

【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12月9日(2004.12.9)

【公表番号】特表2000-512979(P2000-512979A)

【公表日】平成12年10月3日(2000.10.3)

【出願番号】特願平9-539622

【国際特許分類第7版】

C 0 7 K 1/04

G 0 1 N 33/53

G 0 1 N 33/566

【F I】

C 0 7 K 1/04

G 0 1 N 33/53 Z

G 0 1 N 33/566

【手続補正書】

【提出日】平成16年4月12日(2004.4.12)

【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

16.4.12
平成 年 月 日



特許庁長官 今井康夫 殿

1. 事件の表示 平成9年特許願第539622号

2. 補正をする者

事件との関係 出願人

名 称 メディヴァー ユーケイ リミテッド

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. (本補正により請求の範囲に記載された請求項の数は合計「14」となりました。)

6. 補正対象書類名 明細書

7. 補正対象項目名 請求の範囲

8. 補正の内容 別紙記載の通り

裏葉 (2)



請求の範囲

1. 活性部位と相互反応する化合物を含む化合物ライブラリーL1 及び L2 の相補対であって、このライブラリーが、溶液中の化合物類の混合物の2種の直交セットを含み、自己デコンボリューション法のために二次元で表示された相補的コンビナトリアルライブラリー（一次及び二次ライブラリーと称す）を提供し、これによっていずれかの化合物群の活性モチーフを特徴付けることができ、該ライブラリーL1 及び L2 が下記式：

-Bb-Cc-Dd-n(Ee)-

の4種の可変基B、C、D及びEを有する化合物類を含むセットを構築し、これは、各ライブラリーに $b \times c \times d \times e = M_n$ 個の化合物をもたらし、各ライブラリーの個々の同定しうる化合物のあらかじめ定められた数(Q_1, Q_2)からそれなる混合物のあらかじめ定められた数(P_1, P_2)があり、ここで L1 及び L2 は両方共、同じ M_n 個の化合物を含むが、L1 の Q_1 個の化合物の1種の混合物中に一緒に認められるいずれか2種の化合物が、L2 の P_2 個の混合物のいずれか1種において一緒に認めらることはないような、相補対。

2. 穴に加えられた活性部位と、この穴内の混合物の1種以上の化合物との相互作用をスクリーニングする方法であって、請求の範囲第1項記載のライブラリー L1 及び L2 を用い、ここで L1 の P_1 個の混合物及び L2 の P_2 個の混合物を各々、穴プレートの個々の穴に個別に配置し、この穴プレートが、L1 の1個の穴及び L2 の1個の穴の中に存在する活性から独自の活性化合物の式を推論することができるように適合されたフォーマットで配列された穴を有する、方法。

3. 前記フォーマットが、下記の一般的デコンボリューションの式を含む、請求の範囲第2項記載の方法：

$$(i) ns = (Rp \cdot Cp) / (Rs \cdot Cs) \cdot Np$$

$$(ii) k = b \cdot c \cdot d \cdot np \cdot e$$

$$(iii) k = x \cdot N \cdot np$$

$$(iv) N = Rp \cdot Cp$$

$$(v) K = X \cdot Rp \cdot Cp \cdot np$$

$$(vi) b \cdot c \cdot d \cdot e = X \cdot Rp \cdot Cp$$

(vii) $C_p \cdot e = X$

(viii) $R_p \cdot e = X$ ($R_p = C_p$ の場合)

及びここで

n_p =一次プレートの数、

n_s =二次プレートの数

R_p =一次列の数

R_s =二次列の数

C_p =一次行の数

C_s =二次行の数

K =化合物の組合せの数

N =プレート上の穴の数、及び

X =穴当たりの化合物の数。

4. 下記の値の、請求の範囲第3項記載の方法：

$n_p = 4$

$n_s = 16$

$R_p = 8$

$R_s = 4$

$C_p = 10$

$C_s = 5$

$K = 6400$

$N = 80$

$X = 20$ 。

5. 前記活性部位が、酵素、レセプター及び抗体からなる群から選択される、請求の範囲第2項記載の方法。

6. 前記活性部位の、該ライブラリーの化合物との相互作用が、基質又は阻害剤の酵素との相互作用、リガンドとレセプターとの相互作用、及び抗原又は抗原決定基と抗体との相互作用からなる群から選択される、請求の範囲第5項記載の方法。

7. 前記活性部位が、下記の酵素クラスからなる群から選択される、請求の範囲

第6項記載の方法：

1. 酸化還元酵素

- a) 脱水素酵素
- b) 酸化酵素
- c) ペルオキシダーゼ
- d) カタラーゼ

2. 加水分解酵素

- f) ペプチダーゼ（タンパク質分解酵素）

3. 転移酵素

- g) アミノトランスフェラーゼ
- h) キナーゼ
- i) グルコシルトランスフェラーゼ

4. 脱離酵素

- j) 脱炭酸酵素
- k) 脱水酵素

5. 異性化酵素

- l) ラセミ化酵素
 - m) ムターーゼ
6. リガーゼ
- n) シンテターゼ
 - o) カルボキシラーゼ。

8. 前記活性部位が、下記からなる群から選択されたプロテアーゼである、請求の範囲第7項記載の方法：

1. アスパラチルプロテアーゼ、例えば、レニン、HIV、カテプシンD、及びカテプシンEなど。
2. メタロプロテアーゼ、例えば、ECE、ゲラチナーゼA及びB、コラゲナーゼ、ストロメライシンなど。
3. システイニルプロテアーゼ、例えば、アポバイン、ICI、DerPI、カテプシンB、カテプシンKなど。

4. セリンプロテアーゼ、例えば、トロンビン、VIIa 因子、Xa 因子、エラスター
ゼ、トリプシン。

5. レオニルプロテアーゼ、例えば、プロテアソーム S。

9. 前記活性部位が、キナーゼであり、かつ前記相互作用が、キナーゼの基質又
は阻害剤との作用である、請求の範囲第 2 項記載の方法。

10. 前記活性部位が、レセプターであり、かつ前記相互作用が、リガンドとの
作用である、請求の範囲第 2 項記載の方法。

11. 前記活性部位が、抗体であり、かつ前記相互作用が、抗原又は抗原決定基
との作用である、請求の範囲第 2 項記載の方法。

12. 前記一次ライブラリー L1 の全ての穴の中の化合物類の混合物が、最初の 2
種の可変基の全ての変形を含み、かつ各穴が、他の 2 種の可変基の独自の対を含
み；かつここで、前記二次ライブラリー L2 の全ての穴の中の化合物類の混合物が、
他の 2 種の可変基の全ての変形を含み、かつ各穴が、最初の 2 種の可変基の独
自の対を含む、請求の範囲第 2 項記載の方法。

13. 前記一次ライブラリーが、可変基 B 及び E の全ての変形、及び可変基 C 及
び D の独自の対を含み；かつ前記二次ライブラリーが、可変基 C 及び D の全ての
変形、及び可変基 B 及び E の独自の対を含む、請求の範囲第 1 2 項記載の方法。

14. 請求の範囲第 1 項のライブラリーを形成する工程、これらのライブラリー
を、請求の範囲第 2 又は 3 のフォーマットにおいて穴プレートの穴内に配置する
工程、これらの穴に活性部位を適用する工程、該活性部位と、一次ライブラリー
L1 及び二次ライブラリー L2 の穴中の混合物の 1 種以上の化合物との相互作用を
スクリーニングする工程、並びにそれぞれの L1 及び L2 の穴位置から独自の活性
化合物の式を推論する工程を含む、請求の範囲第 2 又は 3 項記載の方法。