



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Thalidomide-O-COOH**
CAS 号: **1061605-21-7**
产品货号: **S87630**

生物活性:						
Description	Thalidomide-O-COOH (Cereblon ligand 3) 是一种基于 Thalidomide 的, 可募集 CRBN 蛋白的 Cereblon 配体。Thalidomide-O-COOH (Cereblon ligand 3) 可通过 linker 与靶蛋白配体连接, 形成 PROTAC 分子。					
IC50 & Target	Cereblon					
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description		
	HEK293	EC ₅₀	> 50 μM	Cytotoxicity against human HEK293 cells assessed as inhibition of cell viability incubated for 30 mins by cell titer-glo assay		
	HEK293	IC ₅₀	> 50 μM	Cytotoxicity against human HEK293 cells assessed as inhibition of cell viability incubated for 30 mins in presence of CRBN-tracer by nanoBRET assay		
	HEK293	IC ₅₀	0.83 μM	Cytotoxicity against permeabilized HEK293 cells assessed as inhibition of cell viability incubated for 30 mins in presence of CRBN-tracer by nanoBRET assay		
In Vitro	PROTAC 包含两个不同的配体, 通过一个接头连接; 一个是 E3 泛素连接酶的配体, 另一个是靶蛋白的配体。PROTAC 利用细胞内泛素-蛋白酶体系统选择性降解靶蛋白。					
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 42 mg/mL (126.40 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)					
	* "≥" means soluble, but saturation unknown					
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
		Concentration				
		1 mM		3.0096 mL	15.0480 mL	30.0960 mL
		5 mM		0.6019 mL	3.0096 mL	6.0192 mL
		10 mM		0.3010 mL	1.5048 mL	3.0096 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。					
	储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (stored under nitrogen)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。					
动物实验:						
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						
方案 一						
请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline						



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.26 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.26 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.26 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Bozilovic J, et al. Novel, highly potent PROTACs targeting AURORA-A kinase. Current Research in Chemical Biology. 2022, 2: 100032. [2]. Yamanaka S, et al. Lenalidomide derivatives and proteolysis-targeting chimeras for controlling neosubstrate degradation. Nat Commun. 2023 Aug 18;14(1):4683.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month (stored under nitrogen)。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.0096 mL	15.0480 mL	30.0960 mL	75.2400 mL
	5 mM	0.6019 mL	3.0096 mL	6.0192 mL	15.0480 mL
	10 mM	0.3010 mL	1.5048 mL	3.0096 mL	7.5240 mL
	15 mM	0.2006 mL	1.0032 mL	2.0064 mL	5.0160 mL
	20 mM	0.1505 mL	0.7524 mL	1.5048 mL	3.7620 mL
	25 mM	0.1204 mL	0.6019 mL	1.2038 mL	3.0096 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	30 mM	0.1003 mL	0.5016 mL	1.0032 mL	2.5080 mL
	40 mM	0.0752 mL	0.3762 mL	0.7524 mL	1.8810 mL
	50 mM	0.0602 mL	0.3010 mL	0.6019 mL	1.5048 mL
	60 mM	0.0502 mL	0.2508 mL	0.5016 mL	1.2540 mL
	80 mM	0.0376 mL	0.1881 mL	0.3762 mL	0.9405 mL
	100 mM	0.0301 mL	0.1505 mL	0.3010 mL	0.7524 mL



源叶