

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載  
 【部門区分】第3部門第2区分  
 【発行日】令和6年11月6日(2024.11.6)

【公開番号】特開2024-105256(P2024-105256A)  
 【公開日】令和6年8月6日(2024.8.6)  
 【年通号数】公開公報(特許)2024-146  
 【出願番号】特願2024-63134(P2024-63134)  
 【国際特許分類】

C 0 7 H 2 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 H 2 1 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 1 2 N 1 5 / 1 1 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】

C 0 7 H 2 1 / 0 4            A

C 0 7 H 2 1 / 0 2

C 1 2 N 1 5 / 1 1            Z Z N A

10

【手続補正書】

【提出日】令和6年10月28日(2024.10.28)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

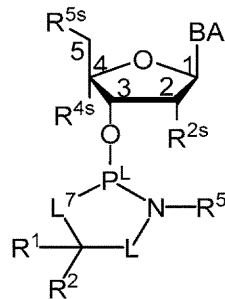
1つ以上のサイクルを含む、オリゴヌクレオチドを調製する方法であって、前記サイクルの各々は、独立に、以下のステップ：

(1) カップリングステップであって、前記カップリングステップは、遊離ヒドロキシル基を各々が独立に含む点で脱ブロック化されている複数の脱ブロック化されたオリゴヌクレオチド又はヌクレオシドを含む脱ブロック化された組成物（脱ブロック化されたオリゴヌクレオチド組成物）を、ヌクレオシド単位を含むパートナー化合物を含むカップリング試薬系と接触させるステップを備え、

前記パートナー化合物は、IV-dの構造：

20

30

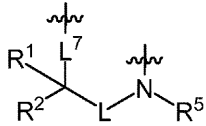


IV-d

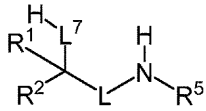
40

(式中、

50

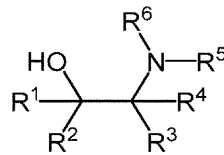


は、



10

の構造であって、I - a の構造：



I-a

20

を有する化合物又はその塩であり、

$P-L$  は、 $P$  であり；

$-L^7$  は、 $-O-$  であり；

$L$  は、 $-C(R^3)(R^4)-$  であり；

$R^1$  及び  $R^2$  の各々は、独立に、 $-H$ 、 $-L^5-R$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-L^5-Si(R)_3$ 、 $-OR$ 、 $-SR$ 、又は  $-N(R)_2$  であり；

$R^3$  は、 $-H$  であり；

$R^4$  及び  $R^5$  は、それらの介在原子と一緒に、1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する任意選択で置換されている 3 ~ 20 員環の多環式の環を形成する；

30

$R^6$  は、 $-H$  であり；

$-NHR^5$  は、式 I - a に示される  $-NR^5R^6$  であり；

各  $L^5$  は、独立に、共有結合であるか、又は  $C_{1-30}$  脂肪族基と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する  $C_{1-30}$  ヘテロ脂肪族基とから選択される二価の任意選択で置換されている直鎖又は分枝状の基であり、ここで、1 つ以上のメチレン単位は、任意選択で、且つ独立に、 $C_{1-6}$  アルキレン、 $C_{1-6}$  アルケニレン、 $-C-C-$ 、1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する二価の  $C_{1-6}$  ヘテロ脂肪族基、 $-C(R')$ <sub>2</sub> $-$ 、 $-Cy-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S-S-$ 、 $-N(R')$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(NR')$ 、 $-C(O)N(R')$ 、 $-N(R')C(O)N(R')$ 、 $-N(R')C(O)O-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2N(R')$ 、 $-C(O)S-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-P(O)(OR')$ 、 $-P(O)(SR')$ 、 $-P(O)(R')$ 、 $-P(O)(NR')$ 、 $-P(S)(OR')$ 、 $-P(S)(SR')$ 、 $-P(S)(R')$ 、 $-P(S)(NR')$ 、 $-P(R')$ 、 $-P(OR')$ 、 $-P(SR')$ 、 $-P(NR')$ 、 $-P(OR')[B(R'_3)]$ 、 $-OP(O)(OR')O-$ 、 $-OP(O)(SR')O-$ 、 $-OP(O)(R')O-$ 、 $-OP(O)(NR')O-$ 、 $-OP(O)(OR')O-$ 、 $-OP(SR')O-$ 、 $-OP(NR')O-$ 、 $-OP(R')O-$  又は  $-OP(OR')[B(R'_3)]O-$  から選択される任意選択で置換されている基によって置き換えられ、及び 1 つ以上の炭素原子は、任意選択で、且つ独立に、 $Cy^L$  に置き換えられ；

50

各 - C<sub>y</sub> - は、独立に、C<sub>3</sub> ~ 20 脂環族環と、C<sub>6</sub> ~ 20 アリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 20 員環ヘテロアリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 20 員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている二価の基であり、

各 C<sub>y</sub><sup>L</sup> は、独立に、C<sub>3</sub> ~ 20 脂環族環と、C<sub>6</sub> ~ 20 アリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 20 員環ヘテロアリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 20 員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている四価の基であり；  
BA は、天然核酸塩基部分と、修飾核酸塩基部分とから選択される任意選択で置換されている基であり；

R<sup>2s</sup>、R<sup>4s</sup>、及び R<sup>5s</sup> の各々は、独立して、- H、ハロゲン、- CN、- N<sub>3</sub>、- NO、- NO<sub>2</sub>、- L<sup>s</sup>- R'、- L<sup>s</sup>- Si(R)<sub>3</sub>、- L<sup>s</sup>- OR'、- L<sup>s</sup>- SR'、- L<sup>s</sup>- N(R')<sub>2</sub>、- O-L<sup>s</sup>- R'、- O-L<sup>s</sup>- Si(R)<sub>3</sub>、- O-L<sup>s</sup>- OR'、- O-L<sup>s</sup>- SR'、又は - O-L<sup>s</sup>- N(R')<sub>2</sub> であり、又は、R<sup>2s</sup> 及び R<sup>4s</sup> は R であり、2 つの R 基は、それらの介在原子と一緒に任意選択で置換されている環を形成する；

各 R' は、独立に、- R、- C(O)R、- C(O)OR 又は - S(O)<sub>2</sub>R であり；

各 R は、独立に、- H であるか、又は C<sub>1</sub> ~ 30 脂肪族と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する C<sub>1</sub> ~ 30 ヘテロ脂肪族と、C<sub>6</sub> ~ 30 アリールと、C<sub>6</sub> ~ 30 アリール脂肪族と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する C<sub>6</sub> ~ 30 アリールヘテロ脂肪族と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 30 員環ヘテロアリールと、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 30 員環ヘテロシクリルとから選択される任意選択で置換されている基であるか、又は 2 つの R 基は、任意選択で、且つ独立に、一緒になって共有結合を形成するか、又は同じ原子上の 2 つ以上の R 基は、任意選択で、且つ独立に、その原子と一緒に、0 ~ 10 個のヘテロ原子をその原子に加えて有する任意選択で置換されている 3 ~ 30 員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成するか；又は

2 つ以上の原子上の 2 つ以上の R 基は、任意選択で、且つ独立に、それらの介在原子と一緒に、0 ~ 10 個のヘテロ原子をそれらの介在原子に加えて有する任意選択で置換されている 3 ~ 30 員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成する）

を有するカップリングステップと；

(2) 修飾前キャッピングステップであって、前記修飾前キャッピングステップは：  
カップリング生成物組成物を修飾前キャッピング試薬系と接触させるステップ；及び  
前記カップリング生成物組成物の 1 つ以上の官能基をキャッピングするステップ  
を備え、

前記修飾前キャッピングステップは、複数の修飾前キャッピング生成物オリゴヌクレオチドを含む修飾前キャッピング生成物組成物を提供し、

前記修飾前キャッピング試薬系は、アシル化剤を含み、前記アシル化剤は、式 R' - C(O) - L<sup>s</sup> - R<sup>s</sup>

(式中、

各 R<sup>s</sup> は、独立に、- H、ハロゲン、- CN、- N<sub>3</sub>、- NO、- NO<sub>2</sub>、- L<sup>s</sup>- R'、- L<sup>s</sup>- Si(R)<sub>3</sub>、- L<sup>s</sup>- OR'、- L<sup>s</sup>- SR'、- L<sup>s</sup>- N(R')<sub>2</sub>、- O-L<sup>s</sup>- R'、- O-L<sup>s</sup>- Si(R)<sub>3</sub>、- O-L<sup>s</sup>- OR'、- O-L<sup>s</sup>- SR' 又は - O-L<sup>s</sup>- N(R')<sub>2</sub> であり；

各 L<sup>s</sup> は、独立に、共有結合であるか、又は C<sub>1</sub> ~ 30 脂肪族基と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される 1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する C<sub>1</sub> ~ 30 ヘテロ脂肪族基とから選択される二価の任意選択で置換されている直鎖又は分枝状の基であり、ここで、1 つ以上のメチレン単位は、任意選択で、且つ独立に、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキレン、C<sub>1</sub> ~ 6 アルケニレン、- C=C-、酸素と窒素と硫黄とリンとケイ素とから独立に選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する二価の C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ヘテロ脂肪族基、- C(R')<sub>2</sub>-、- C<sub>y</sub>-、- O-、- S-、- S-S-、- N(R')-、- C(O)-、- C(S)-、- C(NR')-、- C(O)N(R')-、- N(R')C(O)N(R')-、

10

20

30

40

N50

(R')C(O)O-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>N(R')-、-C(O)S-、-C(O)O-、-P(O)(OR')、-P(O)(SR')、-P(O)(R')、-P(O)(NR')、-P(S)(OR')、-P(S)(SR')、-P(S)(R')、-P(S)(NR')、-P(R')、-P(OR')、-P(SR')、-P(NR')、-P(OR')[B(R<sub>3</sub>')]、-OP(O)(OR')O-、-OP(O)(SR')O-、-OP(O)(R')O-、-OP(O)(NR')O-、-OP(OR')O-、-OP(SR')O-、-OP(NR')O-、-OP(R')O-又は-OP(OR')[B(R<sub>3</sub>)]O-から選択される任意選択で置換されている基によって置き換えられ、及び1つ以上の炭素原子は、任意選択で、且つ独立に、Cy<sup>L</sup>に置き換えられ；

10

各Cyは、独立に、C<sub>3</sub>~20脂環族環と、C<sub>6</sub>~20アリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する5~20員環ヘテロアリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する3~20員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている二価の基であり；

各Cy<sup>L</sup>は、独立に、C<sub>3</sub>~20脂環族環と、C<sub>6</sub>~20アリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する5~20員環ヘテロアリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する3~20員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている四価の基であり；

20

各R'は、独立に、-R、-C(O)R、-C(O)OR又は-S(O)<sub>2</sub>Rであり；

各Rは、独立に、-Hであるか、又はC<sub>1</sub>~30脂肪族と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有するC<sub>1</sub>~30ヘテロ脂肪族と、C<sub>6</sub>~30アリールと、C<sub>6</sub>~30アリール脂肪族と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有するC<sub>6</sub>~30アリールヘテロ脂肪族と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する5~30員環ヘテロアリールと、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する3~30員環ヘテロシクリルとから選択される任意選択で置換されている基であるか、又は

2つのR基は、任意選択で、且つ独立に、一緒になって共有結合を形成するか、又は同じ原子上の2つ以上のR基は、任意選択で、且つ独立に、その原子と一緒に、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される0~10個のヘテロ原子をその原子に加えて有する任意選択で置換されている3~30員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成するか；又は

30

2つ以上の原子上の2つ以上のR基は、任意選択で、且つ独立に、それらの介在原子と一緒に、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される0~10個のヘテロ原子をそれらの介在原子に加えて有する任意選択で置換されている3~30員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成する）

のものであり、

前記修飾前キャッピングステップのキャッピング条件は、エステル化よりもアミド化に選択的又は特異的である、修飾前キャッピングステップと；

40

(3) 修飾ステップであって、前記修飾ステップは、カップリング生成物組成物又は修飾前キャッピング生成物組成物を、修飾試薬を含む修飾試薬系と接触させるステップを備え、前記修飾ステップは、硫化を備え、前記硫化は、-P(-)-結合リン原子を-P(=S)(-)-結合リン原子に変換するステップを備える修飾ステップと；

(4) 修飾後キャッピングステップと；

(5) 脱ブロック化ステップと

を備えることを特徴とする方法。

【請求項2】

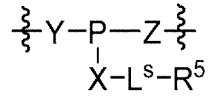
請求項1に記載の方法において、カップリングステップ後且つ次の修飾ステップ前の各修

50

飾前キャッピングステップは、独立に、エステル化触媒を含まないか、又はそれが1つ以上のエステル化触媒を含む場合、前記1つ以上のエステル化触媒の各々の量は、独立に、前記オリゴヌクレオチドの最初に取り込まれるヌクレオチドに対して0.1当量以下であることを特徴とする方法。

【請求項3】

請求項1に記載の方法において、各カップリングステップは、独立に、式VII-b:



VII-b

10

(式中、

$R^1$ 及び $R^5$ の各々は、独立に、-H、 $-L^S-R$ 、ハロゲン、-CN、 $-NO_2$ 、 $-L^S-Si(R)_3$ 、-OR、-SR又は $-N(R)_2$ であり；

X、Y及びZの各々は、独立に、-O-、-S-、 $-N(-L^S-R^1)$ 又は $L^S$ であり；

各 $L^S$ は、独立に、共有結合であるか、又は $C_{1-30}$ 脂肪族基と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する $C_{1-30}$ ヘテロ脂肪族基とから選択される二価の任意選択で置換されている直鎖又は分枝状の基であり、ここで、1つ以上のメチレン単位は、任意選択で、且つ独立に、 $C_{1-6}$ アルキレン、 $C_{1-6}$ アルケニレン、-C-C-、酸素と窒素と硫黄とリンとケイ素とから独立に選択される1~5個のヘテロ原子を有する二価の $C_{1-6}$ ヘテロ脂肪族基、 $-C(R')_2-$ 、 $-Cy-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S-S-$ 、 $-N(R')$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(NR')$ 、 $-C(O)N(R')$ 、 $-N(R')C(O)N(R')$ 、 $-N(R')C(O)O-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2N(R')$ 、 $-C(O)S-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-P(O)(OR')$ 、 $-P(O)(SR')$ 、 $-P(O)(R')$ 、 $-P(O)(NR')$ 、 $-P(S)(OR')$ 、 $-P(S)(SR')$ 、 $-P(S)(R')$ 、 $-P(S)(NR')$ 、 $-P(R')$ 、 $-P(OR')$ 、 $-P(SR')$ 、 $-P(NR')$ 、 $-P(OR')[B(R_3)]$ 、 $-OP(O)(OR')O-$ 、 $-OP(O)(SR')O-$ 、 $-OP(O)(R')O-$ 、 $-OP(O)(NR')O-$ 、 $-OP(OR')O-$ 、 $-OP(SR')O-$ 、 $-OP(NR')O-$ 、 $-OP(R')O-$ 又は $-OP(OR')[B(R_3)]O-$ から選択される任意選択で置換されている基によって置き換えられ、及び1つ以上の炭素原子は、任意選択で、且つ独立に、 $Cy^L$ に置き換えられ；

各 $Cy-$ は、独立に、 $C_{3-20}$ 脂環族環と、 $C_{6-20}$ アリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する5~20員環ヘテロアリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する3~20員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている二価の基であり；

各 $Cy^L$ は、独立に、 $C_{3-20}$ 脂環族環と、 $C_{6-20}$ アリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する5~20員環ヘテロアリール環と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する3~20員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている四価の基であり；

各 $R'$ は、独立に、-R、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 又は $-S(O)_2R$ であり；

各Rは、独立に、-Hであるか、又は $C_{1-30}$ 脂肪族と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する $C_{1-30}$ ヘテロ脂肪族と、 $C_{6-30}$ アリールと、 $C_{6-30}$ アリール脂肪族と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1~10個のヘテロ原子を有する $C_{6-30}$ アリールヘテロ脂肪

50

族と、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1～10個のヘテロ原子を有する5～30員環ヘテロアリアルと、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される1～10個のヘテロ原子を有する3～30員環ヘテロシクリルとから選択される任意選択で置換されている基であるか、又は

2つのR基は、任意選択で、且つ独立に、一緒になって共有結合を形成するか、又は同じ原子上の2つ以上のR基は、任意選択で、且つ独立に、その原子と一緒に、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される0～10個のヘテロ原子をその原子に加えて有する任意選択で置換されている3～30員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成するか；又は

2つ以上の原子上の2つ以上のR基は、任意選択で、且つ独立に、それらの介在原子と一緒に、酸素、窒素、硫黄、リン及びケイ素から独立に選択される0～10個のヘテロ原子をそれらの介在原子に加えて有する任意選択で置換されている3～30員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成する)

又はその塩形態のインターヌクレオチド結合を形成することを特徴とする方法。

10

【請求項4】

請求項2に記載の方法において、修飾前キャッピング試薬系は、塩基をさらに含むことを特徴とする方法。

【請求項5】

請求項1に記載の方法において、修飾前キャッピング試薬系は、2,6-ルチジン/  $Ac_2O$  の溶液であることを特徴とする方法。

20

【請求項6】

請求項1に記載の方法において、修飾試薬系は、1つ以上の硫化試薬を含む硫化試薬系であり、硫化試薬系は、POS(3-フェニル-1,2,4-ジチアゾリン-5-オン)、DDTT((ジメチルアミノ-メチリデン)アミノ)-3H-1,2,4-ジチアゾリン-3-チオン)、DTD(ジメチルチアルムジスルフィド)、キサントヒドリド(XH)、S-(2-シアノエチル)メタンスルホノチオエート(MTS-CNE)又はフェニルアセチルジスルフィドから選択される硫化試薬を含むことを特徴とする方法。

【請求項7】

請求項1に記載の方法において、複数のヒドロキシル基をキャッピングする修飾後キャッピングステップを備えることを特徴とする方法。

30

【請求項8】

請求項1に記載の方法において、修飾後キャッピング試薬系は、2,6-ルチジン/NMI/  $Ac_2O$  の溶液であることを特徴とする方法。

【請求項9】

請求項1に記載の方法において、脱ブロック化試薬を含む脱ブロック化試薬系を利用する脱ブロック化ステップを備え、前記脱ブロック化試薬は、酸であることを特徴とする方法。

【請求項10】

請求項9に記載の方法において、複数のオリゴヌクレオチドを1つ以上の切断/脱保護試薬系と接触させることを備える切断/脱保護ステップを備え；

40

前記切断/脱保護ステップは、複数の最終生成物オリゴヌクレオチドを含む最終生成物組成物を提供することを特徴とする方法。

【請求項11】

請求項1に記載の方法において、複数の最終生成物オリゴヌクレオチドを含む最終生成物組成物は、キラル制御されたオリゴヌクレオチド組成物であり、

前記複数のオリゴヌクレオチドは、同じ組成を共有し；及び

前記複数のオリゴヌクレオチドは、少なくとも1つのキラル制御されたインターヌクレオチド結合を含み、前記インターヌクレオチド結合は、前記複数のオリゴヌクレオチドが前記インターヌクレオチド結合のキラルな結合リンにおいて同じ立体化学配置を共有する点

50

でキラル制御されており；

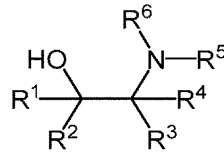
前記最終生成物組成物中の同じ塩基配列を共有する全てのオリゴヌクレオチドの少なくとも  $(DS)^{N_c} \times 100$  % は、前記複数のオリゴヌクレオチドであり、式中、DS は、少なくとも 80 % であり、及び  $N_c$  は、キラル制御されたインターヌクレオチド結合の数であることを特徴とする方法。

【請求項 1 2】

請求項 1 1 に記載の方法において、少なくとも 40 % の粗純度の最終生成物組成物を提供し、前記粗純度は、% 完全長生成物であることを特徴とする方法。

【請求項 1 3】

請求項 3 に記載の方法において、 $-X-L^S-R^5$  は、 $H-X-L^S-R^5$  の構造であつて、式 I - a ；



I-a

(式中、

$R^1$  及び  $R^2$  の各々は、独立に、 $-H$ 、 $-L^S-R$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-L^S-Si(R)_3$ 、 $-OR$ 、 $-SR$  又は  $-N(R)_2$  であり；

$R^3$  は、 $-H$  であり；

$R^4$  及び  $R^5$  は、それらの介在原子と一緒に、1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する任意選択で置換されている 3 ~ 20 員環のヘテロシクリル環を形成し；

$R^6$  は、 $-H$  であり；

各  $L^S$  は、独立に、共有結合であるか、又は  $C_{1-30}$  脂肪族基と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する  $C_{1-30}$  ヘテロ脂肪族基とから選択される二価の任意選択で置換されている直鎖又は分枝状の基であり、ここで、1 つ以上のメチレン単位は、任意選択で、且つ独立に、 $C_{1-6}$  アルキレン、 $C_{1-6}$  アルケニレン、 $-C-C-$ 、1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する二価の  $C_{1-6}$  ヘテロ脂肪族基、 $-C(R')_2-$ 、 $-Cy-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S-S-$ 、 $-N(R')$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(NR')$ 、 $-C(O)N(R')$ 、 $-N(R')C(O)N(R')$ 、 $-N(R')C(O)O-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2N(R')$ 、 $-C(O)S-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-P(O)(OR')$ 、 $-P(O)(SR')$ 、 $-P(O)(R')$ 、 $-P(O)(NR')$ 、 $-P(S)(OR')$ 、 $-P(S)(SR')$ 、 $-P(S)(R')$ 、 $-P(S)(NR')$ 、 $-P(R')$ 、 $-P(OR')$ 、 $-P(SR')$ 、 $-P(NR')$ 、 $-P(OR')[B(R'_3)]$ 、 $-OP(O)(OR')O-$ 、 $-OP(O)(SR')O-$ 、 $-OP(O)(R')O-$ 、 $-OP(O)(NR')O-$ 、 $-OP(O)(OR')O-$ 、 $-OP(SR')O-$ 、 $-OP(NR')O-$ 、 $-OP(R')O-$  又は  $-O$  から選択される任意選択で置換されている基によって置き換えられ、及び 1 つ以上の炭素原子は、任意選択で、且つ独立に、 $Cy^L$  に置き換えられ；

各  $-Cy-$  は、独立に、 $C_{3-20}$  脂環族環と、 $C_{6-20}$  アリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 20 員環ヘテロアリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 20 員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている二価の基であり；

各  $Cy^L$  は、独立に、 $C_{3-20}$  脂環族環と、 $C_{6-20}$  アリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 20 員環ヘテロアリール環と、1 ~ 10 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 20 員環ヘテロシクリル環とから選択される任意選択で置換されている四価の基であり；

20

30

P40

50

各 R' は、独立に、 $-R$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$  又は  $-S(O)_2R$  であり；  
 各 R は、独立に、 $-H$  であるか、又は  $C_{1-30}$  脂肪族と、 $1 \sim 10$  個のヘテロ原子を有する  $C_{1-30}$  ヘテロ脂肪族と、 $C_{6-30}$  アリールと、 $C_{6-30}$  アリール脂肪族と、 $1 \sim 10$  個のヘテロ原子を有する  $C_{6-30}$  アリールヘテロ脂肪族と、 $1 \sim 10$  個のヘテロ原子を有する  $5 \sim 30$  員環ヘテロアリールと、 $1 \sim 10$  個のヘテロ原子を有する  $3 \sim 30$  員環ヘテロシクリルとから選択される任意選択で置換されている基であるか、又は  
 2つの R 基は、任意選択で、且つ独立に、一緒になって共有結合を形成するか、又は  
 同じ原子上の2つ以上の R 基は、任意選択で、且つ独立に、その原子と一緒に、 $0 \sim 10$  個のヘテロ原子をその原子に加えて有する任意選択で置換されている  $3 \sim 30$  員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成するか；又は  
 2つ以上の原子上の2つ以上の R 基は、任意選択で、且つ独立に、それらの介在原子と一緒に、 $0 \sim 10$  個のヘテロ原子をそれらの介在原子に加えて有する任意選択で置換されている  $3 \sim 30$  員環の単環式、二環式又は多環式の環を形成する)  
 の化合物又はその塩であることを特徴とする方法。

10

【請求項 14】

請求項 13 に記載の方法において、 $R^1$  は  $-H$  であり、 $R^2$  は  $-CH_2-Si(R)_3$  であり、 $-Si(R)_3$  の各 R は独立して  $-H$  ではないことを特徴とする方法。

【請求項 15】

請求項 13 に記載の方法において、 $R^1$  は  $-H$  であり、 $R^2$  は  $-CH_2-Si(R)_3$  であり、各 R は独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族及びフェニルから選択される任意で置換されている基であることを特徴とする方法。

20

【請求項 16】

請求項 13 に記載の方法において、 $H-X-L^S-R^5$  は、



であることを特徴とする方法。

30

【請求項 17】

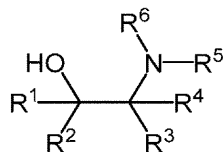
請求項 1 に記載の方法において、 $R^1$  は  $-H$  であり、 $R^2$  は  $-CH_2-Si(R)_3$  であり、 $-Si(R)_3$  の各 R は独立して  $-H$  ではないことを特徴とする方法。

【請求項 18】

請求項 1 に記載の方法において、 $R^1$  は  $-H$  であり、 $R^2$  は  $-CH_2-Si(R)_3$  であり、各 R は独立して、 $C_{1-6}$  脂肪族及びフェニルから選択される任意で置換されている基であることを特徴とする方法。

【請求項 19】

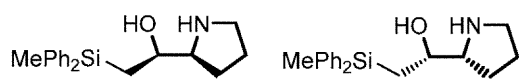
請求項 1 に記載の方法において、



40

は、

50

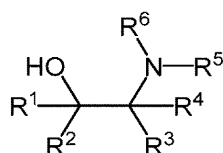


または

であることを特徴とする方法。

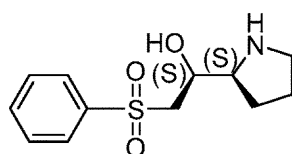
【請求項 20】

請求項 1 に記載の方法において、



10

は、

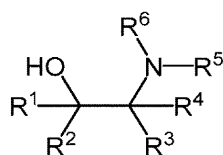


20

であることを特徴とする方法。

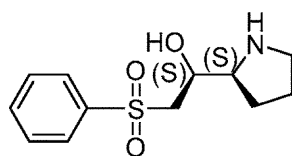
【請求項 21】

請求項 13 に記載の方法において、



30

は、



40

であることを特徴とする方法。

50