盐酸小檗碱

溶解性数据：

体外实验：

DMSO：8.33 mg/mL (22.40 mM; Need ultrasonic)

H2O： < 0.1 mg/mL (ultrasonic) (insoluble)

制备储备液	Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.6895 mL	13.4477 mL	26.8955 mL
	5 mM	0.5379 mL	2.6895 mL	5.3791 mL
	10 mM	0.2690 mL	1.3448 mL	2.6895 mL

体内实验：

请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

1. 请依序添加每种溶剂： 0.5% CMC-Na/saline water

Solubility: 11 mg/mL (29.59 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

2. 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% saline

Solubility：≥ 1.25 mg/mL (3.36 mM)；Clear solution

3. 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in saline)

Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (3.36 mM)；Clear solution

BIOLOGICAL ACTIVITY：

生物活性：

Berberine chloride 是一种生物碱，常用作抗生素。Berberine chloride 诱导活性氧 (ROS)生成并抑制 DNA 拓扑异构酶 (topoisomerase)。抗肿瘤特性。

IC_{50} & Target：

ROS

DNA topoisomerase

体外研究：

Berberine (1.25-160 μM；72 hours) 对四种结直肠癌细胞系 LoVo、HCT116、SW480 和 HT-29 的增殖具有潜在的抑制作用。

Berberine (1.25-160 μM；24-72 小时) 诱导 LoVo 细胞生长的时间和剂量依赖性抑制。

LoVo 细胞暴露于小檗碱 (10 -80 μM) 24 小时。通过流式细胞术对 40 μM 小檗碱处理的 LoVo 细胞进行细胞周期分析显示细胞在 G2/M 期积累。

Berberine (10 -80 μM) 抑制细胞周期蛋白 B1，24 h 后 cdc2 和 cdc25c 蛋白表达，尤其是在80.0 μM 剂量下。

Cell Proliferation Assay：

Cell Line:	Four colorectal carcinoma cell lines LoVo, HCT116, SW480, and HT-29
Concentration:	1.25, 2.5, 5, 10, 20, 40, 80, and 160 μM
Incubation Time:	72 hours
Result:	Inhibited the proliferation of four cell lines. The IC50 ranged from 40.8±4.1 μM (LoVo) to 98.6±2.9 μM (HCT116).

Cell Proliferation Assay：

Cell Line:	Colorectal carcinoma cell lines LoVo
Concentration:	1.25, 2.5, 5, 10, 20, 40, 80, and 160 μM
Incubation Time:	24, 48, 72 hours

Result:	Induced a time- and dose-dependent inhibition of cell growth. By 72 h, 160.0 μM induced 71.1±1.9 % growth inhibitions in LoVo cells.

Cell Cycle Analysis：

Cell Line:	LoVo cells
Concentration:	0, 10, 20, 40, or 80 μM
Incubation Time:	24 hours
Result:	Exposure to 40.0 μM induced G2/M-phase cell cycle arrest, an increase in the G2/M-phase population and a progressive decline in the G1 population.

Western Blot Analysi：

Cell Line:	LoVo cells
Concentration:	10, 20, 40, or 80 μM
Incubation Time:	24 hours
Result:	Suppressed cyclin B1, cdc2 and cdc25c protein expression.

体内研究：

Berberine (10、30 或 50 mg/kg/天；胃肠道强饲法；连续 10 天)在体内抑制人结直肠腺癌的生长。胃肠道灌胃剂量为 30和 50 mg/kg/day 的小檗碱对人结直肠腺癌裸鼠异种移植物生长的抑制率分别为 33.1% 和 45.3。

Animal Model:	5-week-old BALB/c nu/nu mice with human colorectal adenocarcinoma LoVo xenografts
Dosage:	10, 30, or 50 mg/kg/day
Administration:	Gastrointestinal gavage; for 10 consecutive days
Result:	Showed inhibitory rates of 33.1 % and 45.3 % at doses of 30 and 50 mg/kg/day.