

# 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

## 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などの幅広い用途が期待できる。

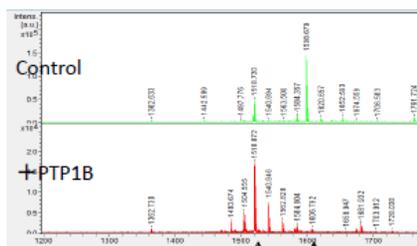
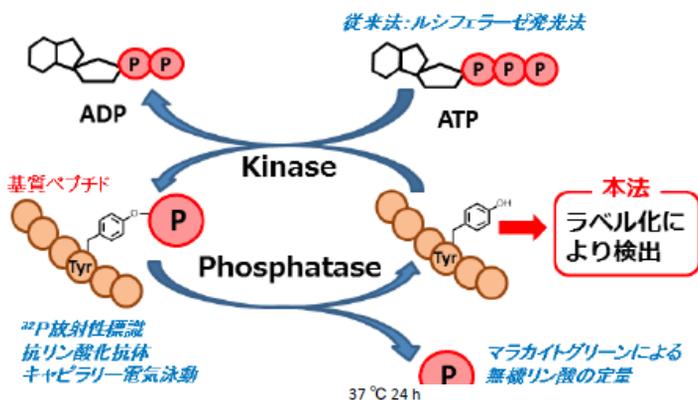
チロシンキナーゼはタンパク質のチロシン残基をリン酸化する酵素であり、それに対してチロシンホスファターゼはリン酸化されたチロシン残基を基質とし、脱リン酸化を触媒する酵素である。実際に、多くのチロシンキナーゼ阻害剤が癌の分子標的治療薬として用いられており、さらに糖尿病、アルツハイマー等の病態との関連も深いとされている。リン酸化シグナルの調節剤開発は学術的にも、医薬品開発の上でも最重要な研究課題といえる。

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)

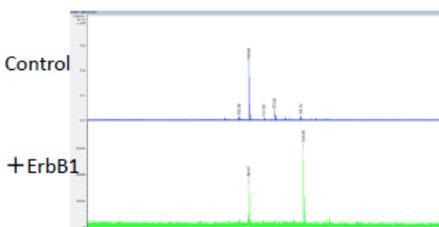
生体内のリン酸化シグナル伝達を担う重要な酵素  
**チロシンキナーゼ**  
**チロシンホスファターゼ**

⇒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。



RR-Src(RRLIEDAEY)AARG pY-RR-Src(RRLIEDAE(pY)AARG)



RR-Src pY-RR-Src

## 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み合わせることができ、ビオチン化でさらに5倍の感度向上効果あり(5×5=25倍感度向上)
- ☆JST支援を受けて、既に国際出願(PCT)も決定している

## 用途分野

各種診断薬等開発ツール

## 特許情報

発明の名称 チロシンホ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 佐藤 伸一 (ほか)

出願番号 2015-198320

本学整理番号 15T078

お問い合わせ先:

東京工業大学 産学連携推進本部

TEL:03-5734-7693 FAX:03-5734-7694

産学連携コーディネーター: 谷村 修也

