

【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8月6日(2020.8.6)

【公表番号】特表2019-529523(P2019-529523A)

【公表日】令和1年10月17日(2019.10.17)

【年通号数】公開・登録公報2019-042

【出願番号】特願2019-523168(P2019-523168)

【国際特許分類】

C 0 7 F 9/6574 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/675 (2006.01)

A 6 1 K 31/77 (2006.01)

C 0 8 G 65/335 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 9/6574 C S P Z

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/02 1 0 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 33/06

A 6 1 P 33/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/12

A 6 1 K 31/675

A 6 1 K 31/77

C 0 8 G 65/335

【誤訳訂正書】

【提出日】令和2年6月23日(2020.6.23)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

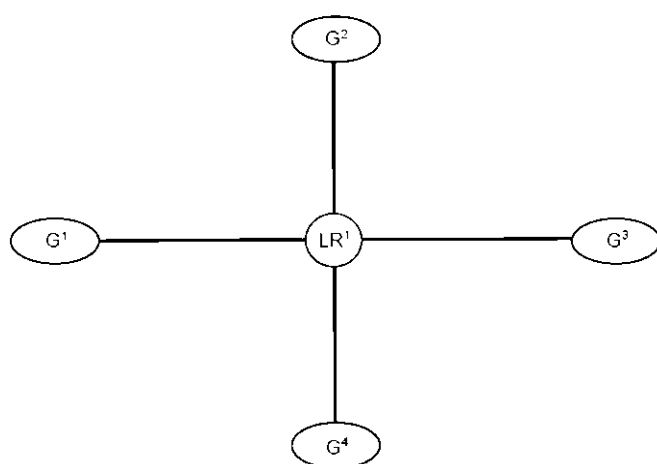
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

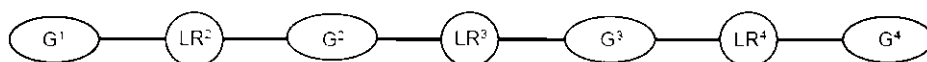
【請求項1】

下記式(I)又は(II)

【化1】



(I)

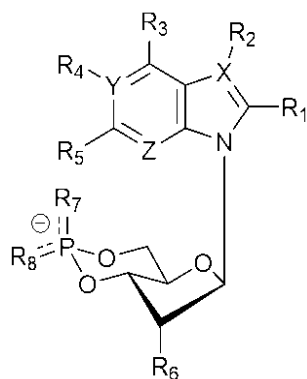


(II)

(式中、

G単位G¹及びG²は、独立に下記式(III)の化合物であり、G単位G³及びG⁴は、G¹及びG²とは独立にかつ互いに独立に式(III)の化合物又は非存在であり、ここで、式(II)の場合、G³が非存在であればG⁴は常に非存在であり、

【化2】



(III)

ここで、式(III)中、

X、Y及びZはNであり、

R₁、R₄、R₅及びR₈は、各G単位(G¹、G²、G³及びG⁴)について等しいか又は個別であり得、同時に

R₁は独立にH、ハロゲン、アジド、シアノ、アシル、アラシル、ニトロ、アルキル、アリール、アラルキル、アミド-アルキル、アミド-アリール、アミド-アラルキル、アミド-O-アルキル、アミド-O-アリール、アミド-O-アラルキル、OH、O-アルキル、O-アリール、O-アラルキル、O-アシル、O-アラシル、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、S-アシル、S-アラシル、S(0)-アルキル、S(0)-アリール、S(0)-アラルキル、S(0)-アシル、S(0)-アラシル、S(0)₂-アルキル、S(0)₂-アリール、S(0)₂-アラルキル、S(0)₂-アシル、S(0)₂-アラシル、SeH、Se-アルキル、Se-アリール、Se-アラルキル、NR₉R₁₀、カルバモイルR

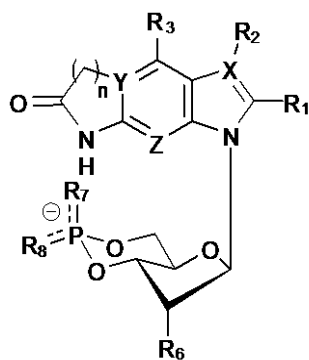
11R12、NH-カルバモイルR11R12、O-カルバモイルR11R12、SiR13R14R15であり得、ここで、R9、R10、R11、R12、R13、R14、R15は互いに独立にH、アルキル、アリール、アラルキルであり得；

R₂は非存在であり；

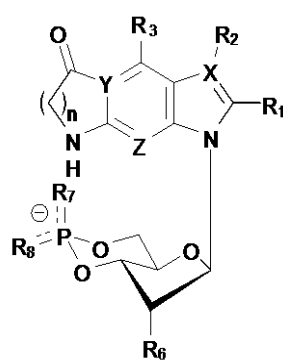
R₃はOHであり；

R₄は独立に非存在、H、アミノ、アルキル、アラルキル、ニトロ、Nオキシドであり得、或いはY及びR₅並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得るイミダゾール環を形成してよく、或いはY及びR₅並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、それぞれ非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る(図示せず)下記イミダゾリノン(構造IV、V、n=1)又は同族環(n=2~8)を形成してよく；

【化3】



(IV)



(V)

R₅は、独立にH、ハロゲン、アジド、シアノ、アシル、アラシル、ニトロ、アルキル、アリール、アラルキル、アミド-アルキル、アミド-アリール、アミド-アラルキル、アミド-O-アルキル、アミド-O-アリール、アミド-O-アラルキル、OH、O-アルキル、O-アリール、O-アラルキル、O-アシル、O-アラシル、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、S-アシル、S-アラシル、S(O)-アルキル、S(O)-アリール、S(O)-アラルキル、S(O)-アシル、S(O)-アラシル、S(O)₂-アルキル、S(O)₂-アリール、S(O)₂-アラルキル、S(O)₂-アシル、S(O)₂-アラシル、SeH、Se-アルキル、Se-アリール、Se-アラルキル、NR30R31、カルバモイルR32R33、NH-カルバモイルR32R33、O-カルバモイルR32R33、SiR34R35R36であり得、ここで、R30、R31、R32、R33、R34、R35、R36は互いに独立にH、アルキル、アリール、アラルキルであり得、或いはR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得るイミダゾール環を形成してよく、或いはR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、それぞれ非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る(図示せず)上記イミダゾリノン環(構造IV、V、n=1)又は同族環(n=2~8)を形成してよく；

R₆はOHであり；

R₇はOであり；

かつ

R₈はSH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、SeH、Se-アルキル、Se-アリール又はSe-アラルキル、ボラノ(BH₃)、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ(BH₂CN)、S-PAP、Se-PAP、S-BAP又はSe-BAPであり、

ここで、PAPは光活性化可能保護基であり、PAP=o-ニトロ-ベンジル、1-(o-ニトロフェニル)-エチリデン、4,5-ジメトキシ-2-ニトロ-ベンジル、7-ジメチルアミノ-クマリン-4-イル(DMACMケージド)、7-ジエチルアミノ-クマリン-4-イル(DEACMケージド)及び6,7-ビス(カルボキシメトキシ)クマリン-4-イル)メチル(BCMCMケージド)であり得、

かつBAPは、生体内活性化可能保護基であり、BAP=メチル、アセトキシメチル、ピバロイ

ルオキシメチル、メトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、ブチリルオキシメチル、シアノエチル、フェニル、ベンジル、4-アセトキシベンジル、4-ピバロイルオキシベンジル、4-イソブチリルオキシベンジル、4-オクタノイルオキシベンジル、4-ベンゾイルオキシベンジルであり得；

かつ

連結残基 LR^1 、 LR^2 、 LR^3 及び LR^4 は、独立に、それらが結合しているG単位(G^{1-4})の特定残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかを置き換えるか又はいずれかに共有結合することができ

、ここで、特定連結残基(LR^{1-4})が残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに共有結合する場合、前記特定残基(R_1 、 R_4 及び／又は R_5)のエンドスタンディング基は、構築化合物内で変換されるか又は置き換えられて、構築化合物内の特定連結残基(LR^{1-4})の一部としてさらに定義され、

同時に、

LR^1 は、(a)三価若しくは四価分岐炭化水素部分又は(b)二価炭化水素部分であり、それぞれヘテロ原子O、N、S、Si、Se、Bであり得るヘテロ原子が組み込まれているか又は組み込まれておらず、その骨格は、好ましくは1~28個の炭素原子を含有し、飽和又は不飽和、置換又は非置換であり得、

同時に

各付着点は独立に置換若しくは非置換炭素又はヘテロ原子であり得、

かつ

ポリエチレングリコール(PEG)部分が定義に従って組み込まれる場合、好ましい炭素原子数は、PEG部分に存在する数だけ超えてよく、全てのPEG部分を合わせて、

二価連結残基(LR^1)の場合は総数1~500のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 500$)を含有し得、

又は

三価連結残基(LR^1)の場合は総数1~750のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 750$)を含有し得、

又は

四価連結残基(LR^1)の場合は総数1~1000のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 1000$)を含有し得、

かつ置換されている場合、

置換基は、1つ以上のアルキル基、ハロゲン原子、ハロアルキル基、(非)置換アリール基、(非)置換ヘテロアリール基、アミノ、オキソ、ニトロ、シアノ、アジド、ヒドロキシ、メルカプト、ケト、カルボキシ、カルバモイル、エポキシ、メトキシ、エチニルを含んでよく、

及び／又は置換基がさらに互いに結合して、ヘテロ原子が組み込まれているか又は組み込まれていない、飽和又は不飽和、置換又は非置換、脂肪族又は芳香族の1~4個の環を有する環系を形成してよく；

LR^2 、 LR^3 及び LR^4 は、ヘテロ原子O、N、S、Si、Se、Bであり得るヘテロ原子が組み込まれているか又は組み込まれていない二価炭化水素部分であり、その骨格は、好ましくは1~28個の炭素原子を含有し、飽和又は不飽和、置換又は非置換であり得、

同時に

各付着点は独立に置換若しくは非置換炭素又はヘテロ原子であり得、

かつ

ポリエチレングリコール(PEG)部分が定義に従って組み込まれる場合、好ましい炭素原子数は、PEG部分に存在する数だけ超えてよく、全てのPEG部分を合わせて、総数1~500のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 500$)を含有し得、

かつ置換されている場合、

置換基は、1つ以上のアルキル基、ハロゲン原子、ハロアルキル基、(非)置換アリール基、(非)置換ヘテロアリール基、アミノ、オキソ、ニトロ、シアノ、アジド、ヒドロキシ、

メルカプト、ケト、カルボキシ、カルバモイル、エポキシ、メトキシ、エチニルを含んでよく、

及び／又は置換基がさらに互いに結合して、ヘテロ原子が組み込まれているか又は組み込まれていない、飽和又は不飽和、置換又は非置換、脂肪族又は芳香族の1～4個の環を有する環系を形成してよく；

ここで、式(II)の場合、 G^4 が非存在であれば、 LR^4 も非存在であり、かつ

式(II)の場合、 G^3 及び G^4 が非存在であれば、 LR^3 及び LR^4 も非存在であり、

かつ

G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 は、さらに塩及び／又は水和物であってよく、

同時に特定リン酸部分の適切な塩は、リチウム、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、亜鉛又はアンモニウム、及びトリアルキルアンモニウム、ジアルキルアンモニウム、アルキルアンモニウム、例えば、トリエチルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、ジエチルアンモニウム及びオクチルアンモニウムであり得；

かつ

G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 は、同位体若しくは放射標識、PEG化、固定化され得るか又は色素若しくは他の報告基で標識され得、

ここで、

前記報告基及び／又は色素は、

(a) 各G単位(G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4)について独立に特定残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに共有結合された又はいずれかを置き換えた連結残基(LR^5)を介して、 G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4 にカップリングされ、

同時に LR^5 は、 LR^2 の定義どおりであり得、

或いは

(b) 式(I)の場合は G^3 及び／又は G^4 を置き換えてよく、

ここで、

適切な色素は、蛍光色素、例えばフルオレセイン、アントラニロイル、N-メチルアントラニロイル、ダンシル又はニトロ-ベンゾフラザニル(NBD)系、ローダミンに基づく色素、例えばTexas Red又はTAMRA、シアニン色素、例えばCyTM3、CyTM5、CyTM7、EVOblueTM10、EVOblueTM30、EVOblueTM90、EVOblueTM100 (EVOblueTMファミリー)、BODIPYTMファミリー、Alexa FluorTMファミリー、DY-547P1、DY-647P1、クマリン、アクリジン、オキサゾン、フェナレノン、蛍光タンパク質、例えばGFP、BFP及びYFP、並びに近赤外及び遠赤外色素を含んでよく、

かつ

報告基は、量子ドット、ビオチン及びチロシルメチルエステルを含んでよく、

かつ

PEG化は、単一又は複数の LR^{PEG} 基の付着を独立に指し、 LR^{PEG} は、 LR^2 の定義どおりであり得、但し、この場合(i)各G単位(G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4)について独立に特定残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに共有結合するか又はいずれかを置き換えることによって、 LR^2 の1つの末端だけがG単位(G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4)に連結され、かつ(ii) LR^2 の他の末端は、共役反応及び／又は水素結合を可能にするアルキル基又は反応基のどちらかであることを条件とし、

同時に、反応基の非限定例は、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、 $-N_3$ 、 $-NHS$ エステル、ハロゲン基、エポキシド、エチニル、アリルであり得、

但し、(iii) LR^{PEG} は、組み込まれたエチレングリコール部分($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=2\sim 500$)を有することを条件とする)

を有する化合物。

【請求項2】

式(I)の場合、 G^3 及び G^4 が非存在であるか

又は

式(II)の場合、 G^3 、 G^4 、 LR^3 及び LR^4 が非存在である、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

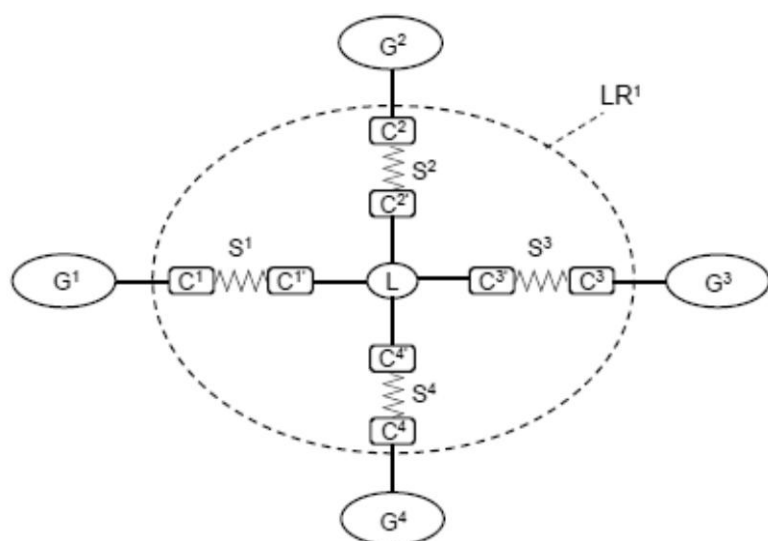
全ての R_8 が SH である、

請求項 1 ～ 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

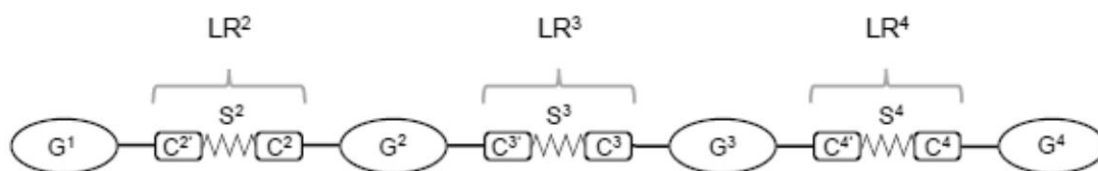
【請求項 4】

連結残基 LR^1 、 LR^2 、 LR^3 及び LR^4 が、下記式 (Ib) 及び (IIb)

【化 4】



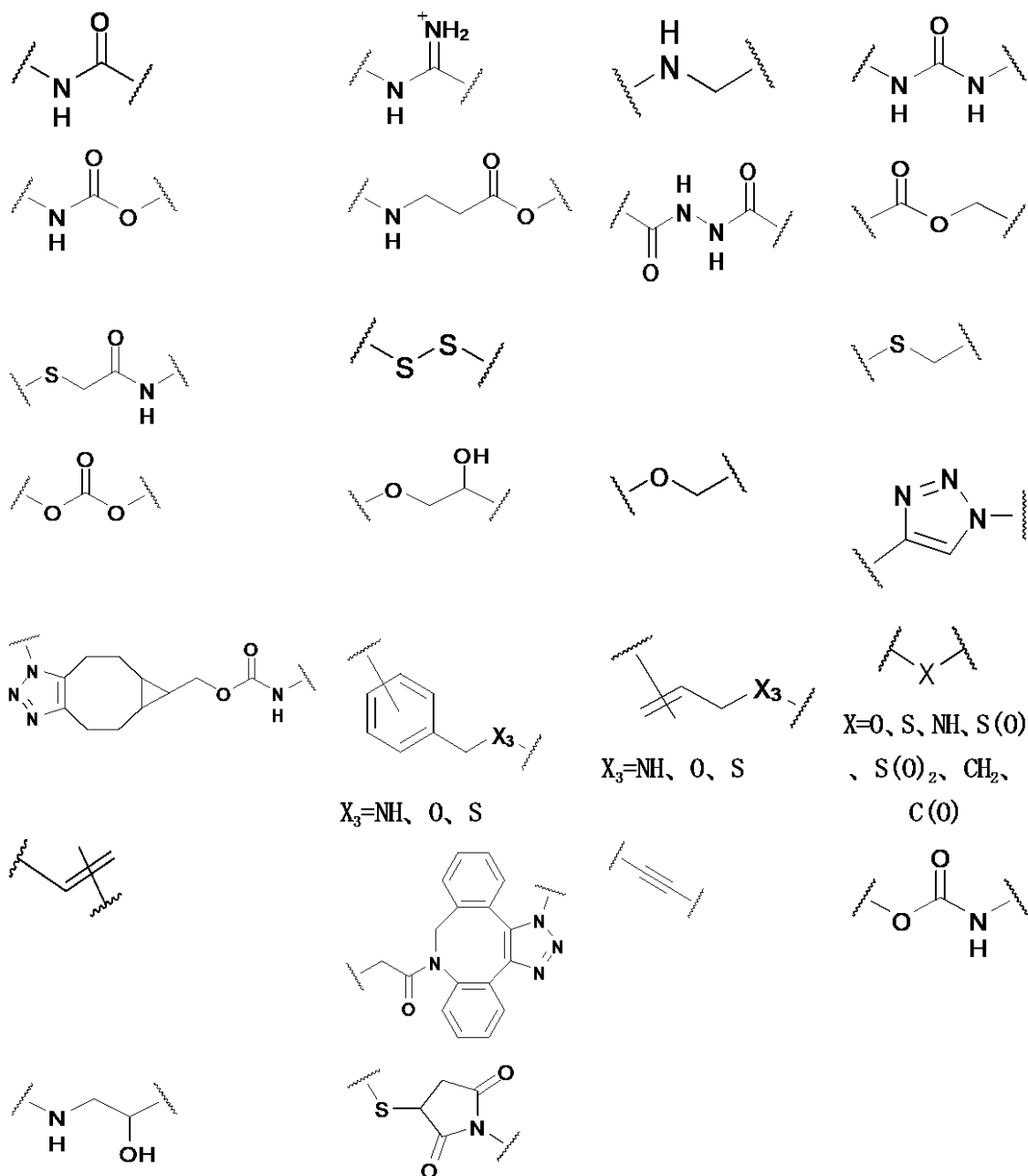
(Ib)



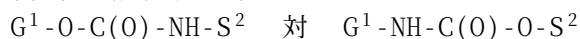
(IIb)

(式中、
カップリング官能基 C^1 、 $C^{1'}$ 、 C^2 、 $C^{2'}$ 、 C^3 、 $C^{3'}$ 、 C^4 及び $C^{4'}$ は、互いに独立に非存在
又は下記構造

【化 5】



から成る群より選択される構造によって定義されたとおりであり、同時に結合性は、



によって例示されるように描写又は反転されたとおりであり得、

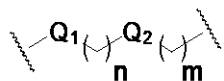
ここで、前記カップリング官能基(C^1 、 $C^{1'}$ 、 C^2 、 $C^{2'}$ 、 C^3 、 $C^{3'}$ 、 C^4 及び／又は $C^{4'}$)が、前記G単位の前記残基(G^{1-4} の R_1 、 R_4 及び／又は R_5)を置き換えるのではなく、それに結合する場合、G単位(又は色素若しくは他の報告基を有するG単位)のカップリングに参与する前記特定残基(R_1 、 R_4 及び／又は R_5)は互いに独立に、

請求項1～3のいずれか1項に記載されたとおりであり、ここで、エンドスタンディング基は前記カップリング官能基に置き換えられるか又は変換され、

或いは

下記群(式中、存在する場合、Q1はG単位に結合する)

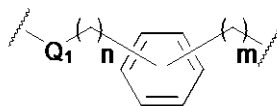
【化 6】



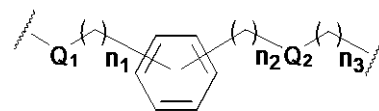
n=0-6 ; m=0-6

Q₁=非存在、S、NH、O、C(O)、S(O)、S(O)₂;Q₂=NH、S、O、C(O)、CH₂、

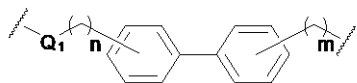
OC(O)、NC(O) ;



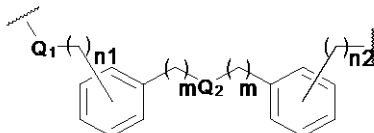
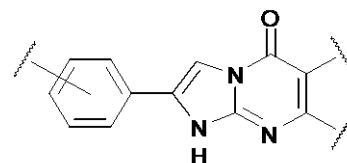
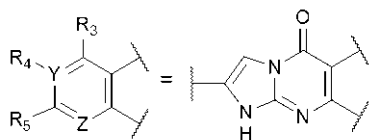
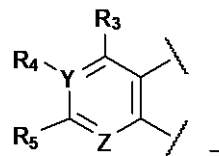
n=0-4、m=0-4

Q₁=非存在、S、NH、O、C(O)、S(O)、S(O)₂ ;n₁=0-4、n₂=0-4、n₃=0-4、Q₁=非存在、S、NH、O、C(O)、S(O)、S(O)₂;Q₂=NH、S、O、C(O)、CH₂、OC(O)

、NC(O) ;



n=0-4 ; m=0-4 ;

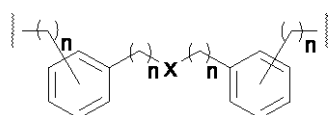
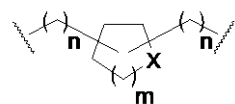
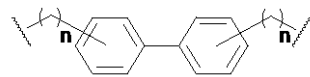
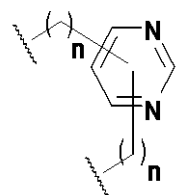
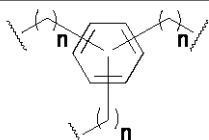
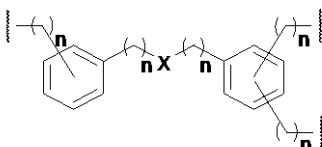
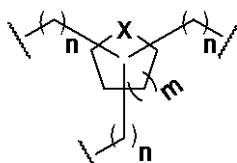
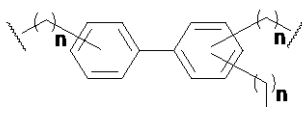
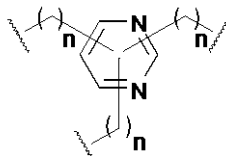
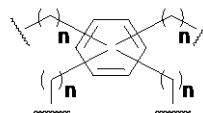
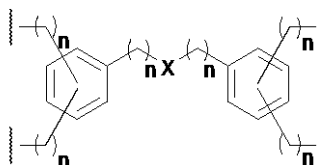
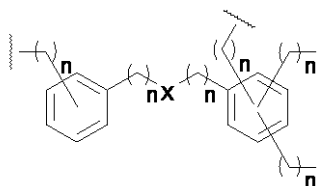
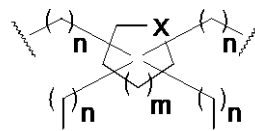
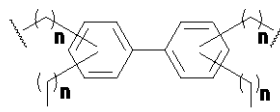
Q₁=非存在、S、NH、O、C(O)、S(O)、S(O)₂ ;n₁=0-4、n₂=0-4 ; m=0-4 ;Q₁=非存在、S、NH、O、C(O)、S(O)、S(O)₂ ;Q₂=CH₂、O、NH、S ;

から選択され、

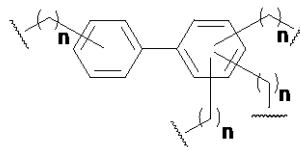
かつ

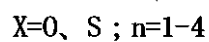
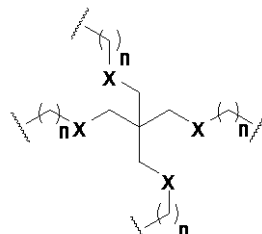
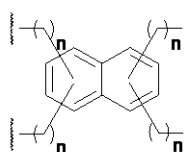
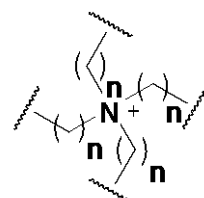
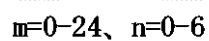
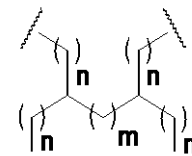
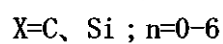
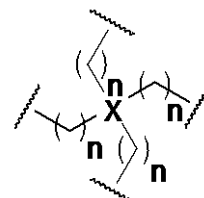
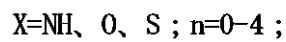
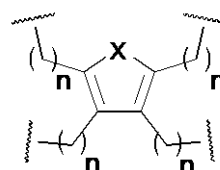
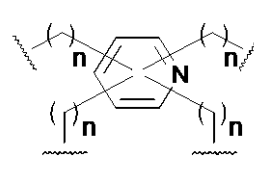
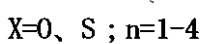
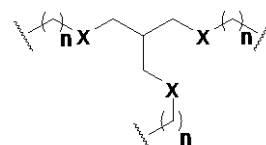
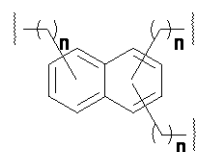
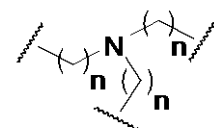
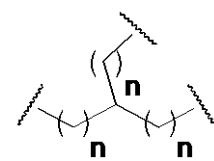
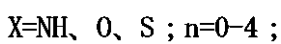
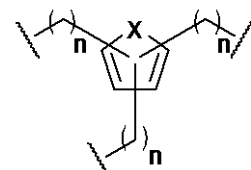
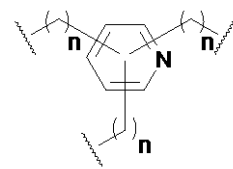
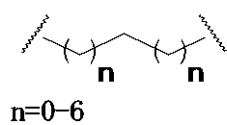
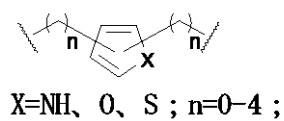
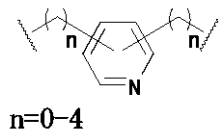
前記リンカー(L)は、下記リンカー

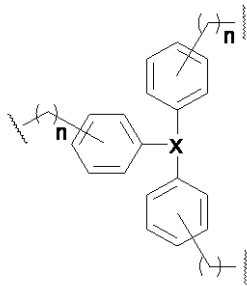
【化 7】

ダイマーリンカー $n=0-4$ 
 $X=CH_2, O, NH, S, S-S, C(O)$
 $); n=0-4$

 $X=CH_2, NH, O, S;$
 $n=0-4; m=1-2$
 $n=0-4$  $n=0-4$ トリマーリンカー $n=0-4$ 
 $X=CH_2, O, NH, S, S-S, C(O)$
 $); n=0-4$

 $X=CH_2, NH, O, S;$
 $n=0-4; m=1-2$
 $n=0-4$  $n=0-4$ テトラマーリンカー $n=0-4$ 
 $X=CH_2, O, NH, S, S-S, C(O)$
 $); n=0-4$
 又は

 $X=CH_2, O, NH, S, S-S, C(O)$
 $); n=0-4$

 $X=CH_2, NH, O, S;$
 $n=0-4; m=1-2$
 $n=0-4$

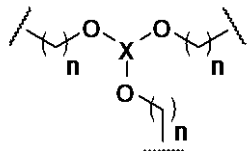
又は

 $n=0-4$

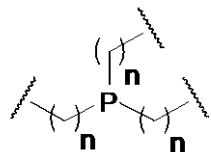




$X = \text{CH}, \text{P}; n = 0-4$

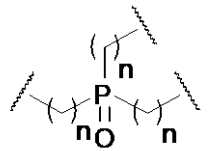


$X = \text{B}, \text{Si}; n = 1-4$

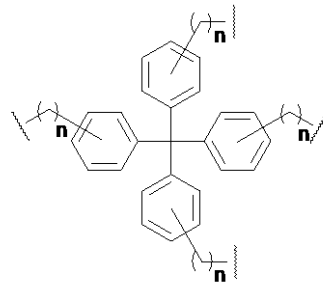
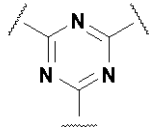


$n = 1-4$

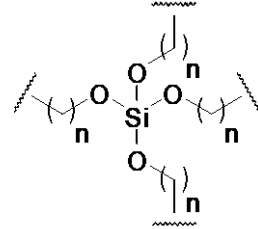
又は



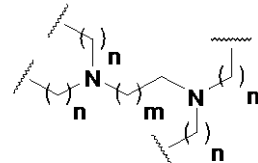
$n = 1-4$



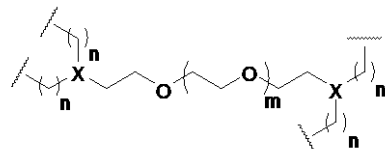
$n = 0-4$



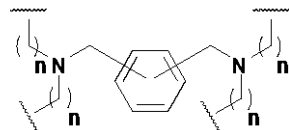
$n = 1-4$



$n = 1-6; m = 1-11$



$X = \text{N}, \text{CH}; n = 1-6; m = 0-10$



$n = 0-6$

から成る群より選択され、

同時に

前記リストの特定リンカー内の各側鎖についての n は、定義どおりの等しいか又は個別の値を有し得、

かつ

前記リストのリンカー(L)の全てのキラル、ジアステレオマー、ラセミ、エピマー、及び全ての幾何異性形は、明示されていないものの、この中に含まれ、

かつ

アンモニウム誘導体等のカチオンリンカー(L)は、クロリド、ブロミド、ヨージド、ホスファート、カルボナート、スルファート、アセタート又はいずれもの他の生理学的に受け入れられる対イオンを含有する塩であり、

かつ

スパーサー (S^1 、 S^2 、 S^3 及び S^4) は、特定化合物内で等しいか又は個別であり、非存在又は $-(CH_2)_{n1}-(CH_2CH_2\beta)_m-(CH_2)_{n2}-$ ($\beta=O$ 、 S 又は NH ; $m=1\sim 500$ 、 $n1=0\sim 8$ 、 $n2=0\sim 8$ であり、同時に両 $n1$ 及び $n2$ は、独立に等しいか又は個別であり得る) 若しくは $-(CH_2)_n-$ ($n=1\sim 24$) であり得る)

に示すようにさらに細分される、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

R_1 が、独立に H 、ハロゲン、アジド、ニトロ、アルキル、アシル、アリール、 OH 、 O -アルキル、 O -アリール、 SH 、 S -アルキル、 S -アリール、 S -アラルキル、 $S(O)$ -アルキル、 $S(O)$ -アリール、 $S(O)$ -アラルキル、 $S(O)$ -ベンジル、 $S(O)_2$ -アルキル、 $S(O)_2$ -アリール、 $S(O)_2$ -アラルキル、アミノ、 NH -アルキル、 NH -アリール、 NH -アラルキル、 NR_9R_{10} 、 $SiR_{13}R_{14}R_{15}$ であり得、ここで、 R_9 、 R_{10} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} はアルキルであり；

及び／又は

R_4 が、独立に非存在、 H 、アミノ、アルキル、アラルキル、ニトロ、 N オキシドであり得、或いは Y 及び R_5 並びに Y と R_5 を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得るイミダゾール環を形成するか、或いは Y 及び R_5 並びに Y と R_5 を架橋する炭素と一緒に、それぞれ非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る (図示せず) 前記イミダゾリノン (構造 IV、V、 $n=1$) 又は同族環 ($n=2\sim 8$) を形成し得、

及び／又は

R_5 が、独立に H 、ハロゲン、アジド、アシル、アラシル、ニトロ、アルキル、アリール、アラルキル、アミド-アルキル、アミド-アリール、アミド-アラルキル、アミド- O -アルキル、アミド- O -アリール、アミド- O -アラルキル、 NH -カルバモイル-アルキル、 NH -カルバモイル-アリール、 NH -カルバモイル-アラルキル、 OH 、 O -アルキル、 O -アリール、 O -アラルキル、 SH 、 S -アルキル、 S -アリール、 S -アラルキル、アミノ、 NH -アルキル、 NH -アリール、 NH -アラルキル、 $NR_{30}R_{31}$ 、 $SiR_{34}R_{35}R_{36}$ であり得、ここで、 R_{30} 、 R_{31} 、 R_{34} 、 R_{35} 、 R_{36} はアルキルであり、或いは R_4 、 Y 並びに Y と R_5 を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る置換イミダゾール環を形成するか、或いは R_4 、 Y 並びに Y と R_5 を架橋する炭素と一緒に、それぞれ非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る (図示せず) 前記イミダゾリノン環 (構造 IV、V、 $n=1$) 又は同族環 ($n=2\sim 8$) を形成し得、

及び／又は

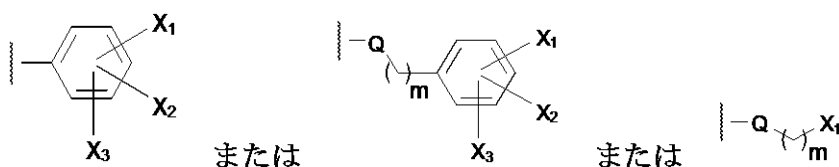
R_8 が、 SH 、 S -アルキル、 S -アリール、 S -アラルキル、ボラノ (BH_3)、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ (BH_2CN) である、

請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

R_1 が、 H 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 N_3 、 NO_2 、 OH 、 SH 、 NH_2 、 CF_3 、2-フリル、3-フリル、2-ブロモ-5-フリル、(2-フリル)チオ、(3-(2-メチル)フリル)チオ、(3-フリル)チオ、2-チエニル、3-チエニル、(5-(1-メチル)テトラゾリル)チオ、1,1,2-トリフルオロ-1-ブテンチオ、(2-(4-フェニル)イミダゾリル)チオ、(2-ベンゾチアゾリル)チオ、(2,6-ジクロロフェノキシプロピル)チオ、2-(N -(7-ニトロベンゾ-2-オキサ-1,3-ジアゾール-4-イル)アミノ)エチルチオ、(4-ブロモ-2,3-ジオキサプロピル)チオ、[2-[(フルオレセインイルチオウレイド)アミノ]エチル]チオ、2,3,5,6-テトラフルオロフェニルチオ、(7-(4-メチル)クマリニル)チオ、(4-(7-メトキシ)クマリニル)チオ、(2-ナフチル)チオ、(2-(1-ブロモ)ナフチル)チオ、ベンズイミダゾリル-2-チオベンゾチアゾリルチオ、4-ピリジル、(4-ピリジル)チオ、2-ピリジルチオ、5-アミノ-3-オキサペンチルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、19-アミノ-4,7,10,13,16-ペンタオキサノナデシルアミノ、17-アミノ-9-アザ-ヘプタデシルアミノ、4-(N -メチルアントラノイル)アミノブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、4-モルホリノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノ、トリフェニルイミノホスホラニルであるか又は残基 R_1 が、残基エントリー 1 又は 2 として以下に示すとおりであり、残基エントリー 1：

【化 8】



(式中、

 $m=0-6$ ； $Q=S, S(O), S(O)_2, O, NH, Se, CH_2, C(O)$ ； X_1, X_2 及び X_3 は、等しいか又は独立に $H, OH, NH_2, N_3, SH, CN, NO_2, F, Cl, Br, I, (CH_2)_nCH_3 (n=0-5), i-Pr, t-Bu,$

【化 9】



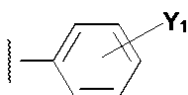
(n=0-5)、

【化 10】

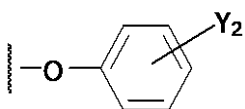


(n=0-5)、 $CH_2OH, (CH_2)_nOCH_3 (n=1-2), CH_2N(CH_3)_2, O(CH_2)_nCH_3 (n=0-5), Oi-Pr, OCy, OCyp, OBn, OC(O)CH_3, OC(O)Ph, OCF_3, N(CH_3)_2, NH(CH_2)_nCH_3 (n=0-5), NHC(O)t-Bu, NHC(O)Ph, NHC(O)Ot-Bu, NHC(O)CH_3, NHC(O)CH_2N_3, B(OH)_2, CF_3, C(O)OH, C(O)OCH_3, C(O)Oi-Pr, C(O)Ot-Bu, C(O)OPh, C(O)OBn, C(O)NH_2, C(O)N(CH_3)_2, C(O)NHPh, C(O)NHBn, C(O)CF_3, CH_2C(O)OH, CH_2C(O)OCH_3, CH_2C(O)Oi-Pr, CH_2C(O)Ot-Bu, CH_2C(O)OBn, S(CH_2)_nCH_3 (n=0-5), S(CH_2)_nOEt (n=1-4), SBn, SO_2CH_3, SO_2CF_3,$

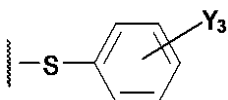
【化 11】

(Y₁=H、SH、CN、Ph、F、CH₃、OCH₃、SCH₃、4-チオフェニル、NO₂、ペンチル)、

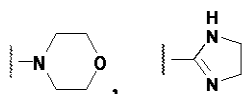
【化 12】

(Y₂=H、SH、F)、

【化 13】

(Y₃=H、SH)、

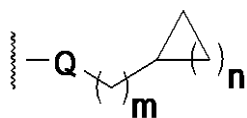
【化 14】



であり得る)；

残基エントリー2：

【化 1 5】



(式中、

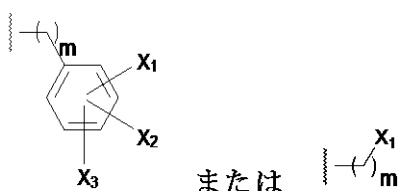
 $m=0-6$; $n=1-6$; $Q=S, S(O), S(O)_2, O, NH, Se$) ;

及び／又は

R_4 が、非存在、アミノ、Nオキシドであるか又は残基 R_4 が、残基エントリー1、2、3又は4として以下に示すとおりであり、

残基エントリー1:

【化 1 6】



(式中、

 $m=1-6$;

X_1, X_2 及び X_3 は、等しいか又は独立に $H, N_3, CN, NO_2, F, Cl, Br, I, (CH_2)_nCH_3 (n=0-5)$ 、 $i-Pr, t-Bu$ 、

【化 1 7】

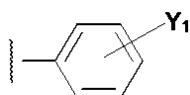
($n=0-5$)、

【化 1 8】

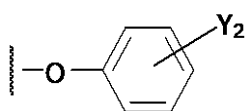


($n=0-5$)、 $(CH_2)_n OCH_3 (n=1-2)$ 、 $CH_2 N(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_n CH_3 (n=0-5)$ 、 $Oi-Pr$ 、 OBn 、 $OC(O)CH_3$ 、 $OC(O)Ph$ 、 OCF_3 、 $N(CH_3)_2$ 、 $NHC(O)t-Bu$ 、 $NHC(O)Ph$ 、 $NHC(O)Ot-Bu$ 、 $NHC(O)CH_3$ 、 $NHC(O)CH_2 N_3$ 、 CF_3 、 $C(O)OCH_3$ 、 $C(O)Oi-Pr$ 、 $C(O)Ot-Bu$ 、 $C(O)OPh$ 、 $C(O)OBn$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)N(CH_3)_2$ 、 $C(O)NHPh$ 、 $C(O)NHBn$ 、 $C(O)CF_3$ 、 $CH_2 C(O)OCH_3$ 、 $CH_2 C(O)Oi-Pr$ 、 $CH_2 C(O)Ot-Bu$ 、 $CH_2 C(O)OBn$ 、 $S(CH_2)_n CH_3 (n=0-5)$ 、 $S(CH_2)_n OEt (n=1-4)$ 、 SBn 、 SPh 、 $SO_2 CF_3$ 、

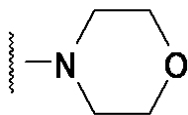
【化 1 9】

($Y_1=H, CN, Ph, F, CH_3, OCH_3, SCH_3, NO_2$ 、ペンチル)、

【化 2 0】

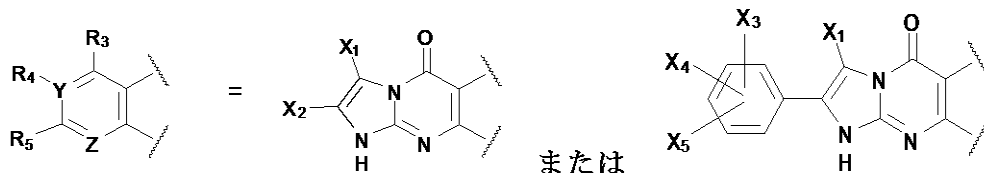
($Y_2=H, F$)、

【化 2 1】



であり得る) ;
残基エントリー-2 :

【化 2 2】



または

(式中、

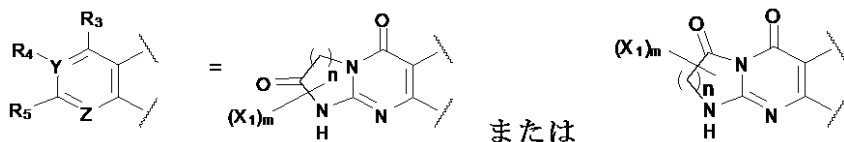
X_1 は、H、 CH_3 、Phであり得 ;

X_2 は、H、Ph、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジ
オキシシン-6-イル、ベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1
-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、C(P
h)₃、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリ
ジニル、5-クロロ-2-チエニル、1-ベンゾフラン-2-イルであり得、

X_3 、 X_4 及び X_5 は、独立に OH、NH、 CH_3 、Cl、Br、F、CN、 N_3 、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、C(O)OH、C(
O)OCH₃、OCH₃、OBn、O-ベンゾイル、SCH₃、t-Bu、N(CH₃)₂、S-フェニル、Ph、S(O)₂CH₃、
C(O)NH₂、NHS(O)₂CH₃ であり得る) ;

残基エントリー-3 :

【化 2 3】



または

(ここで、上記定義から逸脱して、環炭素原子のいずれかに付着したいずれの水素原子 (描
写され、暗示され、若しくは明示的に定義された水素を含む)、又は同一の特定炭素原
子に付着した両水素原子(m=2)は、安定構造が形成される限り、1つ又は2つの(等しい)「
フローティング基」 X_1 にそれぞれ置き換えられてよく、
同時にm=1又は2 ;

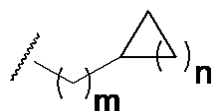
n=1-4 ;

X_1 は、H、 CH_3 、Et、Pr、i-Pr、Bu、F、Ph、 $(CH_2)_2OH^*$ であり得る

(*第1の場合についてののみ) ;

残基エントリー-4 :

【化 2 4】



(式中、

m=1-6 ;

n=1-6) ;

及び/又は

R_5 が、H、NH₂、F、Cl、Br、I、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、n-ヘキシル、6-ア
ミノ-n-ヘキシル、トリフルオロメチル、フェニル、4-N,N-ジメチルアミノフェニル、ベ

ンジル、4-アジドベンジル、アミド-n-ブチル、アミドイソブチル、アミド(6-アミノ-n-ヘキシル)、OH、メチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、SH、メチルチオ、エチルチオ、6-アミノ-n-ヘキシルチオ、フェニルチオ、4-アジドフェニルチオ、ベンジルチオ、4-アジドベンジルチオ、メチルアミノ、NH-ベンジル、NH-フェニル、NH-4-アジドフェニル、NH-フェニルエチル、NH-フェニルプロピル、2-アミノエチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、6-アミノ-n-ヘキシルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、ジメチルアミノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノ、トリメチルシリル、トリエチルシリル、tert-ブチルジメチルシリルであるか又はR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、上記リスト(エントリー2及び3)に示した環系を形成し得；

及び／又は

R₈が、SH、メチルチオ、アセトキシメチルチオ、ピバロイルオキシメチルチオ、メトキシメチルチオ、プロピオニルオキシメチルチオ、ブチリルオキシメチルチオ、シアノエチルチオ、フェニルチオ、ベンジルチオ、4-アセトキシベンジルチオ、4-ピバロイルオキシベンジルチオ、4-イソブチリルオキシベンジルチオ、4-オクタノイルオキシベンジルチオ、4-ベンゾイルオキシベンジルチオ、ボラノ(BH₃)、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ(BH₂CN)である、

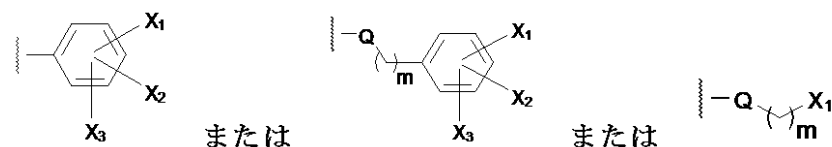
請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

R₁が、H、Cl、Br、I、F、N₃、NO₂、OH、SH、NH₂、CF₃、2-フリル、3-フリル、(2-フリル)チオ、(3-(2-メチル)フリル)チオ、(3-フリル)チオ、2-チエニル、3-チエニル、(5-(1-メチル)テトラゾリル)チオ、1,1,2-トリフルオロ-1-ブテンチオ、(2-(4-フェニル)イミダゾリル)チオ、(2-ベンゾチアゾリル)チオ、(2,6-ジクロロフェノキシプロピル)チオ、2-(N-(7-ニトロベンゾ-2-オキサ-1,3-ジアゾール-4-イル)アミノ)エチルチオ、(4-プロモ-2,3-ジオキサプロピル)チオ、[2-[(フルオレセインイルチオウレイド)アミノ]エチル]チオ、2,3,5,6-テトラフルオロフェニルチオ、(7-(4-メチル)クマリニル)チオ、(4-(7-メトキシ)クマリニル)チオ、(2-ナフチル)チオ、(2-(1-プロモ)ナフチル)チオ、ベンズイミダゾリル-2-チオ、ベンゾチアゾリルチオ、4-ピリジル、(4-ピリジル)チオ、2-ピリジルチオ、5-アミノ-3-オキソペンチルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、19-アミノ-4,7,10,13,16-ペンタオキサノナデシルアミノ、17-アミノ-9-アザ-ヘプタデシルアミノ、4-(N-メチルアントラノイル)アミノブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、4-モルホリノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノ、トリフェニルイミノホスホラニルであるか又は残基R₁が、残基エントリー1又は2として以下に示すとおりであり、

残基エントリー1：

【化25】



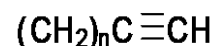
(式中、

m=0-6；

Q=S、S(O)₂、NH；

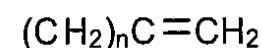
X₁、X₂及びX₃は、等しいか又は独立にH、OH、NH₂、N₃、SH、CN、NO₂、F、Cl、Br、I、(CH₂)_nCH₃(n=0-5)、i-Pr、t-Bu、Ph、

【化26】



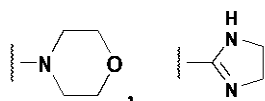
(n=0-5)、

【化27】



($n=0-5$)、 CH_2OH 、 $(\text{CH}_2)_n\text{OCH}_3$ ($n=1-2$)、 $\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CH}_3$ ($n=0-5$)、 $\text{O}i\text{-Pr}$ 、 OCy 、 OCyp 、 OPh 、 OBn 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{Ph}$ 、 OCF_3 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{NH}(\text{CH}_2)_n\text{CH}_3$ ($n=0-5$)、 $\text{NHC}(\text{O})t\text{-Bu}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{Ph}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})Ot\text{-Bu}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_2\text{N}_3$ 、 $\text{B}(\text{OH})_2$ 、 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}i\text{-Pr}$ 、 $\text{C}(\text{O})Ot\text{-Bu}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OPh}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OBn}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHPh}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHBn}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{O}i\text{-Pr}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})Ot\text{-Bu}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OBn}$ 、 $\text{S}(\text{CH}_2)_n\text{CH}_3$ ($n=0-5$)、 $\text{S}(\text{CH}_2)_n\text{OEt}$ ($n=1-4$)、 SBn 、 SPh 、

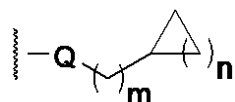
【化 2 8】



であり得る)；

残基エントリー2：

【化 2 9】



(式中、

$m=0-6$ ；

$n=1-6$ ；

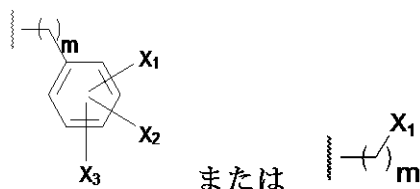
$Q=\text{S}$ 、 $\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{S}(\text{O})_2$ 、 NH)；

及び／又は

R_4 が、非存在、アミノ、Nオキシドであるか又は残基 R_4 が、残基エントリー1、2、3又は4として以下に示すとおりであり、

残基エントリー1：

【化 3 0】



(式中、

$m=1-3$ ；

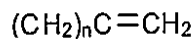
X_1 、 X_2 及び X_3 は、等しいか又は独立に H 、 N_3 、 CN 、 NO_2 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $(\text{CH}_2)_n\text{CH}_3$ ($n=0-5$)、 $i\text{-Pr}$ 、 $t\text{-Bu}$ 、 Ph 、

【化 3 1】



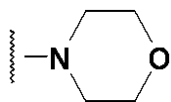
($n=0-5$)、

【化 3 2】



($n=0-5$)、 $(\text{CH}_2)_n\text{OCH}_3$ ($n=1-2$)、 $\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CH}_3$ ($n=0-5$)、 $\text{O}i\text{-Pr}$ 、 OPh 、 OBn 、 $\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{Ph}$ 、 OCF_3 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})t\text{-Bu}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{Ph}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})Ot\text{-Bu}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_2\text{N}_3$ 、 CF_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}i\text{-Pr}$ 、 $\text{C}(\text{O})Ot\text{-Bu}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OPh}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OBn}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHPh}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHBn}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{O}i\text{-Pr}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})Ot\text{-Bu}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OBn}$ 、 $\text{S}(\text{CH}_2)_n\text{CH}_3$ ($n=0-5$)、 $\text{S}(\text{CH}_2)_n\text{OEt}$ ($n=1-4$)、 SBn 、 SPh 、 SO_2CF_3 、

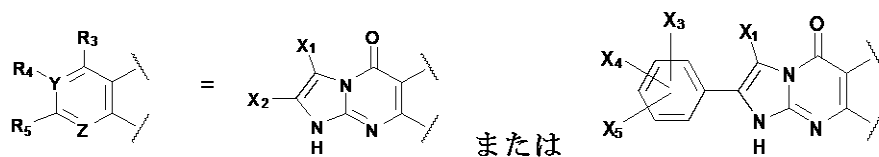
【化 3 3】



であり得る) ;

残基エントリー-2 :

【化 3 4】



(式中、

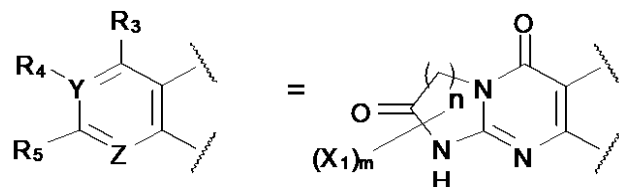
X_1 は、H、 CH_3 、Phであり得 ;

X_2 は、H、Ph、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジ
オキシシ-6-イル、ベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1
-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、C(P
h)₃、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリ
ジニル、1-ベンゾフラン-2-イルであり得 ;

X_3 、 X_4 及び X_5 は、独立にOH、NH、 CH_3 、Cl、Br、F、CN、 N_3 、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 OCH_3 、OBn、O-ベンゾイル、 SCH_3 、t-Bu、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、S-フェニル、Ph、 $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{CH}_3$ であり得る) ;

残基エントリー-3 :

【化 3 5】



(ここで、上記定義から逸脱して、環炭素原子のいずれかに付着したいずれの水素原子 (描
写され、暗示され、若しくは明示的に定義された水素を含む)、又は同一の特定炭素原
子に付着した両水素原子($m=2$)は、安定構造が形成される限り、1つ又は2つの(等しい)「
フローティング基」 X_1 にそれぞれ置き換えられてよく、

同時に $m=1$ 又は2 ;

$n=1-4$;

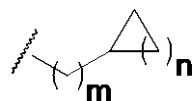
X_1 は、H、 CH_3 、Et、Pr、i-Pr、Bu、F、Ph、 $(\text{CH}_2)_2\text{OH}^*$ であり得る

(*第1の場合についてののみ) ;

残基エントリー-4 :

【化 3 6】

又は



(式中、

$m=1-6$;

$n=1-6$) ;

及び/又は

R_5 が、H、 NH_2 、F、Cl、Br、I、ニトロ、SH、メチルチオ、エチルチオ、6-アミノ-n-ヘキ
シルチオ、フェニルチオ、4-アジドフェニルチオ、ベンジルチオ、4-アジドベンジルチオ

、メチルアミノ、NH-ベンジル、NH-フェニル、NH-4-アジドフェニル、NH-フェニルエチル、NH-フェニルプロピル、2-アミノエチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、6-アミノ-n-ヘキシルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、ジメチルアミノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノであるか又はR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、上記リスト(エントリ-2及び3)に示した環系を形成し得；

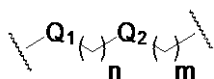
及び／又は

G単位を別のG単位又は色素若しくは他の報告基と連結することに関する残基は、R₁、R₄及び／又はR₅であり得、この場合、特定残基は、直前に定義した(特定残基について)とおりであり、ここで、エンドスタンディング基はカップリング官能基に変換されるか又は置き換えられ、

或いは

下記リスト(存在する場合、Q₁はG単位に結合する)：

【化37】

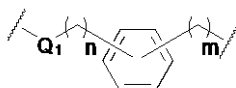
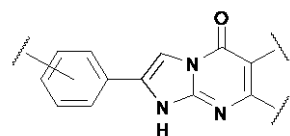
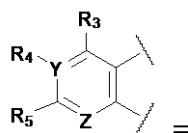


n=0-6 ; m=0-6 ;

Q₁=非存在、S、NH、O；

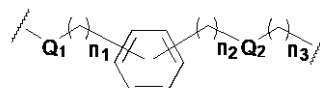
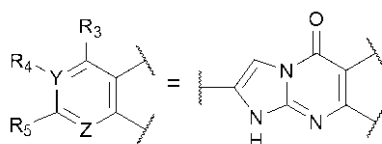
Q₂=NH、S、O、C(O)、CH₂

、OC(O)、NC(O)；



n=0-4、m=0-4

Q₁=非存在、S、NH、O；



n₁=0-4、n₂=0-4、n₃=0-4、

Q₁=非存在、S、NH、O；

Q₂=NH、S、O、C(O)、CH₂、O

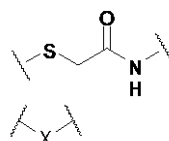
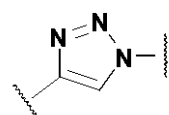
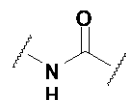
C(O)、NC(O)；

に示すとおりであり、

及び／又は

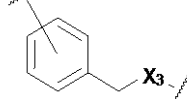
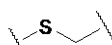
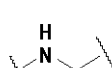
カップリング官能基(C¹⁻⁴及びC^{1'-4'})が、下記基

【化38】

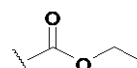
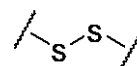
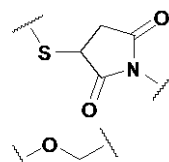
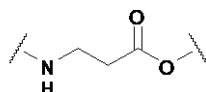


X=O、S、NH、S(O)、S(O)₂、

CH₂、C(O)



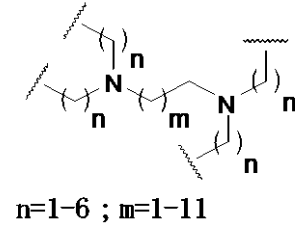
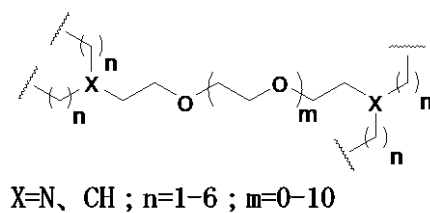
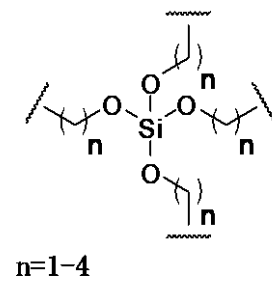
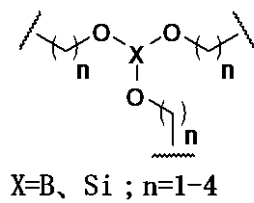
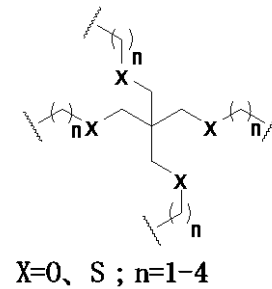
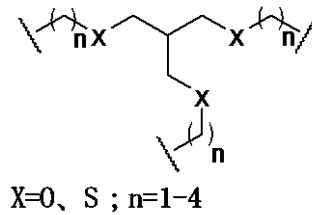
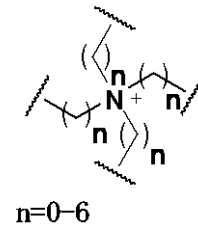
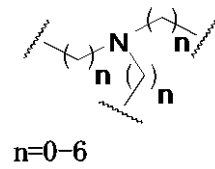
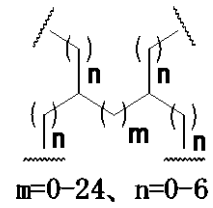
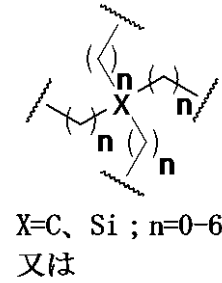
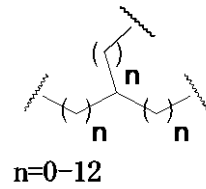
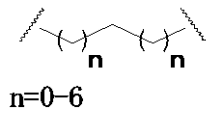
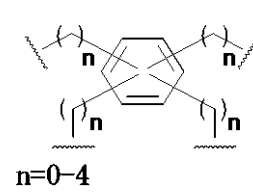
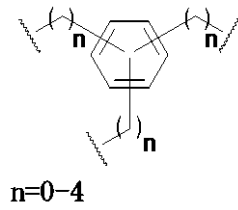
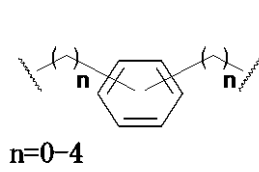
X₃=NH、O、S



から成る群より選択され、
及び／又は

前記リンカー(L)が、非存在又はリンカー(L)の下記リスト：

【化 3 9】



に示すとおりであり得、

同時に特定リンカー内の各側鎖についてのnは、定義どおりの等しいか又は個別の値を有し得、

及び／又は

R_gが、SH、メチルチオ、アセトキシメチルチオ、ピバロイルオキシメチルチオ、メトキシメチルチオ、プロピオニルオキシメチルチオ、ブチリルオキシメチルチオ、シアノエチルチオ、フェニルチオ、ベンジルチオ、4-アセトキシベンジルチオ、4-ピバロイルオキシベンジルチオ、4-イソブチリルオキシベンジルチオ、4-オクタノイルオキシベンジルチオ、4-ベンゾイルオキシベンジルチオ、ボラノ(BH₃)、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ(BH₂CN)である、

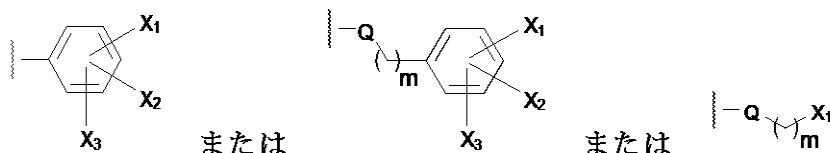
請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

R₁が、H、Cl、Br、SH、2-フリル、3-フリル、(2-フリル)チオ、(3-(2-メチル)フリル)チオ、(3-フリル)チオ、2-チエニル、3-チエニル、(5-(1-メチル)テトラゾリル)チオ、1,1,2-トリフルオロ-1-ブテンチオ、(2-(4-フェニル)イミダゾリル)チオ、(2-ベンゾチアゾリル)チオ、(2,6-ジクロロフェノキシプロピル)チオ、2-(N-(7-ニトロベンゾ-2-オキサ-1,3-ジアゾール-4-イル)アミノ)エチルチオ、(4-ブromo-2,3-ジオキソブチル)チオ、[2-[(フルオレセインイルチオウレイド)アミノ]エチル]チオ、2,3,5,6-テトラフルオロフェニルチオ、(7-(4-メチル)クマリニル)チオ、(4-(7-メトキシ)クマリニル)チオ、(2-ナフチル)チオ、(2-(1-ブromo)ナフチル)チオ、ベンズイミダゾリル-2-チオ、ベンゾチアゾリルチオ、4-ピリジル、(4-ピリジル)チオ、2-ピリジルチオ、トリフェニルイミノホスホラニルであるか又は残基R₁が、残基エントリー1又は2として以下に示すとおりであり、

残基エントリー1：

【化40】



(式中、

m=0-3；

Q=S；

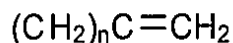
X₁、X₂及びX₃は、等しいか又は独立にH、OH、NH₂、N₃、SH、CN、NO₂、F、Cl、Br、I、(CH₂)_nCH₃(n=0-5)、i-Pr、t-Bu、Ph、

【化41】



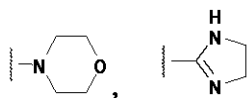
(n=0-5)、

【化42】



(n=0-5)、CH₂OH、(CH₂)_nOCH₃(n=1-2)、CH₂N(CH₃)₂、O(CH₂)_nCH₃(n=0-5)、Oi-Pr、OCy、OCyp、OPh、OBn、OC(O)CH₃、OC(O)Ph、OCF₃、N(CH₃)₂、NH(CH₂)_nCH₃(n=0-5)、NHC(O)t-Bu、NHC(O)Ph、NHC(O)Ot-Bu、NHC(O)CH₃、NHC(O)CH₂N₃、B(OH)₂、CF₃、C(O)OH、C(O)OCH₃、C(O)Oi-Pr、C(O)Ot-Bu、C(O)OPh、C(O)OBn、C(O)NH₂、C(O)N(CH₃)₂、C(O)NHPh、C(O)NHBn、C(O)CF₃、CH₂C(O)OH、CH₂C(O)OCH₃、CH₂C(O)Oi-Pr、CH₂C(O)Ot-Bu、CH₂C(O)OBn、S(CH₂)_nCH₃(n=0-5)、S(CH₂)_nOEt(n=1-4)、SBn、SPh、

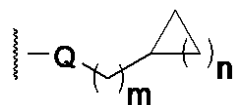
【化 4 3】



であり得る) ;

残基エントリー-2 :

【化 4 4】



(式中、

$m=0-6$;

$n=1-6$;

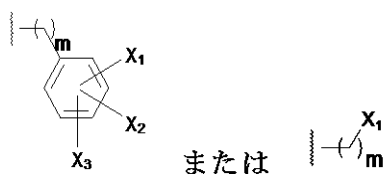
$Q=S$) ;

及び／又は

R_4 が、非存在又は残基エントリー-1、2、3又は4として以下に示すとおりであり、

残基エントリー-1 :

【化 4 5】



(式中、

$m=1-3$;

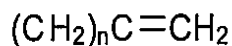
X_1 、 X_2 及び X_3 は、等しいか又は独立にH、 N_3 、CN、 NO_2 、F、Cl、Br、I、 $(CH_2)_nCH_3$ ($n=0-5$)、*i*-Pr、*t*-Bu、Ph、

【化 4 6】



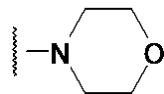
($n=0-5$)、

【化 4 7】



($n=0-5$)、 $(CH_2)_n OCH_3$ ($n=1-2$)、 $CH_2 N(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_n CH_3$ ($n=0-5$)、*Oi*-Pr、*O*Ph、*O*Bn、*OC*(*O*)*CH*₃、*OC*(*O*)Ph、*OCF*₃、 $N(CH_3)_2$ 、*NHC*(*O*)*t*-Bu、*NHC*(*O*)Ph、*NHC*(*O*)*Ot*-Bu、*NHC*(*O*)*CH*₃、*NHC*(*O*)*CH*₂*N*₃、*CF*₃、*C*(*O*)*OCH*₃、*C*(*O*)*Oi*-Pr、*C*(*O*)*Ot*-Bu、*C*(*O*)*O*Ph、*C*(*O*)*O*Bn、*C*(*O*)*NH*₂、*C*(*O*)*N*(*CH*₃)₂、*C*(*O*)*NH*Ph、*C*(*O*)*NH*Bn、*C*(*O*)*CF*₃、*CH*₂*C*(*O*)*OCH*₃、*CH*₂*C*(*O*)*Oi*-Pr、*CH*₂*C*(*O*)*Ot*-Bu、*CH*₂*C*(*O*)*O*Bn、 $S(CH_2)_n CH_3$ ($n=0-5$)、 $S(CH_2)_n OEt$ ($n=1-4$)、*S*Bn、*S*Ph、*SO*₂*CF*₃、

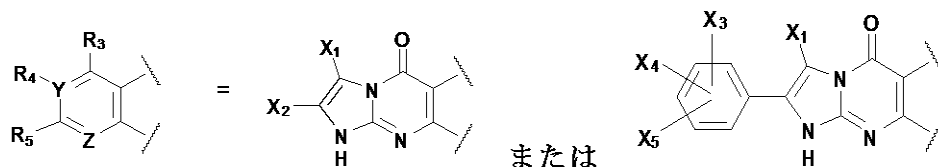
【化 4 8】



であり得る) ;

残基エントリー-2 :

【化 4 9】



(式中、

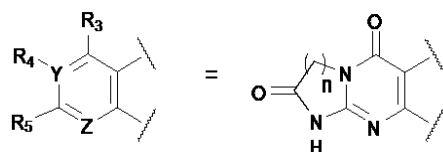
X_1 はH、 CH_3 、Phであり得；

X_2 はH、Ph、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、ベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、 $\text{C}(\text{Ph})_3$ 、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジニル、1-ベンゾフラン-2-イルであり得；

X_3 、 X_4 及び X_5 は、独立にOH、NH、 CH_3 、Cl、Br、F、CN、 N_3 、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 OCH_3 、OBn、O-ベンゾイル、 SCH_3 、t-Bu、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、S-フェニル、Ph、 $\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHS}(\text{O})_2\text{CH}_3$ であり得る)；

残基エントリー3：

【化 5 0】

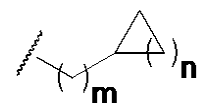


(式中、

$n=1-4$)；

残基エントリー4：

【化 5 1】



(式中、

$m=1-3$ ；

$n=1-6$)；

及び／又は

R_5 が NH_2 であるか、或いは R_4 、Y並びにYと R_5 を架橋する炭素と一緒に、上記リスト(エントリー2及び3)に示した環系を形成し得；

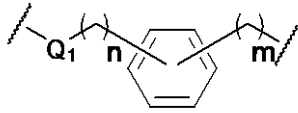
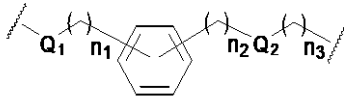
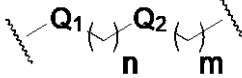
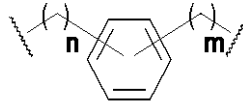
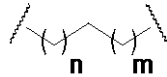
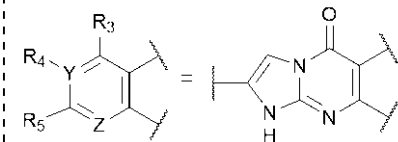
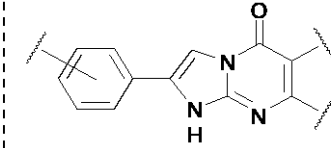
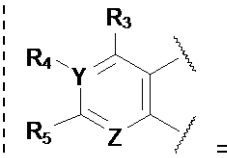
及び／又は

G単位を別のG単位又は色素若しくは他の報告基と連結することに関与する残基は、 R_1 、 R_4 及び R_5 であり得、この場合、特定残基は、直前に定義した(特定残基について)とおりであり、ここで、エンドスタンディング基はカップリング官能基に変換されるか又は置き換えられ、

或いは

下記リスト(存在する場合、Q1はG単位に結合する)

【化 5 2】

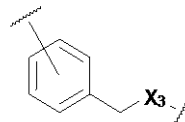
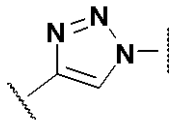
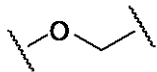
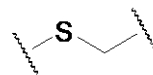
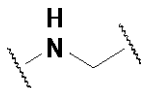
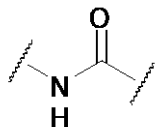
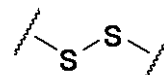
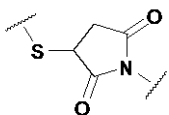
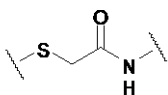
 $\underline{R}_1$  $n=0-4, m=0-4$ $Q_1 = \text{非存在}, S;$  $n_1=0-4, n_2=0-4, n_3=0-4,$ $Q_1 = \text{非存在} (n_1=0), S;$ $Q_2 = \text{NH}, S, O, \text{CH}_2, \text{NC}(O);$  $n=0-6; m=0-6;$ $Q_1 = S;$ $Q_2 = \text{NH}, S, O, \text{CH}_2, \text{NC}(O);$ $\underline{R}_4$  $n=0-4, m=0-4$  $n=0-6, m=0-6$ $\underline{R}_4 + \underline{R}_5$ 

に示すとおりであり、

及び／又は

カップリング官能基(C^{1-4} 及び $C^{1'-4'}$ が、下記構造

【化 5 3】

 $X_3 = \text{NH}, O, S$  $X = O, S, \text{NH}, \text{CH}_2$

から成る群より選択される構造によって示されるとおりであり、

及び／又は

 R_8 が、SH、メチルチオ、アセトキシメチルチオ、ピバロイルオキシメチルチオ、メトキシメチルチオ、プロピオニルオキシメチルチオ、ブチリルオキシメチルチオ、シアノエチル

チオ、フェニルチオ、ベンジルチオ、4-アセトキシベンジルチオ、4-ピバロイルオキシベンジルチオ、4-イソブチルオキシベンジルチオ、4-オクタノイルオキシベンジルチオ、4-ベンゾイルオキシベンジルチオである、
請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

下記化合物

- (1) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオメチルアミド-(オクタエトキシ)-エチルアミドメチルチオ-8]-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (2) β -フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオメチルアミド-(オクタエトキシ)-エチルアミドメチルチオ-8]- β -フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (3) β -1,N²-アセチルグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオメチルアミド-(オクタエトキシ)-エチルアミドメチルチオ-8]- β -1,N²-アセチルグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (4) β -フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオ-(ペンタエトキシ)-エチルチオ-8]- β -フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (5) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオメチルアミド-(EO)n-エチルアミドメチルチオ-8]-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (6) β -フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオメチルアミド-(EO)n-エチルアミドメチルチオ-8]- β -フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (7) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオ-(ペンタエトキシ)-エチルチオ-8]-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (8) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオ-(ドデカニル)-チオ-8]-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (9) 8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[1,N²-エテノ- β -フェニル-4-イル-(1-[1,2,3]-トリアゾール-4-イル)-メトキシ-(ヘキサエトキシ)-メチル-(4-(4-[1,2,3]-トリアゾール-1-イル)- β -フェニル-1,N²-エテノ))-8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (10) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオメチルアミド-(オクタエトキシ)-エチルアミドメチルチオ-8]- β -フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (11) ベンゼン-1,3,5-トリ-[(8-アミドメチル-(ペンタエトキシ)-プロピルアミドメチルチオ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]]
- (12) エチレングリコール-ビス(2-アミノエチルエーテル)-N,N,N',N'-テトラ-[(8-メチルアミドエチルチオ)-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]]
- (13) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオエチルアミドメチル-(1-[1,2,3]-トリアゾール-4-イル)-メトキシ-(ヘキサエトキシ)-メチル-(4-[1,2,3]-トリアゾール-1-イル)-メチルアミドエチルチオ-8]-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (14) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[8-チオエチルアミドメチル-(1-[1,2,3]-トリアゾール-4-イル)-メトキシ-(ヘキサエトキシ)-メチル-(4-(4-[1,2,3]-トリアゾール-1-イル)- β -フェニル-1,N²-エテノ))-8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (15) 8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[1-(ペンタエトキシ)-エチル-1]-8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]
- (16) 8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]-[1-プロピルアミドメチル-(ペンタエトキシ)-プロピルアミドプロピル-1]-8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート[Rp]

ノホスホロチオアート [Rp]

(17) 8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]-[1-プロピルアミドメチル-(ペンタエトキシ)-プロピルアミドメチルチオ-8]-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]

(18) 8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]-[1-プロピルアミドメチル-(ペンタエトキシ)-プロピルアミドメチルチオ-8]-β-フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]

(19) グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]-[8-(フェニル-4-チオ)-(ペンタエトキシ)-エチル-(4-チオフェニル)-8]-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]

(20) β-(3-チオフェニル)-1,N²-エテノ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]-[8-チオメチルアミド-(PEG pd 2000)-アミドメチルチオ-8]-β-(3-チオフェニル)-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート [Rp]

から成る群より選択される、請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

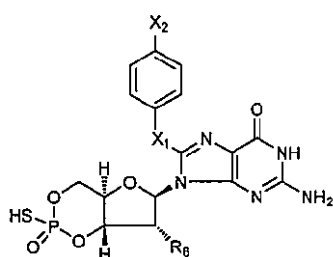
【請求項 10】

式(III)のモノマー化合物及び／又は式(III)のモノマー前駆体が、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載されるとおりであり、かつ

R₈が、置換若しくは非置換ボラノ官能基でないという条件を満たし、

かつさらに、式(III)のモノマー化合物及び／又は式(III)のモノマー前駆体化合物が、下記

【化 5 4】

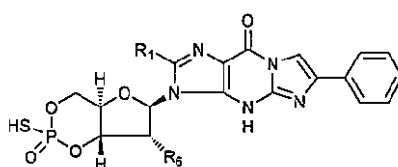


Rp-異性体

X₁=NH又はS;

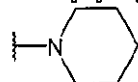
X₂=F、Cl、Br、I、OH、SH、NH₂、NO₂、OCH₃、CH₃、又はCF₃

R₈=OH

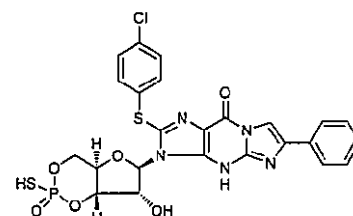


Rp-異性体.

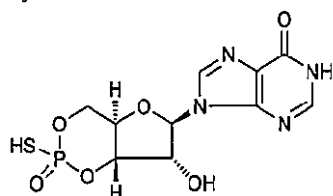
R₁=H、F、Cl、Br、I、CF₃、N
H(CH₂)₂NH₂、S(CH₂)₂NH₂又は



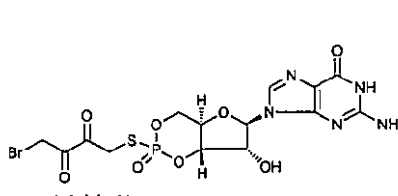
R₆=OH



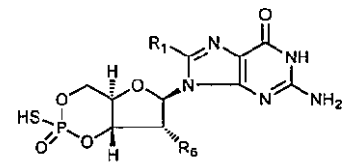
Rp-異性体



Rp-異性体

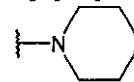


Rp-異性体

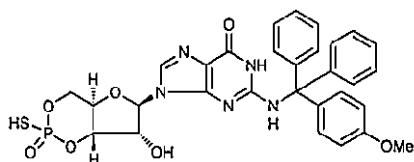


Rp-異性体,

R₁=H、CF₃、Br、Cl、NH(C
H₂)₂NH₂、S(CH₂)₂NH₂又は



R₆=OH



Rp-異性体

から成る化合物の群より選択されず、
及び／又は

式(III)のモノマー化合物及び／又は(III)のモノマー前駆体が、下記

- (21) β -1, N^2 -アセチル-8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (22) 8-プロモ-(4-メチル- β -フェニル-1, N^2 -エテノ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (23) 8-プロモ-(3-チオフエン-イル-1, N^2 -エテノ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (24) 8-プロモ-(2-ナフチル-1, N^2 -エテノ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (25) 8-プロモ-(α -メチル- β -フェニル-1, N^2 -エテノ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (26) 1-ベンジル-8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (27) 8-チオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (28) 8-(4-イソプロピルフェニルチオ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (29) 8-カルボキシメチルチオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (30) 8-(2-アミノフェニルチオ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (31) 8-フェニルアミドメチルチオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (32) 8-カルボキシメチルチオ- β -フェニル-1, N^2 -エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (33) β -フェニル-1, N^2 -エテノ-8-フェニルアミドメチルチオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (34) 8-(4-ヒドロキシフェニルチオ)- β -フェニル-1, N^2 -エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (35) 8-(4-イソプロピルフェニルチオ)- β -フェニル-1, N^2 -エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (36) 8-(2-アミノフェニルチオ)- β -フェニル-1, N^2 -エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (37) β -フェニル-1, N^2 -エテノ-8-チオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (38) 8-(4-イソプロピルフェニルチオ)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (39) β -(4-アジドフェニル)-1, N^2 -エテノ-8-プロモグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (40) 8-(2-アミノエチル)-(オクタエトキシ)-アミドメチルチオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (41) 8-(3-アミノプロピル)-(ペンタエトキシ)-メチルアミドメチルチオ-グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (42) 8-アジドメチルアミドエチルチオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (43) 8-(4-(プロパルギルオキシ-(ヘキサエトキシ)-メチル)-[1,2,3]-トリアゾール-1-イル)-メチルアミドエチルチオグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (44) 8-プロモ-1-(3-カルボキシプロピル)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体
- (45) 8-プロモ- δ -1, N^2 -ブチリルグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(46)1-[アミノメチル-(ペンタエトキシ)-プロピルアミドプロピル]-8-ブromoグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(47)8-フェニルグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(48)8-(2-フリル)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(49)8-(4-クロロフェニル)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(50)8-フェニル-β-フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(51)8-(4-クロロフェニル)-β-フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(52)8-(4-クロロフェニルスルホキシド)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(53)8-(4-クロロフェニルスルホニル)グアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

(54)8-(4-クロロフェニルスルホニル)-β-フェニル-1,N²-エテノグアノシン-3',5'-環状モノホスホロチオアート、Rp-異性体

から成る群より選択される

という条件を満たす、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物の式(III)のモノマー化合物及び／又は式(III)のモノマー前駆体。

【請求項11】

請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物を含む、疾患又は障害、好ましくは網膜疾患若しくは障害又は神経若しくは神経変性疾患若しくは障害から成る群より選択される疾患又は障害の治療に使用するための組成物。

【請求項12】

請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物を含む、下記：

- 網膜色素変性症又は網膜の別の遺伝性疾患；
 - 代謝性若しくは神経変性疾患、症候群又は眼疾患の結果としての続発性色素性網膜変性症；
 - 糖尿病性網膜症、年齢関連黄斑変性症、黄斑円孔／パッカー、眼腫瘍、網膜芽細胞腫、網膜剥離及び河川盲目症を含む網膜の疾患、；
 - 神経又は神経変性障害、脳卒中、嗅覚脱失、炎症性及び神経障害性疼痛、軸索再生及び脊髄損傷後修復、
 - 寄生虫症、例えばマラリア、アフリカトリパノソーマ症、及びシャーガス病
 - 心血管疾患、高血圧症、癌、又は急性ショック
- の少なくとも1つの治療に使用するための組成物。

【請求項13】

研究ツール化合物、好ましくは疾患又は障害、好ましくは網膜疾患若しくは障害又は神経若しくは神経変性疾患若しくは障害から成る群より選択される疾患又は障害に関する研究ツール化合物としての、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0022

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0022】

ここで、式(III)中、

X、Y及びZはNであり、

R₁、R₄、R₅、及びR₈は、各G単位(G¹、G²、G³及びG⁴)について独立に等しいか又は個別であってよく、

その上、

R₁は、独立にH、ハロゲン、アジド、シアノ、アシル、アラシル、ニトロ、アルキル、ア

リール、アラルキル、アミド-アルキル、アミド-アリール、アミド-アラルキル、アミド-O-アルキル、アミド-O-アリール、アミド-O-アラルキル、OH、O-アルキル、O-アリール、O-アラルキル、O-アシル、O-アラシル、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、S-アシル、S-アラシル、S(O)-アルキル、S(O)-アリール、S(O)-アラルキル、S(O)-アシル、S(O)-アラシル、S(O)₂-アルキル、S(O)₂-アリール、S(O)₂-アラルキル、S(O)₂-アシル、S(O)₂-アラシル、SeH、Se-アルキル、Se-アリール、Se-アラルキル、NR₉R₁₀、カルバモイルR₁₁R₁₂、NH-カルバモイルR₁₁R₁₂、O-カルバモイルR₁₁R₁₂、SiR₁₃R₁₄R₁₅であり得、ここで、R₉、R₁₀、R₁₁、R₁₂、R₁₃、R₁₄、R₁₅は、互いに独立にH、アルキル、アリール、アラルキルであり得；

R₂は非存在であり；

R₃はOHであり；

R₄は、独立に非存在、H、アミノ、アルキル、アラルキル、ニトロ、Nオキシドであり得、或いはY及びR₅並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得るイミダゾール環を形成してよく、或いはY及びR₅並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る(図示せず)下記イミダゾリノン(構造IV、V、n=1)又は同族環(n=2~8)を形成してよく；

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0024

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0024】

R₅は、独立にH、ハロゲン、アジド、シアノ、アシル、アラシル、ニトロ、アルキル、アリール、アラルキル、アミド-アルキル、アミド-アリール、アミド-アラルキル、アミド-O-アルキル、アミド-O-アリール、アミド-O-アラルキル、OH、O-アルキル、O-アリール、O-アラルキル、O-アシル、O-アラシル、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、S-アシル、S-アラシル、S(O)-アルキル、S(O)-アリール、S(O)-アラルキル、S(O)-アシル、S(O)-アラシル、S(O)₂-アルキル、S(O)₂-アリール、S(O)₂-アラルキル、S(O)₂-アシル、S(O)₂-アラシル、SeH、Se-アルキル、Se-アリール、Se-アラルキル、NR₃₀R₃₁、カルバモイルR₃₂R₃₃、NH-カルバモイルR₃₂R₃₃、O-カルバモイルR₃₂R₃₃、SiR₃₄R₃₅R₃₆であり得、ここで、R₃₀、R₃₁、R₃₂、R₃₃、R₃₄、R₃₅、R₃₆は、互いに独立にH、アルキル、アリール、アラルキルであり得、或いはR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得るイミダゾール環を形成してよく、或いはR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、それぞれ非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る(図示せず)上記イミダゾリノン環(構造IV、V、n=1)又は同族環(n=2~8)を形成してよく；

R₆はOHであり；

R₇はOであり；

かつ

R₈は、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、SeH、Se-アルキル、Se-アリール又はSe-アラルキル、ボラノ(BH₃)、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ(BH₂CN)、S-PAP、Se-PAP、S-BAP又はSe-BAPであり、

ここで、PAPは、光活性化可能保護基であり、その非限定例は、任意に、PAP=o-ニトロ-ベンジル、1-(o-ニトロフェニル)-エチリデン、4,5-ジメトキシ-2-ニトロ-ベンジル、7-ジメチルアミノ-クマリン-4-イル(DMACMケージド)、7-ジエチルアミノ-クマリン-4-イル(DEACMケージド)及び6,7-ビス(カルボキシメトキシ)クマリン-4-イル)メチル(BCMCMケージド)であり；

かつBAPは、生体内活性化可能保護基であり、その非限定例は、任意に、BAP=メチル、アセトキシメチル、ピバロイルオキシメチル、メトキシメチル、プロピオニルオキシメチル

、ブチリルオキシメチル、シアノエチル、フェニル、ベンジル、4-アセトキシベンジル、4-ピバロイルオキシベンジル、4-イソブチリルオキシベンジル、4-オクタノイルオキシベンジル、4-ベンゾイルオキシベンジルであり；

かつ、

連結残基 LR^1 、 LR^2 、 LR^3 及び LR^4 は、独立に、それらが結合しているG単位(G^{1-4})の特定残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかを置き換えるか又はいずれかに共有結合することができ

、

ここで、それらが残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに結合する場合、上記特定残基(R_1 、 R_4 及び／又は R_5)のエンドスタンディング(endstanding)基は、結合を確立するプロセス中に変換されるか又は置き換えられて、構築された化合物内の特定連結残基(LR^{1-4})の一部としてさらに定義され、

同時に

LR^1 は、(a)三価若しくは四価分岐炭化水素部分又は(b)二価炭化水素部分であり、それぞれ、例えば、限定するものではないが、O、N、S、Si、Se、B等のヘテロ原子が組み込まれているか又は組み込まれず、その骨格は、好ましくは1～28個の炭素原子を含有し、飽和又は不飽和、置換又は非置換であり得、

同時に

各付着点は、独立に置換又は非置換炭素又はヘテロ原子であり得、

ポリエチレングリコール(PEG)部分が定義に従って組み込まれる場合、好ましい炭素原子数は、PEG部分に存在する数だけ超えてよく、全てのPEG部分を合わせて

二価連結残基(LR^1)の場合は総数1～500のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 500$)を含有し得、

又は

二価連結残基(LR^1)の場合は総数1～750のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 750$)を含有し得

又は

四価連結残基(LR^1)の場合は総数1～1000のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 1000$)を含有し得、

かつ置換されている場合、

置換基としては、限定するものではないが、任意に1つ以上のアルキル基、ハロゲン原子、ハロアルキル基、(非)置換アリール基、(非)置換ヘテロアリール基、アミノ、オキソ、ニトロ、シアノ、アジド、ヒドロキシ、メルカプト、ケト、カルボキシ、カルバモイル、エポキシ(epoxy)、メトキシ、エチニルが挙げられ、

及び／又は置換基がさらに互いに結合して、ヘテロ原子が組み込まれているか又は組み込まれていない、飽和又は不飽和、置換又は非置換、脂肪族又は芳香族の1～4個の環を有する環系を形成してよく；

LR^2 、 LR^3 及び LR^4 は、例えば、限定するものではないが、ヘテロ原子（ヘテロ原子O、N、S、Si、Se、Bであり得る）が組み込まれているか又は組み込まれていない二価炭化水素部分であり、その骨格は、好ましくは1～28個の炭素原子を含有し、飽和又は不飽和、置換又は非置換であり得、

同時に

各付着点は独立に置換若しくは非置換炭素又はヘテロ原子であり得、

かつ

ポリエチレングリコール(PEG)部分が定義に従って組み込まれる場合、好ましい炭素原子数は、PEG部分に存在する数だけ超えてよく、全てのPEG部分を合わせて、総数1～500のエチレングリコール基($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=1\sim 500$)を含有し得、

かつ置換されている場合、

置換基としては、限定するものではないが、任意に1つ以上のアルキル基、ハロゲン原子、ハロアルキル基、(非)置換アリール基、(非)置換ヘテロアリール基、アミノ、オキソ、ニトロ、シアノ、アジド、ヒドロキシ、メルカプト、ケト、カルボキシ、カルバモイル、

エポキシ、メトキシ、エチニルが挙げられ、及び／又は置換基がさらに互いに結合して、ヘテロ原子が組み込まれているか又は組み込まれていない、飽和又は不飽和、置換又は非置換、脂肪族又は芳香族の1～4個の環を有する環系を形成してよく；

ここで、式(II)の場合、 G^4 が非存在であれば、 LR^4 も非存在であり、かつ

式(II)の場合、 G^3 及び G^4 が非存在であれば、 LR^3 及び LR^4 も非存在であり、

かつ

G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 は、さらに塩及び／又は水和物であってよく、

同時に、任意に、特定リン酸部分の適切な塩の非限定例は、リチウム、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、亜鉛又はアンモニウム、及びトリアルキルアンモニウム、ジアルキルアンモニウム、アルキルアンモニウム、例えば、トリエチルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、ジエチルアンモニウム及びオクチルアンモニウムであり；

かつ

G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 は、任意に同位体若しくは放射標識、PEG化、固定化されるか又は色素若しくは他の報告基で標識され得、

ここで、

該報告基及び／又は色素は、

(a) 各G単位(G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4)について独立に特定残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに共有結合された又はいずれかを置き換えた連結残基(LR^5)を介して、 G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4 にカップリングされる、

同時に LR^5 は、 LR^2 の定義どおりであり得、

或いは

(b) 式(I)の場合は G^3 及び／又は G^4 を置き換えてよく、

ここで、

任意に適切な色素の例としては、限定するものではないが、蛍光色素、例えばフルオレセイン、アントラニロイル、N-メチルアントラニロイル、ダンシル又はニトロ-ベンゾフラザニル(NBD)系、ローダミンに基づく色素、例えばTexas Red又はTAMRA、シアニン色素、例えばCyTM3、CyTM5、CyTM7、EVOblueTM10、EVOblueTM30、EVOblueTM90、EVOblueTM100 (EVOblueTM-ファミリー)、BODIPYTM-ファミリー、Alexa FluorTM-ファミリー、DY-ファミリー、例えばDY-547P1、DY-647P1、クマリン、アクリジン、オキサゾン、フェナレノン、蛍光タンパク質、例えばGFP、BFP及びYFP、並びに近赤外及び遠赤外色素が挙げられ、

かつ

報告基には、任意に、限定するものではないが、量子ドット、ビオチン及びチロシルメチルエステルが含まれ；

かつ

PEG化は、単一又は複数の LR^{PEG} 基の付着を独立に指し、 LR^{PEG} は、 LR^2 の定義どおりであり得、但し、この場合(i)各G単位(G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4)について独立に特定残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに共有結合するか又はいずれかを置き換えることによって、 LR^2 の1つの末端だけがG単位(G^1 、 G^2 、 G^3 及び／又は G^4)に連結され、かつ(ii) LR^2 の他の末端は、共役反応及び／又は水素結合を可能にするアルキル基又は反応基のどちらかであることを条件とし、

同時に、任意に、反応基の非限定例は、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、 $-N_3$ 、 $-NHS$ -エステル、ハロゲン基、エポキシド、エチニル、アリルであり、

かつ(iii) LR^{PEG} は、エチレングリコール部分($-(CH_2CH_2O)_n-$ 、 $n=2\sim 500$)が組み込まれることを条件とする。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0033

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0033】

において側鎖又は残基を「フローティング基」と描写するときはいつでも、これらの側鎖(又は残基)は、安定構造が形成される限り、描写され、暗示され、若しくは明示的に定義された水素を含め、環原子のいずれかに付着したいずれの水素原子を置き換え得る。従って結果として生じる全ての置換パターンが含まれる。所与の例について、これは下記に相当する。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

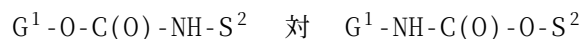
【訂正対象項目名】0040

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0040】

同時に結合性は、下記によって例示されるように描写又は反転され得る。



ここで、

カップリング官能基(C^1 、 $C^{1'}$ 、 C^2 、 $C^{2'}$ 、 C^3 、 $C^{3'}$ 、 C^4 及び／又は $C^{4'}$)が、G単位の残基(G^{1-4} の R_1 、 R_4 及び／又は R_5)を置き換えるのではなく、それに結合する場合、G単位(又は色素若しくは他の報告基を有するG単位)のカップリングに關与する特定の残基(R_1 、 R_4 及び／又は R_5)は、互いに独立に、

上記でさらに定義したように、エンドスタンディング基がカップリング官能基に置き換えられるか又は変換され

或いは

下記群(存在する場合、Q1はG単位に結合する)

【誤訳訂正6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0045

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0045】

から成る群より選択され、

同時に

上記リストの特定リンカー内の各側鎖についてのnは、定義どおりの等しいか又は別個の値を有し得、

かつ

上記リストのリンカー(L)の全てのキラル、ジアステレオマー、ラセミ、及び全ての幾何異性形は、たとえ明示的に描写されなくても、この中に含まれ、

かつ

アンモニウム誘導体等のカチオンリンカー(L)は、クロリド、ブロミド、ヨージド、ホスファート、カルボナート、スルファート、アセタート又は他のいずれもの生理学的に受け入れられる対イオンを含有する塩であり、

かつ

スペーサー(S^1 、 S^2 、 S^3 及び S^4)は、特定化合物内で等しいか又は個別であり、非存在又は $-(CH_2)_{n1}-(CH_2CH_2\beta)_m-(CH_2)_{n2}-$ ($\beta=O$ 、S又はNH； $m=1\sim 500$ 、 $n1=0\sim 8$ 、 $n2=0\sim 8$ であり、同時に両 $n1$ 及び $n2$ は、独立に等しいか又は個別であり得る)若しくは $-(CH_2)_n-$ ($n=1\sim 24$)であり得る。

【誤訳訂正7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0046

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0046】

特に、連結残基 LR^1 、 LR^2 、 LR^3 及び LR^4 が、式(Ib)及び(IIb)に示すようにさらに細分され、スペーサー部分(S^{1-4})、カップリング官能基(C^{1-4} 、 $C^{1'-4'}$)及びリンカー(L、構造Ibのマルチマーのみ)を含有するのが好ましい、本発明の好ましい実施形態では、カップリング官能基(C^{1-4} 、 $C^{1'-4'}$)は、

残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに結合するか又はいずれかを置き換えることによってスペーサーとG単位(G^{1-4})との間に(式IIIの構造と比較せよ)

及び／又は

スペーサーとリンカー(L)、色素若しくは別の報告基との間に

及び／又は

(特定スペーサーが非存在の場合)残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに結合するか又はいずれかを置き換えることによってG単位(G^{1-4})と色素若しくは別の報告基との間に

及び／又は

(特定スペーサーが非存在であり及び／又はG単位が色素若しくは他の報告基に置き換えられる場合)リンカー(L)と色素若しくは他の報告基又はG単位との間に(G^{1-4} 、残基 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 のいずれかに結合するか又はいずれかを置き換えることによって)

共有結合を確立する。

【誤訳訂正8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0056

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

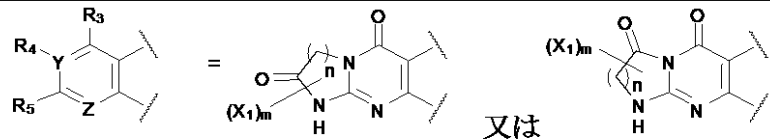
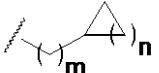
【0056】

本発明によれば、上記に加えて又は上記と無関係に、 R_4 が、H、アミノ、アルキル、アラルキル、ニトロ、Nオキシドから成る群より選択されるか或いは R_4 が、Y及び R_5 並びにYと R_5 を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得るイミダゾール環を形成し得るか、或いはY及び R_5 並びにYと R_5 を架橋する炭素と一緒に、それぞれ非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る(図示せず)上記イミダゾリノン(構造IV、V、 $n=1$)又は同族環($n=2\sim 8$)を形成し得るのが好ましい。

本発明によれば、 R_4 が非存在であるか又はアミノ、Nオキシドから成る群より選択されるか又は下表5に示すとおりであるのがさらに好ましい。

表5 基 R_4 。

エン トリ ー	残基
1	式中、 $m=1-6$。 X_1、X_2及びX_3は、等しいか又は独立にH、N_3、CN、NO_2、F、Cl、Br、I、$(CH_2)_nCH_3$ ($n=0-5$)、i-Pr、t-Bu、$(CH_2)_mC\equiv CH$ ($n=0-5$)、$(CH_2)_mC=CH_2$ ($n=0-5$)、$(CH_2)_nOCH_3$ ($n=1-2$)、$CH_2N(CH_3)_2$、$O(CH_2)_nCH_3$ ($n=0-5$)、Oi-Pr、OBn、$OC(O)CH_3$、$OC(O)Ph$、OCF_3、$N(CH_3)_2$、$NHC(O)t-Bu$、$NHC(O)Ph$、$NHC(O)Ot-Bu$、$NHC(O)CH_3$、$NHC(O)CH_2N_3$、CF_3、$C(O)OCH_3$、$C(O)Oi-Pr$、$C(O)Ot-Bu$、$C(O)OPh$、$C(O)OBn$、$C(O)NH_2$、$C(O)N(CH_3)_2$、$C(O)NHPh$、$C(O)NHBn$、$C(O)CF_3$、$CH_2C(O)OCH_3$、$CH_2C(O)Oi-Pr$、$CH_2C(O)Ot-Bu$、$CH_2C(O)OBn$、$S(CH_2)_nCH_3$ ($n=0-5$)、$S(CH_2)_nOEt$ ($n=1-4$)、SBn、SPh、SO_2C F_3、$(Y_1=H, CN, Ph, F, CH_3, OCH_3, SCH_3, NO_2, \text{ペンチル})$、$(Y_2=H, F)$、であり得る。
2	式中、 X_1はH、CH_3、Phであり得る。 X_2はH、Ph、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、ベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、$C(Ph)_3$、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジニル、5-クロロ-2-チエニル、1-ベンゾフラン-2-イルであり得、 X_3、X_4及びX_5は、独立にOH、NH、CH_3、Cl、Br、F、CN、N_3、CF_3、OCF_3、NO_2、$C(O)OH$、$C(O)OCH_3$、OCH_3、OBn、O-ベンゾイル、SCH_3、t-Bu、$N(CH_3)_2$、S-フェニル、Ph、$S(O)_2CH_3$、$C(O)NH_2$、$NHS(O)_2CH_3$であり得、

3	 ここで、上記定義から逸脱して、環炭素原子のいずれかに付着したいずれの水素原子（描写され、暗示され、若しくは明示的に定義された水素を含む）、又は同一の特定炭素原子に付着した両水素原子(m=2)は、安定構造が形成される限り、それぞれ1つ又は2つの(等しい)「フローティング基」X₁に置き換えられ得る。 同時にm=1又は2。 n=1-4。 X₁は、H、CH₃、Et、Pr、i-Pr、Bu、F、Ph、(CH₂)₂OH*であり得る。 *第1の場合についてのみ。
4	 又は 式中、 m=1-6。 n=1-6。

【誤訳訂正9】

【訂正対象書類名】明細書

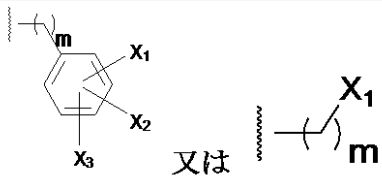
【訂正対象項目名】0058

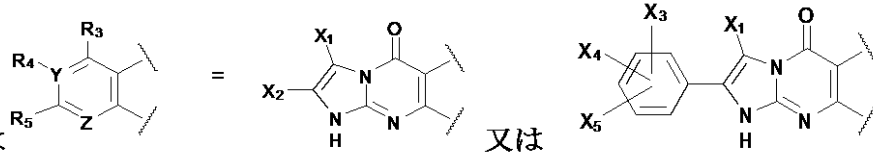
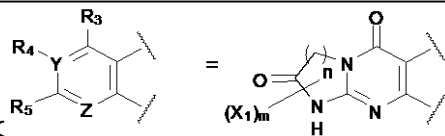
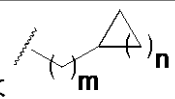
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0058】

表6 残基R₄。

エン トリ ー	残基
1	 式中、 m=1-3。 X₁、X₂及びX₃は、等しいか又は独立にH、N₃、CN、NO₂、F、Cl、Br、I、(CH₂)_nCH₃ (n=0-5)、i-Pr、t-Bu、Ph、(CH₂)_nC≡CH (n=0-5)、(CH₂)_nC=CH₂ (n=0-5)、(CH₂)_nOCH₃ (n=1-2)、CH₂N(CH₃)₂、O(CH₂)_nCH₃ (n=0-5)、Oi-Pr、OPh、OBn、OC(O)CH₃、OC(O)Ph、OCF₃、N(CH₃)₂、NHC(O)t-Bu、NHC(O)Ph、NHC(O)Ot-Bu、NHC(O)CH₃、NHC(O)CH₂N₃、CF₃、C(O)OCH₃、C(O)Oi-Pr、C(O)Ot-Bu、C(O)OPh、C(O)OBn、C(O)NH₂、C(O)N(CH₃)₂、C(O)NHPh、C(O)NHBn、C(O)CF₃、CH₂C(O)OCH₃、CH₂C(O)Oi-Pr、CH₂C(O)Ot-Bu、CH₂C(O)OBn、S(CH₂)_nCH₃ (n=0-5)、S(CH₂)_nOEt (n=1-4)、SBn、SPh、SO₂CF₃、であり得る。

2	 又は 式中、 X₁はH、CH₃、Phであり得る。 X₂はH、Ph、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、ベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、C(Ph)₃、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジニル、1-ベンゾフラン-2-イルであり得； X₃、X₄及びX₅は、独立にOH、NH、CH₃、Cl、Br、F、CN、N₃、CF₃、OCF₃、NO₂、C(O)OH、C(O)OCH₃、OCH₃、OBn、O-ベンゾイル、SCH₃、t-Bu、N(CH₃)₂、S-フェニル、Ph、S(O)₂CH₃、C(O)NH₂、NHS(O)₂CH₃であり得、
3	 又は ここで、上記定義から逸脱して、環炭素原子のいずれかに付着した<u>いずれの水素原子</u>（描写され、暗示され、若しくは明示的に定義された水素を含む）、又は同一の特定炭素原子に付着した<u>両水素原子</u>（m=2）は、安定構造が形成される限り、それぞれ1つ又は2つの（等しい）「フローティング基」X₁に置き換えられ得る。 同時にm=1又は2。 n=1-4。 X₁はH、CH₃、Et、Pr、i-Pr、Bu、F、Ph、(CH₂)₂OH*であり得、 *第1の場合についてのみ。
4	 又は 式中、 m=1-6。 n=1-6。

【誤訳訂正 10】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0061

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0061】

上記に加えて又は上記とは無関係に、本発明によれば、R₅が、H、ハロゲン、アジド、アシル、アラシル、ニトロ、アルキル、アリール、アラルキル、アミド-アルキル、アミド-アリール、アミド-アラルキル、アミド-O-アルキル、アミド-O-アリール、アミド-O-アラルキル、NH-カルバモイル-アルキル、NH-カルバモイル-アリール、NH-カルバモイル-アラルキル、OH、O-アルキル、O-アリール、O-アラルキル、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、アミノ、NH-アルキル、NH-アリール、NH-アラルキル、NR₃₀R₃₁、SiR₃₄R₃₅R₃₆から成る群より選択され、R₃₀、R₃₁、R₃₄、R₃₅、R₃₆がアルキルであり、或いはR₄、

Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得るイミダゾール環を形成するか、或いはR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、それぞれ非置換又はアルキル、アリール若しくはアラルキルで置換され得る(図示せず)上記イミダゾリノン環(構造IV、V、n=1)又は同族環(n=2~8)を形成し得るのが好ましい。

【誤訳訂正 1 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0062

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0062】

本発明によれば、R₅が、H、NH₂、F、Cl、Br、I、ニトロ、メチル、エチル、n-プロピル、n-ヘキシル、6-アミノ-n-ヘキシル、トリフルオロメチル、フェニル、4-N,N-ジメチルアミノフェニル、ベンジル、4-アジドベンジル、アミド-n-ブチル、アミドイソブチル、アミド(6-アミノ-n-ヘキシル)、OH、メチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、SH、メチルチオ、エチルチオ、6-アミノ-n-ヘキシルチオ、フェニルチオ、4-アジドフェニルチオ、ベンジルチオ、4-アジドベンジルチオ、メチルアミノ、NH-ベンジル、NH-フェニル、NH-4-アジドフェニル、NH-フェニルエチル、NH-フェニルプロピル、2-アミノエチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、6-アミノ-n-ヘキシルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、ジメチルアミノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノ、トリメチルシリル、トリエチルシリル、tert-ブチルジメチルシリルから成る群より選択されるか又はR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、表5に記載の環系(エントリー2及び3)を形成し得るのがさらに好ましい。

【誤訳訂正 1 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0063

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0063】

本発明によれば、R₅が、H、NH₂、F、Cl、Br、I、ニトロ、SH、メチルチオ、エチルチオ、6-アミノ-n-ヘキシルチオ、フェニルチオ、4-アジドフェニルチオ、ベンジルチオ、4-アジドベンジルチオ、メチルアミノ、NH-ベンジル、NH-フェニル、NH-4-アジドフェニル、NH-フェニルエチル、NH-フェニルプロピル、2-アミノエチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、6-アミノ-n-ヘキシルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、ジメチルアミノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノから成る群より選択されるか又はR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に、表6に記載の環系(エントリー2及び3)を形成し得るのが特に好ましい。

。

本発明によれば、R₅がNH₂であるか、又はR₄、Y並びにYとR₅を架橋する炭素と一緒に表7に記載の環系(エントリー2及び3)を形成し得るのがさらに好ましい。

【誤訳訂正 1 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0066

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0066】

上記に加えて又は上記とは無関係に、本発明によれば、G単位を別のG単位又は色素若しくは他の報告基と結合することに関与する残基は、R₁、R₄及び／又はR₅であり得、この場合、特定の残基は、エンドスタンディング基がカップリング官能基に置き換えられるか又は変換される上記好ましい実施形態についての定義どおりであるか

又は

下表8(存在する場合、Q1はG単位に結合する)に示す群から選択されるのが好ましい。

【誤訳訂正 1 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 6 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 6 8】

本発明によれば、G単位を別のG単位又は色素若しくは他の報告基と結合することに関与する残基は、 R_1 、 R_4 及び／又は R_5 であり得、この場合、特定の残基は、エンドスタンディング基がカップリング官能基に置き換えられる又は変換されるその好ましい実施形態についての定義どおりであるか

又は

下表9(存在する場合、Q1はG単位に結合する)に示す群から選択されるのがさらに好ましい。

【誤訳訂正 1 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 7 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 7 6】

同時に特定リンカー内の各側鎖についての n は、定義どおりの等しいか又は個別の値を有し得る。

上記に加えて又は上記とは無関係に、本発明によれば、式(I)の場合に G^4 又は G^4 及び G^3 が非存在であるか、

又は式(II)の場合に G^4 及び LR^4 又は G^4 、 LR^4 、 G^3 及び LR^3 が非存在であるのが好ましい。

本発明によれば、式(I)の場合に G^4 及び G^3 が非存在であるか

又は式(II)の場合に G^4 、 LR^4 、 G^3 及び LR^3 が非存在であるのがさらに好ましい。

上記例示に基づく本発明の特に好ましい実施形態は、請求項5、6、7及び8のいずれか1項に記載されたとおりである。

本発明によれば、表13の化合物、及び請求項9に記載の化合物が特に好ましい。疑念がある場合には、式で示した化学構造が有効なものであることに留意すべきである。さらに表13の化合物は遊離酸として示されていることに留意すべきである。しかしながら、本発明は、限定するものではないが、 Na^+ 、 Li^+ 、 NH_4^+ 、 Et_3NH^+ 及び $(i-Pr)_2EtNH^+$ 等のカチオンを備えるこれらの化合物の塩をも含む。