(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
25. März 2004 (25.03.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/024751 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07K 1/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/009694

(22) Internationales Anmeldedatum:
1. September 2003 (01.09.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 40 098.9 30. August 2002 (30.08.2002) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **MAX-PLANCK-GESELLSCHAFT ZUR FOERDERUNG DER WISSENSCHAFTEN E.V.** [DE/DE]; Hofgartenstrasse 8, 80539 Muenchen (DE). **RUDOLPH, Rainer** [DE/DE]; Dr. Hans Litten Strasse 28, 06120 Halle/Saale (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **BORDUSA, Frank** [DE/DE]; Karl-Marx-Platz 2, 06242 Rossbach (DE). **WEHOFSKY, Nicole** [DE/DE]; Kurt-Guenther-Strasse 20, 03417 Leipzig (DE).

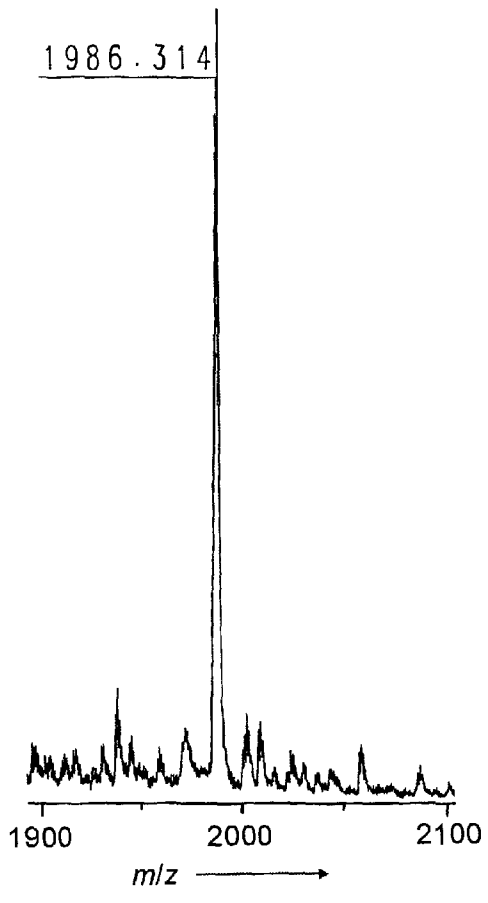
(74) Anwälte: **BEHNISCH, Werner** usw.; Reinhard Skuhra Weise & Partner, Friedrichstrasse 31, 80801 Muenchen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR THE SYNTHESIS AND SELECTIVE BIOCATALYTIC MODIFICATION OF PEPTIDES, PEPTIDE MIMETICS AND PROTEINS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR SYNTHESE UND SELEKTIVEN BIOKATALYTISCHEN MODIFIZIERUNG VON PEPTIDEN, PEPTIDMIMETIKA UND PROTEINEN



(57) Abstract: The invention relates to a method for the synthesis of peptides, peptide mimetics and/or proteins and/or for the selective N-terminal modification of peptides, peptide mimetics and/or proteins. Said method comprises the following steps: a) an amino constituent comprising at least one amino acid is prepared, b) a carboxy constituent comprising a leaving group on the carboxyl group is prepared, said carboxy constituent being a compound comprising at least one amino acid or a compound comprising at least one marker group or reporter group, and c) the amino constituent and the carboxy constituent are reacted in a reaction medium comprising at least one ionic liquid, in the presence of a protease, a peptidase and/or a hydrolase, a peptide bond being formed between the amino constituent and the carboxy constituent, splitting off the leaving group.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Synthese von Peptiden, Peptidmimetika und/oder Proteinen und/oder zur selektiven N-terminalen Modifizierung von Peptiden, Peptidmimetika und/oder Proteinen, mit den Schritten: a) Bereitstellen einer Aminokomponente, wobei die Aminokomponente mindestens eine Aminosäure aufweist, b) Bereitstellen einer Carboxykomponente, wobei die Carboxykomponente eine Abgangsgruppe an der Carboxylgruppe aufweist, und die Carboxykomponente eine Verbindung mit mindestens einer Aminosäure ist oder eine Verbindung mit mindestens einer Marker- oder Reportergruppe, c) Umsetzen der Aminokomponente und der Carboxykomponente in einem Reaktionsmedium, welches ein oder mehrere ionische Flüssigkeiten aufweist, in Gegenwart einer Protease, Peptidase und/oder Hydrolase, wobei zwischen der Aminokomponente und der Carboxykomponente unter Abspaltung der Abgangsgruppe eine Peptidbindung gebildet wird.

WO 2004/024751 A1

CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten** *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.