

PROTAC リンカー

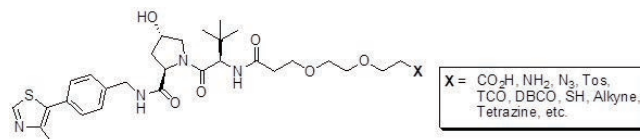
BroadPharm 社では、PEG、アルキル鎖およびグリコール鎖などの PROTAC の研究・開発において最も一般的に使用される PROTAC リンカーを取りそろえています。

MEMO

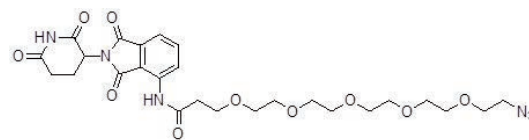
PROTAC リンカーについて

PROTAC 分子の物理化学的特性と生物活性において、リンカーが重要な役割を担うことが明らかにされています。すなわち、リンカーの長さにより、2つのリガンドの相互作用の強さが決まり、それに応じて PROTAC 分子の最大活性が決定されます。

(S, R, S)-AHPC-PEG は、von Hippel-Lindau (VHL) E3 リガーゼリガンドと PEG リンカーを組み込んだ PROTAC リンカー分子です。(S, R, S)-AHPC-PEG リンカーは標的タンパク質リガンドと結合させるために、カルボキシル、アミン、アジド、アルキン、Tos、TCO、DBCO などのさまざまな官能基の製品があります。PEG スペーサーは、水溶液での試薬の溶解度を高めます。BroadPharm 社では、PEG スペーサーの長さおよび官能基が異なる製品を幅広く取りそろえています。



(S, R, S)-AHPC-PEG



Pomalidomide-PEG5-azide

Pomalidomide ベースのセレブロン (CRBN、Cereblon) リガンドは、E3 リガンドとして広く使用されています。Pomalidomide-PEG5-azide は、5 ユニットの PEG リンカーと末端アジド基を有する CRBN リガンドです。このアジド基を有する PROTAC リンカーを用いることで、アルキン、DBCO、BCN 分子とのクリックケミストリーが可能になります。

製品の一例

■VHL リガンド関連

[メーカー：BRP]

品名	商品コード	包装	価格 (¥)
VHL Ligand1 HCl salt	BP-24441	250 mg	45,000
(S, R, S)-AHPC-PEG4-amine hydrochloride salt	BP-24446	100 mg	134,000
(S, R, S)-AHPC-PEG4-azide	BP-24458	100 mg	134,000
(S, R, S)-AHPC-PEG4-acid	BP-24468	100 mg	134,000
(S, R, S)-AHPC-PEG4-tosyl	BP-24474	100 mg	119,000
(S, R, S)-AHPC-PEG4-NHS ester	BP-25120	100 mg	139,000

■セレブロンリガンド関連

[メーカー：BRP]

品名	商品コード	包装	価格 (¥)
Thalidomide-O-PEG4-amine	BP-24435	100 mg	134,000
Thalidomide-O-PEG4-t-butyl ester	BP-24443	100 mg	107,000
Thalidomide-O-PEG4-NHS ester	BP-24453	100 mg	139,000
Thalidomide-O-amido-PEG4-azide	BP-24454	100 mg	134,000
Thalidomide-O-PEG4-acid	BP-24509	100 mg	134,000
Pomalidomide-PEG5-azide	BP-24497	100 mg	134,000