

# PATENT COOPERATION TREATY

From the  
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

To:

MEWBURN ELLIS LLP  
City Tower  
40 Basinghall Street  
London  
Greater London EC2V 5DE  
ROYAUME UNI



## PCT

### NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF THE INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(PCT Rule 71.1)

Date of mailing  
(day/month/year)

12.05.2020

Applicant's or agent's file reference  
007441454

#### IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.  
PCT/EP2019/054685

International filing date (day/month/year)  
26.02.2019

Priority date (day/month/year)  
27.02.2018

Applicant  
ZEALAND PHARMA A/S

1. The applicant is hereby notified that this International Preliminary Examining Authority transmits herewith the international preliminary report on patentability and its annexes, if any, established on the international application.
2. A copy of the report and its annexes, if any, is being transmitted to the International Bureau for communication to all the elected Offices.
3. Where required by any of the elected Offices, the International Bureau will prepare an English translation of the report (but not of any annexes) and will transmit such translation to those Offices.
4. **REMINDER**

The applicant must enter the national phase before each elected Office by performing certain acts (filing translations and paying national fees) within 30 months from the priority date (or later in some Offices) (Article 39(1)) (see also the reminder sent by the International Bureau with Form PCT/IB/301).

Where a translation of the international application must be furnished to an elected Office, that translation must contain a translation of any annexes to the international preliminary report on patentability. It is the applicant's responsibility to prepare and furnish such translation directly to each elected Office concerned.

For further details on the applicable time limits and requirements of the elected Offices, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

The applicant's attention is drawn to Article 33(5), which provides that the criteria of novelty, inventive step and industrial applicability described in Article 33(2) to (4) merely serve the purposes of international preliminary examination and that "any Contracting State may apply additional or different criteria for the purposes of deciding whether, in that State, the claimed inventions is patentable or not" (see also Article 27(5)). Such additional criteria may relate, for example, to exemptions from patentability, requirements for enabling disclosure, clarity and support for the claims.

Name and mailing address of the international preliminary examining authority:



European Patent Office  
D-80298 Munich  
Tel. +49 89 2399 - 0  
Fax: +49 89 2399 - 4465

Authorized Officer

Papiol Rovira, M

Tel. +49 89 2399-7199



# PATENT COOPERATION TREATY

## PCT

### INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                          |                                                                                                                                                                             |                       |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| Applicant's or agent's file reference<br>007441454                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                          | FOR FURTHER ACTION                                                                                                                                                          | See Form PCT/IPEA/416 |
| International application No.<br>PCT/EP2019/054685                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | International filing date (day/month/year)<br>26.02.2019 | Priority date (day/month/year)<br>27.02.2018                                                                                                                                |                       |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC<br>INV. C07K7/08                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                                                          |                                                                                                                                                                             |                       |
| Applicant<br>ZEALAND PHARMA AS                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                          |                                                                                                                                                                             |                       |
| <p>1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>5</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p>3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of <u>37</u> sheets, as follows:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority, unless those sheets were superseded or cancelled, and any accompanying letters (see Rules 46.5, 66.8, 70.16, 91.2, and Section 607 of the Administrative Instructions).</p> <p><input type="checkbox"/> sheets containing rectifications, where the decision was made by this Authority not to take them into account because they were not authorized by or notified to this Authority at the time when this Authority began to draw up this report, and any accompanying letters (Rules 66.4bis, 70.2(e), 70.16 and 91.2).</p> <p><input type="checkbox"/> superseded sheets and any accompanying letters, where this Authority either considers that the superseding sheets contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, or the superseding sheets were not accompanied by a letter indicating the basis for the amendments in the application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box (see Rule 70.16(b)).</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) , containing a sequence listing, in the form of an Annex C/ST.25 text file, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see paragraph 3ter of Annex C of the Administrative Instructions).</p> |                                                          |                                                                                                                                                                             |                       |
| <p>4. This report contains indications relating to the following items:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. I Basis of the report</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. II Priority</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. IV Lack of unity of invention</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VI Certain documents cited</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VII Certain defects in the international application</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VIII Certain observations on the international application</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                          |                                                                                                                                                                             |                       |
| Date of submission of the demand<br><br>23.12.2019                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                          | Date of completion of this report<br><br>12.05.2020                                                                                                                         |                       |
| Name and mailing address of the international preliminary examining authority:<br> European Patent Office<br>D-80298 Munich<br>Tel. +49 89 2399 - 0<br>Fax: +49 89 2399 - 4465                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                          | Authorized officer<br><br>Pinheiro Vieira, E<br><br>Telephone No. +49 89 2399-7865<br> |                       |

---

**Box No. I Basis of the report**

---

1. With regard to the **language**, this report is based on
- ☒ the international application in the language in which it was filed
  - ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of:
    - ☐ international search (under Rules 12.3(a) and 23.1(b))
    - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4(a))
    - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2(a) and/or 55.3(a) and (b))
2. With regard to the **elements\*** of the international application, this report is based on (*replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report*):

**Description, Pages**

1-83 as originally filed

**Claims, Numbers**

1-44 filed with the letter of

23-12-2019

**Drawings, Sheets**

1/3-3/3 as originally filed

- ☐ a sequence listing - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.
3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:
- ☐ the description, pages
  - ☐ the claims, Nos.
  - ☐ the drawings, sheets/figs
  - ☐ the sequence listing (*specify*):
4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since either they are considered to go beyond the disclosure as filed, or they were not accompanied by a letter indicating the basis for the amendments in the application as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rules 70.2(c) and (c-bis)):
- ☐ the description, pages
  - ☐ the claims, Nos.
  - ☐ the drawings, sheets/figs
  - ☐ the sequence listing (*specify*):
5. ☐ This report has been established:
- ☐ taking into account the **rectification of an obvious mistake** authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rules 66.1(d-bis) and 70.2(e)).
  - ☐ without taking into account the **rectification of an obvious mistake** authorized by or notified to this Authority under Rule 91(Rules 66.4bis and 70.2(e)).

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.  
PCT/EP2019/054685

6. ☒ With regard to top-up searches (Rules 66.1 *ter* and 70.2(f)):
- ☒ A top-up search was carried out by this Authority on 29.04.2020 (all discovered documents are listed in the Supplemental Box Relating to Top-up Search).
  - ☐ Additional relevant documents have been discovered during the top-up search.
  - ☐ No top-up search was carried out by this Authority because it would serve no useful purpose.
7. ☐ Supplementary international search report(s) from Authority(ies) has/have been received and taken into account in establishing this report (Rule 45bis.8(b) and (c)).

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded".

---

## Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

---

### 1. Statement

|                               |             |             |
|-------------------------------|-------------|-------------|
| Novelty (N)                   | Yes: Claims | <u>1-44</u> |
|                               | No: Claims  |             |
| Inventive step (IS)           | Yes: Claims | <u>1-44</u> |
|                               | No: Claims  |             |
| Industrial applicability (IA) | Yes: Claims | <u>1-44</u> |
|                               | No: Claims  |             |

### 2. Citations and explanations (Rule 70.7):

see separate sheet

Re Item V

1 Cited documents.

1.1 Reference is made to the following documents:

- D1 US 2014/113874 A1 (LAMBRIS JOHN D [US] ET AL) 24 April 2014 (2014-04-24)
- D2 EP 2 424 557 A1 (UNIV PENNSYLVANIA [US]) 7 March 2012 (2012-03-07)
- D3 BELLOWS M L ET AL: "New Compstatin Variants through Two De Novo Protein Design Frameworks", BIOPHYSICAL JOURNAL, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 98, no. 10, 19 May 2010 (2010-05-19), pages 2337-2346, XP002632554, ISSN: 0006-3495, DOI: 10.1016/J.BPJ.2010.01.057 [retrieved on 2010-05-18]
- D4 WO 2014/078734 A2 (APELLIS PHARMACEUTICALS INC [US]) 22 May 2014 (2014-05-22)
- D5 WO 2014/100407 A1 (UNIV CALIFORNIA [US]; UNIV PRINCETON [US]; UNIV CYPRUS [CY]) 26 June 2014 (2014-06-26)cited in the application

1.2 D1 to D5 discloses compstatin analogues with Val at position 3.

2 Novelty and Inventive step (Article 33 PCT)

2.1 None of the cited documents discloses or suggests a compstatin analogue having Ile3 and Glu9. Novelty is therefore, acknowledged (Art. 33(2) PCT)

2.2 Any document could be considered the closest prior art document. They all disclose compstatin analogues capable of binding to C3 protein and inhibiting complement activation.

- 2.3 The replacement of Val3 by Ile3 leads to compounds having a better solubility and greater activity. The present problem to be solved can therefore, be seen as the provision of compstatin analogues having improved activity and solubility.

The Applicant solves the problem by providing the claimed compounds where Val3 is replaced by Ile3.

The Applicant has shown by the examples that the posed problem has been credibly solved. An increase in solubility as well as a greater activity was obtained for compounds showing the mutation at position 3 (see tables 1 to 4, 6 and 7). The Applicant has also validated the position 3 by comparing activity changes with several amino acids at position 3 (see table 4).

Bearing in mind that none of the cited documents discloses ou suggests Ile3 at position 3 in addition to Glu at position 9, a position considered conserved and important for binding to protein C3, and that the Applicant has shown that said position could be modified by Ile3 without loss of activity it is considered that the present set of claims on file is inventive. To note is that it is accepted a broader structure for the peptide based on the data provided and bearing in mind that positions 2, 3, 5, 7,9, 10 and 12 are conserved.

The claimed subject matter is therefore, considered to comply with the requirements of Art. 33(3) PCT.

- 2.4 Although claims 40, 41, 43 and 44 are directed to a method of treatment of the human/animal body, the search has been carried out and based on the alleged effects of the compound. Patentability, in particular novelty and inventive step, of said claims has been assessed on the basis of a purpose-limited product claim taking into account the alleged effects of the compound.

The patentability can be dependent upon the formulation of the claims. The EPO, for example, does not recognise as patentable claims to the use of a compound in medical treatment, but may allow claims to a product, in particular substances or compositions for use in a first or further medical treatment.

European Patent Office  
Acting as International Preliminary Examining Authority  
D-80298 München  
Germany

23 December 2019

Dear Sirs

**International Patent Application No. PCT/EP2019/054685**  
**Applicant: ZEALAND PHARMA A/S**  
**Our Ref: GRF/BP7441454**

This letter accompanies the Chapter II Demand filed in connection with this application.

## 1. Fees

The following fees are being paid online today:

|                                 |             |                        |
|---------------------------------|-------------|------------------------|
| PCT Preliminary Examination Fee | Euro        | <b>1830.00</b>         |
| PCT Handling Fee                | Euro        | <b>176.00</b>          |
| TOTAL:                          | <u>Euro</u> | <b><u>2,006.00</u></b> |

If any additional fees are required so that this Chapter II Demand is deemed to be filed, then the EPO is authorised to deduct such fees from my firm's deposit account number 2805.0013 under the reference SHORTFALL, informing me in writing that this has been done.

## 2. Amendments

Amended claims 1-44 are filed under Article 34 PCT.

For the examiner's convenience a marked-up version is included for reference only.

Claims 1-4, 10 and 12-14 are amended to specify that the residue present at position X9 is glutamic acid (E; Glu). Basis is found in the original versions of those claims. Subsequent claims have been adapted for consistency where necessary.

## 4. Novelty

None of the prior art documents cited in the International Search Report or provided with the third party observation of 28 October 2019 describe a compstatin analogue having I at position 3 and E at position 9. For example, see the table at page 3 of "document #9" provided with the third party observation.

## 5. Inventive Step

The prior art provides no incentive for the skilled person to combine I (Ile) at position 3 with E (Glu) at position 9 as now claimed.

The only reference which mentions I at position 3 is WO 99/13899 ("citation 1" from the third party observation). Notably that document contains no exemplification of molecules having I at position 3, so the reader would be unaware whether such a substitution was technically viable.

In the generic formula on pages 15-16, X9 is listed as "*any amino acid, preferably His or Ala*". It appears that only H (His; the original compstatin residue) is exemplified at that position.

The present application contains data showing that the combination of I3 and E9 is particularly advantageous. For example, the table below shows data for compounds having similar backbone sequences, presented in rank order of their complement inhibitory activity (low to high). The compounds having I3 all have greater inhibitory activity (i.e. lower IC50) than those having V3, and those having the combination of I3 and E9 have the highest inhibitory activity of all.

| Compound |    | 1 | 2    | 3 | 4 | 5 | 6 | 7 | 8 | 9 | 10 | 11 | 12   | 13 |                 | CP<br>hemolysis<br>IC50 (nM) |
|----------|----|---|------|---|---|---|---|---|---|---|----|----|------|----|-----------------|------------------------------|
| E        | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | A | H  | S  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | >1000                        |
| F        | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | E | H  | S  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 540                          |
| A        | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | E | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 350                          |
| 4W9A     | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | A | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 250                          |
| 1        | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | A | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 150                          |
| 19       | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | A | H  | S  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 140                          |
| 2        | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | E | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 94                           |
| 20       | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | E | H  | S  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 59                           |

Clearly the combination of I3 and E9 is not suggested by WO 99/13899 ("citation 1"). None of the other documents point to the use of E (Glu) at position 9 at all, still less in combination with I3. (Again, see the summary table provided in "document #9" of the third party observation.) Thus it is impossible to arrive at the claimed combination from the cited documents.

We note that citations 1 to 7 provided by the third party apparently originate from the same research group (or at least share a common inventor / author of John D Lambris). Despite WO 99/13899 ("citation 1") being published as long ago as March 1999, none of the subsequent documents appear to have adopted the suggestion to use Ile (or any other residue) at position 3 instead of Val. Rather, Val3 appears to be regarded as essential in all of those disclosures. See claim 1 of each of citations 4-7, for example. The same applies to citation 8, from a different group. This strongly suggests that the claimed invention is not obvious.

The present application therefore shows for the first time that compstatin analogues having the residues I3 and E9 can be highly active, and even superior to compounds having more commonly used residues at those positions in a similar peptide backbone. This could not have been predicted from the prior art.

We therefore believe that the claims as amended are both novel and inventive.

6. Closing Remarks

It is requested that an International Preliminary Report on Patentability (IPRP/Chapter II) be issued indicating that all claims are novel, inventive, and industrially applicable.

In the event the Examiner considers that any objections remain outstanding, we ask that a further written opinion be issued as soon as possible, in view of the limited period allowed for the IPE procedure.

Yours faithfully

/GRAHAM R FORREST/

Graham R Forrest  
Appointed Agent  
For and on behalf of Mewburn Ellis LLP (Association No. 929)  
*graham.forrest@mewburn.com*

To contact me personally  
please telephone + 44 117 945 1234

**Claims:**

1. A compstatin analogue represented by the formula:

5 Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-X8-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Formula I)

wherein:

Y1 is hydrogen, acetyl or a lipophilic group  $\Phi$ ;

10

X1 is I, Y, F or Sar;

X4 is W, F, V, Y, 1-Me-Trp, D-Trp, N-Me-Trp, 1-For-Trp, 1-Nal, 2-Nal, 5-Me-Trp, Bpa or 2-Igl;

15

X6 is E, K or D;

X8 is G or Sar;

20 X11 is R, S or K;

X13 is T, S, E, F, H, K, Sar, G, I, D, N-Me-Ile or N-Me-Thr;

Y2 is  $\text{NH}_2$ , OH or a lipophilic group  $\Phi$ ;

25

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3, Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof; and

- 5 R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3, Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

10 wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

and wherein the compstatin analogue optionally has a lipophilic group  $\Phi$  covalently linked to the side chain of one or more amino acid residues;

15 or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

2. A compstatin analogue represented by the formula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-X8-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Formula II)

20

wherein:

Y1 is hydrogen, acetyl, or a lipophilic group  $\Phi$ ;

25 X1 is I, Y, F or Sar;

X4 is W, V, Y, 2-Nal, 1-Nal or 1-Me-Trp;

X6 is E or D;

X8 is G or Sar;

5

X11 is R, S or K;

X13 is T, S, E, I, Sar, K, G or N-Me-Ile;

10 Y2 is NH<sub>2</sub>, OH or a lipophilic group  $\Phi$ ;

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof, or Peg3, Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof; and

15

R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

20 wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

and wherein the compstatin analogue optionally has a lipophilic group  $\Phi$  covalently linked to the side chain of one or more amino acids;

25

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

3. A compstatin analogue represented by the formula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Formula III)

5 wherein:

Y1 is hydrogen, acetyl or a lipophilic group  $\Phi$ ;

X1 is I, Y, F or Sar;

10

X4 is W, V, Y, 1-Nal, 2-Nal or 1-Me-Trp;

X6 is E or D;

15 X11 is R, S or K;

X13 is T, I, S, E, K or Sar;

Y2 is  $\text{NH}_2$ , OH or a lipophilic group  $\Phi$ ;

20

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof, or Peg3, Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof; and

25 R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

- 5 and wherein the compstatin analogue optionally has a lipophilic group  $\Phi$  covalently linked to the side chain of one or more amino acids;

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

- 10 4. A compstatin analogue represented by the formula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Formula IV)

wherein:

- 15 Y1 is hydrogen, acetyl or a lipophilic group  $\Phi$ ;

X1 is I, Y, F or Sar;

X4 is W, V, Y, 1-Nal, 2-Nal or 1-Me-Trp;

20

X6 is E or D;

X13 is T, S, E or Sar;

- 25 Y2 is  $\text{NH}_2$ , OH or a lipophilic group  $\Phi$ ;

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof, or Peg3, Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof; and

- 5 R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

- 10 wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

and wherein the compstatin analogue optionally has a lipophilic group  $\Phi$  covalently linked to the side chain of one or more amino acids;

- 15 or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

5. A compstatin analogue according to any one of claims 1 to 4 comprising at least one lipophilic group  $\Phi$ .

- 20 6. A compstatin analogue according to claim 5 wherein Y1 or Y2 is a lipophilic group  $\Phi$ .

7. A compstatin analogue according to claim 5 or claim 6 comprising a lipophilic group  $\Phi$  linked to the side chain of an amino acid residue at position X1, X11 or X13, or  
25 an amino acid residue in R1 or R2.

8. A compstatin analogue according to claim 7 wherein said amino acid residue is a lysine residue.

9. A compstatin analogue according to any one of claims 1 to 4 which does not comprise a lipophilic group  $\Phi$ .

10. A compstatin analogue according to claim 1, represented by the formula:

5

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Formula V)

wherein:

10 Y1 is hydrogen or acetyl;

X1 is Y or F ;

X4 is W, Y, 1-Me-Trp;

15

X6 is E or D;

X13 is T, E or Sar;

20 Y2 is NH<sub>2</sub> or OH;

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof, or Peg3, Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof; and

25

R2 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

- 5 wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

- 10 11. A compstatin analogue according to claim 10, represented by the formula:

Y1-R1-X1-C-I-[1-Me-Trp]-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Formula VI)

wherein:

- 15 Y1 is hydrogen or acetyl;

X1 is Y or F;

X6 is E or D;

20

X13 is T, E or Sar;

Y2 is NH<sub>2</sub> or OH;

- 25 R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof, or Peg3, Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof; and

R2 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

5

wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

10

12. A compstatin analogue according to claim 1, represented by the formula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-X8-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Formula VIII)

15 wherein:

Y1 is hydrogen, acetyl or a lipophilic group  $\Phi$ ;

X1 is I, Y, F or Sar;

20

X4 is W, V, Y, 2-Nal, 1-Nal or 1-Me-Trp;

X6 is E or D;

25 X8 is G or Sar;

X11 is R, S or K\*;

X13 is T, S, E, I, Sar, K, G or N-Me-Ile;

5 Y2 is NH<sub>2</sub>, OH or a lipophilic group  $\Phi$ ;

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V or Sar, or a corresponding D form thereof;

10 R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg 3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

wherein \* indicates that the amino acid residue bears a lipophilic group  $\Phi$  covalently  
15 linked to its side chain;

wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

20 and wherein the compstatin analogue comprises at least one lipophilic group  $\Phi$ ;

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

13. A compstatin analogue according to claim 11, represented by the formula:

25

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Formula IX)

wherein:

Y1 is hydrogen, acetyl, or a lipophilic group  $\Phi$ ;

5 X1 is I, Y, F or Sar;

X4 is W, V, Y, 1-Nal, 2-Nal or 1-Me-Trp;

X6 is E or D;

10

X11 is R, S or K\*;

X13 is T, I, S, E, K or Sar;

15 Y2 is NH<sub>2</sub>, OH or a lipophilic group  $\Phi$ ;

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V or Sar, or a corresponding D form thereof; and

20 R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg 3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

wherein \* indicates that the amino acid residue bears a lipophilic group  $\Phi$  covalently

25 attached to its side chain;

wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

and wherein the compstatin analogue comprises at least one lipophilic group  $\Phi$ ;

5

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

14. A compstatin analogue according to claim 12 or claim 13, represented by the formula:

10

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Formula X)

wherein:

Y1 is hydrogen, acetyl or a lipophilic group  $\Phi$ ;

15

X1 is I, Y, F or Sar;

X4 is W, V, 1-Nal, 2-Nal or 1-Me-Trp;

20 X6 is E or D;

X13 is T, S, E or Sar;

Y2 is NH<sub>2</sub>, OH or a lipophilic group  $\Phi$ ;

25

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V or Sar, or a corresponding D form thereof;

5 R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, or  $\beta$ Ala, or a corresponding D form thereof; or Peg3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

wherein \* indicates that the amino acid residue bears a lipophilic group  $\Phi$  covalently attached to its amino acid side chain;

10

wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

15 and wherein the compstatin analogue comprises at least one lipophilic group  $\Phi$ , e.g. exactly one lipophilic group  $\Phi$ ;

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

15. A compstatin analogue according to claim 14, represented by the formula:

20

Y1-R1-X1-C-I-[1-Me-Trp]-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Formula XI)

wherein:

Y1 is hydrogen or acetyl;

25

X1 is Y or F;

X6 is E or D;

X13 is T, E or Sar;

5 Y2 is NH<sub>2</sub> or OH;

R1 is absent or is a sequence of 1 to 6 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V or Sar, or a corresponding D form thereof;

10 R2 is absent or is a sequence of 1 to 8 amino acid residues selected from A, E, G, L, K, K\* F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, or βAla, or a corresponding D form thereof; or Peg3 or Peg4, or 8-aminooctanoyl, or derivatives thereof;

wherein \* indicates that the amino acid residue bears a lipophilic group Φ covalently  
15 attached to its side chain;

wherein the compstatin analogue has a disulphide bond between the cysteine residues at positions 2 and 12;

20 and wherein the compstatin analogue comprises at least one lipophilic group Φ, e.g. exactly one lipophilic group Φ;

or a pharmaceutically acceptable salt and/or solvate thereof.

25 16. A compstatin analogue according to any one of the preceding claims wherein the 13-mer peptide portion (X1-X13) of the compstatin analogue has a sequence selected from:

- [Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];
- [Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;
- [Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)T;
- [Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar];
- 5 [Sar]C(1)IWQDWGEHRC(1)T;
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar];
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)T;
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];
- 10 FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)E;
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)S;
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;
- FC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar];
- FC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)T;
- 15 FC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)T;
- FC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar];
- FC(1)IWQDWGEHRC(1)T;
- IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];
- IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;
- 20 IC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)[Sar];
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar];
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)E;
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)S;
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)T;
- 25 IC(1)IWQDWGEHSC(1)T;

IC(1)IWQEWGEHRC(1)T;

IC(1)IWQKWGEHRC(1)T;

YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];

YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;

5 YC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar];

YC(1)I[2NaI]QDWGEHRC(1)T;

YC(1)IWQDWGEHRC(1)T;

YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH[K\*]C(1)[Sar]; and

YC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar].

10

17. A compstatin analogue according to any one of the preceding claims wherein R1 has a sequence selected from:

{d}Y, EGSE, AGSE, SASE, EYSE, GSE, ASE, ESSA, KGSA, AKGE, ASGE, ASSE, ASSES, GSAE, ESSE, ESGA, SEG, GES, ESS, EGSA, ESE, EGE, ESA, SAE, SGA, YLEA, GSA, KEK, EKG, ES, AE, TE, KE, GE, FE, YE, AS, SE, RS, SR, SA, GE, Y, S and E.

15

18. A compstatin analogue according to claim 17 comprising a lipophilic group  $\Phi$  covalently linked to an amino acid side chain of R1.

20

19. A compstatin analogue according to claim 18 wherein R1 has the sequence K\*GSA.

20. A compstatin analogue according to any one of the preceding claims wherein R2 has a sequence selected from:

25

EGASGSG, EGAGSG, EGASAG, EGAGAG, EGESGSG, EGE GSG, EGESAG, EGE GAG, EK[ $\gamma$ Glu]AK, EK[ $\gamma$ Glu]A, EGE G, EGAGG, EGE SS, GAESK, EGAK, EGEK, EGG, EGK, EGKK, EGS, EK, EGA, EGAK, EK[ $\square$ Glu], EK[ $\gamma$ Glu]-K, EGE[Peg3], EGE[Peg3]-K, EGE[Peg3][Peg3], EGE[Peg3][Peg3]-K, EGE[Peg3][Peg3][Peg3],

EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-K GESESE, GAESSES, EGESES, EGESESK, EGE[Peg3]-ES,  
 EGE[Peg3]-ESK, GESESE, EGE-[8-aminooctanoyl], EGE-[8-aminooctanoyl]-K, EGE-[8-  
 aminooctanoyl]-EK, EGE<sup>GGG</sup>, EGE<sup>GGG</sup>K, EK[γGlu]GGG, EK[γGlu]GGGK, EGE-[8-  
 aminooctanoyl]-E, E[Peg3][Peg3], E[Peg3][Peg3]-K, EA[Peg3][Peg3], EA[Peg3][Peg3]-  
 5 K, GAES, EYGS, EGYA, EAGS, EAKS, EKSA, ESGA, EGGS, EGGA, ESSG, ESAG,  
 GEES, AEES, ESEG, AEGS, ESGS, SEGA, SEG, EGK, , ESG, EAG, GAE, EGEA,  
 EGE, EA, E, S, GE, GEK, EG, EA, EKE or EKP.

21. A compstatin analogue according to claim 20 comprising a lipophilic group  $\Phi$   
 10 covalently linked to an amino acid side chain of R2.

22. A compstatin analogue according to claim 21 wherein R2 has the sequence  
 EK[γGlu]AK\*, EGKK\*, EK[γGlu]K\*, EGE[Peg3]-K\*, EGESESK\*, EGE[Peg3]-ESK\*, EGE-  
 [8-aminooctanoyl]-K\*, EGE-[8-aminooctanoyl]-EK\*, EGE<sup>GGG</sup>K\*, EK[γGlu]GGGK\*,  
 15 EGE[Peg3][Peg3]-K\*, EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-K\*, E[Peg3][Peg3]-K\*, EA[Peg3][Peg3]-  
 K\*, GAESK\*, EGAk\*, EGEK\*, EGK\* EGE[Peg3]-ESK\*, GESESEK\*, GEK\* or EK\*.

23. A compstatin analogue according to claim 1, comprising a sequence selected  
 from:

20 IC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
 ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
 IC(1)I[1MeTrp]QDWGEHRC(1)T  
 IC(1)IWQKWGEHRC(1)T  
 YC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
 25 ESSAYC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
 [Sar]C(1)IWQDWGEHRC(1)T  
 IC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]  
 ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES  
 IC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES

- IC(1)IWQEWGEHRC(1)T
- IC(1)IWQDWGEHSC(1)T
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)S
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)E
- 5 FC(1)IWQDWGEHRC(1)T
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TE
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE
- 10 EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E
- EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T
- EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T
- ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T
- SEIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA
- 15 EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE
- EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE
- EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE
- ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE
- KEKIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKE
- 20 EKGIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKP
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGK
- GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E
- SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E
- SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG
- 25 FC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAE

- EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]EGE  
 EGSAFC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E  
 EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 EGSAIC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 5 IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 IC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE  
 10 EGSAFC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TE  
 EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE  
 EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE  
 EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE  
 EGSAFC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TE  
 15 FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 FC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 FC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 YC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 20 YC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEAGS  
 YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TESGA  
 EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 25 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA

- FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES  
 {d}YFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]GAES  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 5 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]EA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TEA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E  
 EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 10 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)SEA  
 EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)ES  
 15 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHKC(1)[Sar]EA  
 GEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 GE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA  
 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)TEA  
 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA  
 20 {d}Y[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA

24. A compstatin analogue according to claim 1 which is:

Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 2)

Ac-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 3)

- 25 Ac-IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 4)

- Ac-IC(1)IWQKWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 7)
- Ac-YC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 9)
- Ac-ESSAYC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 10)
- Ac-[Sar]C(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 11)
- 5 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]-NH<sub>2</sub> (Compound 13)
- Ac-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 14)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 15)
- Ac-IC(1)IWQEWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 16)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHSC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 20)
- 10 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)S-NH<sub>2</sub> (Compound 21)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)E-NH<sub>2</sub> (Compound 22)
- Ac-FC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 23)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compound 24)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compound 25)
- 15 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compound 26)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compound 27)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 28)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 29)
- Ac-EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 30)
- 20 Ac-ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compound 31)
- Ac-SEIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compound 32)
- Ac-EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compound 33)
- Ac-EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compound 34)
- Ac-EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compound 35)
- 25 Ac-ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compound 36)

- Ac-KEKIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKE-NH<sub>2</sub> (Compound 37)
- Ac-EKGIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKP-NH<sub>2</sub> (Compound 38)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGK-NH<sub>2</sub> (Compound 39)
- Ac-GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 40)
- 5 Ac-SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 41)
- Ac-SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-NH<sub>2</sub> (Compound 42)
- Ac-FC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAE-NH<sub>2</sub> (Compound 43)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]EGE-NH<sub>2</sub> (Compound 44)
- Ac-EGSAFC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 45)
- 10 Ac-EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 49)
- Ac-EGSAIC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 50)
- Ac-IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 51)
- Ac-IC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 52)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 53)
- 15 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 54)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compound 55)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compound 56)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compound 57)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compound 58)
- 20 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compound 59)
- Ac-EGSAFC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compound 60)
- Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 61)
- Ac-YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 62)
- Ac-FC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 63)
- 25 Ac-FC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 64)

- Ac-YC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 65)
- Ac-YC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 66)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 67)
- Ac-YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEAGS-NH<sub>2</sub> (Compound 68)
- 5 Ac-YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TESGA-NH<sub>2</sub> (Compound 69)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 70)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 71)
- Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 72)
- H-{d}YFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compound 73)
- 10 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]GAES-NH<sub>2</sub> (Compound 74)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 75)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 76)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compound 77)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 78)
- 15 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 79)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 80)
- Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 81)
- Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compound 82)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 83)
- 20 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)SEA-NH<sub>2</sub> (Compound 84)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)ES-NH<sub>2</sub> (Compound 85)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 86)
- Ac-GEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 87)
- Ac-GE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compound 88)
- 25 Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compound 89)

Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compound 90)

H-{d}Y[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compound 91)

- 5 25. A compstatin analogue according to claim 1 comprising a sequence selected from:
- [K\*]GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE (Compound 100)
- ASGEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*] (Compound 113)
- EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-[K\*] (Compound 134)
- 10 EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*] (Compound 101)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH[K\*]C(1)[Sar]E (Compound 103)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EG-[K\*] (Compound 104)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*] (Compound 109)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-[K\*] (Compound 110)
- 15 EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]-[K\*] (Compound 111)
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES[K\*] (Compound 102)
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*] (Compound 92)
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-[K\*] (Compound 94)
- SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-[K\*] (Compound 105)
- 20 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*] (Compound 119)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 123)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGEGGG-[K\*] (Compound 129)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]-[K\*] (Compound 138)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]ES-[K\*] (Compound 140)
- 25 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 127)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-[K\*] (Compound 139)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]GGG-[K\*] (Compound 132)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE-[8-aminooctanoyl]-[K\*] (Compound 136)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE-[8-aminooctanoyl]-E-[K\*] (Compound 137)
- 30 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-[K\*] (Compound 130)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3]ES-[K\*] (Compound 142)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 126)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEK[γGlu]GGG-[K\*] (Compound 133)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-[K\*] (Compound 135)

- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*] (Compound 120)  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][K\*] (Compound 124)  
 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*] (Compound 112)  
 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 117)  
 5 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*] (Compound 114)  
 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar]EK[γGlu]A[K\*] (Compound 121)  
 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA[K\*] (Compound 122)  
 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 125)  
 EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E (Compound 107)  
 10 ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE (Compound 99)  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 143)  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 144)  
 EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compound 145)

15

26. A compstatin analogue according to claim 25 comprising a sequence selected from:

- Ac-[K\*]GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compound 100)  
 Ac-ASGEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*]-[NH<sub>2</sub>] (Compound 113)  
 20 Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-[K\*]-[NH<sub>2</sub>] (Compound 134)  
 Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*]-[NH<sub>2</sub>] (Compound 101)  
 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH[K\*]C(1)[Sar]E-[NH<sub>2</sub>] (Compound 103)  
 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 104)  
 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 109)  
 25 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 110)  
 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 111)  
 Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 102)  
 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 92, 93, 95, 96, 98)  
 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 94, 97)  
 30 Ac-SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 105, 106)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 119)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 123)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGEGGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 129)  
 35 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 138)

- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]ES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 140)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 127, 128)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 139, 141)  
 5 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]GGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 132)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoyl]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 136)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoyl]E-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 137)  
 10 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 130, 131)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3]ES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 142)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 126)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEK[γGlu]GGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 133)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 135)  
 15 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 120)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 124)  
 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 112, 118)  
 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 117)  
 20 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 114, 115, 116)  
 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar]EK[γGlu]A-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 121)  
 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 122)  
 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 125)  
 25 Φ-EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 107, 108)  
 Φ-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compound 99)  
 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 143)  
 30 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 144)  
 Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compound 145)  
 35 27. A compstatin analogue according to any one of claims 1 to 8, 12 to 23, 25 or 26 which comprises a lipophilic group Φ, and wherein the lipophilic group Φ is Z<sup>1</sup>- or Z<sup>1</sup>-Z<sup>2</sup>-;

wherein

Z<sup>1</sup> is A-C<sub>12-22</sub>alkylene-(CO)-;

where A is H or -COOH, and wherein the alkylene may be linear or branched and may  
5 be saturated or unsaturated, and may optionally incorporate a phenylene or  
piperazinylene moiety in its length; and

Z<sup>2</sup> is a sequence of 1 to 6 residues of compounds selected from γ-Glu, E, K, Orn, S, T,  
A, β-Ala, G, P, V, L, I, Y, Q, N, Dapa, Gaba, or Aib, or a corresponding D form thereof,  
10 5-aminopentanoyl, 6-aminohexanoyl, 7-aminoheptanoyl, 8-aminooctanoyl, 9-  
aminononanoyl, and 10-aminodecanoyl. 8-amino-3,6-dioxaoctanoic acid (Peg3), 11-  
amino-3,6,9-trioxaundecanoic acid (Peg4) and (piperazine-1-yl)-carboxylic acid.

28. A compstatin analogue according to claim 27 wherein Z<sup>1</sup> is selected from:

15 Dodecanoyl i.e. H-(CH<sub>2</sub>)<sub>11</sub>-(CO)-;

Tetradecanoyl i.e. H-(CH<sub>2</sub>)<sub>13</sub>-(CO)-;

Hexadecanoyl, i.e. H-(CH<sub>2</sub>)<sub>15</sub>-(CO)-;

13-carboxytridecanoyl, i.e. HOOC-(CH<sub>2</sub>)<sub>12</sub>-(CO)-;

15-carboxypentadecanoyl, i.e. HOOC-(CH<sub>2</sub>)<sub>14</sub>-(CO)-;

20 17-carboxyheptadecanoyl, i.e. HOOC-(CH<sub>2</sub>)<sub>16</sub>-(CO)-;

19-carboxynonadecanoyl, i.e. HOOC-(CH<sub>2</sub>)<sub>18</sub>-(CO)-; or

21-carboxyheneicosanoyl, i.e. HOOC-(CH<sub>2</sub>)<sub>20</sub>-(CO)-

29. A compstatin analogue according to claim 27 or claim 28 wherein Z<sup>2</sup> is selected  
25 from:

[γGlu],

[γGlu][Peg3][Peg3]-;

[(Piperazine-1-yl)-acetyl][Peg3][Peg3];

[γGlu]G[γGlu];

30 [γGlu]K[γGlu];

[γGlu]KG[γGlu]; or

[γGlu]G[Peg3][γGlu][Peg3].

For example, Z<sup>2</sup> may be, or may comprise:

30. A compstatin analogue according to any one of claims 27 to 29 wherein Z<sup>1</sup>- or Z<sup>1</sup>-Z<sup>2</sup>- is selected from:

- 15-carboxy-pentadecanoyl;
- 5 15-carboxy-pentadecanoyl[γGlu]-,
- 15-carboxy-pentadecanoyl[γGlu][Peg3][Peg3]-;
- 19-carboxy-nonadecanoyl[γGlu][Peg3][Peg3]-;
- 15-carboxy-pentadecanoyl-[(Piperazine-1-yl)-acetyl][Peg3][Peg3];
- 17-carboxy-heptadecanoyl[γGlu]G[γGlu];
- 10 17-carboxy-heptadecanoyl[γGlu]K[γGlu];
- 17-carboxy-heptadecanoyl[γGlu]KG[γGlu];
- 17-carboxy-heptadecanoyl[γGlu]G(Peg3)[γGlu]-(Peg3);
- 15-carboxy-hexadecanoyl[γGlu]G[γGlu];
- 17-carboxy-heptadecanoyl;
- 15 17-carboxy-heptadecanoyl[γGlu]
- 19-carboxy-nonadecanoyl[γGlu]G[γGlu];and
- 17-carboxy-heptadecanoyl[γGlu][Peg3][Peg3].

31. A compstatin analogue according to claim 1 which is:

- 20 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([15-carboxy-pentadecanoyl][γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 92)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([15-carboxy-pentadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 93)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-K([15-carboxy-pentadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 94)
- 25 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K((15-carboxy-pentadecanoyl)-[(Piperazine-1-yl)-acetyl][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 95)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 96)
- 30 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 97)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([19-carboxy-nonadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 98)
- [15-Carboxy-pentadecanoyl]-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compound 99)

- Ac-[K([15-carboxy-pentadecanoyl]-  
[γGlu][Peg3][Peg3])]GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compound 100)  
Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([15-carboxy-pentadecanoyl][γGlu])-NH<sub>2</sub>  
(Compound 101)
- 5 Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-K([15-carboxy-  
pentadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 102)  
Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH-K([15-carboxy-  
pentadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-C(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compound 103)  
Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EG-K([15-carboxy-  
10 pentadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 104)  
Ac-SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-K([17-carboxy-  
heptadecanoyl][γGlu]KG[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 105)  
Ac-SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-K([17-carboxy-  
heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 106)
- 15 [15-Carboxy-pentadecanoyl]-EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub>  
(Compound 107)  
[17-Carboxy-heptadecanoyl]-EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub>  
(Compound 108)  
Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxy-heptadecanoyl]-  
20 [γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 109)  
Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-K([17-carboxy-  
heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 110)  
Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]-K([17-carboxy-  
heptadecanoyl][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 111)
- 25 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-  
G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 112)  
Ac-ASGEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxy-  
heptadecanoyl][γGlu]-G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 113)  
Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-  
30 G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 114)  
Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-  
G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 115)  
Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-  
K[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 116)
- 35 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-  
heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 117)

- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-G[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 118)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-G[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 119)
- 5 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-G[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 120)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar]EK[γGlu]A-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]G[Peg3][γGlu]-[Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 121)
- 10 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]-G-[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compound 122)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 123)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-
- 15 heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 124)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 125)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 126)
- 20 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([15-carboxy-pentadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 127)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([19-carboxy-nonadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 128)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGEGGG-K([17-carboxy-heptadecanoyl]-
- 25 [γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 129)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-K([17-carboxy-heptadecanoyl]-[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 130)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-K([15-carboxy-pentadecanoyl]-[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 131)
- 30 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]GGG-K([17-carboxy-heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 132)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEK[γGlu]GGG-K([17-carboxy-heptadecanoyl]-[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 133)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-K([17-carboxy-
- 35 heptadecanoyl][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 134)

- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-K([15-carboxy-hexadecanoyl])[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 135)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoyl]-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 136)
- 5 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoyl]E-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 137)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu]-G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 138)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-K([17-carboxy-heptadecanoyl]-
- 10 [γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 139)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]ES-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 140)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 141)
- 15 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3]ES-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 142)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 143)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E[Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 144)
- 20 Ac-EF[C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA[Peg3][Peg3]-K([17-carboxy-heptadecanoyl])[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compound 145)

32. A composition comprising a compstatin analogue according to any one of claims 1 to 31, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, in admixture with a carrier.

33. A composition according to claim 32, wherein the composition is a pharmaceutical composition and the carrier is a pharmaceutically acceptable carrier.

30

34. A pharmaceutical composition comprising a compstatin analogue according to any one of claims 1 to 31, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, in admixture with a pharmaceutically acceptable carrier, excipient or vehicle.

35. A compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31 for use in therapy.
- 5 36. A compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31 for use in a method of inhibiting complement activation.
37. The compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, for use according to claim 36, wherein inhibiting complement activation comprises one or more biological activities selected from (1) binding to C3 protein, (2) binding to C3b protein and/or (3) inhibiting the cleavage of native C3 by C3 convertases.
- 10 38. A compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31 for use in a method of prophylaxis or treatment of age-related macular degeneration, Stargardt disease, periodontitis, diabetic retinopathy, glaucoma, uveitis, rheumatoid arthritis, spinal cord injury, stroke, multiple sclerosis, Parkinson's disease, Alzheimer's disease, cancer, and respiratory disorders such as asthma, chronic obstructive pulmonary disease (COPD), allergic inflammation, emphysema, bronchitis, bronchiectasis, cystic fibrosis, tuberculosis, pneumonia, respiratory distress syndrome (RDS - neonatal and adult), rhinitis and sinusitis; bacterial infections such as sepsis, ischemia-reperfusion injury in various tissues, myocardial infarction, anaphylaxis, paroxysmal nocturnal hemoglobinuria, autoimmune hemolytic anemias, psoriasis, hidradenitis suppurativa, myasthenia gravis, systemic lupus erythematosus, CHAPLE syndrome, C3 glomeropathy, IgA nephropathy, atypical hemolytic uremic syndrome, Crohn's disease, ulcerative colitis or antiphospholipid syndrome.
- 15 20 25 39. A compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31 for use in a method of inhibiting complement activation that occurs during cell or organ transplantation.
- 30

40. A method of inhibiting complement activation for treating a subject in need thereof, the method comprising administering to the subject a compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31 thereby to inhibit complement activation in the subject.

5

41. The method of claim 40, wherein the subject has age-related macular degeneration, Stargardt disease, periodontitis, diabetic retinopathy, glaucoma, uveitis, rheumatoid arthritis, spinal cord injury, stroke, multiple sclerosis, Parkinson's disease, Alzheimer's disease, cancer, and respiratory disorders such as asthma, chronic obstructive pulmonary disease (COPD), allergic inflammation, emphysema, bronchitis, bronchiectasis, cystic fibrosis, tuberculosis, pneumonia, respiratory distress syndrome (RDS - neonatal and adult), rhinitis and sinusitis; bacterial infections such as sepsis, ischemia-reperfusion injury in various tissues, myocardial infarction, anaphylaxis, paroxysmal nocturnal hemoglobinuria, autoimmune hemolytic anemias, psoriasis, hidradentitis suppurativa, myasthenia gravis, systemic lupus erythematosus, CHAPLE syndrome, C3 glomeropathy, IgA nephropathy, atypical hemolytic uremic syndrome, Crohn's disease, ulcerative colitis or antiphospholipid syndrome, the method comprising administering to the subject a compstatin analogue according to any one of claims 1 to 30.

20

42. An *ex vivo* method of inhibiting complement activation during extracorporeal shunting of a physiological fluid, the method comprising contacting the physiological fluid with a compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31, thereby inhibiting complement activation.

25

43. Use of a compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31, in the preparation of a medicament for inhibiting complement activation.

30

44. Use of a compstatin analogue, or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof, according to any one of claims 1 to 31 in the preparation of a medicament for the treatment of age-related macular degeneration, Stargardt disease, periodontitis,

diabetic retinopathy, glaucoma, uveitis, rheumatoid arthritis, spinal cord injury, stroke, multiple sclerosis, Parkinson's disease, Alzheimer's disease, cancer, and respiratory disorders such as asthma, chronic obstructive pulmonary disease (COPD), allergic inflammation, emphysema, bronchitis, bronchiectasis, cystic fibrosis, tuberculosis, pneumonia, respiratory distress syndrome (RDS - neonatal and adult), rhinitis and sinusitis; bacterial infections such as sepsis, ischemia-reperfusion injury in various tissues, myocardial infarction, anaphylaxis, paroxysmal nocturnal hemoglobinuria, autoimmune hemolytic anemias, psoriasis, hidradenitis suppurativa, myasthenia gravis, systemic lupus erythematosus, CHAPLE syndrome, C3 glomeropathy, IgA nephropathy, atypical hemolytic uremic syndrome, Crohn's disease, ulcerative colitis or antiphospholipid syndrome.

Bitte beachten Sie, dass angeführte Nichtpatentliteratur (wie z. B. wissenschaftliche oder technische Dokumente) je nach geltendem Recht dem Urheberrechtsschutz und/oder anderen Schutzarten für schriftliche Werke unterliegen könnte. Die Vervielfältigung urheberrechtlich geschützter Texte, ihre Verwendung in anderen elektronischen oder gedruckten Publikationen und ihre Weitergabe an Dritte ist ohne ausdrückliche Zustimmung des Rechtsinhabers nicht gestattet.

Veuillez noter que les ouvrages de la littérature non-brevets qui sont cités, par exemple les documents scientifiques ou techniques, etc., peuvent être protégés par des droits d'auteur et/ou toute autre protection des écrits prévue par les législations applicables. Les textes ainsi protégés ne peuvent être reproduits ni utilisés dans d'autres publications électroniques ou imprimées, ni rediffusés sans l'autorisation expresse du titulaire du droit d'auteur.

Please be aware that cited works of non-patent literature such as scientific or technical documents or the like may be subject to copyright protection and/or any other protection of written works as appropriate based on applicable laws. Copyrighted texts may not be copied or used in other electronic or printed publications or re-distributed without the express permission of the copyright holder.

# TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

De la  
AUTORIDAD DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

|                                                                                                                        |                                                                     |                                                                                                                                   |  |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|
| A:<br><br>MEWBURN ELLIS LLP<br>City Tower<br>40 Basinghall Street<br>Londres<br>Greater London EC2V 5DE<br>ROYAUME UNI |                                                                     | <b>PCT</b><br><br>NOTIFICACIÓN DE TRANSMISIÓN DEL INFORME<br>PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE<br>PATENTABILIDAD<br>(Regla PCT 71.1) |  |
| <div>RECIBIDO<br/>15 MAY 2020<br/>BRISTOL</div>                                                                        |                                                                     | Fecha de envío<br>(día/mes/año) 12.05.2020                                                                                        |  |
| Referencia del expediente del solicitante o del mandatario<br>007441454                                                |                                                                     | <b>NOTIFICACIÓN IMPORTANTE</b>                                                                                                    |  |
| Solicitud internacional N.º<br><br>PCT/EP2019/054685                                                                   | Fecha de presentación internacional (día/mes/año)<br><br>26.02.2019 | Fecha de prioridad (día/mes/año)<br><br>27.02.2018                                                                                |  |
| Solicitante<br>ZEALAND PHARMA A/S                                                                                      |                                                                     |                                                                                                                                   |  |

1. Por la presente, se notifica al solicitante que esta Autoridad de Examen Preliminar Internacional transmite con el presente el informe preliminar internacional sobre patentabilidad y sus anexos, en su caso, establecidos en la solicitud internacional.
2. Una copia del informe y sus anexos, si los hay, se transmiten a la Oficina Internacional para su comunicación a todas las Oficinas elegidas.
3. Cuando lo requiera cualquiera de las Oficinas elegidas, la Oficina internacional preparará una traducción al inglés del informe (pero no de los anexos) y transmitirá dicha traducción a esas Oficinas.

#### 4. RECORDATORIO

El solicitante debe ingresar a la fase nacional antes de cada Oficina elegida mediante la realización de ciertos actos (presentación de traducciones y pago de tarifas nacionales) dentro de los 30 meses a partir de la fecha de prioridad (o más tarde en algunas Oficinas) (Artículo 39(1)) (consulte también el recordatorio enviado por la Oficina Internacional con el Formulario PCT/IB/301).

Cuando una traducción de la solicitud internacional deba entregarse a una Oficina elegida, esa traducción debe contener una traducción de cualquier anexo del informe preliminar internacional sobre patentabilidad. Es responsabilidad del solicitante preparar y proporcionar dicha traducción directamente a cada Oficina elegida interesada.

Para obtener más detalles sobre los límites de tiempo aplicables y los requisitos de los cargos elegidos, consulte el Volumen II de la Guía del Solicitante PCT.

Se llama la atención del solicitante al Artículo 33(5), que establece que los criterios de novedad, actividad inventiva y aplicación industrial descritos en el Artículo 33(2) a (4) simplemente sirven para propósitos de examen preliminar internacional y que "cualquier Estado Contratante puede aplicar criterios adicionales o diferentes para decidir si, en ese Estado, las invenciones reivindicadas son patentables o no" (véase también el Artículo 27(5)). Dichos criterios adicionales pueden relacionarse, por ejemplo, con exenciones de patentabilidad, requisitos para permitir la divulgación, claridad y soporte para las reivindicaciones.

Nombre y dirección postal de la Autoridad de  
Examen Preliminar Internacional



Oficina Europea de Patentes  
D-80298 Múnich  
Tel. +49 89 2399 - 0  
Fax: +49 89 2399 - 4465

Funcionario Autorizado

Papiol Rovira, M

Tel: +49 89 2399-7199



# TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

## PCT

### INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD

(Capítulo II del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes)

(Artículo 36 y Regla 70 del PCT)

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                                                                   |                                                       |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------|
| Referencia del expediente del solicitante o del mandatario<br><b>007441454</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       | <b>PARA CONTINUAR<br/>LA TRAMITACIÓN</b><br>Véase formulario PCT/IPEA/416                                                                                                         |                                                       |
| Solicitud internacional N.º<br><b>PCT/EP2019/054685</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | Fecha de presentación internacional<br>(día/mes/año)<br><b>26.02.2019</b>                                                                                                         | Fecha de prioridad (día/mes/año)<br><b>27.02.2018</b> |
| Clasificación Internacional de Patentes (CIP) o a la vez clasificación nacional e CIP<br><b>INV. C07K708</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                                                                                                                                                                   |                                                       |
| Solicitante<br><b>ZEALAND PHARMA A/S</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                   |                                                       |
| <p>1. El presente informe preliminar internacional sobre patentabilidad, se establece por esta Administración encargada del examen preliminar internacional según el Artículo 35 y se transmite al solicitante conforme al Artículo 36.</p> <p>2. Este INFORME comprende <u>5</u> hojas, incluida la presente hoja de portada.</p> <p>3. Este informe también contiene ANEXOS, que comprenden:</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (remitido al solicitante y a la Oficina Internacional) un total de <u>10</u> hojas. descritas a continuación:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li><input checked="" type="checkbox"/> hojas de la descripción, las reivindicaciones y/o los dibujos que han sido modificadas, y/u hojas que contienen rectificaciones autorizadas por esta Administración, a menos que estas hojas hubieran sido reemplazadas o canceladas, y cualquier escrito de acompañamiento (véase Reglas 46.5, 66.8, 70.16, 91.2 y la Instrucción Administrativa 607 del PCT).</li> <li><input type="checkbox"/> hojas que contienen rectificaciones no tomadas en cuenta por esta Administración porque no estuvieran disponibles en el momento en el que esta Administración comenzó a elaborar este informe, así como los escritos de acompañamiento (Reglas 66.4bis, 70.2.e), 70.16 y 91.2)</li> <li><input type="checkbox"/> hojas de reemplazo y escritos de acompañamiento, que esta Administración considera que, o bien contienen una modificación que se extiende más allá de lo divulgado en la solicitud internacional tal y como fue inicialmente presentada, o bien las hojas de reemplazo no se acompañaron de un escrito indicando la base para la modificación en la solicitud tal y como se presentó, según se indica en el punto 4 del Recuadro I y en el Recuadro Suplementario (véase Regla 70.16.b)).</li> </ul> <p>b. <input type="checkbox"/> (remitido únicamente a la Oficina Internacional) un total de (indicar tipo y número de soporte(s) electrónico(s)), que contienen un listado de secuencias, en formato de archivo de texto según Anexo C/ST.25, como se indica en el Recuadro Suplementario relativo a listas de secuencias (ver párrafo 3ter del Anexo C de las Instrucciones Administrativas).</p> |                                                                                                                                                                                   |                                                       |
| <p>4. El presente informe contiene indicaciones relativas a los puntos siguientes:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li><input checked="" type="checkbox"/> Recuadro I Base de este informe</li> <li><input type="checkbox"/> Recuadro II Prioridad</li> <li><input type="checkbox"/> Recuadro III No formulación de opinión sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial</li> <li><input type="checkbox"/> Recuadro IV Falta de unidad de invención</li> <li><input checked="" type="checkbox"/> Recuadro V Declaración motivada según el Artículo 35(2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración</li> <li><input type="checkbox"/> Recuadro VI Ciertos documentos citados</li> <li><input type="checkbox"/> Recuadro VII Defectos en la solicitud internacional</li> <li><input type="checkbox"/> Recuadro VIII Observaciones relativas a la solicitud internacional</li> </ul>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                                                                                                                                                   |                                                       |
| Fecha de presentación del requerimiento<br><b>23.12.2019</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | Fecha de finalización del presente informe<br><b>12.05.2020</b>                                                                                                                   |                                                       |
| Nombre y dirección postal de la Autoridad de Examen Preliminar Internacional<br><br>Oficina Europea de Patentes<br>D-80298 Múnich<br>Tel. +49 89 2399 - 0<br>Fax: +49 89 2399 - 4465                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | Funcionario autorizado<br><b>Pinheiro Vieira, E</b><br>N.º de teléfono: +49 89 2399-7865<br> |                                                       |

**Recuadro I. Base de este informe**

1. Por lo que respecta al **idioma**, este informe se ha establecido sobre la base:
  - ☒ de la solicitud internacional en el idioma en el cual se depositó
  - ☐ Una traducción de la solicitud internacional, que es el idioma de una traducción suministrada con el propósito de:
    - ☐ búsqueda internacional (según Reglas 12.3.a) y 23.1.b))
    - ☐ publicación de la solicitud internacional (según Regla 12.4.a))
    - ☐ examen preliminar internacional (según Reglas 55.2.a) y/o 55.3.a) y b))
2. Por lo que respecta a los **elementos\*** de la solicitud internacional, esta opinión se ha establecido sobre la base de *(las hojas de reemplazo que hayan sido enviadas a la Oficina Receptora en respuesta a un requerimiento según el Artículo 14 se las denomina en este informe como "inicialmente presentadas" y no se anexan a este informe)*:

**Descripción, Páginas**

1-83 como se presentó originalmente

**Reivindicaciones, Números**

1-44 presentadas con la carta del día 23-12-2019

**Dibujos, Páginas**

1/3-3/3 como se presentaron originalmente

- ☐ un listado de secuencias - consulte el Recuadro Complementario Relacionado con el Listado de Secuencias
3. ☐ Las modificaciones han ocasionado la anulación de:
    - ☐ la descripción, páginas
    - ☐ las reivindicaciones, Nos.
    - ☐ los dibujos, láminas/fig.
    - ☐ el listado de secuencias (*precisar*):
  4. ☐ Esta opinión se ha establecido como si (algunas de) las modificaciones listadas más abajo no se hubieran realizado ya que, o bien se considera que van más allá de la divulgación de la invención tal como fue presentada, o bien no se acompañaron de una carta indicando la base para las modificaciones en la solicitud tal y como se presentó, como se indica en el Recuadro Suplementario (Regla 70.2.c) y c-bis)).
    - ☐ la descripción, páginas
    - ☐ las reivindicaciones, Nos.
    - ☐ los dibujos, hojas/fig.
    - ☐ el listado de secuencias (*precisar*):
  5. ☐ Esta opinión se ha establecido:
    - ☐ tomando en consideración la **rectificación de un error evidente** autorizado por o notificado a esta Administración según la Regla 91 (Reglas 66.1.d-bis) y 70.2.e)).
    - ☐ sin tomar en consideración la **rectificación de un error evidente** autorizado por o notificado a esta Administración según la Regla 91 (Reglas 66.4bis y 70.2.e)).

6. ☒ Por lo que respecta a las búsquedas complementarias (Reglas 66.1ter y 70.2(f)):
- ☒ esta Administración ha realizado una búsqueda complementaria el **29.04.2020** (todos los documentos descubiertos se enumeran en el Recuadro Complementario Relacionado con la Búsqueda Complementaria).
  - ☐ se han recuperado documentos adicionales durante la búsqueda complementaria.
  - ☐ esta Administración no ha realizado búsqueda complementaria por considerar que no sería de utilidad.
7. ☐ El(los) informe(s) de búsqueda internacional suplementario(s) emitido(s) por la(s) Administración(es) ha(n) sido recibido(s) y tomados(s) en consideración para establecer esta opinión (Regla 45bis.8(b) y (c))

\* Si se utiliza el punto 4, algunas o todas estas páginas pueden llevar el sello de "sustituida".

---

**Recuadro V. Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración**

---

1. Declaración

|                            |                      |             |
|----------------------------|----------------------|-------------|
| Novedad (N)                | SÍ: Reivindicaciones | <u>1-44</u> |
|                            | NO: Reivindicaciones |             |
| Actividad inventiva (AI)   | SÍ: Reivindicaciones | <u>1-44</u> |
|                            | NO: Reivindicaciones |             |
| Aplicación industrial (AI) | SÍ: Reivindicaciones | <u>1-44</u> |
|                            | NO: Reivindicaciones |             |

2. Citas y explicaciones (Regla 70.7)

**ver hoja separada**

Re Punto V

1 Documentos citados.

1.1 Se hace referencia a los siguientes documentos:

D1 US 2014/113874 A1 (LAMBRIS JOHN D [US] ET AL) 24 de abril de 2014 (2014-04-24)

D2 EP 2424557 A1 (UNIV PENNSYLVANIA [US]) 7 de marzo de 2012 (2012-03-07)

D3 BELLOWS M L ET AL: "New Compstatin Variants through Two De Novo Protein Design Frameworks (Nuevas variantes de compstatina a través de dos marcos de diseño de proteínas de Novo)",  
BIOPHYSICAL JOURNAL, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 98, no. 10, 19 de mayo de 2010 (2010-05-19), páginas 2337-2346, XP002632554,  
ISSN: 0006-3495, DOI: 10.1016/J.BPJ.2010.01.057 [consultado el 2010-05-18]

D4 WO 2014/078734 A2 (APELLIS PHARMACEUTICALS INC [US]) 22 de mayo de 2014 (2014-05-22)

D5 WO 2014/100407 A1 (UNIV CALIFORNIA [US]; UNIV PRINCETON [US]; UNIV CHIPRE [CY]) 26 de junio de 2014 (2014-06-26) citado en la solicitud

1.2 D1 a D5 divulga análogos de compstatina con Val en la posición 3.

2 Novedad y actividad inventiva (artículo 33 del PCT)

2.1 Ninguno de los documentos citados divulga o sugiere un análogo de compstatina que tenga Ile3 y Glu9. Por lo tanto, se reconoce la novedad (Art. 33(2) del PCT)

2.2 Cualquier documento podría considerarse el documento de la técnica anterior más cercano. Todos divulgan análogos de compstatina capaces de unirse a la proteína C3 e inhibir la activación del complemento.

- 2.3 La sustitución de Val3 por Ile3 conduce a compuestos con mejor solubilidad y mayor actividad. Por lo tanto, el presente problema a resolver puede verse como la provisión de análogos de compstatina que tienen una actividad y solubilidad mejoradas.

El Solicitante resuelve el problema proporcionando los compuestos reivindicados en los que Val3 se reemplaza por Ile3.

El solicitante ha demostrado a través de los ejemplos que el problema planteado ha sido resuelto de forma creíble. Se obtuvo un aumento de la solubilidad, así como una mayor actividad para los compuestos que presentaban la mutación en la posición 3 (ver tablas 1 a 4, 6 y 7). El Solicitante también ha validado la posición 3 mediante la comparación de los cambios de actividad con varios aminoácidos en la posición 3 (ver tabla 4).

Teniendo en cuenta que ninguno de los documentos citados divulga o sugiere Ile3 en la posición 3 además de Glu en la posición 9, una posición considerada conservada e importante para la unión a la proteína C3, y que el Solicitante ha demostrado que dicha posición podría ser modificada por Ile3 sin pérdida de actividad, se considera que el presente conjunto de reivindicaciones presentado es inventivo. Cabe destacar que se acepta una estructura más amplia para el péptido con base en los datos proporcionados y teniendo en cuenta que las posiciones 2, 3, 5, 7, 9, 10 y 12 se conservan.

Por lo tanto, se considera que la materia objeto reivindicada cumple con los requisitos del Art. 33(3) PCT.

- 2.4 Aunque las reivindicaciones 40, 41, 43 y 44 están dirigidas a un procedimiento de tratamiento del cuerpo humano/animal, la búsqueda se ha realizado y se ha basado en los supuestos efectos del compuesto. La patentabilidad, en particular la novedad y la actividad inventiva, de dichas reivindicaciones ha sido evaluada sobre la base de una reivindicación de producto de propósito limitado que tiene en cuenta los supuestos efectos del compuesto.

La patentabilidad puede depender de la formulación de las reivindicaciones. La EPO, por ejemplo, no reconoce como patentables las reivindicaciones del uso de un compuesto en un tratamiento médico, pero puede permitir las reivindicaciones de un producto, en particular sustancias o composiciones para su uso en un primer o posterior tratamiento médico.



City Tower  
40 Basinghall Street  
London EC2V 5DE  
Reino Unido

T +44 (0)20 7776 5300

F +44 (0)330 111 4455

[mewburn.com](http://mewburn.com)

Oficina Europea de Patentes  
Que actúa en calidad de Autoridad de Examen Preliminar Internacional  
D-80298 Múnich  
Alemania

23 de diciembre de 2019

Estimados Señores:

**Solicitud de Patente Internacional No. PCT/EP2019/054685**  
**Solicitante: ZEALAND PHARMA A/S**  
**Nuestra Ref.: GRF/BP7441454**

Esta carta acompaña a la Demanda del Capítulo II presentada en relación con esta solicitud.

1. Tasas

El día de hoy, se han pagado las siguientes tasas en línea:

|                               |             |                      |
|-------------------------------|-------------|----------------------|
| Tasa de Examen Preliminar PCT | Euro        | <b>1830,00</b>       |
| Tasa de Manejo PCT            | Euro        | <b>176,00</b>        |
| TOTAL:                        | <u>Euro</u> | <b><u>2006,0</u></b> |

Si se requieren tasas adicionales para que esta Demanda del Capítulo II se considere presentada, entonces la EPO queda autorizada a deducir dichas tasas del número de cuenta de depósito de mi firma 2805.0013 bajo la referencia SHORTFALL, informándome por escrito que dicha deducción ha sido realizada.

2. Enmiendas

Las reivindicaciones 1 a 44 enmendadas se presentan de conformidad con el Artículo 34 del PCT.

Para comodidad del Examinador, se incluye una versión marcada solo como referencia.

Las reivindicaciones 1 a 4, 10 y 12 a 14 han sido enmendadas para especificar que el residuo presente en la posición X9 es ácido glutámico (E; Glu). La base se encuentra en las versiones originales de tales reivindicaciones. Las reivindicaciones posteriores han sido adaptadas para mantener la coherencia cuando fue necesario.

4. Novedad

Ninguno de los documentos de la técnica anterior citados en el Informe de Búsqueda Internacional o proporcionados con la observación de terceros del 28 de octubre de 2019 describe un análogo de compstatina que tenga I en la posición 3 y E en la posición 9. Por ejemplo, consulte la tabla en la página 3 del "documento # 9" proporcionado con la observación de terceros.

## 5. Actividad Inventiva

La técnica anterior no proporciona ningún incentivo para que el experto en la técnica combine I (Ile) en la posición 3 con E (Glu) en la posición 9 como se reivindica actualmente.

La única referencia que menciona I en la posición 3 es WO 99/13899 ("cita 1" de la observación de terceros). Cabe destacar que ese documento no contiene ejemplos de moléculas que tengan I en la posición 3, por lo que el lector no sabría si tal sustitución era técnicamente viable.

En la fórmula genérica de las páginas 15-16, X9 se enumera como "cualquier aminoácido, preferentemente His o Ala". Parece que solo H (His; el residuo de compstatina original) se ejemplifica en esa posición.

La presente solicitud contiene datos que muestran que la combinación de I3 y E9 es particularmente ventajosa. Por ejemplo, la siguiente tabla muestra datos para compuestos que tienen secuencias de estructura similar, presentados en orden de clasificación según su actividad inhibidora del complemento (de baja a alta). Todos los compuestos que tienen I3 tienen una mayor actividad inhibidora (es decir, menor IC50) que los que tienen V3, y los que tienen la combinación de I3 y E9 tienen la mayor actividad inhibidora de todos.

| Compuesto |    | 1 | 2    | 3 | 4 | 5 | 6 | 7 | 8 | 9 | 10 | 11 | 12   | 13 |                 | CP<br>hemólisis<br>IC50 (nM) |
|-----------|----|---|------|---|---|---|---|---|---|---|----|----|------|----|-----------------|------------------------------|
| E         | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | A | H  | S  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | >1000                        |
| F         | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | E | H  | S  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 540                          |
| A         | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | E | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 350                          |
| 4W9A      | Ac | I | C(1) | V | W | Q | D | W | G | A | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 250                          |
| 1         | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | A | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 150                          |
| 19        | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | A | H  | S  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 140                          |
| 2         | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | E | H  | R  | C(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 94                           |
| 20        | Ac | I | C(1) | I | W | Q | D | W | G | E | H  | S  | O(1) | T  | NH <sub>2</sub> | 59                           |

Claramente, la combinación de I3 y E9 no está sugida en el documento WO 99/13899 ("cita 1"). Ninguno de los otros documentos apunta al uso de E (Glu) en la posición 9 en absoluto, mucho menos en combinación con I3. (Una vez más, consulte la tabla de resumen proporcionada en el "documento #9" de la observación de terceros). Por lo tanto, es imposible llegar a la combinación reivindicada a partir de los documentos citados.

Hacemos notar que las citas 1 a 7 proporcionadas por el tercero aparentemente provienen del mismo grupo de investigación (o al menos comparten un inventor / autor común de John D Lambris). A pesar de que WO 99/13899 ("cita 1") se publicó ya en marzo de 1999, ninguno de los documentos posteriores parece haber adoptado la sugerencia de usar Ile (o cualquier otro residuo) en la posición 3 en lugar de Val. Más bien, Val3 parece considerarse esencial en todas esas divulgaciones. Consulte la reivindicación 1 de cada una de las citas 4-7, por ejemplo. Lo mismo se aplica a la cita 8, de un grupo diferente. Esto sugiere fuertemente que la invención reivindicada no es obvia.

Por lo tanto, la presente solicitud muestra por primera vez que los análogos de compstatina que tienen los residuos I3 y E9 pueden ser muy activos, e incluso superiores a los compuestos que tienen residuos usados con mayor frecuencia en esas posiciones en una estructura peptídica similar. Esto no podría haberse predicho a partir de la técnica anterior.

Por lo tanto, creemos que las reivindicaciones enmendadas son novedosas e inventivas.

#### 6. Comentarios de Conclusión

De manera respetuosa, se solicita que se emita un Informe Preliminar Internacional sobre Patentabilidad (IPRP/Capítulo II) en el que se indique que todas las reivindicaciones son novedosas, inventivas y tienen aplicación industrial.

En caso de que el Examinador considere que quedan objeciones pendientes, solicitamos que se emita una nueva opinión por escrito lo antes posible, en vista del período limitado permitido para el procedimiento IPE.

Atentamente,

/GRAHAM R FORREST/

Graham R Forrest  
Agente Designado  
Por y en nombre de Mewburn Ellis LLP (Asociación No. 929)  
*graham.forrest@mewburn.com*

Para ponerse en contacto conmigo personalmente  
por favor llame al + 44 117 945 1234.

**Reivindicaciones:**

1. Un análogo de compstatina representado por la fórmula:

5 Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-X8-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Fórmula I)

en la que:

Y1 es hidrógeno, acetilo o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

10 X1 es I, Y, F o Sar;

X4 es W, F, V, Y, 1-Me-Trp, D-Trp, N-Me-Trp, 1-For-Trp, 1-Nal, 2-Nal, 5-Me-Trp, Bpa o 2-Igl;

X6 es E, K o D;

15

X8 es G o Sar;

X11 es R, S o K;

20 X13 es T, S, E, F, H, K, Sar, G, I, D, N-Me-Ile o N-Me-Thr;

Y2 es  $\text{NH}_2$ , OH o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G,

25 L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon\text{Lys}$ ,  $\gamma\text{Glu}$ ,  $\beta\text{Asp}$ , o  $\beta\text{Ala}$ , o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3, Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos; y

R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, o  $\beta$ Ala, o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3, Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

- 5 en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

y en el que el análogo de compstatina opcionalmente tiene un grupo lipófilo  $\Phi$  ligado covalentemente a la cadena lateral de uno o más residuos de aminoácidos;

10

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un análogo de compstatina representado por la fórmula:

15 Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-X8-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Fórmula II)

en la que:

Y1 es hidrógeno, acetilo, o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

20

X1 es I, Y, F o Sar;

X4 es W, V, Y, 2-Nal, 1-Nal o 1-Me-Trp;

25 X6 es E o D;

X8 es G o Sar;

X11 es R, S o K;

X13 es T, S, E, I, Sar, K, G o N-Me-Ile;

Y2 es NH<sub>2</sub>, OH o un grupo lipófilo Φ;

5

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de los mismos, o Peg3, Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos; y

10 R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;  
en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

15

y en el que el análogo de compstatina opcionalmente tiene un grupo lipófilo Φ ligado covalentemente a la cadena lateral de uno o más aminoácidos;

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

20

3. Un análogo de compstatina representado por la fórmula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Fórmula III)

25 en la que:

Y1 es hidrógeno, acetilo o un grupo lipófilo Φ;

X1 es I, Y, F o Sar;

X4 es W, V, Y, 1-Nal, 2-Nal o 1-Me-Trp;

X6 es E o D;

5

X11 es R, S o K;

X13 es T, I, S, E, K o Sar;

10 Y2 es NH<sub>2</sub>, OH o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, o  $\beta$ Ala, o una forma D correspondiente de los mismos, o Peg3, Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos; y

15

R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, o  $\beta$ Ala, o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

20 en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

y en el que el análogo de compstatina opcionalmente tiene un grupo lipófilo  $\Phi$  ligado covalentemente a la cadena lateral de uno o más aminoácidos;

25

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

4. Un análogo de compstatina representado por la fórmula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Fórmula IV)

en la que:

5 Y1 es hidrógeno, acetilo o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

X1 es I, Y, F o Sar;

X4 es W, V, Y, 1-Nal, 2-Nal o 1-Me-Trp;

10

X6 es E o D;

X13 es T, S, E o Sar;

15 Y2 es  $\text{NH}_2$ , OH o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon\text{Lys}$ ,  $\gamma\text{Glu}$ ,  $\beta\text{Asp}$ , o  $\beta\text{Ala}$ , o una forma D correspondiente de los mismos, o Peg3, Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos; y

20

R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon\text{Lys}$ ,  $\gamma\text{Glu}$ ,  $\beta\text{Asp}$ , o  $\beta\text{Ala}$ , o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

25 en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

y en el que el análogo de compstatina opcionalmente tiene un grupo lipófilo  $\Phi$  ligado covalentemente a la cadena lateral de uno o más aminoácidos;

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

5. Un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4  
5 que comprende al menos un grupo lipófilo  $\Phi$ .
6. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 5 en el que Y1 o Y2 es un grupo lipófilo  $\Phi$ .
- 10 7. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 5 o reivindicación 6 que comprende un grupo lipófilo  $\Phi$  ligado a la cadena lateral de un residuo de aminoácido en la posición X1, X11 o X13, o un residuo de aminoácido en R1 o R2.
8. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 7 en el que dicho residuo de  
15 aminoácido es un residuo de lisina.
9. Un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 que no comprende un grupo lipófilo  $\Phi$ .
- 20 10. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 1, representado por la fórmula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Fórmula V)

25 en la que:

Y1 es hidrógeno o acetilo;

X1 es Y o F;

X4 es W, Y, 1-Me-Trp;

X6 es E o D;

5

X13 es T, E o Sar;

Y2 es NH<sub>2</sub> u OH;

10 R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de los mismos, o Peg3, Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos; y

15 R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

20

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

11. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 10, representado por la fórmula:

25

Y1-R1-X1-C-I-[1-Me-Trp]-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Fórmula VI)

en la que:

Y1 es hidrógeno o acetilo;

X1 es Y o F;

5 X6 es E o D;

X13 es T, E o Sar;

Y2 es NH<sub>2</sub> u OH;

10

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de los mismos, o Peg3, Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos; y

15 R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

20 en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

12. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 1, representado por la  
25 fórmula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-X8-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Fórmula VIII)

en la que:

Y1 es hidrógeno, acetilo o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

X1 es I, Y, F o Sar;

5

X4 es W, V, Y, 2-Nal, 1-Nal o 1-Me-Trp;

X6 es E o D;

10 X8 es G o Sar;

X11 es R, S o K\*;

X13 es T, S, E, I, Sar, K, G o N-Me-Ile;

15

Y2 es  $\text{NH}_2$ , OH o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V o Sar, o una forma D correspondiente de los mismos;

20

R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon\text{Lys}$ ,  $\gamma\text{Glu}$ ,  $\beta\text{Asp}$ , o  $\beta\text{Ala}$ , o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

25 en el que \* indica que el residuo de aminoácido lleva un grupo lipófilo  $\Phi$  ligado covalentemente a su cadena lateral;

en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

y en el que el análogo de compstatina comprende al menos un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

5

13. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 11, representado por la fórmula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-X11-C-X13-R2-Y2 (Fórmula IX)

10

en la que:

Y1 es hidrógeno, acetilo, o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

15 X1 es I, Y, F o Sar;

X4 es W, V, Y, 1-Nal, 2-Nal o 1-Me-Trp;

X6 es E o D;

20

X11 es R, S o K\*;

X13 es T, I, S, E, K o Sar;

25 Y2 es NH<sub>2</sub>, OH o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V o Sar, o una forma D correspondiente de los mismos; y

R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\* F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar,  $\epsilon$ Lys,  $\gamma$ Glu,  $\beta$ Asp, o  $\beta$ Ala, o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

- 5 en el que \* indica que el residuo de aminoácido lleva un grupo lipófilo  $\Phi$  unido covalentemente a su cadena lateral;

en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

10

y en el que el análogo de compstatina comprende al menos un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

- 15 14. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 12 o reivindicación 13, representado por la fórmula:

Y1-R1-X1-C-I-X4-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Fórmula X)

- 20 en la que:

Y1 es hidrógeno, acetilo o un grupo lipófilo  $\Phi$ ;

X1 es I, Y, F o Sar;

25

X4 es W, V, 1-Nal, 2-Nal o 1-Me-Trp;

X6 es E o D;

X13 es T, S, E o Sar;

Y2 es NH<sub>2</sub>, OH o un grupo lipófilo Φ;

- 5 R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V o Sar, o una forma D correspondiente de los mismos;

- R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de  
10 los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

en el que \* indica que el residuo de aminoácido lleva un grupo lipófilo Φ unido covalentemente a su cadena lateral de aminoácido;

- 15 en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

y en el que el análogo de compstatina comprende al menos un grupo lipófilo Φ, por ejemplo, exactamente un grupo lipófilo Φ;

20

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

15. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 14, representado por la fórmula:

25

Y1-R1-X1-C-I-[1-Me-Trp]-Q-X6-W-G-E-H-R-C-X13-R2-Y2 (Fórmula XI)

en la que:

Y1 es hidrógeno o acetilo;

X1 es Y o F;

5 X6 es E o D;

X13 es T, E o Sar;

Y2 es NH<sub>2</sub> u OH;

10

R1 está ausente o es una secuencia de 1 a 6 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\*, F, P, S, T, W, Y, R, V o Sar, o una forma D correspondiente de los mismos;

15 R2 está ausente o es una secuencia de 1 a 8 residuos de aminoácidos seleccionados de A, E, G, L, K, K\* F, P, S, T, W, Y, R, V, Sar, εLys, γGlu, βAsp, o βAla, o una forma D correspondiente de los mismos; o Peg3 o Peg4, o 8-aminooctanoílo, o derivados de los mismos;

en el que \* indica que el residuo de aminoácido lleva un grupo lipófilo Φ unido covalentemente a su cadena lateral;

20

en el que el análogo de compstatina tiene un enlace disulfuro entre los residuos de cisteína en las posiciones 2 y 12;

25 y en el que el análogo de compstatina comprende al menos un grupo lipófilo Φ, por ejemplo, exactamente un grupo lipófilo Φ;

o una sal y/o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

16. Un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en el que la porción de péptido de 13-mero (X1-X13) del análogo de compstatina tiene una secuencia seleccionada de:

- 5 [Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];  
[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;  
[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)T;  
[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar];  
[Sar]C(1)IWQDWGEHRC(1)T;
- 10 FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar];  
FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)T;  
FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHKC(1)[Sar];  
FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];  
FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)E;
- 15 FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)S;  
FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;  
FC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar];  
FC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)T;  
FC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)T;
- 20 FC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar];  
FC(1)IWQDWGEHRC(1)T;  
IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];  
IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;  
IC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)[Sar];
- 25 IC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar];  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)E;  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)S;  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)T;  
IC(1)IWQDWGEHSC(1)T;

IC(1)IWQEWGEHRC(1)T;

IC(1)IWQKWGEHRC(1)T;

YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar];

YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T;

5 YC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar];

YC(1)I[2NaI]QDWGEHRC(1)T;

YC(1)IWQDWGEHRC(1)T;

YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH[K\*]C(1)[Sar]; y

YC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar].

10

17. Un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en el que R1 tiene una secuencia seleccionada de:

{d}Y, EGSE, AGSE, SASE, EYSE, GSE, ASE, ESSA, KGSA, AKGE, ASGE, ASSE, ASES, GSAE,  
 15 ESSE, ESGA, SEG, GES, ESS, EGSA, ESE, EGE, ESA, SAE, SGA, YLEA, GSA, KEK, EKG,  
 ES, AE, TE, KE, GE, FE, YE, AS, SE, RS, SR, SA, GE, Y, S y E.

18. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 17 que comprende un grupo lipófilo  $\Phi$  ligado covalentemente a una cadena lateral de aminoácido de R1.

20

19. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 18 en el que R1 tiene la secuencia K\*GSA.

20. Un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones  
 25 precedentes en el que R2 tiene una secuencia seleccionada de:

EGASGSG, EGAGSG, EGASAG, EGAGAG, EGESGSG, EGE GSG, EGESAG, EGEGAG,  
 EK[ $\gamma$ Glu]AK, EK[ $\gamma$ Glu]A, EGE G G, EGAGG, EGE SS, GAESK, EGAK, EGEK, EGG, EGK, EGKK,  
 EGS, EK, EGA, EGAK, EK[ $\gamma$ Glu], EK[ $\gamma$ Glu]-K, EGE[Peg3], EGE[Peg3]-K, EGE[Peg3][Peg3],

EGE[Peg3][Peg3]-K, EGE[Peg3][Peg3][Peg3], EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-K GESESE, GAESES, EGESES, EGESESK, EGE[Peg3]-ES, EGE[Peg3]-ESK, GESESE, EGE-[8-aminooctanoil], EGE-[8-aminooctanoil]-K, EGE-[8-aminooctanoil]-EK, EGE<sup>3</sup>GGG, EGE<sup>3</sup>GGGK, EK[γGlu]GGG, EK[γGlu]GGGK, EGE-[8-aminooctanoil]-E, E[Peg3][Peg3], E[Peg3][Peg3]-K, EA[Peg3][Peg3],  
 5 EA[Peg3][Peg3]-K, GAES, EYGS, EGYA, EAGS, EAKS, EKSA, ESGA, EGGS, EGGA, ESSG, ESAG, GEES, AEES, ESEG, AEGS, ESGS, SEGA, SEG, EGK,ESG, EAG, GAE, EGEA, EGE, EA, E, S, GE, GEK, EG, EA, EKE o EKP.

21. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 20 que comprende un grupo  
 10 lipófilo Φ ligado covalentemente a una cadena lateral de aminoácido de R2.

22. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 21 en el que R2 tiene la secuencia EK[γGlu]AK\*, EGKK\*, EK[γGlu]K\*, EGE[Peg3]-K\*, EGESESK\*, EGE[Peg3]-ESK\*, EGE-[8-aminooctanoil]-K\*, EGE-[8-aminooctanoil]-EK\*, EGE<sup>3</sup>GGGK\*, EK[γGlu]GGGK\*,  
 15 EGE[Peg3][Peg3]-K\*, EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-K\*, E[Peg3][Peg3]-K\*, EA[Peg3][Peg3]-K\*, GAESK\*, EGAk\*, EGEK\*, EGK\* EGE[Peg3]-ESK\*, GESESEK\*, GEK\* o EK\*.

23. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende una secuencia seleccionada de:

20 IC(1)IWQDWGEHRC(1)T

ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T

IC(1)I[1MeTrp]QDWGEHRC(1)T

IC(1)IWQKWGEHRC(1)T

25 YC(1)IWQDWGEHRC(1)T

ESSAYC(1)IWQDWGEHRC(1)T

[Sar]C(1)IWQDWGEHRC(1)T

IC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]

ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES

IC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES  
IC(1)IWQEWGEHRC(1)T  
IC(1)IWQDWGEHSC(1)T  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)S  
5 IC(1)IWQDWGEHRC(1)E  
FC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)TE  
10 IC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE  
EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E  
EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T  
15 SEIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA  
EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE  
EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE  
EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE  
ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE  
20 KEKIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKE  
EKGIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKP  
IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGK  
GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E  
SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E  
25 SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG  
FC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAE  
EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]EGE  
EGSAFC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E  
EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E

HOJA MODIFICADA

EGSAIC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 IC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 5 EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE  
 EGSAFC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TE  
 EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE  
 EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE  
 10 EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE  
 EGSAFC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TE  
 FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 FC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 15 FC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 YC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES  
 YC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES  
 YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEAGS  
 20 YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TESGA  
 EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E  
 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES  
 {d}YFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES  
 25 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]GAES  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]EA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TEA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E

HOJA MODIFICADA

- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E  
 EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA  
 5 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)SEA  
 EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)ES  
 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 GEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA  
 10 GE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA  
 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)TEA  
 SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA  
 {d}Y[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA  
 15 24. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 1 que es:  
 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 2)  
 Ac-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 3)  
 Ac-IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 4)  
 Ac-IC(1)IWQKWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 7)  
 20 Ac-YC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 9)  
 Ac-ESSAYC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 10)  
 Ac-[Sar]C(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 11)  
 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 13)  
 Ac-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 14)  
 25 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 15)  
 Ac-IC(1)IWQEWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 16)  
 Ac-IC(1)IWQDWGEHSC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 20)  
 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)S-NH<sub>2</sub> (Compuesto 21)  
 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 22)

- Ac-FC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 23)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 24)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 25)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 26)
- 5 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 27)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 28)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 29)
- Ac-EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 30)
- Ac-ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)T-NH<sub>2</sub> (Compuesto 31)
- 10 Ac-SEIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 32)
- Ac-EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 33)
- Ac-EIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 34)
- Ac-EGEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 35)
- Ac-ESEIC(1)IWQDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 36)
- 15 Ac-KEKIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 37)
- Ac-EKGIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEKP-NH<sub>2</sub> (Compuesto 38)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGK-NH<sub>2</sub> (Compuesto 39)
- Ac-GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 40)
- Ac-SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 41)
- 20 Ac-SAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-NH<sub>2</sub> (Compuesto 42)
- Ac-FC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 43)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]EGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 44)
- Ac-EGSAFC(1)IWQDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 45)
- Ac-EGSAIC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 49)
- 25 Ac-EGSAIC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 50)
- Ac-IC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 51)
- Ac-IC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 52)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 53)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 54)

- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 55)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 56)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 57)
- Ac-EGSAFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 58)
- 5 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 59)
- Ac-EGSAFC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 60)
- Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 61)
- Ac-YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 62)
- Ac-FC(1)I[1-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 63)
- 10 Ac-FC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 64)
- Ac-YC(1)I[2-Nal]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 65)
- Ac-YC(1)IWQDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 66)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 67)
- Ac-YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEAGS-NH<sub>2</sub> (Compuesto 68)
- 15 Ac-YC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TESGA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 69)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 70)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 71)
- Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 72)
- H-{d}YFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TGAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 73)
- 20 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]GAES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 74)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 75)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 76)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 77)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 78)
- 25 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 79)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 80)
- Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 81)
- Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 82)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 83)

- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)SEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 84)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)ES-NH<sub>2</sub> (Compuesto 85)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHKC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 86)
- Ac-GEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 87)
- 5 Ac-GE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 88)
- Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 89)
- Ac-SE[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 90)
- H-{d}Y[Sar]C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEA-NH<sub>2</sub> (Compuesto 91)
- 10 25. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende una secuencia seleccionada de:

- [K\*]GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE (Compuesto 100)
- ASGEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*] (Compuesto 113)
- 15 EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-[K\*] (Compuesto 134)
- EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*] (Compuesto 101)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH[K\*]C(1)[Sar]E (Compuesto 103)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EG-[K\*] (Compuesto 104)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*] (Compuesto 109)
- 20 EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-[K\*] (Compuesto 110)
- EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]-[K\*] (Compuesto 111)
- FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES[K\*] (Compuesto 102)
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*] (Compuesto 92)
- IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-[K\*] (Compuesto 94)
- 25 SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-[K\*] (Compuesto 105)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*] (Compuesto 119)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 123)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGEGGG-[K\*] (Compuesto 129)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]-[K\*] (Compuesto 138)

- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]ES-[K\*] (Compuesto 140)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 127)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-[K\*] (Compuesto 139)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]GGG-[K\*] (Compuesto 132)
- 5 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE-[8-aminooctanoil]-[K\*] (Compuesto 136)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE-[8-aminooctanoil]-E-[K\*] (Compuesto 137)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-[K\*] (Compuesto 130)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3]ES-[K\*] (Compuesto 142)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 126)
- 10 SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEK[γGlu]GGG-[K\*] (Compuesto 133)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-[K\*] (Compuesto 135)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*] (Compuesto 120)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][K\*] (Compuesto 124)
- SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*] (Compuesto 112)
- 15 SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 117)
- SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*] (Compuesto 114)
- SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar]EK[γGlu]A[K\*] (Compuesto 121)
- SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA[K\*] (Compuesto 122)
- SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 125)
- 20 EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E (Compuesto 107)
- ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE (Compuesto 99)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 143)
- SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 144)
- EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA[Peg3][Peg3]-[K\*] (Compuesto 145)

- 25
26. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 25 que comprende una secuencia seleccionada de:

Ac-[K\*]GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 100)

- Ac-ASGEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*]-[NH<sub>2</sub>] (Compuesto 113)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-[K\*]-[NH<sub>2</sub>] (Compuesto 134)
- Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*]-[NH<sub>2</sub>] (Compuesto 101)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH[K\*]C(1)[Sar]E-[NH<sub>2</sub>] (Compuesto 103)
- 5 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 104)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 109)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 110)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 111)
- Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 102)
- 10 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 92,93, 95. 96, 98)
- Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 94, 97)
- Ac-SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 105, 106)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 119)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 123)
- 15 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGEGGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 129)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 138)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]ES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 140)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 127, 128)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 139, 141)
- 20 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]GGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 132)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoil]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 136)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoil]E-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 137)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 130, 131)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3]ES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 142)
- 25 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 126)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEK[γGlu]GGG-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 133)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 135)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 120)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 124)

- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 112, 118)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 117)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 114, 115, 116)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar]EK[γGlu]A-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 121)
- 5 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 122)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 125)
- Φ-EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 107, 108)
- Φ-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 99)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 143)
- 10 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 144)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA[Peg3][Peg3]-[K\*]-NH<sub>2</sub> (Compuesto 145)

27. Un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, 12 a 23, 25 o 26 que comprende un grupo lipófilo Φ, y en el que el grupo lipófilo Φ es Z<sup>1</sup>- o Z<sup>1</sup>-Z<sup>2</sup>-  
 15 ; en el que

Z<sup>1</sup> es A–alquileo C<sub>12-22</sub>–(CO)–;

en el que A es H o –COOH, y en el que el alquileo puede ser lineal o ramificado y puede ser saturado o insaturado, y opcionalmente puede incorporar una fracción de fenileno o piperazinileno  
 20 en su longitud; y

Z<sup>2</sup> es una secuencia de 1 a 6 residuos de los compuestos seleccionados de γ-Glu, E, K, Orn, S, T, A, β-Ala, G, P, V, L, I, Y, Q, N, Dapa, Gaba, o Aib, o una forma D correspondiente de los mismos, 5-aminopentanoílo, 6-aminohexanoílo, 7-aminoheptanoílo, 8-aminooctanoílo, 9-  
 25 aminononanoílo, y 10-aminodecanoílo, ácido 8-amino-3,6-dioxaoctanoico (Peg3), ácido 11-amino-3,6,9-trioxaundecanoico (Peg4) y ácido (piperazina-1-il)-carboxílico.

28. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 27 en el que Z<sup>1</sup> se selecciona de:

Dodecanoílo, es decir,  $\text{H}-(\text{CH}_2)_{11}-(\text{CO})-$ ;

Tetradecanoílo, es decir,  $\text{H}-(\text{CH}_2)_{13}-(\text{CO})-$ ;

Hexadecanoílo, es decir,  $\text{H}-(\text{CH}_2)_{15}-(\text{CO})-$ ;

5 13-carboxitridecanoílo, es decir,  $\text{HOOC}-(\text{CH}_2)_{12}-(\text{CO})-$ ;

15-carboxipentadecanoílo, es decir,  $\text{HOOC}-(\text{CH}_2)_{14}-(\text{CO})-$ ;

17-carboxiheptadecanoílo, es decir,  $\text{HOOC}-(\text{CH}_2)_{16}-(\text{CO})-$ ;

19-carboxinonadecanoílo, es decir,  $\text{HOOC}-(\text{CH}_2)_{18}-(\text{CO})-$ ; o

21-carboxiheneicosanoílo, es decir,  $\text{HOOC}-(\text{CH}_2)_{20}-(\text{CO})-$

10

29. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 27 o reivindicación 28 en el que  $\text{Z}^2$  se selecciona de:

[ $\gamma$ Glu],

[ $\gamma$ Glu][Peg3][Peg3]-;

15 [(Piperazina-1-il)-acetilo][Peg3][Peg3];

[ $\gamma$ Glu]G[ $\gamma$ Glu];

[ $\gamma$ Glu]K[ $\gamma$ Glu];

[ $\gamma$ Glu]KG[ $\gamma$ Glu]; o

[ $\gamma$ Glu]G[Peg3][ $\gamma$ Glu][Peg3].

20 Por ejemplo,  $\text{Z}^2$  puede ser, o puede comprender:

30. Un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 27 a 29 en el que  $\text{Z}^1$ - o  $\text{Z}^1\text{-Z}^2$ - se selecciona de:

15-carboxi-pentadecanoílo;

25 15-carboxi-pentadecanoil[ $\gamma$ Glu]-,

15-carboxi-pentadecanoil[ $\gamma$ Glu][Peg3][Peg3]-;

19-carboxi-nonadecanoil[ $\gamma$ Glu][Peg3][Peg3]-;

15-carboxi-pentadecanoil-[(Piperazina-1-il)-acetilo][Peg3][Peg3];

17-carboxi-heptadecanoil[ $\gamma$ Glu]G[ $\gamma$ Glu];

17-carboxi-heptadecanoil[γGlu]K[γGlu];  
 17-carboxi-heptadecanoil[γGlu]KG[γGlu];  
 17-carboxi-heptadecanoil[γGlu]G(Peg3)[γGlu]-(Peg3);  
 15-carboxi-hexadecanoil[γGlu]G[γGlu];  
 5 17-carboxi-heptadecanoilo;  
 17-carboxi-heptadecanoil[γGlu]]  
 19-carboxi-nonadecanoil[γGlu]G[γGlu];y  
 17-carboxi-heptadecanoil[γGlu][Peg3][Peg3].

10 31. Un análogo de compstatina de acuerdo con la reivindicación 1 que es:

Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 92)

Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub>  
 (Compuesto 93)

15 Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-K([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub>  
 (Compuesto 94)

Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K((15-carboxi-pentadecanoil)-[(Piperazina-1-il)-  
 acetilo][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 95)

Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub>

20 (Compuesto 96)

Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub>  
 (Compuesto 97)

Ac-IC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([19-carboxi-nonadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub>  
 (Compuesto 98)

25 [15-Carboxi-pentadecanoil]-ESSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub> (Compuesto 99)

Ac-[K([15-carboxi-pentadecanoil]-[γGlu][Peg3][Peg3])]GSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEGE-NH<sub>2</sub>  
 (Compuesto 100)

Ac-EGSAIC(1)IWQDWGEHRC(1)TEG-K([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto  
 101)

- Ac-FC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-K([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 102)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEH-K([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-C(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 103)
- 5 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EG-K([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 104)
- Ac-SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]KG[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 105)
- Ac-SAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 106)
- 10 [15-Carboxi-pentadecanoil]-EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 107)
- [17-Carboxi-heptadecanoil]-EGSEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]E-NH<sub>2</sub> (Compuesto 108)
- 15 Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 109)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 110)
- Ac-EGSAYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu][Peg3][Peg3]))-NH<sub>2</sub> (Compuesto 111)
- 20 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[γGlu]))-NH<sub>2</sub> (Compuesto 112)
- Ac-ASGEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 113)
- 25 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 114)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGK-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 115)

- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-K[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 116)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 117)
- 5 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 118)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 119)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 120)
- 10 Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEW[Sar]EHRC(1)[Sar]EK[γGlu]A-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[Peg3][γGlu]-[Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 121)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGA-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]-G[Peg3][γGlu][Peg3])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 122)
- 15 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 123)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 124)
- Ac-SEYC(1)I[1-Me-Trp]QEWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 125)
- 20 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 126)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K]([15-carboxi-pentadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 127)
- 25 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3]-[K]([19-carboxi-nonadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 128)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGEGGG-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 129)

- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-K([17-carboxi-heptadecanoil]-[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 130)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGEGGG-K([15-carboxi-pentadecanoil]-[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 131)
- 5 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EK[γGlu]GGG-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 132)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEK[γGlu]GGG-K([17-carboxi-heptadecanoil]-[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 133)
- Ac-EFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)EGE-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub>
- 10 (Compuesto 134)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TGAES-K([15-carboxi-hexadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 135)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoil]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 136)
- 15 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[8-aminooctanoil]E-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 137)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 138)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-K([17-carboxi-heptadecanoil]-[γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 139)
- 20 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3]ES-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 140)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGESES-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 141)
- 25 Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)TEGE[Peg3]ES-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 142)
- Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EGE[Peg3][Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 143)

Ac-SEFC(1)I[1-Me-Trp]QDW[Sar]EHRC(1)[Sar]E[Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 144)

Ac-EF[C(1)I[1-Me-Trp]QDWGEHRC(1)[Sar]EA[Peg3][Peg3]-K([17-carboxi-heptadecanoil][γGlu]G[γGlu])-NH<sub>2</sub> (Compuesto 145)

5

32. Una composición que comprende un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, en mezcla con un portador.

10 33. Una composición de acuerdo con la reivindicación 32, en la que la composición es una composición farmacéutica y el portador es un portador farmacéuticamente aceptable.

34. Una composición farmacéutica que comprende un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31, o una sal o solvato farmacéuticamente  
15 aceptable del mismo, en mezcla con un portador, excipiente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

35. Un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31 para su uso en terapia.

20

36. Un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31 para su uso en un procedimiento de inhibición de activación del complemento.

25 37. El análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, para su uso de acuerdo con la reivindicación 36, en el que inhibir la activación del complemento comprende una o más actividades biológicas seleccionadas de (1) unión a proteína C3, (2) unir a proteína C3b y/o (3) inhibición de la división de C3 nativo mediante convertasas C3.

38. Un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31 para su uso en un procedimiento de profilaxis o tratamiento de la degeneración macular relacionada con la edad, enfermedad de Stargardt, periodontitis, retinopatía diabética, glaucoma, uveítis, artritis reumatoide, lesión de la médula espinal, apoplejía, esclerosis múltiple, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Alzheimer, cáncer, y trastornos respiratorios tales como asma, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (COPD), inflamación alérgica, enfisema, bronquitis, bronquiectasias, fibrosis quística, tuberculosis, neumonía, síndrome de dificultad respiratoria (RDS - neonatal y adulto), rinitis y sinusitis; infecciones bacterianas tales como septicemia, lesión por isquemia-reperfusión en varios tejidos., infarto de miocardio, anafilaxia, hemoglobinuria paroxística nocturna, anemias hemolíticas autoinmunitarias, soriasis, hidradenitis supurativa, miastenia gravis, lupus eritematoso sistémico, síndrome de CHAPLE, glomerulopatía C3, nefropatía por IgA, síndrome urémico hemolítico atípico, enfermedad de Crohn, colitis ulcerosa o síndrome antifosfolípido.
39. Un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31 para su uso en un procedimiento de inhibición de la activación del complemento que se produce durante trasplante de células u órganos.
40. Un procedimiento de inhibición de la activación del complemento para tratamiento de un sujeto en necesidad del mismo, el procedimiento comprende administrar al sujeto un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31 para inhibir de esta manera la activación del complemento en el sujeto.
41. El procedimiento de la reivindicación 40, en el que el sujeto tiene degeneración macular relacionada con la edad, enfermedad de Stargardt, periodontitis, retinopatía diabética, glaucoma, uveítis, artritis reumatoide, lesión de la médula espinal, apoplejía, esclerosis múltiple, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Alzheimer, cáncer, y trastornos respiratorios tales como asma,

enfermedad pulmonar obstructiva crónica (COPD), inflamación alérgica, enfisema, bronquitis, bronquiectasias, fibrosis quística, tuberculosis, neumonía, síndrome de dificultad respiratoria (RDS - neonatal y adulto), rinitis y sinusitis; infecciones bacterianas tales como septicemia, lesión por isquemia-reperfusión en varios tejidos., infarto de miocardio, anafilaxia, hemoglobinuria

5 paroxística nocturna, anemias hemolíticas autoinmunitarias, soriasis, hidradenitis supurativa, miastenia gravis, lupus eritematoso sistémico, síndrome de CHAPLE, glomerulopatía C3, nefropatía por IgA, síndrome urémico hemolítico atípico, enfermedad de Crohn, colitis ulcerosa o síndrome antifosfolípido, el procedimiento comprende administrar al sujeto un análogo de compstatina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 30,

10

42. Un procedimiento *ex vivo* de inhibición de la activación del complemento durante la derivación extracorpórea de un fluido fisiológico, el procedimiento comprende poner en contacto el fluido fisiológico con un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31, inhibiendo

15 de esta manera la activación del complemento.

43. Uso de un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31, en la preparación de un medicamento para inhibir la activación del complemento.

20

44. Uso de un análogo de compstatina, o una sal o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 31 en la preparación de un medicamento para el tratamiento de la degeneración macular relacionada con la edad, enfermedad de Stargardt, periodontitis, retinopatía diabética, glaucoma, uveítis, artritis

25 reumatoide, lesión de la médula espinal, apoplejía, esclerosis múltiple, enfermedad de Parkinson, enfermedad de Alzheimer, cáncer, y trastornos respiratorios tales como asma, enfermedad pulmonar obstructiva crónica (COPD), inflamación alérgica, enfisema, bronquitis, bronquiectasias, fibrosis quística, tuberculosis, neumonía, síndrome de dificultad respiratoria (RDS - neonatal y adulto), rinitis y sinusitis; infecciones bacterianas tales como septicemia, lesión

por isquemia-reperfusión en varios tejidos., infarto de miocardio, anafilaxia, hemoglobinuria paroxística nocturna, anemias hemolíticas autoinmunitarias, soriasis, hidradenitis supurativa, miastenia gravis, lupus eritematoso sistémico, síndrome de CHAPLE, glomerulopatía C3, nefropatía por IgA, síndrome urémico hemolítico atípico, enfermedad de Crohn, colitis ulcerosa o

5 síndrome antifosfolípido.

Por favor tome en cuenta que las obras citadas de literatura no perteneciente a patentes, tal como documentos científicos o técnicos o similares, podrían estar sujetas a protección por derechos de autor y/o cualquier otra protección de obras escritas, según corresponda, de conformidad con las leyes aplicables. Los textos protegidos por derechos de autor no pueden copiarse ni utilizarse en otras publicaciones electrónicas o impresas ni distribuirse nuevamente sin el permiso expreso del titular de los derechos de autor.

XS CPRTENFRDE