

科研进展

强磁场中心发现新型选择性STK16激酶抑制剂

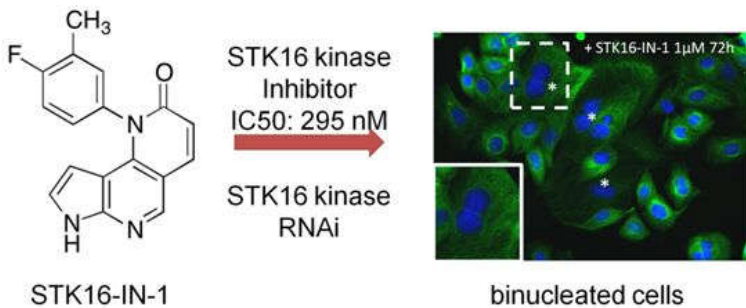
文章来源：强磁场中心 刘飞扬 发布时间：2016-04-27

近日，强磁场科学中心刘青松课题组和美国哈佛大学医学院教授Nathaneal Gray课题组合作开发了一种针对STK16激酶的选择性抑制剂STK16-IN-1，该小分子探针为揭示STK16激酶在人体内的生理和病理功能奠定了基础，并为验证STK16是否可以作为抗癌药物开发的靶点提供了有力的工具。相关研究结果于4月15日在《美国化学学会化学生物学杂志》(ACS Chemical Biology) 上在线发表，题目为“STK16激酶高选择性抑制剂的发现”(Discovery of a Highly Selective STK16 Kinase Inhibitor, DOI: 10.1021/acscchembio.6b00250)。

STK16激酶是一种在真核生物中广泛表达的丝氨酸/苏氨酸蛋白激酶，主要位于细胞的高尔基体内。目前，人们对于STK16激酶功能的认知非常有限。有研究提出，STK16激酶可能参与调节了乳腺导管形成；也有学者认为STK16可能与肝细胞内货运蛋白的分泌有关。但STK16具体参与了哪些细胞内信号通路以及它在细胞内具体发挥怎样的作用，目前还尚未有文献报道。因此，开发STK16的选择性抑制剂将帮助人们解答这些问题。

研究团队利用高通量筛选的方法，发现了靶向STK16激酶的小分子化合物STK16-IN-1。在对这种化合物进行一系列体外生化水平测试后，研究发现STK16-IN-1对STK16激酶的自磷酸化和底物的磷酸化均有抑制作用，对同一激酶家族的其他成员几乎没有抑制作用，具有很高的选择性。将STK16-IN-1处理一系列人肿瘤细胞后，STK16-IN-1并未明显抑制肿瘤细胞的增殖，但可以使肿瘤细胞出现双核现象，提示STK16激酶可能参与调控了细胞的有丝分裂过程。研究者进一步将STK16-IN-1和临床上常用的有丝分裂抑制剂Paclitaxel和Colchicine等组合使用后，发现STK16-IN-1有增加有丝分裂抑制剂诱导肿瘤细胞凋亡的效果。

强磁场科学中心的博士研究生刘飞扬、研究实习员杨星星，助理研究员李滨华主要参与了此项工作。



小分子激酶抑制剂STK16-IN-1可以抑制STK16激酶使乳腺癌细胞系MCF-7产生双核现象，RNA干扰STK16激酶也产生了同样的现象。

科学岛报

更多



科学岛视讯

更多



子站

- 内部信息 | 综合处 | 人教处 | 财务处 | 科研处 | 科发处 | 研究生处 | 纪检监察审计 | 离退休 | 保密办 | 安保办
- 基建管理 | 质量管理 | 信息中心 | 服务中心 | 健康管理中心 | 科院附中 | 归国学人联谊会 | 供应商竞价平台 | 职能部门 | 常用信息 |

友情链接



版权保护 | 隐私与安全 | 网站地图 | 常见问题 | 联系我们

Copyright © 2016 hfcas.ac.cn All Rights Reserved 中国科学院合肥物质科学研究院 版权所有 皖ICP备 050001008

地址：安徽省合肥市蜀山湖路350号 邮编：230031 电话：0551-65591295 电邮：office@hfcas.ac.cn

