チロシンホスファターゼ及びチロシンキナーゼ活性の測定方法

Tokyo Tech

新技術の目的

蛋白質、ペプチドの「リン酸化チロシン残基」を選択的にラベル化する手法

チロシンキナーゼ等（分子標的薬に利用）の選択的蛋白質ケミカルラベリング法であり、リン酸化チロシンの測定や分子標的薬等の創薬ツール開発等、幅広い用途が期待できる。

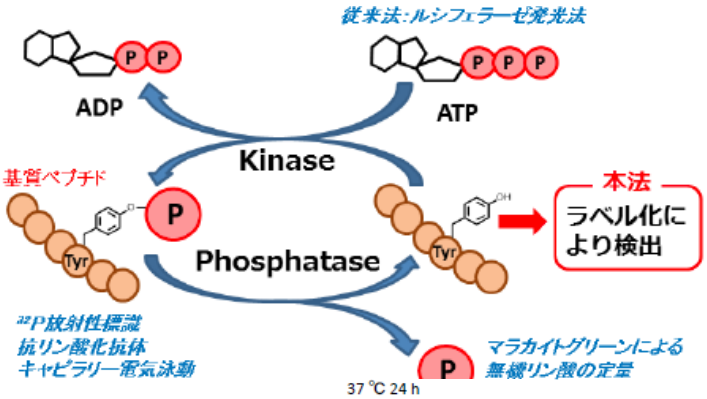
チロシンキナーゼはタンパク質のチロシン残基をリン酸化する酵素であり、それに対してチロシンホスファターゼはリン酸化されたチロシン残基を基質とし、脱リン酸化を触媒する酵素である。実際に、多くのチロシンキナーゼ阻害剤が癌の分子標的治療薬として用いられており、さらに糖尿病、アルツハイマー等の病態との関連も深いとされている。リン酸化シグナルの調節剤開発は学術的にも、医薬品開発の上でも最重要な研究課題といえる。

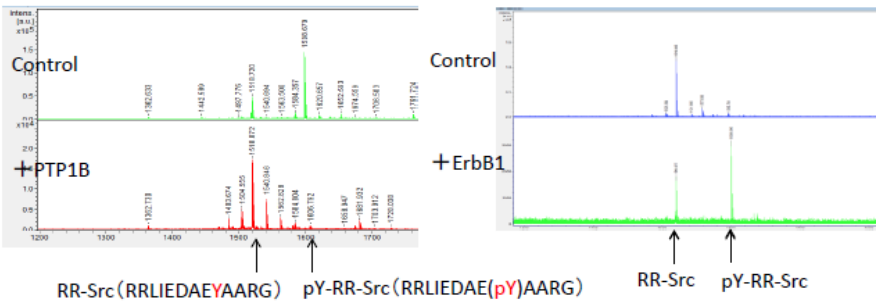
リン酸化されたモデルペプチドをPT1B酵素にて酵素反応させて、脱リン酸化することができるか確認した。また、モデルペプチドがErB1酵素によって、リン酸化されることも確認している。（下図参照）

生体内のリン酸化シグナル伝達を担う重要な酵素
チロシンキナーゼ
チロシンホスファターゼ

⇒がんをはじめとする多くの**疾患の治療薬の標的分子**

⇒**安価・簡便・高感度な活性測定法の開発**が望まれる。





本技術の特徴

☆各種診断薬･分析試薬及び、バイオ医薬品開発ツール
☆選択的蛋白質ケミカルラベリング法であり、リン酸化チロシンの選択性が非常に高く、また既存法＊の5倍以上の感度を有する。（＊マラカイトグリーン法）
☆ビオチン化ビーズ捕捉法とも組合わせることができ、ビオチン化で5倍の感度向上をもたらすことを確認済み（既存法と比較すると5×5＝約25倍の感度向上）

用途分野

各種診断薬等開発ツール

特許情報

発明の名称　チロシンフォスファターゼ及びチロシンキナーゼ活性の測定方法
発明者　中村浩之、佐藤伸一　ほか
出願番号　2017-544450。優先権主張番号 2015-198320（優先日:2015/10/6）
公開番号　WO2017/061288（国際公開日:2017/4/13）
本学整理番号　15T078P/JP

Tokyo Tech
お問い合わせ先：
東京工業大学　研究・産学連携本部
E-mail: : yasumatsu@sangaku.titech.ac.jp
TEL： 03-5734-7634　URA 安松　浩