【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成16年11月18日(2004.11.18)

【公表番号】特表2001-507027(P2001-507027A)
【公表日】平成13年5月29日(2001.5.29)
【出願番号】特願平10-528717
【国際特許分類第７版】
　Ｃ０７Ｋ　1/02
　Ｃ０７Ｋ　1/04
　Ｃ０７Ｋ　2/00
【ＦＩ】
　Ｃ０７Ｋ　1/02
　Ｃ０７Ｋ　1/04
　Ｃ０７Ｋ　2/00

【手続補正書】
【提出日】平成15年12月19日(2003.12.19)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【補正方法】変更
【補正の内容】

手　続　補　正　書

15.12.19

平成　　年　　月　　日 適

特許庁長官　　今　井　康　夫　　殿

1.事件の表示　　平成１０年特許願第５２８７１７号

2.補正をする者

事件との関係　　出　願　人

名　称　　ザ　スクリップス　リサーチ　インスティテュート

3.代　理　人

住　所　　東京都千代田区丸の内３丁目３番１号
電話（代）3211-8741

氏　名　　(5995) 弁理士　中　　村　　稔

4.補正命令の日付　　自　　発

5.補正対象書類名　　明細書

6.補正対象項目名　　請求の範囲

7.補正の内容　　別紙記載の通り

特許庁 15.12.22 出願支援課 金井

方式審査 佐藤

請求の範囲

１．第一のオリゴペプチドと第二のオリゴペプチドとを末端と末端で結合し、オリゴペプチド生成物を製造する方法であって、

工程Ａ：第一及び第二のオリゴペプチドを、触媒性チオールを含む反応溶液中で混合する工程であって、第一のオリゴペプチドはＣ末端チオエステルを有するＣ末端残基を含み、第二のオリゴペプチドは非酸化スルフヒドリル部分を有するＮ末端補助官能基を有するＮ末端残基を含み、Ｎ末端残基がグリシンでない場合、Ｃ末端残基はグリシンであり、Ｃ末端残基がグリシンでない場合、Ｎ末端残基はグリシンである工程、

工程Ｂ：Ｎ末端補助官能基の非酸化スルフヒドリル部分とＣ末端チオエステルとを縮合し、第一及び第二のオリゴペプチドがアミノチオエステル結合で結合している中間体オリゴペプチドを製造する工程、及び、

工程Ｃ：工程Ｂの中間体オリゴペプチドのアミノチオエステル結合を転位し、第一及び第二のオリゴペプチドがＮ結合補助官能基を有するアミド結合で結合しているオリゴペプチド生成物を製造する工程、

を含むことを特徴とする方法。

２．触媒性チオールが、ベンジルメルカプタン及びチオフェノールからなる群より選ばれる、請求項１に記載の方法。

３．Ｎ末端補助官能基が$N-\alpha-(CH_2)_n-SH$（式中、$1 \leqq n \leqq 3$である）である、請求項２に記載の方法。

４．追加の工程である、

工程Ｄ：Ｎ末端補助官能基を、工程Ｃのオリゴペプチド生成物から、還元剤を用いて除去し、天然ペプチド結合を生成する工程、

を含む、請求項２に記載の方法。

５．Ｎ末端補助官能基が$N-\alpha-O-(CH_2)_n-SH$（式中、$1 \leqq n \leqq 2$である）である、請求項４に記載の方法。

６．還元剤が亜鉛である、請求項５に記載の方法。

７．Ｃ末端チオエステルを含む第一のオリゴペプチドセグメント、

非酸化スルフヒドリル部分を有するN末端補助官能基を含む第二のオリゴペプチドセグメント、及び、

C末端チオエステルと補助官能基の非酸化スルフヒドリル基とを結合するアミノチオエステル結合、

を含むオリゴペプチド中間体であって、アミノチオエステル結合単位が自発的に分子内転位して、該第一及び第二のオリゴペプチドセグメントを末端と末端で結合するアミド結合を形成することを特徴とする中間体。

８．２つのペプチド配列、すなわちアミノ末端ペプチド配列とカルボキシル末端配列とを結合する結合単位であって、

第一のアミノ酸残基（aa_1）、第二のアミノ酸残基（aa_2）並びに第一及び第二のアミノ酸残基の間の分解された結合、

を含み、第一のアミノ酸残基はバックボーンカルボニル基、すなわち（aa_1-CO-）を有し、

第二のアミノ酸残基は、バックボーンアミノ基、すなわち（$-NR-aa_2$）（式中、Rは、$\alpha-O-(CH_2)N-SH$及び$\alpha-(CH_2)N-SH$（式中、$1 \leqq n \leqq 2$である）からなる群より選ばれる補助部分である）を有し、

第一のアミノ酸残基中のカルボニル基は、第二のアミノ酸残基を、第二のアミノ酸の補助部分のスルフヒドリル基で、第一のアミノ酸へ結合する単結合を有し、

第一及び第二のアミノ酸残基の間の分解された結合は、以下の式：

（$aa_1-CO)-S-(CH_2)N-X-(N-aa_2$）（式中、$1 \leqq n \leqq 2$であり、Xは酸素及びメチレンからなる群より選ばれる）

で示され、

ジペプチドの第一のアミノ酸残基（aa_1）は、アミノ末端ペプチド配列とのペプチド結合の形成に使用可能であり、ジペプチドの第二のアミノ酸残基（aa_2）は、カルボキシル末端ペプチド配列とのペプチド結合の形成に使用可能であり、これによりアミノ末端ペプチド配列とカルボキシル末端ペプチド配列とを分解された結合で結合することを特徴とする結合単位。