑	$C_3H_5N_3$	[10]
141	正己醛	$C_6H_{12}O$	[27]	149	cytochalasin H	$C_{30}H_{39}NO_5$	[28]
142	2－正戊基呋喃	$C_9H_{14}O$	[27]				

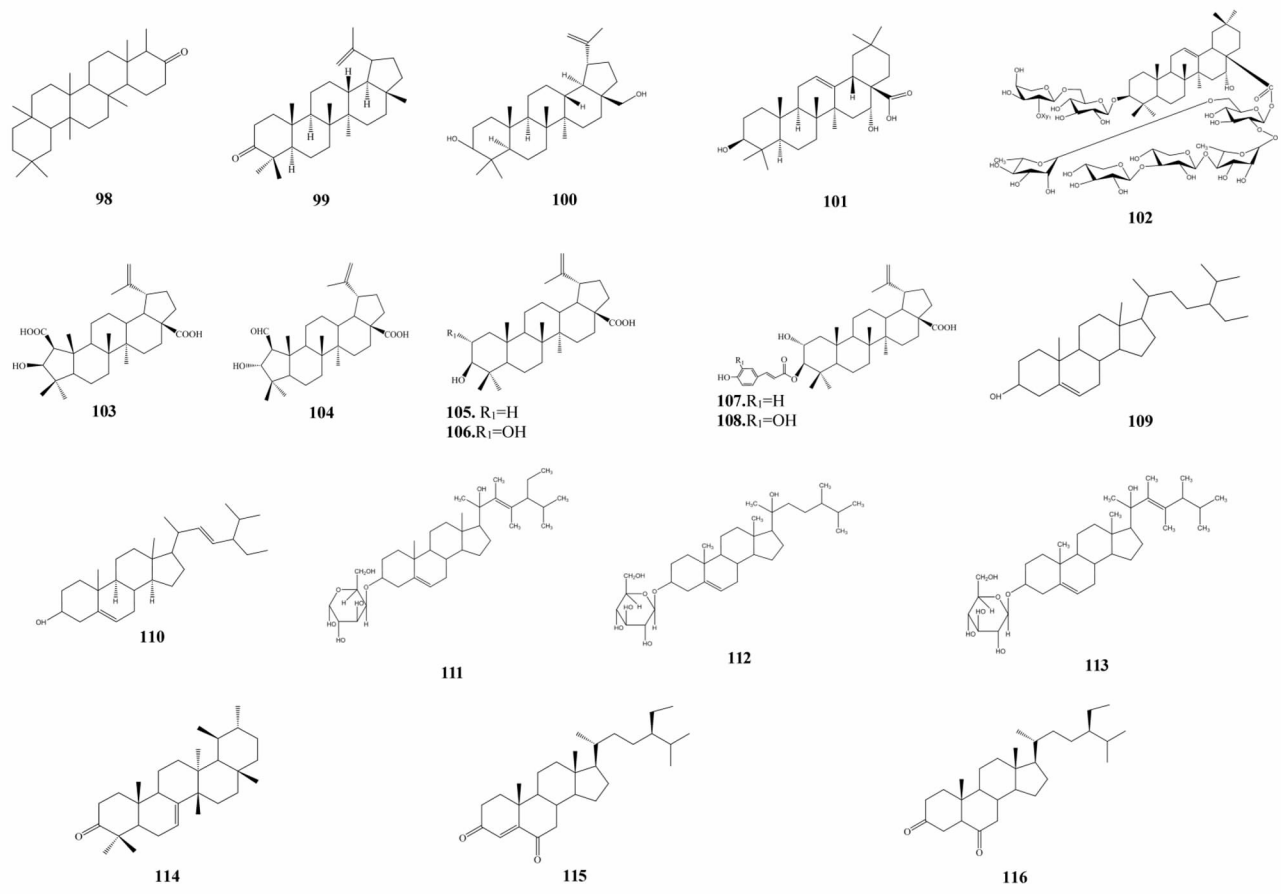


图3 萜类及甾醇类化合物

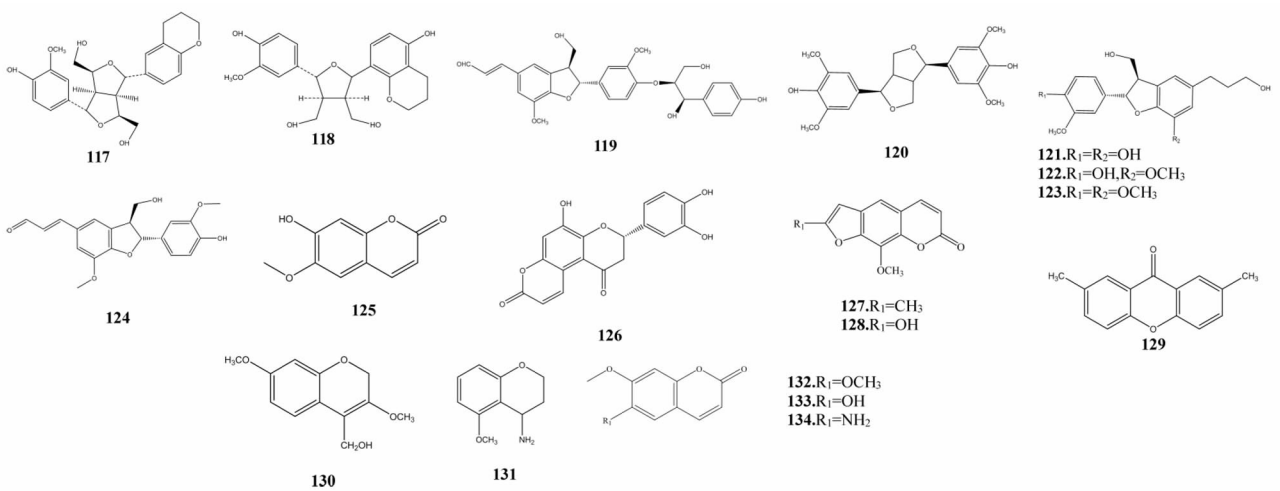


图4 木脂素及香豆素类化合物

7721的生长抑制作用较强。皂角刺中单体化合物 p-hydroxyl cinnamicalde-hyde、trans-coniferyl aldehyde 和 sinapaldehyde 对体外人肝癌 SK-hep1 细胞具有较强及中等的细胞毒活性[5],(2R,3R)-5,3′,4′-三甲氧基-7-羟基二氢黄酮醇、5-甲氧基-3′,4′,7-三羟基二氢黄酮醇和5,7,3′,4′-四羟基二氢黄酮醇主要作用于肝癌(HepG2)和食管癌(EC109)细胞株,而黄颜木素、槲皮素对肝癌、肺癌和食管癌肿瘤细胞均有较强的增殖抑制活性[16-17]。综上,皂角刺黄酮类、香豆素类成分和单体化合物槲皮素、黄颜木素、(2R,3R)-5,3′,4′-三甲氧基-7-羟基二氢黄酮醇和5-甲氧基-3′,4′,7-三羟基二氢黄酮醇等对人体肺癌细胞、肝癌细胞和乳腺癌细胞等多种肿瘤细胞具有抗癌活性。可见,皂角刺中槲皮素、黄颜木素、(2R,3R)-5,3′,4′-三甲氧基-7-羟基二氢黄酮醇和5-甲氧基-3′,4′,7-三羟基二氢黄酮醇等为抗癌活性的主要生物活性成分。具体作用机制见插页Ⅱ图6。

2.2 抗菌作用

皂角刺具有多种抑菌活性,其中单体化合物槲皮素、3,3′,5,5′,7-五羟基二氢黄酮醇和咖啡酸对囊泡杆菌和枯草芽孢

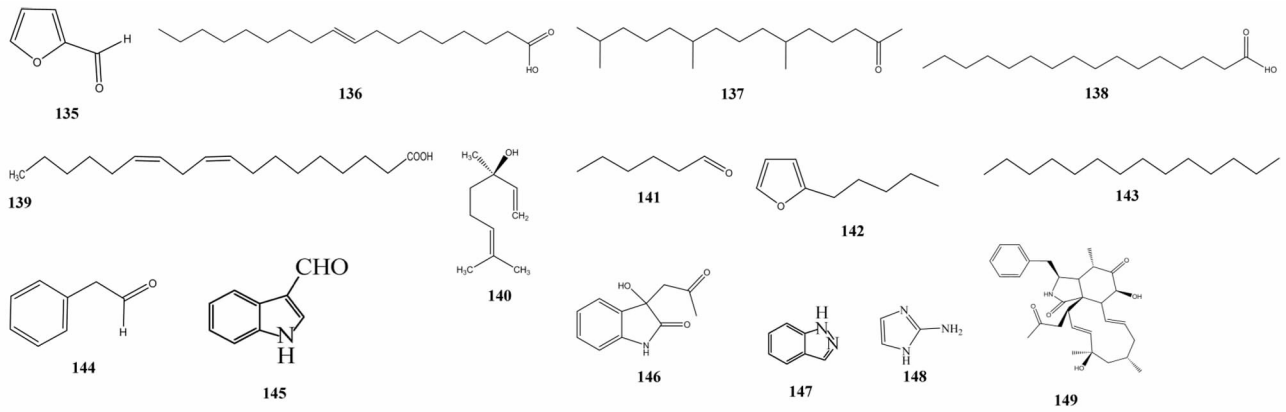


图5 皂角刺中挥发成分及其他类化合物

杆菌均表现出中等的抑制活性[4]。皂角刺甾体皂苷对革兰氏阳性菌和革兰氏阴性菌均有明显的抑菌活性[17],皂角刺总三萜在一定剂量下可以降低瘤胃球菌属、肠球菌属的相对丰度[45];皂角刺中白桦脂酸型三萜类化合物对抗橙色青霉 UC-4367、金黄色葡萄球菌、结核分歧杆菌和肺炎链球菌有一定的抑菌活性[46]。皂角刺提取物对大肠杆菌和金黄色葡萄球菌最低抑菌浓度为0.05 g/mL[47],且对革兰氏阳性菌的抑制作用优于革兰氏阴性菌,对真菌抑制作用不明显[48]。此外,皂角刺作为抗菌成分制备抗菌牙膏,其对口腔中的金黄色葡萄球菌有较强抑制效果[49]。综上,皂角刺抑菌作用除少数的单体化合物外,主要集中于皂角刺提取部位:如槲皮素、3,3′,5,5′,7-五羟基二氢黄酮醇对囊泡杆菌、枯草芽孢杆菌表现出一定的抑菌活性,皂角刺提取物及其皂苷类化合物的抑菌活性被广泛研究,具有广谱抗菌活性,可以抑制多种革兰氏阳性菌和革兰氏阴性菌。具体抗菌活性见插页Ⅱ图6。

2.3 抗炎作用

皂角刺水提物除了显著降低了 PGE2、肿瘤坏死因子-α(TNF-α)、白介素(IL)-1β 和 IL-6 的产生,抑制其炎性细胞因子的 mRNA 表达[50],还能通过信号转导和转录激活因子(STAT)3/STAT6 信号通路抑制 IL-4/IL-13 刺激人鼻上皮细胞中 MUC5AC 的产生,减少了鼻腔炎症[51]。发酵的皂角刺提取物降低了小鼠血清亚硝酸盐和总胆固醇,还降低了炎症相关的血清生物标志物[52]。皂角刺乙醇提取物不仅抑制 VSMC TNF-α 诱导的基质金属蛋白酶-9(MMP-9)的表达,还对 VSMC 的细胞增殖和 MMP-9 表达有很强的抑制作用[53]。皂角刺还可通过乳腺癌疾病通路、TNF 信号通路和雌激素信号通路治疗乳痈[54]。综上,关于皂角刺抗炎作用的研究主要集中在水提取物和乙醇提取物,主要通过降低炎症相关因子的产生而起到抗炎作用,关于皂角刺提取物抗炎活性的单体化合物还未深入研究。具体抗炎活性及机制见插页Ⅱ图6。

2.4 抗凝血、免疫调节功能

皂角刺水提物不仅能够显著延长小鼠凝血时间,抑制家兔体外血小板聚集和动静脉血栓的形成[55];还发现能升高小鼠血中细胞因子 IL-2、IL-6、IL-12 和 TNF-α 的水平,提高了荷瘤小鼠的胸腺指数、脾指数[56]。低剂量的皂角刺乙醇提取物可以显著提高肉仔鸡的 B、T 淋巴细胞转化率,从而促进细胞免疫功能[57]。皂角刺总黄酮对肿瘤坏死因子 TNF 有明显的抑制作用,且呈剂量依赖性[58]。皂角皂苷的抗凝血、抑制血栓形成、改善微循环的作用机制为:延长凝血酶时间,降低血浆纤维蛋白原浓度,减小 MCV 及 RDW-CV,降低血小板平均体积及体积分布宽度[59]。此外,皂角刺对细胞因子的调节作用,还表现在免疫调节功能层面[60]。综上所述,皂角刺提取物具有多种生物活性,如皂角刺水提物及其皂苷具有明显的抗凝血作用,皂角刺乙醇提取物及其总黄酮具有一定的免疫调节功能。

2.5 抗氧化、治疗抑郁症

随皂角刺样品中多糖质量浓度的增加,对 Fe^{3+} 还原能力越强,且比 Vc 作用强;其多糖对·OH、DPPH·及·O_2^- 的清除率比 Vc 弱[61]。皂角刺总黄酮质量浓度处于0.1~0.3 g/L时,不同提取物的抗氧化能力与浓度呈正相关关系[62]。皂角刺水提取物是一种抗氧化剂,可以抑制 LPS 诱导的细胞中 ROS 的产生[50],还可能通过提高神经递质浓度和调节 cAMP-CREB-BDNF 通路来缓解皮质酮诱导的抑郁样行为[63-64]。综上所述,皂角刺提取物具有多种生物活性,如皂角刺多糖、总黄酮及水提物具有一定的抗氧化活性,水提物还具有抗抑郁作用。

2.6 其他作用

皂角刺在抗动脉硬化机理中,既具有降脂作用还兼具了降低炎性因子作用[65]。皂角刺水提物可抑制大鼠全身过敏反应,同时也显著抑制由 anti-DNPIgE 致敏的局部过敏反应[66]。皂角刺醇提物具有抗哮喘作用,其机制是通过减少氧化应激和气道炎症介导[67],还可以通过降低 PDGF 处理的 VSMC 中 NF-κB、AP-1 和 Sp-1 的结合活性来诱导 p27KIP1 介导的 G1 期细胞周期阻滞,减少 Akt 磷酸化并阻止 MMP-9 表达[68]。皂角刺对脂多糖诱导的正常大鼠肾小管上皮样细胞凋亡具有肾保护作用[69-70]。皂角刺提取物中豆甾醇的抗突变活性最强[24],皂苷对 α-葡萄糖苷酶有较强抑制作用[71],黄颜木素抑制 TGFβ1 诱导的细胞内胶原合成,有助于预防肝纤维化的发生[72]。综上所述,皂角刺提取物具有抗动脉粥样硬化、抗哮喘、抗突变、抗过敏和抗纤维化等作用,目前相关的研究报道较少。

3 皂角刺 Q-Marker 预测分析

中药材质量是保证中药饮片及其中成药药效的重要基础,中药材质量控制及其标准的评价方法是优质中药生产加工过程中重要的技术保障。2020 年版《中华人民共和国药典》中皂角刺仅规定了“性状”“鉴别”项检测,主要以皂角刺的对照药材作为鉴别依据,但皂角刺中有效成分易受到产地、采收时间、加工储藏等多因素的影响,仅以皂角刺的性状、鉴别项进行质

量评价难以全面反映皂角刺的总体质量。基于刘昌孝院士提出的中药Q－Marker的概念，将化学成分的标志性物质、有效性与安全性关联起来，充分体现药效与成分的差异性特征，完善质量控制评价体系。因此，本文基于现有的研究报告对皂角刺Q－Marker进行预测分析，为建立皂角刺药材全面的质量控制评价方法提供参考。

3.1 植物亲缘学及化学成分特有性

皂角刺为豆科植物皂荚（*Gleditsia sinensis* Lam.）的干燥棘刺，始载于神农本草经，全球约12种，主要分布在美洲、亚洲和非洲，中国有8种，引进1种，广泛分布于河南、河北、江苏及湖北等省区[73]。目前已从中分离出黄酮类、多酚和三萜类等化学成分，黄酮类作为其化学结构多样的主要次生代谢产物，具有抗癌、抗炎、抗菌等多种药理活性，常用于消炎、镇痛及癌症等的治疗[74]，可为Q－Marker的筛选提供参考。（2R,3R）－5,3′,4′－三甲氧基－7－羟基二氢黄酮醇和5－甲氧基－3′,4′,7－三羟基二氢黄酮醇，分别为皂角刺中分离得到的新化合物和首次发现的化合物[15]。花旗松素、槲皮素是导致皂角刺不同部位质量差异的主要特征成分[75]，花旗松素、木犀草苷和槲皮苷在皂角刺中的含量显著高于大皂角和猪牙皂[14]，黄颜木素和3β－acetoxyolean－12－en－28－oicacid对多种肿瘤细胞生长增殖均具有显著的抑制作用。皂角刺总黄酮能明显抑制人结肠癌细胞的增殖，且呈现出一定的浓度依赖性[42]。皂角刺皂苷可显著抑制前列腺癌细胞增殖，诱导细胞凋亡[43]。综上，黄酮类成分（2R,3R）－5,3′,4′－三甲氧基－7－羟基二氢黄酮醇和5－甲氧基－3′,4′,7－三羟基二氢黄酮醇分别为新化合，花旗松素、槲皮素和黄颜木素等化合物在不同药用部位中的含量差别较大，具有特异性，可作为皂角刺Q－Marker选择的参考。

3.2 不同产地及采收时期

中药的化学成分与疗效受不同产地及采收时期等因素影响，可为其质量控制提供一定参考。不同产地皂角刺的槲皮素、总多酚含量均呈现显著差异，如槲皮素和总多酚含量均是河南最高，山东次之，山西最低，可见，河南产皂角刺品质最优更适宜药用[76]。周爱芹[77]采用HPLC法测定26批不同产地皂角刺药材中黄颜木素、花旗松素和槲皮素进行含量测定，其中花旗松素含量较高，可作为皂角刺药材的质控指标。不同采收期皂角刺中槲皮素和刺囊酸的含量在采摘期10月普遍高于6月[78]；槲皮素和总多酚含量7月中旬—8月初含量持续增加，9月—10月后其含量开始降低，故9月—10月是皂角刺的最佳采收期[79]。综上所述，评价不同产地、采收期皂角刺的质量及其可测性，考虑将皂角刺多酚类化学成分刺囊酸，黄酮类化学成分槲皮素、花旗松素和黄颜木素等为其潜在Q－Marker选择的参考依据。

3.3 成分与功效相关性

皂角刺中黄酮类成分对多种癌细胞诱导凋亡发挥抑制增殖作用[80－81]，其中，（2R,3R）－5,3′,4′－三甲氧基－7－羟基二氢黄酮醇和5－甲氧基－3′,4′,7－三羟基二氢黄酮醇主要作用于肝癌HepG2和食管癌EC109细胞株[16]，滨蒿内酯、异东莨菪内酯对肿瘤细胞A549和7721的生长较强抑制作用。紫铆查耳酮对MCF－7细胞具有明显细胞毒活性[6,10]。此外，槲皮素、咖啡酸、3,3′,5,5′,7－五羟基二氢黄酮醇、白桦脂酸型三萜类和总三萜等化合物还具有抑菌的作用[4,46,80]。cytochalasin H是皂角刺乙醇提取物的活性抗血管生成成分[82]，其抗血管活性是由于内皮素－1等促血管生成因子的表达减少而引起的[28]。没食子酸乙酯和槲皮素随剂量的增加对炎症介质的抑制作用越强[18]，黄颜木素具有双重抑制作用，提示黄颜木素具有抗肝纤维化作用[66]。皂角刺多糖具有显著抗氧化作用[61]、皂角皂苷为主要抗凝血物质[49]。可见，皂角刺中主要活性成分黄酮类及三萜类化合物具有抗癌、抑菌、抗炎等多种生物活性，基于中药化学成分与生物活性的量效相关性，结合皂角刺的成分与功效进行Q－Marker的预测分析。因此，可考虑将槲皮素、黄颜木素、3,3′,5,5′,7－五羟基二氢黄酮醇、5－甲氧基－3′,4′,7－三羟基二氢黄酮醇、没食子酸乙酯等化学成分作为皂角刺潜在Q－Marker选择的参考依据。

3.4 传统药性

中药的传统药性主要体现在“四气五味”方面，其“性味归经”是中药理论体系、临床用药及中药配伍重要参考的内涵。刘昌孝等提出“性－效－物”的三元关系，指出性味也可作为Q－Marker预测的依据[83]。皂角刺辛、温，归肝、肺、胃经，功能主治为消肿托毒，排脓，杀虫。在临床上常用于痈疽初起或脓成不溃，也可以用来外治疥癣麻风。温性药的基本归经为肝、脾、肾、胃、肺，所含的基本化学成分为挥发油、黄酮类、皂苷类[84]。辛味药“辛能行气”的共有物质基础为挥发油[85]。综上，这些化学成分在一定意义上与皂角刺的温、辛有关，因此，可将槲皮素、黄颜木素、3,3′,5,5′,7－五羟基二氢黄酮醇、5－甲氧基－3′,4′,7－三羟基二氢黄酮醇等作为皂角刺潜在Q－Marker选择的参考依据。

3.5 复方配伍

中药通过科学的复方配伍，能更好地应用于临床的诊断治疗，体现方随症辨的治疗原则，提高疗效、减少药物的不良反应。潘谊等[86]根据肝癌的“毒、痰、瘀、虚”特性，通过筛选中药形成了毒痰瘀脾肾虚方。皂角刺槲皮素在复方中能够通过作用于其他靶点，促进癌细胞凋亡并抑制癌症复发，在肝癌的治疗中具有重要的应用价值[87]。痤疮方是一种具有散肺经风热、解毒散结功效的药物，由皂角刺等14种中药材配制而成，活性成分主要为槲皮素、黄颜木素、豆甾醇等，有效治疗寻常型痤疮肺经风热证的临床表现[88]。此外，皂角刺常作为经典方剂的主要配伍药味，用于治疗恶性肿瘤、吹乳结核、乳腺增生、抗炎、抗病毒和息肉等疾病，主要活性成分为黄酮类[89－96]。综上，皂角刺在复方配伍的功效应用与现代药理学研究具有相同的作用，可将皂角刺中槲皮素、黄颜木素和豆甾醇等作为皂角刺潜在Q－Marker选择的重要参考依据。

3.6 化学成分可测性

化合物的定性鉴别和定量测定可作为中药材Q－Marker的评价指标，目前可通过高效液相色谱法、气相色谱质谱联用等方法对皂角刺化学成分进行分析，为可测性的Q－Marker提供参考依据。DESs和HSCCC联合技术，获得皂角刺总黄酮的质量控制标志物为3,3′,5,5′,7－五羟基二氢黄酮醇、槲皮素[97]，皂角刺中主要香豆素类化合物主要有滨蒿内酯和异东莨菪内酯[26]。此外，原儿茶酸、花旗松素作为HPLC含量测定的指标性成分[98－99]；3,3′,5,5′,7－五羟基二氢黄酮醇量较大且稳定，可作为皂角刺药材质量控制的指标性成分[100]。综上，基于质量标志物的有效性和成分可测性强的槲皮素、花旗松素、3,3′,5,5′,7－五羟基二氢黄酮醇、原儿茶酸、滨蒿内酯、异东莨菪内酯等成分，作为皂角刺的潜在Q－Marker选择的重要参考依据。

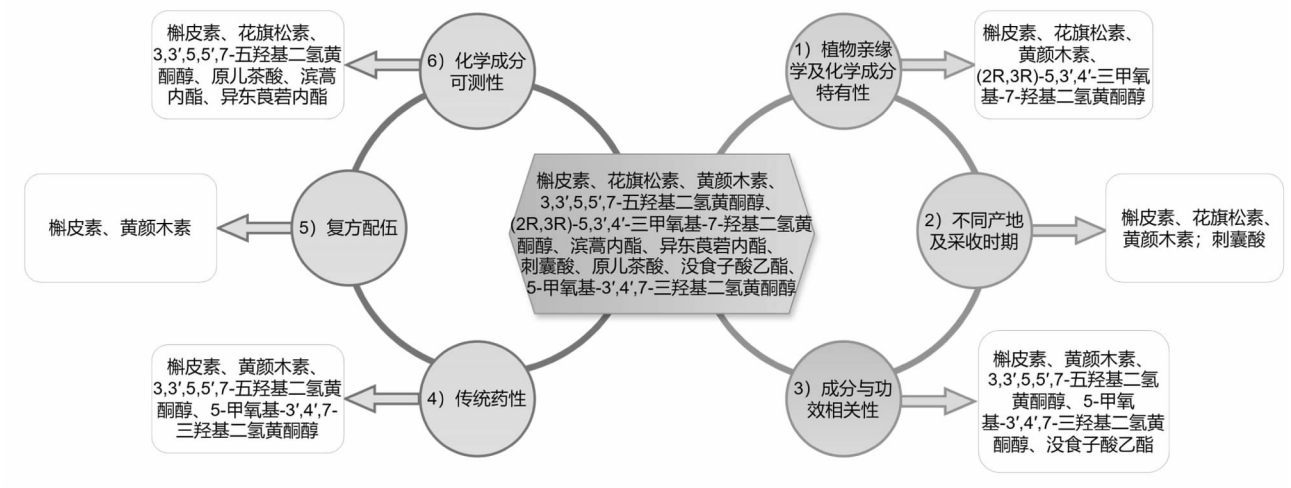


图 7　皂角刺 Q－Marker 预测分析

4　结语与展望

皂角刺属于我国的传统中药，含有丰富的活性成分，在抗癌与抑菌方面具有广阔的开发利用前景。近年来，围绕皂角刺中主要化学成分黄酮类、多酚类及皂苷类的抗癌、抑菌等生物活性做了大量的工作，其中黄酮类槲皮素、花旗松素、黄颜木素等化学成分具有较强的抑制人体乳腺癌细胞、肺癌细胞、结肠癌细胞等多种肿瘤细胞的作用，多酚类及皂苷类等具有较强的抑菌作用。目前皂角刺无明确指标性成分，质量评价方法不够全面，无法满足其质量控制需求。本文在系统对皂角刺化学成分、现代药理作用进行归纳综述的基础上，以 Q－Marker 理论为指导，从皂角刺的植物亲缘学、化学成分特有性、不同产地及采收时期、成分与功效相关性、传统药性、复方配伍、化学成分可测性等多个角度进行预测分析，选取皂角刺特有的、可测定的、含量高的药效活性成分。结果表明皂角刺中的黄酮类成分是发挥其临床疗效的代表性成分，故初步推测槲皮素、花旗松素、黄颜木素、3,3′,5,5′,7－五羟基二氢黄酮醇、(2R,3R)－5,3′,4′－三甲氧基－7－羟基二氢黄酮醇、滨蒿内酯、异东莨菪内酯、刺囊酸、原儿茶酸等化学成分作为皂角刺潜在 Q－Marker 的候选物，见图 7。

皂角刺用于治疗病原菌为葡萄球菌引起的痈疽症状，是临床上中医皮肤科常用药。目前基于化学成分与抗菌功效相关性的研究尚不够全面，结合功效与质量控制的深入研究还非常欠缺。可基于皂角刺抗菌活性物质的追踪，开展代谢组学的分析及抗菌活性导向追踪分离“抗菌活性组分”，以“抗菌活性组分”纯化后的化合物作为备选的质量标志物。在此基础上，利用网络药理学预测与抗菌相关的化学成分作为质量标志物。最后，对预测质量标志物的化合物进行抗菌活性验证，挖掘出准确、可靠的 Q－Marker。现代皂角刺的生物活性研究主要集中在抗肿瘤方面，但对抗菌、抗炎等的研究多处于指标检测阶段，还需深入研究其内在机理。皂角刺的黄酮类物质作为化学结构多样的主要次生代谢产物，具有抗肿瘤、抑菌和抗肝纤维化等多种生物活性，其药理学研究的单体成分主要有槲皮素、花旗松素和黄颜木素等。皂角刺所含多酚类、三萜类及甾醇类等化合物及其单体的生物活性还有待深入研究。此外，现阶段皂角刺不同化学成分在机体内的代谢分布、入血成分等相关研究很少，无法为临床合理应用提供相关数据支持。建议对黄酮类、多酚类及皂苷类化学成分的药效学进一步深入研究，建立量效相关关系，为建立全面、科学的皂角刺质量评价体系提供参考，为更好地利用皂角刺药用资源奠定了科学基础。

参考文献

[1] 国家药典委员会. 中华人民共和国药典：一部[S]. 北京：中国医药科技出版社，2020：185.
[2] 刘勇，张彩虹，谢普军，等. 皂角刺化学组成及药理活性应用研究进展[J]. 生物质化学工程，2023，57(2)：89－98.
[3] ZHOU L G，LI D，JIANG W B，et al. Two ellagic acid glycosides from *Gleditsia sinensis* Lam. with antifungal activity on *Magnaporthe grisea*[J]. Nat Prod Res，2007，21(4)：303－309.
[4] ZHOU L G，LI D，WANG J G，et al. Antibacterial phenolic compounds from the spines of *Gleditsia sinensis* Lam[J]. Nat Prod Res，2007，21(4)：283－291.
[5] YU J Q，XIAN Y X，GENG Y L，et al. Anti－liver cancer constituents from the thorns of *Gleditsia sinensis*[J]. Phytochem Lett，2015，13：343－347.
[6] 李岗，王召平，仙云霞，等. 皂角刺中黄酮类成分及其抗肿瘤活性研究[J]. 中草药，2016，47(16)：2812－2816.
[7] ZHANG H M，ZHANG Y K，WANG Y X，et al. A new neolignan from the thorns of *Gleditsia japonica* var. *delavayi*[J]. Nat Prod Res，2019，33(2)：239－243.
[8] 齐曼，郑晓珂，曹彦刚，等. 皂角刺醋酸乙酯部位化学成分研究[J]. 中草药，2018，49(23)：5510－5515.
[9] ZHANG Y B，LAM K H，CHEN L F，et al. Chemical constituents from the thorns of *Gleditsia sinensis* and their cytotoxic activities[J]. J Asian Nat Prod Res，2020，22(12)：1121－1129.
[10] 李岗，仙云霞，王晓，等. 皂角刺化学成分及其抗肿瘤活性研究[J]. 中草药，2015，46(19)：2846－2850.
[11] 徐哲，赵晓峁，王漪檬，等. 皂角刺抗肿瘤活性成分的分离鉴定与活性测定[J]. 沈阳药科大学学报，2008，25(2)：108－111，162.
[12] 李万华，李琴，王小刚，等. 皂角刺中黄酮类化学成分的分离鉴定[J]. 西北大学学报(自然科学版)，2005，35(6)：763－765，770.
[13] LI J，JIANG K，WANG L J，et al. HPLC－MS/MS determination of flavonoids in Gleditsiae Spina for its quality assessment[J]. J Sep Sci，2018，41(8)：1752－1763.
[14] 谢胡敏，宓月光，徐晓艳，等. 大皂角、猪牙皂和皂角刺中 10 种黄酮与生物碱成分的含量测定[J]. 中国中药杂志，2023，48(7)：1899－1907.

[15] YU J Q, XIAN Y X, LI G, et al. One new flavanocoumarin from the thorns of *Gleditsia sinensis*[J]. Nat Prod Res, 2017, 31(3): 275 - 280.
[16] 曹冉冉, 高嘉屿, 刘华清, 等. 皂角刺中二氢黄酮醇类化合物及其细胞毒活性研究[J]. 中草药, 2016, 47(5): 707 - 711.
[17] 曹冉冉. 中药材皂角刺有效成分分离及连翘品质资源研究[D]. 洛阳: 河南科技大学, 2015.
[18] SEO C S, LIM H S, HA H, et al. Quantitative analysis and anti - inflammatory effects of *Gleditsia sinensis* thorns in RAW 264.7 macrophages and HaCaT keratinocytes[J]. Mol Med Rep, 2015, 12(3): 4773 - 4781.
[19] MOHAMMED R S, ABOU ZEID A H, ELHAWARY S S, et al. Flavonoid constituents, cytotoxic and antioxidant activities of *Gleditsia triacanthos* L. leaves[J]. Saudi J Biol Sci, 2014, 21(6): 547 - 553.
[20] 李万华, 栗巧云, 王小刚, 等. 皂角刺中白桦脂酸型三萜化合物提取工艺研究[J]. 西北大学学报(自然科学版), 2011, 41(5): 827 - 829.
[21] 李万华, 傅建熙, 范代娣, 等. 皂角刺化学成分的研究[J]. 汉中师范学院学报(自然科学), 1999, 17(3): 41 - 42.
[22] 李万华, 傅建熙, 范代娣, 等. 皂角刺化学成分的研究——皂甙成分的研究[J]. 西北大学学报(自然科学版), 2000, 30(2): 137 - 138.
[23] LI W H, ZHANG X M, TIAN R R, et al. A new anti - HIV lupane acid from *Gleditsia sinensis* Lam[J]. J Asian Nat Prod Res, 2007, 9(6 - 8): 551 - 555.
[24] LIM J C, PARK J H, BUDESINSKY M, et al. Antimutagenic constituents from the thorns of *Gleditsia sinensis*[J]. Chem Pharm Bull (Tokyo), 2005, 53(5): 561 - 564.
[25] 何晨, 曹彦刚, 齐曼, 等. 皂角刺中的一个新木脂素[J]. 药学学报, 2020, 55(12): 2951 - 2954.
[26] 尹卫平, 刘华清, 高嘉屿, 等. 皂角刺中 3 个香豆素类化合物及其细胞毒活性研究[J]. 中草药, 2016, 47(14): 2424 - 2427.
[27] 黄小安, 蓝云英, 李莎莎, 等. 气相色谱质谱联用技术分析皂角刺挥发油成分[J]. 广州中医药大学学报, 2020, 37(6): 1147 - 1151.
[28] LEE J, YI J M, KIM H, et al. Cytochalasin H, an active anti - angiogenic constituent of the ethanol extract of *Gleditsia sinensis* thorns[J]. Biol Pharm Bull, 2014, 37(1): 6 - 12.
[29] 龙玲, 耿果霞, 李青旺. 皂角刺抑制小鼠宫颈癌 U14 的生长及对增殖细胞核抗原和 p53 表达的影响[J]. 中国中药杂志, 2006, 31(2): 150 - 153.
[30] YU J Q, LI G, MU Y, et al. Anti - breast cancer triterpenoid saponins from the thorns of *Gleditsia sinensis*[J]. Nat Prod Res, 2019, 33(16): 2308 - 2313.
[31] LEE S J, RYU D H, JANG L C, et al. Suppressive effects of an ethanol extract of *Gleditsia sinensis* thorns on human SNU - 5 gastric cancer cells[J]. Oncol Rep, 2013, 29(4): 1609 - 1616.
[32] 陈皆春, 高健生, 吴正正. 皂角刺抑制人脐静脉血管内皮细胞增殖的实验研究[J]. 世界中西医结合杂志, 2018, 13(6): 794 - 797.
[33] 徐哲. 皂角刺抗肿瘤活性成分与含量测定方法研究[D]. 沈阳: 沈阳药科大学, 2007.
[34] CAI Y, ZHANG C Z, ZHAN L, et al. Anticancer effects of *Gleditsia sinensis* extract in rats transplanted with hepatocellular carcinoma cells[J]. Oncol Res, 2019, 27(8): 889 - 899.
[35] RYU S, PARK K M, LEE S H. *Gleditsia sinensis* thorn attenuates the collagen - based migration of PC3 prostate cancer cells through the suppression of α2β1 integrin expression[J]. Int J Mol Sci, 2016, 17(3): 328.
[36] 王莹莹, 刘伟杰, 杜钢军. 皂角刺抗肿瘤的初步研究[J]. 河南大学学报(医学版), 2014, 33(2): 88 - 90, 103.
[37] DUAN H T, ZHANG R, YUAN L, et al. Exploring the therapeutic mechanisms of Gleditsiae Spina acting on pancreatic cancer *via* network pharmacology, molecular docking and molecular dynamics simulation[J]. RSC Adv, 2023, 13(20): 13971 - 13984.
[38] 钱湃梓, 彭桂原, 郭赛, 等. 皂角刺提取液对人鼻咽癌 CNE - 2 细胞增殖和凋亡的影响[J]. 蚌埠医学院学报, 2021, 46(12): 1664 - 1667.
[39] 袁丁, 熊正国, 张长城, 等. 皂角刺皂苷对前列腺癌 PC - 3 细胞增殖抑制作用的研究[J]. 天津医药, 2008, 36(4): 280 - 282.
[40] 刘伟杰, 杜钢军, 李佳桓, 等. 皂角刺总黄酮对肺癌的防治作用及其机制研究[J]. 中草药, 2013, 44(20): 2878 - 2883.
[41] 刘伟杰. 皂角刺对肺癌的防治作用及其机制初步探讨[D]. 开封: 河南大学, 2014.
[42] 李荣. 皂角刺总黄酮诱导结肠癌 HCT116 细胞凋亡的作用研究[D]. 泸州: 泸州医学院, 2010.
[43] 王海燕, 郭良淼, 何丽娅. 槲皮素诱导肿瘤细胞凋亡的相关基因调控[J]. 中药药理与临床, 2005, 21(6): 89 - 91.
[44] 杨橹, 谭文霞, 王婷婷, 等. 皂角刺黄酮和香豆素类活性成分的体外抗癌活性筛选[J]. 中国继续医学教育, 2017, 9(12): 215 - 217.
[45] 张驹. 皂角刺提取工艺研究及对糖尿病大鼠的肠道菌群的调节作用[D]. 成都: 西华大学, 2021.
[46] 李万华, 李琴, 栗巧云, 等. 皂角刺中 5 个白桦脂酸型三萜的分离及抗菌[J]. 西北大学学报(自然科学版), 2008, 38(6): 937 - 942.
[47] 孙建瑞,邱智军,王大红,等. 皂角刺提取物抑菌活性及稳定性研究[C]//河南省农产品加工与贮藏工程学会第四次学术年会论文集,2017:58 - 63.
[48] 任冬冬, 罗思婧, 杨红. 皂角刺气化爆鸣液体外抑菌作用及成分的初步研究[J]. 广东药学院学报, 2010, 26(6): 579 - 582.
[49] 牛江秀, 王静, 任倩倩, 等. 皂角刺抗菌牙膏的研究[J]. 洛阳师范学院学报, 2019, 38(8): 24 - 28.
[50] LI K K, ZHOU X L, WONG H L, et al. *In vivo* and *in vitro* anti - inflammatory effects of Zao - Jiao - Ci (the spine of *Gleditsia sinensis* Lam.) aqueous extract and its mechanisms of action[J]. J Ethnopharmacol, 2016, 192: 192 - 200.
[51] JUNG M A, SONG H K, JO K, et al. *Gleditsia sinensis* Lam. aqueous extract attenuates nasal inflammation in allergic rhinitis by inhibiting MUC5AC production through suppression of the STAT3/STAT6 pathway[J]. Biomed Pharmacother, 2023, 161: 114482.
[52] EOR J Y, PARK N, SON Y J, et al. Therapeutic effects of *Gleditsia sinensis* thorn extract fermented by *Lactobacillus casei* 3260 in a type II collagen - induced rheumatoid arthritis mouse model[J]. Food Sci Anim Resour, 2021, 41(3): 497 - 508.
[53] LEE S J, PARK S S, KIM W J, et al. *Gleditsia sinensis* thorn extract inhibits proliferation and TNF - α - induced MMP - 9 expression in vascular smooth muscle cells[J]. Am J Chin Med, 2012, 40(2): 373 - 386.
[54] 顾笑颜, 林昭伶, 钟悦, 等. 基于网络药理学探讨皂角刺治疗乳痈的作用机制[J]. 现代生物医学进展, 2021, 21(16): 3180 - 3186.
[55] 胡慧娟, 祁公任, 洪敏. 皂角刺水煎剂的抗凝血作用[J]. 中药

药理与临床,1995(1):30 - 32.
[56] 刘明华, 黄兴武, 肖顺汉, 等. 皂角刺提取物对荷瘤小鼠肿瘤生长及细胞因子的影响[J]. 肿瘤防治研究, 2009, 36(5): 365 - 367.
[57] 王占彬, 郭鲜敏, 杨兰香, 等. 皂角刺提取物对肉仔鸡免疫功能的影响[J]. 养禽与禽病防治, 2005(10): 16 - 19.
[58] 曹学锋, 郭澄, 张俊平. 皂角刺总黄酮对小鼠细胞因子的调节作用[J]. 时珍国医国药, 2002, 13(10): 588 - 589.
[59] 方伟, 廖诗平, 钟晖, 等. 皂角皂苷对大鼠血栓形成及微循环障碍的影响[J]. 中药药理与临床, 2009, 25(5): 76 - 79.
[60] 何光志, 邓树轩, 何前松, 等. 皂角刺总黄酮对肝癌 HepG2 细胞增殖、凋亡和侵袭能力影响的实验研究[J]. 湖南师范大学自然科学学报, 2012, 35(1): 77 - 81.
[61] 楚红英, 罗晓, 李瑜. 皂角刺多糖的提取及抗氧化活性的研究[J]. 理化检验 - 化学分册, 2015, 51(8): 1063 - 1066.
[62] 宋忠兴, 唐志书, 严邑萍, 等. 皂角刺中总黄酮含量测定及其抗氧化活性研究[J]. 中国药业, 2019, 28(6): 1 - 3.
[63] 张莉, 王慧慧, 徐瑞豪, 等. 皂角刺水提物对皮质酮诱导小鼠抑郁症模型的研究[J]. 中药药理与临床, 2020, 36(5): 100 - 104.
[64] 张莉, 王慧慧, 徐瑞豪, 等. 皂角刺提取物对皮质酮诱导 PC - 12 细胞损伤的保护作用研究[J]. 中药材, 2020, 43(6): 1473 - 1477.
[65] 宋歌. 丝瓜络、皂刺对动脉硬化模型大鼠血脂及大鼠 IL - 6、VEGF 的影响[D]. 郑州:河南中医药大学,2010.
[66] 熊正国, 张长城, 袁丁. 皂角刺药理作用的研究进展[J]. 山东医药, 2007, 47(20): 112 - 113.
[67] LEE M Y, SHIN I S, SEO C S, et al. Antiasthmatic effects of *Gleditsia sinensis* in an ovalbumin - induced murine model of asthma[J]. Int J Toxicol, 2011, 30(5): 528 - 537.
[68] PARK S S, KIM W J, MOON S K. *Gleditsia sinensis* thorn extract inhibits the proliferation and migration of PDGF - induced vascular smooth muscle cells[J]. Mol Med Rep, 2014, 10(4): 2031 - 2038.
[69] ZENG M N, QI M, KAN Y X, et al. A new flavonoid from the thorn of *Gleditsia sinensis* Lam[J]. Nat Prod Res, 2023, 37(2): 283 - 288.
[70] CAO Y G, HAO Z Y, ZHANG Y L, et al. Two new flavonoids from the thorns of *Gleditsia sinensis*[J]. Phytochem Lett, 2021, 45: 168 - 170.
[71] 刘勇, 张彩虹, 谢普军, 等. 响应面优化皂角刺皂苷超声波辅助提取工艺及其降血糖活性[J]. 林产化学与工业, 2023, 43(2): 12 - 18.
[72] 张珉, 张俊平, 王杰松, 等. 黄颜木素对 HSC - T6 细胞增殖和胶原合成的影响[J]. 第二军医大学学报, 1999, 20(5): 304 - 305.
[73] 罗立梅, 王继伟, 杨巡纭, 等. 皂角属植物化学成分及生物活性研究进展[J]. 吉林农业, 2014(12): 17, 16.
[74] 覃华亮, 韦怡. 皂角刺研究进展及临床应用[J]. 亚太传统医药, 2014, 10(17): 54 - 56.
[75] 王瑜婷, 黄贵发, 何荣荣, 等. 皂角刺不同部位高效液相色谱特征图谱及化学模式识别[J]. 化学分析计量, 2023, 32(1): 11 - 16.
[76] 尚星晨. 皂荚资源评价与良繁体系构建[D]. 新乡: 河南师范大学, 2018.
[77] 周爱芹. HPLC 法同时测定不同产地皂角刺中黄颜木素、花旗松素和槲皮素的含量[J]. 中国处方药, 2022, 20(10): 26 - 28.
[78] 李淑芳. HPLC 法测定皂角刺中槲皮素和刺囊酸的含量[J]. 中医药临床杂志, 2019, 31(2): 395 - 397.
[79] 李建军, 尚星晨, 马静潇, 等. 皂角刺发育过程形态特征变化规律与槲皮素、总多酚积累动态研究[J]. 中国中药杂志, 2018, 43(16): 3249 - 3254.
[80] 陈海霞, 肖顺汉. 皂角刺抗肿瘤作用有效成分研究进展[J]. 四川生理科学杂志, 2010, 32(1): 35 - 37.
[81] 权琦, 陈平, 黄圆圆, 等. 基于网络药理学研究皂角刺治疗乳腺癌的作用机制[J]. 中国当代医药, 2021, 28(9): 4 - 8, 13.
[82] YI J M, LEE J, KIM J, et al. Anti - tumor activity of *Gleditsia sinensis* thorns targeting angiogenesis[J]. Integr Med Res, 2015, 4(1): 46 - 47.
[83] 张铁军, 许浚, 申秀萍, 等. 基于中药质量标志物(Q - Marker)的元胡止痛滴丸的“性 - 效 - 物”三元关系和作用机制研究[J]. 中草药, 2016, 47(13): 2199 - 2211.
[84] 李瑞奇, 苗明三. 药性温的现代研究及相互关系[J]. 中医学报, 2012, 27(11): 1456 - 1459.
[85] 郭建生, 辛味药"辛能行气"物质基础与功效的相关性研究[D]. 长沙:湖南中医药大学,2012.
[86] 潘谊, 吴辉坤. 中药复方对 HepG2 肝癌小鼠肿瘤组织病理及微血管密度的影响[J]. 四川中医, 2021, 39(2): 52 - 55.
[87] 李昊晨. 基于网络药理学的毒痰瘀脾肾虚方有效成分对肝癌的作用机制研究[D]. 承德:承德医学院,2022.
[88] 王靓怡. 痤疮方治疗寻常型痤疮肺经风热证临床疗效及作用机制探索研究[D]. 沈阳: 辽宁中医药大学, 2022.
[89] 房良华. 透脓散抗肿瘤作用及其机制的研究[D]. 南京: 南京中医药大学, 2013.
[90] 顾红, 陈红锦. 透脓散作用机制与药理研究[J]. 吉林中医药, 2013, 33(3): 283 - 285.
[91] 李子午, 王德慧. 立效散加味治疗乳腺囊性增生病 42 例[J]. 中医杂志, 2010, 51(S1): 187.
[92] 李辉, 龚雯婧, 郑轶芬. 复方皂角刺膏治疗癌性疼痛的临床研究[J]. 中国现代医生, 2021, 59(34): 97 - 100.
[93] 郑轶芬, 李辉. 复方皂角刺膏辅治中晚期卵巢癌的临床效果[J]. 临床合理用药杂志, 2022, 15(8): 136 - 138.
[94] 郑蔚婵, 李辉, 龚雯婧. 复方皂角刺膏外敷治疗原发性肝癌重度癌性疼痛 28 例临床观察[J]. 湖南中医杂志, 2022, 38(10): 8 - 11.
[95] 鲍婷婷, 王涵, 顾成娟, 等. 仝小林运用威灵仙、皂角刺、生薏苡仁治疗息肉经验[J]. 吉林中医药, 2021, 41(12): 1568 - 1570.
[96] 李鸿儒, 赵贝, 杜钢军. 升麻联合皂角刺抗肿瘤处方筛选及疗效评价的实验研究[J]. 中国中医药信息杂志, 2013, 20(8): 32 - 35.
[97] YU J, ZHAO L, SUN X, et al. Application of choline chloride deep eutectic solvents and high - speed counter - current chromatography to the extraction and purification of flavonoids from the thorns of *Gleditsia sinensis* Lam[J]. Phytochem Anal, 2021, 32(4): 457 - 465.
[98] 吴思佳, 王可可, 徐双双, 等. 基于 HPLC 指纹图谱和含量测定的皂角刺配方颗粒质量控制研究[J]. 上海中医药大学学报, 2023, 37(2): 54 - 60, 95.
[99] 王金淼, 池军, 江雪, 等. 皂角刺药材和饮片质量标准研究[J]. 中国中药杂志, 2021, 46(17): 4417 - 4423.
[100] 于金倩, 李岗, 仙云霞, 等. 皂角刺的高效液相指纹图谱分析及多组分测定[J]. 中草药, 2017, 48(7): 1416 - 1419.