

迷迭香酸的临床应用研究现状

姜荣善, 李伟东*

佳木斯大学附属第一医院 黑龙江佳木斯

【摘要】迷迭香酸 (rosmarinic acid, ROA) 是一种天然水溶性多酚类化合物, 其化学结构为(2R)-3-(3,4-二羟基苯基)-2-[(E)-3-(3,4-二羟基苯基)丙烯酰氧基]丙酸, 其广泛存在于迷迭香、丹参、夏枯草、薄荷等多种植物中, 其具酚酸的抗氧化性和酯类的化学稳定性。经查阅近年来相关研究, 迷迭香酸可被证实具有抗氧化、抗炎、抗菌、抗病毒、抗肿瘤以及神经保护等多种药理活性作用。近年来, 随着对天然药物研究的深入, 迷迭香酸在多种疾病临床治疗及辅助治疗中的应用潜力日益受到关注。本文旨在系统梳理迷迭香酸的药代动力学特征、作用机制及其在各类疾病临床前与临床研究中的应用进展, 整理出部分对于该物质的相关临床研究进展, 便于参考。

【关键词】迷迭香酸; 药代动力学; 药理作用; 临床应用

【收稿日期】2026 年 5 月 8 日

【出刊日期】2026 年 6 月 5 日

【DOI】10.12208/j.ijcr.20260283

Research status of clinical application of rosmarinic acid

Rongshan Jiang, Weidong Li*

The First Affiliated Hospital of Jiamusi University, Jiamusi, Heilongjiang

【Abstract】Rosmarinic acid (ROA) is a naturally occurring water-soluble polyphenolic compound with the chemical structure (2R)-3-(3,4-dihydroxyphenyl)-2-[(E)-3-(3,4-dihydroxyphenyl) acryloyloxy]propionic acid, widely distributed in various plants (such as rosemary, salvia miltiorrhiza, Prunella vulgaris, and mint). It possesses the antioxidant properties of phenolic acids and the chemical stability of esters. Recent studies have confirmed its pharmacological activities, including antioxidant, anti-inflammatory, antibacterial, antiviral, antitumor, and neuroprotective effects. With the deepening research on natural medicines, the therapeutic potential of rosmarinic acid in clinical and adjunctive treatments for multiple diseases has garnered increasing attention. This article aims to systematically review the pharmacokinetic characteristics, mechanisms of action, and advances in preclinical and clinical research involving rosmarinic acid across various diseases, summarizing relevant clinical studies for reference.

【Keywords】Rosmarinic acid; Pharmacokinetics; Pharmacological effects; Clinical applications

迷迭香酸广泛存在于多种常见植物(如迷迭香、丹参、夏枯草、薄荷等)及多种中成药(清热消炎宁、养血清脑颗粒)的核心生物活性成分, 自被分离鉴定以来, 其药理作用与应用价值受到广泛关注。与传统化学药物相比, 迷迭香酸多靶点、多途径的作用特征使其在复杂病理过程的干预中具有独特优势, 特别是应用在相关氧化应激及炎症反应介导的疾病中具有显著的积极作用。近年来, 随着分子生物学技术的发展, 迷迭香酸的作用机制不断被阐明, 相关研究表明该药物在器官缺血再灌注损伤、急性肾损伤、心血管疾病、神经退行性疾病等领域都具备充分的应用价值。

1 迷迭香酸的药代动力学与作用机制

相关研究表明^[1], 迷迭香酸口服后主要在小肠上段通过被动扩散吸收, 其血药浓度达峰约在 1-2 小时左右达到, 但其经口服用的生物利用度极低(大鼠约 3.8%, 人体≤5%), 主要受肠渗透性差和肝脏首关效应影响。吸收入血后, 药物能广泛分布, 并可透过血脑屏障, 在脑、心、肾等器官中检测到有效浓度, 为其器官保护作用提供依据。其在体内核心途径主要经肝脏代谢, 由葡萄糖醛酸化和硫酸化后, 生成无活性的代谢物。药物及其代谢物主要经肾脏排泄, 24 小时内约 60-70%通过尿液排出, 48 小时内基本排尽, 无明显蓄积, 安全性较好。此外, 磷脂复合物及纳米粒等新型递送系统, 可提高其血药浓度、半衰期和生物利用度, 显著增加其作用效果。

*通讯作者: 李伟东

迷迭香酸的核心药理作用^[2]基础源于其分子中的邻二酚羟基等结构, 发挥协同调控多条信号通路的药理作用。其既可以直接清除活性氧自由基, 又能激活 Nrf2/ARE 信号通路, 上调多种内源性抗氧化酶 (如 GSH-Px、HO-1、SOD) 的表达, 从而减轻氧化应激损伤。同时, 它能通过抑制 NF- κ B 和 MAPK 通路, 减少促炎因子 (如 TNF- α 、IL-6) 的产生, 减轻炎症反应。此外激活 PI3K/Akt 通路, 促进 Akt 磷酸化, 进而通过上调 Bcl-2、下调 Bax 等方式调控凋亡相关蛋白, 抑制线粒体凋亡途径, 保护细胞免受死亡。这些机制的共同作用, 使其最终达到出色的抗氧化、抗炎及抗凋亡作用。

2 迷迭香酸的临床应用研究进展

2.1 器官缺血再灌注损伤领域

缺血再灌注损伤是临床休克、器官移植、心脏大手术等场景的常见并发症, 肾脏、心脏、肺、脑为最易受累器官。迷迭香酸的多靶点作用使其成为该损伤防治的潜在药物, 在肾脏缺血再灌注损伤模型中^[3], 腹腔注射 200 mg/kg 迷迭香酸可显著改善肾功能, 降低血清肌酐、尿素氮及肾损伤早期标志物 NGAL 水平, 可缓解肾小管上皮细胞变性坏死的程度并减轻间质炎症浸润效应, 表明肾脏相关损伤机制与 PI3K/Akt 信号通路的激活、抑制氧化应激与炎症反应密切相关。此外, 相关研究表明^[4], 迷迭香酸在缺血再灌注的动物实验模型中 (如心肌细胞), 可以达到减轻组织水肿, 控制炎症浸润, 起到了一定的保护作用。这些研究为临床器官移植围手术期的器官保护提供了重要实验依据, 有望开发为缺血再灌注损伤的辅助治疗药物。

2.2 炎症性疾病领域

迷迭香酸的强效抗炎作用在类风湿性关节炎及骨关节炎等临床前实验得到证实^[5]。迷迭香酸作用于相关炎症性疾病大鼠模型后, 它能显著降低血清中 TNF- α 、IL-6 等促炎因子水平, 减轻组织肿胀及炎症浸润情况, 且发现其抗炎机制与阻断 NF- κ B 信号通路活化密切相关, 仅 10 mg/kg 剂量即可使相关炎症标志物下降 60% 以上。并且, 在炎症性肠病中^[10], 迷迭香酸表现出调节肠道菌群平衡与抑制肠道黏膜炎症反应的双重作用, 可明显改善了结肠组织病理损伤, 促进肠黏膜的修复, 从而缓解溃疡性结肠炎模型大鼠的腹泻、便血等症状。此外, 迷迭香酸对慢性肾炎也具有潜在治疗价值, 其机制可能通过抑制炎症通路活化、减轻肾组织炎症浸润与纤维化损伤发挥保护作用。

2.3 心血管疾病领域

相关在高血压模型研究中^[6], 发现其降压效果与常

用药物替米沙坦相当, 且在相关临床初步研究中, 高血脂患者口服迷迭香酸补充剂可使体内的总胆固醇、甘油三酯与“坏胆固醇” (低密度脂蛋白) 水平明显下降, 并提升“好胆固醇” (高密度脂蛋白) 水平。而在动脉粥样硬化防治研究里, 迷迭香酸能够抑制“坏胆固醇”的氧化修饰, 阻碍由此形成的泡沫细胞, 并抑制了血管平滑肌细胞的异常增殖与迁移, 从而减缓了动脉粥样硬化斑块形成与发展。此外, 迷迭香酸的深层机制还包括通过 miR-25-3p/SIRT6 轴激活 Nrf2/ARE 信号通路来抑制有害的血管重塑, 这些均表明其在心血管疾病中仍有莫大的研究价值。

2.4 神经退行性疾病领域

现有对阿尔茨海默病研究中, 迷迭香酸具有通过血脑屏障的优点且有着明确的中枢神经保护作用, 针对 β 淀粉样蛋白 A β 1-42 诱导的星形胶质细胞损伤, 迷迭香酸可通过激活 Nrf2/HO-1 信号通路, 有效抑制细胞氧化应激反应、减轻炎症因子释放、减少星形胶质细胞凋亡, 进而改善细胞活力, 逆转 A β 1-42 介导的胶质细胞损伤效应。2025 年, 斯克里普斯研究所^[7]开发的迷迭香酸稳定衍生物 diAcCA (二酰基迷迭香酸) 被应用在小鼠阿尔茨海默病模型中, 发现该衍生物可使认知功能提升 40%, 增加脑细胞连接强度, 显著降低 β -淀粉样蛋白和 tau 蛋白水平, 且在肠道中可完全转化为迷迭香酸被吸收, 解决了纯迷迭香酸不稳定的问题, 为临床转化奠定了基础。

2.5 代谢性疾病领域

迷迭香酸在 2 型糖尿病及代谢综合征的干预中展现出显著潜力, 临床前实验证实^[8]其能有效改善模型动物的胰岛素抵抗状态, 显著降低血糖与血脂水平。其改善糖脂代谢的核心作用机制涉及对 PI3K/Akt 胰岛素信号通路的正向调控及对肝脏糖异生过程的抑制, 同时激活 PPAR- γ 受体发挥降糖调脂效应; 此外, 迷迭香酸还能通过抑制氧化应激与炎症反应, 减轻肾脏、视网膜组织的病理损伤, 对糖尿病肾病、视网膜病变等糖尿病并发症具有一定改善作用。

2.6 肿瘤领域

在肿瘤领域, 尽管迷迭香酸直接抗肿瘤的临床证据有待充实, 但相关研究表明^[9], 迷迭香酸具备广谱抗肿瘤活性, 该成分可有效抑制肝癌、乳腺癌、宫颈癌、卵巢癌、前列腺癌等多种肿瘤细胞的生长和发展。其共性核心作用与机制主要包括: 有效抑制肿瘤细胞增殖、阻滞细胞周期进程, 并诱导肿瘤细胞凋亡; 通过下调基质金属蛋白酶 (MMP-2/9) 表达, 抑制肿瘤细胞的迁移、

侵袭与转移过程;此外迷迭香酸还可以改善肿瘤微环境,增强肿瘤细胞对化疗药物的敏感性,逆转部分耐药效应,整体通过调控多条致癌信号通路阻断肿瘤发生发展。

2.7 皮肤疾病领域

在皮肤疾病治疗中,基于抗炎、抗氧化和抗菌特性,迷迭香酸其护肤价值与应用形式正通过多维度进行扩展。有研究发现^[10]迷迭香活性成分异迷迭香酚兼具良好的美白作用与抗氧化活性,使迷迭香酸类成分在美白抗氧化护肤品中得到了开发;且通过可溶性透明质酸微针经皮递送系统,实现了高效经皮递送,可协同光热发挥抗菌效果,创新了迷迭香酸在皮肤局部给药中的应用形式;此外,迷迭香酸能与多种天然提取物复配达到协同作用,可复合应用在开发皮肤保护类制剂。

3 迷迭香酸的不良反应的研究

迷迭香酸作为天然来源的活性成分,整体安全性较高,不良反应轻微且具有自限性。动物急性毒性试验显示其半数致死量(LD_{50}) >2000 mg/kg(大鼠),未变现出致突变性,长期给药也未发现明显器官损伤与蓄积毒性。临床应用层面,常见不良反应集中在胃肠道系统,如恶心、腹胀、便秘、腹泻等轻微症状,多在大剂量口服时出现,减量或停药后可自行缓解。少数受试者可能出现头痛、囊性痤疮恶化、油性头皮等情况,停药后亦可自行恢复。值得注意的是,迷迭香酸可能轻微抑制血小板聚集^[4],出血倾向患者、手术患者需慎用,避免与抗凝血或抗血小板药物联用。外用相关制剂可能出现局部皮肤红斑、瘙痒等刺激反应,建议稀释后使用并避免接触黏膜。孕妇及哺乳期妇女因相关研究数据不足,应避免使用。

4 结束语

综上所述,迷迭香酸作为一种具有抗炎、抗氧化及组织保护等多功能的天然活性化合物,有望在多种疾病的预防和治疗中得到实际的临床应用。且其安全性可控,长期应用未发现明显毒物蓄积性的器官损害,常见不良反应多为轻微、可逆的生理反应。未来的临床研究应更侧重于高质量的人体临床试验,以确证其有效性和最佳用药方案,并深入探索其与其他药物联合应用的综合治疗潜力。同时,应针对迷迭香酸生物利用度低的瓶颈进一步研究,以提高其临床应用的可行性。

参考文献

- [1] Tavafi M,Ahmadvand H,Tamjidipour A,et al. Rosmarinic acid ameliorates renal ischemia reperfusion damage in rats [J]. Journal of Nephro pharmacology,2020,9 (2):e15.
- [2] 张练,王茂娟,谢红,等.迷迭香酸对脓毒症急性肾损伤大鼠 NF- κ B 和 p38 MAPK 信号通路的影响[J].现代免疫学,2024,44(03):221-226+233.
- [3] Firouzeh G ,Samira H M ,Zeinab K .Rosmarinic acid: a promising agent for male rats' renal protection against ischemia/reperfusion injury[J].Molecular Biology Reports,2025,52(1):325-325.
- [4] 魏文,王勇.迷迭香酸对急性心肌梗死大鼠 Treg/Th17 平衡及 NLRP3、IL-1 β 和 IL-10 水平的影响[J].中西医结合心脑血管病杂志,2023,21(11):1984-1988.
- [5] 王建华,孙伟,李红.迷迭香酸对胶原诱导性关节炎大鼠的抗炎作用及机制探讨 [J]. 中国药理学通报, 2022,38 (5):723-728.
- [6] 陈瑞丹,张彦,杨培丽,等. 迷迭香酸通过抑制 NADPH 氧化酶/ROS/NLRP3 炎症小体通路改善高血压肾病[J]. 第三军医大学学报,2021,43(12):1153-1161.
- [7] Banerjee P ,Wang Y ,Carnevale N L , et al.diAcCA, a Pro-Drug for Carnosic Acid That Activates the Nrf2 Transcriptional Pathway, Shows Efficacy in the 5xFAD Transgenic Mouse Model of Alzheimer's Disease[J]. Antioxidants, 2025,14(3):293-293.
- [8] 鹿爱娟,向晓琴,曹静,等. 迷迭香叶酚类成分分析及抗糖尿病活性研究[J]. 中国食品添加剂,2026,37(1):33-39.
- [9] 刘航,杨删,陈龙. 迷迭香酸抗肿瘤作用及其机制研究进展[J]. 中成药,2025,47(1):155-162.
- [10] 郭庆宇,曹丹,陈冬.迷迭香活性成分异迷迭香酚的美白作用及抗氧化活性评价[J].日用化学工业(中英文),2025, 55(10):1306-1312.

版权声明: ©2026 作者与开放获取期刊研究中心(OAJRC)所有。本文章按照知识共享署名许可条款发表。

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



OPEN ACCESS