

29amS-010

アリールスルホニル保護蛍光プローブを用いたグルタチオントランスフェラーゼの検出

○柴田 綾¹, 中野 佑妃子^{2,4}, Ralf MOGENSTERN³, 伊藤 嘉浩², 阿部 洋⁴, 北出 幸夫¹(¹岐大工, ²理研, ³Karolinska研, ⁴北大院薬)

【目的】グルタチオン-S-トランスフェラーゼ(GST)の過剰発現が腫瘍の薬剤耐性の一因となっているため、細胞内の GST 活性レベルを知ることは、抗がん剤選定等の決定のための重要な指針になる。

【方法】求電子性保護基であるアリールスルホニル基を用いて細胞内 GST 活性を測定するための蛍光プローブの開発を計画した(図)。それぞれ異なる置換基を4位に導入した蛍光プローブを合成し、各 GST サブタイプとの反応性を検討した。

【結果および考察】合成したプローブといずれのプローブも、GST 存在下でグルタチオンと反応させることでその蛍光強度が大きく増大したことから、GST のよい基質になることが分かった。この際、アリールスルホニル基の4位置換基が反応に及ぼす影響は GST サブタイプによって異なることが明らかとなった。また生細胞内の GST 活性を検出する際には、シアノ基を導入したものがよいことが分かった(*Analyst.*, **138**, 7326-7330)。

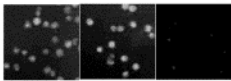
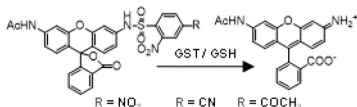


図 アリールスルホニル保護 GST 検出プローブ