

【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2年12月17日(2020.12.17)

【公表番号】特表2019-536770(P2019-536770A)

【公表日】令和1年12月19日(2019.12.19)

【年通号数】公開・登録公報2019-051

【出願番号】特願2019-524074(P2019-524074)

【国際特許分類】

C 0 7 K	17/00	(2006.01)
G 0 1 N	33/531	(2006.01)
C 0 7 K	7/02	(2006.01)
C 0 7 K	14/00	(2006.01)
C 0 7 K	16/00	(2006.01)
C 1 2 M	1/00	(2006.01)
C 0 7 K	5/02	(2006.01)
C 0 7 K	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	33/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/27	(2006.01)
C 0 8 G	65/334	(2006.01)
C 0 8 G	65/336	(2006.01)
C 0 8 G	69/42	(2006.01)
C 0 7 C	311/51	(2006.01)
B 0 1 J	20/281	(2006.01)
C 1 2 N	15/115	(2010.01)
C 1 2 N	15/11	(2006.01)

【F I】

C 0 7 K	17/00	
G 0 1 N	33/531	Z
C 0 7 K	7/02	
C 0 7 K	14/00	
C 0 7 K	16/00	
C 1 2 M	1/00	A
C 0 7 K	5/02	
C 0 7 K	1/04	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	31/12	

A 6 1 P	31/10
A 6 1 P	33/00
A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	37/02
A 6 1 K	31/27
C 0 8 G	65/334
C 0 8 G	65/336
C 0 8 G	69/42
C 0 7 C	311/51
B 0 1 J	20/22
C 1 2 N	15/115
C 1 2 N	15/11
	C S P
	D
	Z
	Z

【手続補正書】

【提出日】令和2年11月6日(2020.11.6)

【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

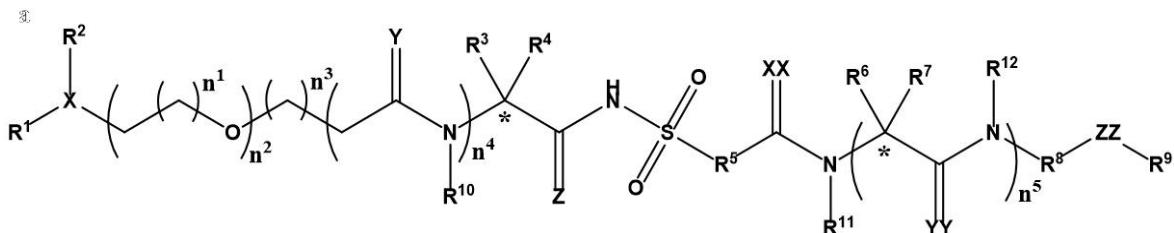
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造を有する分子、

【化1】



またはその塩であって、

式中、 n^1 は独立して、0、1、2、若しくは3であり； n^2 は0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、1

5、16、17、18、19、若しくは20であり；

 n^3 は0、1、2、若しくは3からのものであり； n^4 は0若しくは1であり；及び n^5 は0、1、2、若しくは3であり；ならびに X はO、N、若しくはSであり； Y 、 Z 、 XX 、及び YY は同一であり、若しくは異なり、独立して、O若しくはSであり；

R^1 及び R^2 は同一であり、若しくは異なり、独立して水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシリル、孤立電子対、若しくは $-CO_2R$ であり、 R^1 はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合されるNは環を形成し；または R^1 若しくは R^2 はヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含み；

R^3 、 R^4 、 R^6 、及び R^7 は同一であり、若しくは異なり、独立して水素、ハロ、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアルキル、アリールアルキル、ヒドロキシアリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、チオアルキル、セレノアルキル、ヒドロキシアルキル、若しくはアミノ置換アルキルであり；

R^5 はアルキル、アルケニル、アルキニル、若しくはアリールであり、水素、ハロ、アルキル、ポリハロアルキル、アルキオキシ、ハロアルコキシ、ポリハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、シアノ、アミノ、置換アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、チオール、アルキルチオ、アルキルカルボニル、アシル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルスルフィニル、スルホニアミド、若しくはスルホニルとすべて任意選択で置換され；

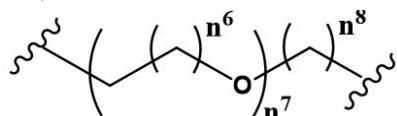
N から ZZ へ配向される R^8 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^8 は

【化2】



であり、 m は1から100であり、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、及び R^{18} は同一であり、若しくは異なり、独立して水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり；または R^8 は、

【化3】



であり、式中、 n^6 及び n^8 は同一であり、若しくは異なり、独立して、1、2、若しくは3であり、 n^8 は1から20であり；

R^9 はアルキル、ヘテロアルキル、ヒドロキシヘテロアルキル、シリルアルキル、シロキシアルキル、シロキシヘテロアルキル、シロキシヒドロキシヘテロアルキルであり、若しくは R^9 は $R^{19} - (CH_2)_3 - Si(Z)_p$ であることができ、 p は1から3であり、 Z はハロ若しくはアルコキシから選択され、 R^{19} はヒドロキシアルキル若しくはカルバメートから選択され；

R^{10} 、 R^{11} 、及び R^{12} は同一であり、若しくは異なり、水素若しくはアルキルから独立して選択され；ならびに R^9 は固相に任意選択で結合され；

ZZ は NR^{20} 、 O 、 S 、若しくは Se であり、 R^{20} は水素若しくはアルキルであり；ならびに

(*)は炭素中心であり、前記炭素中心は独立して、不斉中心若しくは非不斉中心であることが可能である；

前記分子またはその塩。

【請求項2】

X は、 N であり、 R^1 及び R^2 は、同一であり、または異なり、水素、アシル、アシルオキシ、ベンジル、トリフェニルメチル、ベンジリデニル、または p -トルエンスルホニルから独立して選択される、請求項1に記載の分子または塩。

【請求項3】

前記固相は、基質、ビーズ、またはクロマトグラフィー用充填剤を含む、請求項1に記載の分子または塩。

【請求項4】

R^3 及び R^4 のいずれかは、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、シクロアルキル、アリール、またはヘテロアリール側鎖を含む、請求項 1 に記載の分子または塩。

【請求項5】

R³ 及び R⁴ のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的にプロトン化される官能基を含む、請求項 1 に記載の分子または塩。

【請求項 6】

R^3 及び R^4 のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的に脱プロトン化される官能基を含む、請求項 1 に記載の分子または塩。

【請求項 7】

R³ 及び R⁴ は、水素である、請求項 1 に記載の分子または塩。

【請求項8】

R⁶ 及び R⁷ のいずれかは、C₁ - C₁₀、アルキル、シクロアルキル、アリール、またはヘテロアリール側鎖を含む、請求項 1 に記載の分子または塩。

【請求項 9】

R⁶ 及び R⁷ のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的にプロトン化される官能基を含む、請求項 1 に記載の分子または塩。

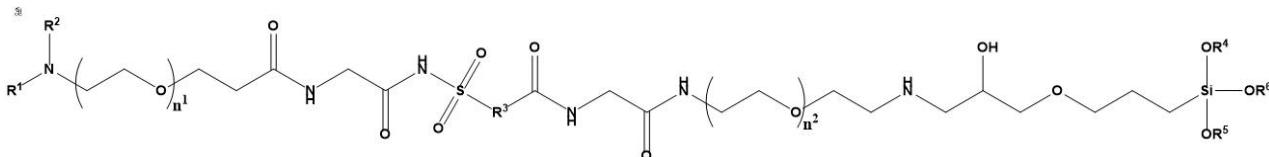
【請求項 10】

R⁶ 及び R⁷ のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的に脱プロトン化される官能基を含む、請求項 1 に記載の分子または塩。

【請求項 11】

以下の構造を有する分子、

【化 4】



またはその塩であって、

式中、 $n^1 = 1 \sim 15$ 、及び $n^2 = 1 \sim 6$ ；ならびに

R^1 及び R^2 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素またはアシルオキシであり；

R^3 はアルキル、アルケニル、アルキニル若しくはアリールであり、水素、ハロ、アルキル、ポリハロアルキル、アルキオキシ(alkoxy)、ハロアルコキシ、ポリハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、シアノ、アミノ、置換アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、チオール、アルキルチオ、アルキルカルボニル、アシル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルスルフィニル、スルホンアミド、若しくはスルホニルから選択される1、2、3、若しくは4基とすべて任意選択で置換され；ならびに

R^4 、 R^5 、及び R^6 は同一であり、若しくは異なり、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシから独立して選択される。

前記分子またはその塩。

【請求項 1 2】

R³は、p-フェニルまたはn-プロピルである、請求項1-1に記載の分子または塩。

【請求項 1 3】

R¹ または R² は、ペプチドを含む、請求項 1 に記載の分子または塩。

【請求項 1 4】

前記ペプチドは、2から100個のアミノ酸を含む、請求項13に記載の分子または塩。

【請求項15】

請求項1に記載の分子または塩を含むアレイ。

【請求項1 6】

前記アレイは、 1 cm^2 あたり少なくとも約10,000、300,000、または100万個のペプチド特徴を含む、請求項15に記載のアレイ。

【請求項1 7】

結合部分をさらに含む、請求項15に記載のアレイ。

【請求項1 8】

前記結合部分は、ヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー、若しくは抗体、またはそのフラグメントを含む、請求項17に記載のアレイ。

【請求項1 9】

脂肪酸をさらに含む、請求項15に記載のアレイ。

【請求項2 0】

前記脂肪酸は、フッ素化脂肪酸である、請求項19に記載のアレイ。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0016

【補正方法】変更

【補正の内容】

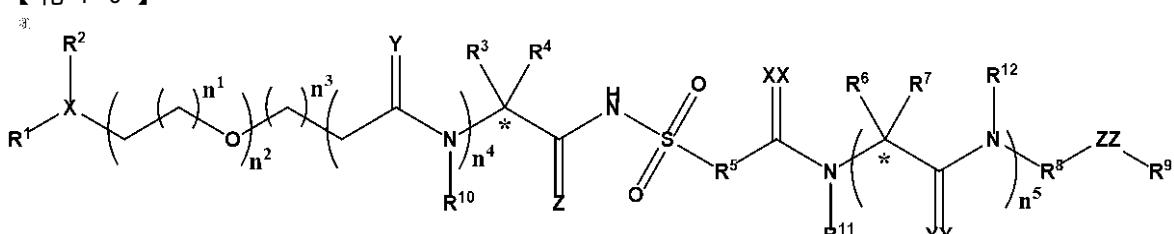
【0016】

本発明の態様をさらに記載する：

[項1]

以下の構造を有する分子、

【化10】



またはその塩であって、

式中、 n^1 は独立して、0、1、2、若しくは3であり；

n^2 は0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、若しくは20であり；

n^3 は0、1、2、若しくは3からのものであり；

n^4 は0若しくは1であり；及び

n^5 は0、1、2、若しくは3であり；ならびに

XはO、N、若しくはSであり；

Y、Z、XX、及びYYは同一であり、若しくは異なり、独立して、O若しくはSであり；

R¹及びR²は同一であり、若しくは異なり、独立して水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシリル、孤立電子対、若しくは-CO₂R¹³であり、R¹³はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；またはR¹及びR²、及びそれらが結合されるNは環を形成し；またはR¹若しくはR²はヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含み；

R^3 、 R^4 、 R^6 、及び R^7 は同一であり、若しくは異なり、独立して水素、ハロ、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアルキル、アリールアルキル、ヒドロキシアリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、チオアルキル、セレノアルキル、ヒドロキシアルキル、若しくはアミノ置換アルキルであり；

R^5 はアルキル、アルケニル、アルキニル、若しくはアリールであり、水素、ハロ、アルキル、ポリハロアルキル、アルキオキシ、ハロアルコキシ、ポリハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、シアノ、アミノ、置換アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、チオール、アルキルチオ、アルキルカルボニル、アシル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルスルフィニル、スルホニアミド、若しくはスルホニルとすべて任意選択で置換され；

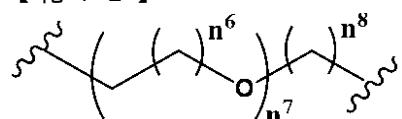
N から ZZ へ配向される R^8 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^8 は

【化11】



であり、 m は1から100であり、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、及び R^{18} は同一であり、若しくは異なり、独立して水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり；または R^8 は、

【化12】



であり、式中、 n^6 及び n^8 は同一であり、若しくは異なり、独立して、1、2、若しくは3であり、 n^8 は1から20であり；

R^9 はアルキル、ヘテロアルキル、ヒドロキシヘテロアルキル、シリルアルキル、シロキシアルキル、シロキシヘテロアルキル、シロキシヒドロキシヘテロアルキルであり、若しくは R^9 は $R^{19} - (CH_2)_3 - Si(Z)_p$ であることができ、 p は1から3であり、 Z はハロ若しくはアルコキシから選択され、 R^{19} はヒドロキシアルキル若しくはカルバメートから選択され；

R^{10} 、 R^{11} 、及び R^{12} は同一であり、若しくは異なり、水素若しくはアルキルから独立して選択され；ならびに R^9 は固相に任意選択で結合され；

ZZ は NR^{20} 、O、S、若しくはSeであり、 R^{20} は水素若しくはアルキルであり；ならびに

(*)は炭素中心であり、前記炭素中心は独立して、不齊中心若しくは非不齊中心であることが可能である；

前記分子またはその塩。

[項2]

Xは、Nであり、 R^1 及び R^2 は、同一であり、または異なり、水素、アシル、アシルオキシ、ベンジル、トリフェニルメチル、ベンジリデニル、または p -トルエンスルホニルから独立して選択される、上記項1に記載の分子または塩。

[項3]

前記固相は、基質、ビーズ、またはクロマトグラフィー用充填剤を含む、上記項1または2に記載の分子または塩。

[項4]

R³ 及び R⁴ のいずれかは、C₁ - C₁₀ アルキル、シクロアルキル、アリール、またはヘテロアリール側鎖を含む、上記項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 5]

R³ 及び R⁴ のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的にプロトン化される官能基を含む、上記項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 6]

R³ 及び R⁴ のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的に脱プロトン化される官能基を含む、上記項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 7]

前記側鎖は、アミド、アルコール、またはチオールを含む、上記項 4 に記載の分子または塩。

[項 8]

R³ 及び R⁴ は、水素である、上記項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 9]

R⁶ 及び R⁷ のいずれかは、C₁ - C₁₀、アルキル、シクロアルキル、アリール、またはヘテロアリール側鎖を含む、上記項 1 から 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 10]

R⁶ 及び R⁷ のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的にプロトン化される官能基を含む、上記項 1 から 9 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 11]

R⁶ 及び R⁷ のいずれかは、約 7.3 の pH で少なくとも部分的に脱プロトン化される官能基を含む、上記項 1 から 9 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 12]

前記側鎖は、アミド、アルコール、またはチオールを含む、上記項 9 に記載の分子または塩。

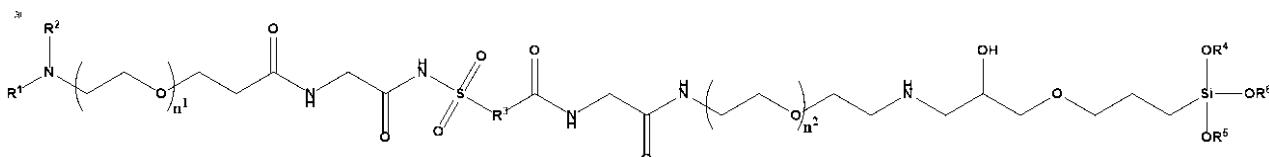
[項 13]

R⁶ 及び R⁷ は、水素である、上記項 1 から 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 14]

以下の構造を有する分子、

【化 13】



またはその塩であって、

式中、n¹ = 1 ~ 15、及び n² = 1 ~ 6；ならびに

R¹ 及び R² は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素またはアシリルオキシであり；

R³ はアルキル、アルケニル、アルキニル若しくはアリールであり、水素、ハロ、アルキル、ポリハロアルキル、アルキオキシ (alkoxy)、ハロアルコキシ、ポリハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、シアノ、アミノ、置換アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、チオール、アルキルチオ、アルキルカルボニル、アシリル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルスルフィニル、スルホニアミド、若しくはスルホニルから選択される 1、2、3、若しくは 4 基とすべて任意選択で置換され；ならびに

R⁴、R⁵、及び R⁶ は同一であり、若しくは異なり、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシから独立して選択される、

前記分子またはその塩。

[項 1 5]

R³ は、 p - フェニルである、上記項 1 4 に記載の分子または塩。

[項 1 6]

R³ は、 n - プロピルである、上記項 1 4 に記載の分子または塩。

[項 1 7]

R¹ または R² は、ペプチドを含む、上記項 1 から 1 6 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 1 8]

前記ペプチドは、2 から 1 0 0 個のアミノ酸を含む、上記項 1 7 に記載の分子または塩。

[項 1 9]

上記項 1 から 1 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩を含むアレイ。

[項 2 0]

前記アレイは、1 cm²あたり少なくとも約 1 0 , 0 0 0 、 3 0 0 , 0 0 0 、または 1 0 0 万個のペプチド特徴を含む、上記項 1 9 に記載のアレイ。

[項 2 1]

結合部分をさらに含む、上記項 1 9 または 2 0 に記載のアレイ。

[項 2 2]

前記結合部分は、ヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー、若しくは抗体、またはそのフラグメントを含む、上記項 2 1 に記載のアレイ。

[項 2 3]

脂肪酸をさらに含む、上記項 1 9 から 2 2 のいずれか 1 項に記載のアレイ。

[項 2 4]

前記脂肪酸は、フッ素化脂肪酸である、上記項 2 3 に記載のアレイ。

[項 2 5]

上記項 1 から 1 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩を基質と会合させることを備える、アレイを作製する方法。

[項 2 6]

前記基質は、Si / SiO₂ ウェハである、上記項 2 5 に記載の方法。

[項 2 7]

前記アレイは、1 cm²あたり少なくとも約 1 0 , 0 0 0 、 3 0 0 , 0 0 0 、または 1 0 0 万個のペプチド特徴を含む、上記項 2 5 または 2 6 に記載の方法。

[項 2 8]

固体支持体を形成する方法であって、

上記項 1 から 1 8 のいずれか 1 項に記載の分子と固体支持体を会合させることを備え、前記固体支持体は基質、ビーズ、ポリマー、またはクロマトグラフィー用充填剤である、前記方法。

[項 2 9]

ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ポリペプチド、アプタマー、若しくは抗体、またはそのフラグメントを結合するための上記項 1 から 1 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩の使用。

[項 3 0]

抗体またはタンパク質を結合するための、上記項 1 から 1 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩の使用。

[項 3 1]

上記項 1 から 1 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩に結合部分を結合させることを備える、方法。

[項 3 2]

前記結合部分を識別することをさらに備える、上記項 3 1 に記載の方法。

[項 3 3]

前記識別は、免疫蛍光アッセイを有する、上記項 3 2 に記載の方法。

[項 3 4]

前記結合部分は、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ポリペプチド、アプタマー、若しくは抗体、またはそのフラグメントを含む、上記項 3 2 に記載の方法。

[項 3 5]

前記結合部分は、対象から得られる、上記項 3 1 から 3 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

[項 3 6]

前記対象が疾患または状態を有する尤度を決定することをさらに備える、上記項 3 1 から 3 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

[項 3 7]

前記対象は、ヒトである、上記項 3 6 に記載の方法。

[項 3 8]

前記疾患または状態は、自己免疫疾患である、上記項 3 7 に記載の方法。

[項 3 9]

前記自己免疫疾患は、ループス、潰瘍性大腸炎、クローン病、または関節リウマチである、上記項 3 8 に記載の方法。

[項 4 0]

前記疾患または状態は、感染症である、上記項 3 7 に記載の方法。

[項 4 1]

前記感染症は、細菌性、ウイルス性、真菌性、または寄生虫性である、上記項 4 0 に記載の方法。

[項 4 2]

前記疾患または状態は、がんである、上記項 3 7 に記載の方法。

[項 4 3]

通信媒体を介して結果を通信することをさらに備える、上記項 3 1 から 4 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

[項 4 4]

上記項 1 から 1 8 のいずれか 1 項に記載の分子における結合を開裂することを備える方法。

[項 4 5]

前記結合は、N - アシルスルホンアミドの C - N 結合である、上記項 4 4 に記載の方法。

[項 4 6]

前記開裂は、第一活性化ステップ及び第二開裂ステップを備える、上記項 4 5 に記載の方法。

[項 4 7]

前記第一活性化ステップは、前記 N - アシルスルホンアミドをアルキル化剤によってアルキル化することを備える、上記項 4 6 に記載の方法。

[項 4 8]

前記アルキル化剤は、ジアゾ化合物またはハロゲン化アルキルである、上記項 4 7 に記載の方法。

[項 4 9]

前記アルキル化剤は、ジアゾメタン、ヨウ化メチル、またはヨードアセトニトリルである、上記項 4 8 に記載の方法。

[項 5 0]

前記開裂は、蒸気相開裂反応を有する、上記項 4 5 に記載の方法。

[項 5 1]

前記開裂は、蒸気相アンモニア開裂反応を有する、上記項 5 0 に記載の方法。

[項 5 2]

上記項 1 から 18 のいずれか 1 項に記載の分子、及び使用のための説明書を含む、キット。

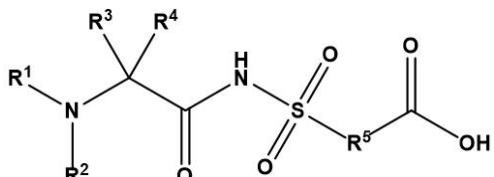
[項 5 3]

上記項 1 から 18 のいずれか 1 項に記載の分子によってキットを形成することを備える、前記キットを作製する方法。

[項 5 4]

以下の構造を有する化合物、

【化 1 4】



またはその塩であって、式中、

R¹ 及び R² は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、孤立電子対、若しくは -CO₂、R⁶ であり、R⁶ はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R¹ 及び R²、及びそれらが結合される N は環を形成し；

R³、R⁴ は同一であり、若しくは異なり、独立して水素、ハロ、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアルキル、アリールアルキル、ヒドロキシアリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、チオアルキル、セレノアルキル、ヒドロキシアルキル、若しくはアミノ置換アルキルであり；ならびに

R⁵ はアルキル、アルケニル、アルキニル若しくはアリールであり、水素、ハロ、アルキル、ポリハロアルキル、アルキオキシ (alkoxy)、ハロアルコキシ、ポリハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、ニトロ、シアノ、アミノ、置換アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、チオール、アルキルチオ、アルキルカルボニル、アシル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルスルフィニル、スルホニアミド、若しくはスルホニルとそれぞれ任意選択で置換される；

前記化合物またはその塩。

[項 5 5]

R¹ 及び R² は、同一であり、または異なり、独立して、水素、アシル、アシルオキシ、フタルイミジル、ベンジル、トリフェニルメチル、ベンジリデニル、または p - トルエンスルホニルである、上記項 5 4 に記載の化合物または塩。

[項 5 6]

R³ 及び R⁴ のいずれかは、C₁ - C₁₀ アルキル、シクロアルキル、アリール、またはヘテロアリール側鎖を含む、上記項 5 4 または 5 5 に記載の化合物または塩。

[項 5 7]

R³ 及び R⁴ のいずれかは、約 7 . 3 の pH で少なくとも部分的にプロトン化される官能基を含む、上記項 5 6 に記載の化合物または塩。

[項 5 8]

R³ 及び R⁴ のいずれかは、約 7 . 3 の pH で少なくとも部分的に脱プロトン化される官能基を含む、上記項 5 6 に記載の化合物または塩。

[項 5 9]

前記側鎖は、アミド、アルコール、またはチオールを含む、上記項 5 6 に記載の化合物または塩。

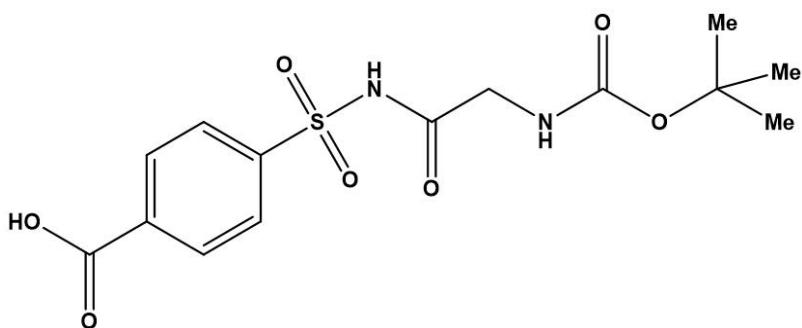
[項 6 0]

R³ 及び R⁴ は、水素である、上記項 5 4 または 5 5 に記載の化合物または塩。

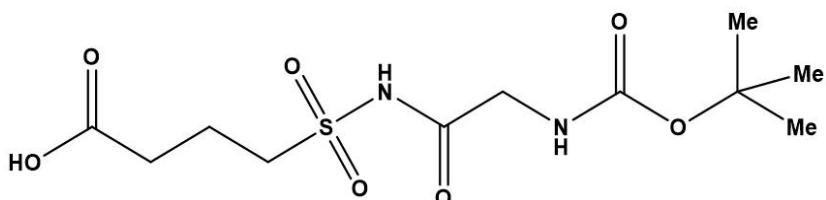
[項 6 1]

以下の構造を含む上記項 5 4 に記載の化合物、

【化 1 5】



【化 1 6】

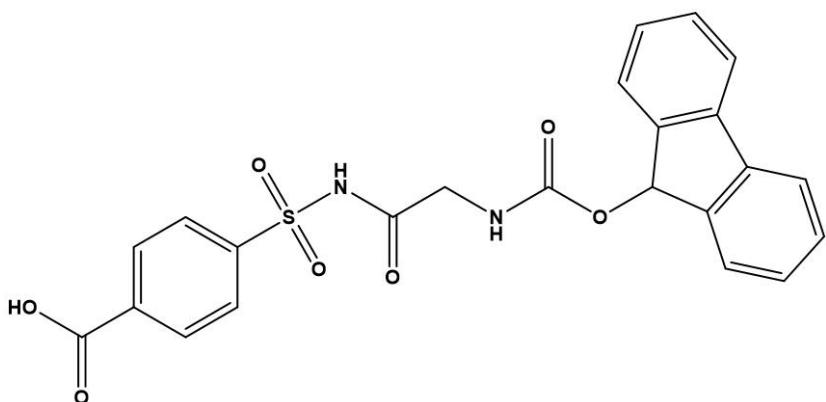


またはその塩。

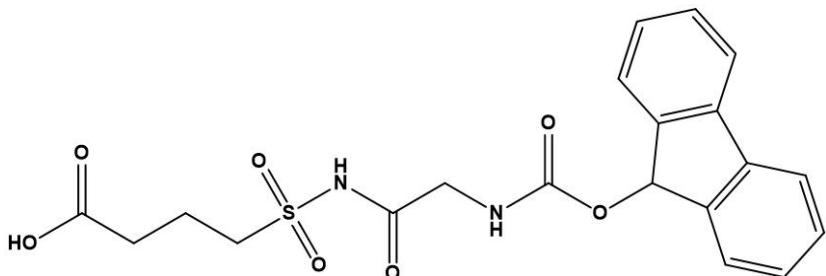
[項 6 2]

以下の構造を含む、上記項 5 4 に記載の化合物、

【化 1 7】



【化 1 8】



またはその塩。

[項 6 3]

分子を合成する方法であつて、

上記項 5 4 から 6 2 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩によって分子を形成することを備え、

- a . 前記化合物を固相上の第一アミノ基にカップリングすること、及び
- b . 前記化合物を脱保護して第二アミノ基を形成すること、
を備える、前記方法。

[項 6 4]

前記固相は、基質、ビーズ、ポリマー、またはクロマトグラフィー用充填剤を含む、上記項 6 3 に記載の方法。

[項 6 5]

前記脱保護は、光酸または光酸発生剤を含む、上記項 6 3 または 6 4 に記載の方法。

[項 6 6]

前記脱保護は、光塩基または光塩基発生剤を含む、上記項 6 3 または 6 4 に記載の方法。

[項 6 7]

ステップ(a)後で、ステップ(b)前に、アミンキャッピングステップをさらに備え、前記第一アミノ基をキャッピング剤と反応させることを備える、上記項 6 3 から 6 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

[項 6 8]

前記アミンキャッピングステップは、アルキルアミン、アリールアミン、アセトアミド、カルバメート、フタルイミド、エナミン、スルホンアミド、または保護アミノ酸を形成する、上記項 6 7 に記載の方法。

[項 6 9]

前記キャッピング剤は、無水酢酸、アセチルクロライド、フッ化アセチル、またはアシルグリシンである、上記項 6 7 に記載の方法。

[項 7 0]

上記項 6 3 から 6 9 のいずれか 1 項に記載のプロセスによって作製される分子。

参照による援用

本明細書におけるすべての刊行物、特許、及び特許出願は、参照によりそれらの全体が援用される。本明細書における用語と、援用された参照における用語との間に抵触がある場合には、本明細書における用語を優先する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 7 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 7 7】

別段に示されない限り、本明細書に定義されるような、それ自体によって、または別の基の部分として、本明細書に用いられる用語としての「アシル」は、カルボニル

【化 1 9】



基に連結される有機ラジカルを指すことが可能である。アシル基の例は、アルカノイル、アルケノイル、アロイル、アラルカノイル(aralkanoyl)、ヘテロアロイル、シクロアルカノイル、シクロヘテロアルカノイル及び同様のものなどの、カルボニルに付着する R 基のいずれかを含む。