

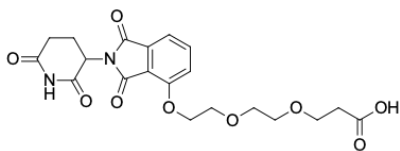
Талидомид-О-ПЭГ2-карбоновая кислота

<http://ru.lumiprobe.com/p/thalidomide-o-peg2-acid>

Строительный блок, содержащий талидомид, с линкером ПЭГ2 и карбоксильной группой для удобной сборки молекулы PROTAC посредством конъюгации с амин-содержащими линкерами и лигандами целевого белка. Карбоксильную группу предварительно необходимо активировать с помощью реагентов для пептидного синтеза, таких как PyBOP, или карбодиимидов (EDC, DCC). ПЭГ2 — гидрофильный линкер, обеспечивающий пространственное разделение компонентов молекулы PROTAC.

Комбинированные молекулы выборочного протеолиза белка (PROteolysis TArgeting Chimeras, PROTACs) — это гетеробифункциональные молекулы, способные проникать через клеточную мембрану, и позволяющие удалять выбранный целевой белок из клетки. Один конец молекулы PROTAC содержит лиганд, способный связываться с белком интереса, а второй — с субстрат-распознающим белком белкового комплекса E3-лигазы. Сближение белка и E3-лигазы вызывает полиубиквитинирование субстрата с последующей его деградацией клеточной протеасомой, которая распознает убиквитиновую метку.

Существует несколько E3-лигазных комплексов, которые на практике подходят для PROTAC. Талидомид — лиганд, который позволяет мобилизовать цереблон E3-лигазу (CRBN). Его используют многие новые исследовательские препараты работающие по механизму PROTAC, находящиеся на последних стадиях клинических испытаний.



Структура Талидомид-О-ПЭГ2-кислоты

Общие свойства

Вид продукта:	бежевое твердое вещество
Молекулярная масса:	434.40
Брутто-формула:	$C_{20}H_{22}N_2O_9$
Растворимость:	в ДМСО, ДМФА
Контроль качества:	ЯМР 1H и ВЭЖХ-МС (95+%)
Условия хранения:	24 месяца (с момента доставки) при $-20^{\circ}C$ в темноте. Транспортировка: до трех недель при комнатной температуре. Берегите от влаги.
Юридическое заявление:	Продукт предлагается и продаётся только в исследовательских целях. Продукт не проверяется на безопасность и эффективность в пищевых продуктах, лекарствах, медицинских приборах, косметических средствах, нет явного или подразумеваемого разрешения на использование для любых других целей, включая, помимо прочего, диагностические цели <i>in vitro</i> , для людей или животных или в коммерческих целях.