

【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 1 部門第 1 区分
 【発行日】 令和 6 年 6 月 3 日 (2024.6.3)

【国際公開番号】 WO2021/241528
 【出願番号】 特願 2022-526549 (P2022-526549)
 【国際特許分類】

C 1 2 N 15/10 (2006.01)
 C 4 0 B 40/06 (2006.01)
 C 1 2 N 15/11 (2006.01)
 C 1 2 Q 1/44 (2006.01)
 C 1 2 Q 1/6813 (2018.01)
 C 1 2 Q 1/686 (2018.01)

10

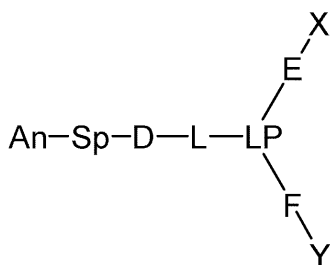
【F I】

C 1 2 N 15/10 Z Z N A
 C 4 0 B 40/06
 C 1 2 N 15/11 Z
 C 1 2 Q 1/44
 C 1 2 Q 1/6813 Z
 C 1 2 Q 1/686 Z

20

【手続補正書】
 【提出日】 令和 6 年 5 月 23 日 (2024.5.23)
 【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】
 式 (I I)
 【化 1】

30



(II)

40

(式中、
 X および Y は、オリゴヌクレオチド鎖であり、
 E および F は、それぞれ独立して
 ヌクレオチド又は核酸アナログにより構成されるオリゴマーであり、
 ただし、E と F が互いに相補的な塩基配列を含み、二重鎖オリゴヌクレオチドを形成し、
 LP は、
(LP 1) p-L S-(LP 2) q で表されるループ部位であり、
L S は、以下の (A) ないし (C) に記載される化合物群から選ばれる部分構造であり、

50

(A) ヌクレオチド

(B) 核酸アナログ

(C) 置換基を有してもよい C 1 ～ 1 4 の 3 価の基

L P 1 は、以下の (1) および (2) に記載される化合物群から単独もしくは異なって p 個選ばれる各部分構造であり、

(1) ヌクレオチド

(2) 核酸アナログ

L P 2 は、以下の (1) および (2) に記載される化合物群から単独もしくは異なって q 個選ばれる各部分構造であり、

(1) ヌクレオチド

(2) 核酸アナログ

p と q の総数は、0 ～ 4 0 であり、

L は、リンカーであり、

D は、反応性官能基由来の 2 価の基であり、

S p は、結合又は 2 官能性スパーサーであり、

A n は、少なくとも 1 つのビルディングブロックにより構成される部分構造である。))

で表される化合物であり、

X と Y は、少なくとも一部で二重鎖を形成しうる配列を有し、

X は 5 ' 末端で E に結合し、

Y は 3 ' 末端で F に結合し、

E、F、又は L P の少なくともいずれか 1 つの部位に、少なくとも 1 つの選択的に切断可能な部位を有する化合物。

【請求項 2】

式 (I I I)

A n - S p - C - B n (I I I)

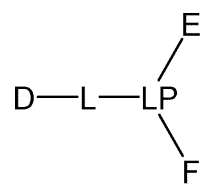
(式中、

A n および S p は、請求項 1 と同じ意味を表し、

B n は、オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とで形成される 2 本鎖オリゴヌクレオチドタグを表し、

C は、式 (I)

【化 2】



(I)

(式中、E、L P、L、D および F は、請求項 1 と同じ意味を表し、ただし、D は A n と直接結合するか、または 2 官能性スパーサーを介して結合し、E と F とは 2 本鎖オリゴヌクレオチドタグ B n のそれぞれ対応する末端側に結合する。)

で表される、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

A n が、請求項 1 と同じであり、かつ、n 個のビルディングブロック $\alpha 1 \sim \alpha n$ (n は、1 ～ 1 0 の整数である。) により構築される部分構造であり、

B n が、オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とで形成される 2 本鎖オリゴヌクレオチドタグであり、かつ、A n の構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドを含む部分構造である、

請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

p と q の総数が 2 ～ 20 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

p と q の総数が 2 ～ 10 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

p と q の総数が 2 ～ 7 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

p と q の総数が 0 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

LP1、LP2 および LS が、それぞれ以下の構造：

(A) ヌクレオチド

または

(B) 以下の (B11) から (B15) を要件とする核酸アナログ

(B11) リン酸（または相当部位）および水酸基（またはその相当部位）を有する、

(B12) 炭素、水素、酸素、窒素、リン又は硫黄により構成される、

(B13) 分子量が 142 から 1500 である、

(B14) 残基間原子数が 3 ～ 30 である、

(B15) 残基間の原子の結合様式は、全て単結合であるか、または 1 乃至 2 つの二重結合を含み残りは単結合である、

から単独もしくは異なって選ばれる構造である、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

LP1、LP2 および LS が、それぞれ以下の構造：

(A) ヌクレオチド

または

(B) 以下の (B21) から (B25) を要件とする核酸アナログ

(B21) リン酸および水酸基を有する、

(B22) 炭素、水素、酸素、窒素又はリンにより構成される、

(B23) 分子量が 142 から 1000 である、

(B24) 残基間原子数が 3 ～ 15 である、

(B25) 残基間の原子の結合様式は、全て単結合である、

から単独もしくは異なって選ばれる構造である、請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

LP1、LP2 および LS が、それぞれ以下の構造：

(A) ヌクレオチド

または

(B) 以下の (B31) から (B35) を要件とする核酸アナログ

(B31) リン酸および水酸基を有する、

(B32) 炭素、水素、酸素、窒素又はリンにより構成される、

(B33) 分子量が 142 から 700 である、

(B34) 残基間原子数が 4 ～ 7 である、

(B35) 残基間の原子の結合様式は、全て単結合である、

から単独もしくは異なって選ばれる構造である請求項 1 ～ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

LP1 および LP2 が、それぞれ以下：

(B41) d-Spacer、

(B5) ポリアルキレングリコールリン酸エステル

10

20

30

40

50

のいずれかである、請求項 1 ～ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

LP1 および LP2 が、それぞれジエチレングリコールリン酸エステルまたはトリエチレングリコールリン酸エステルである、請求項 1 ～ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 13】

LP1 および LP2 が、それぞれトリエチレングリコールリン酸エステルである、請求項 1 ～ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 14】

LP1 および LP2 が、それぞれ d-Spacer である、請求項 1 ～ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

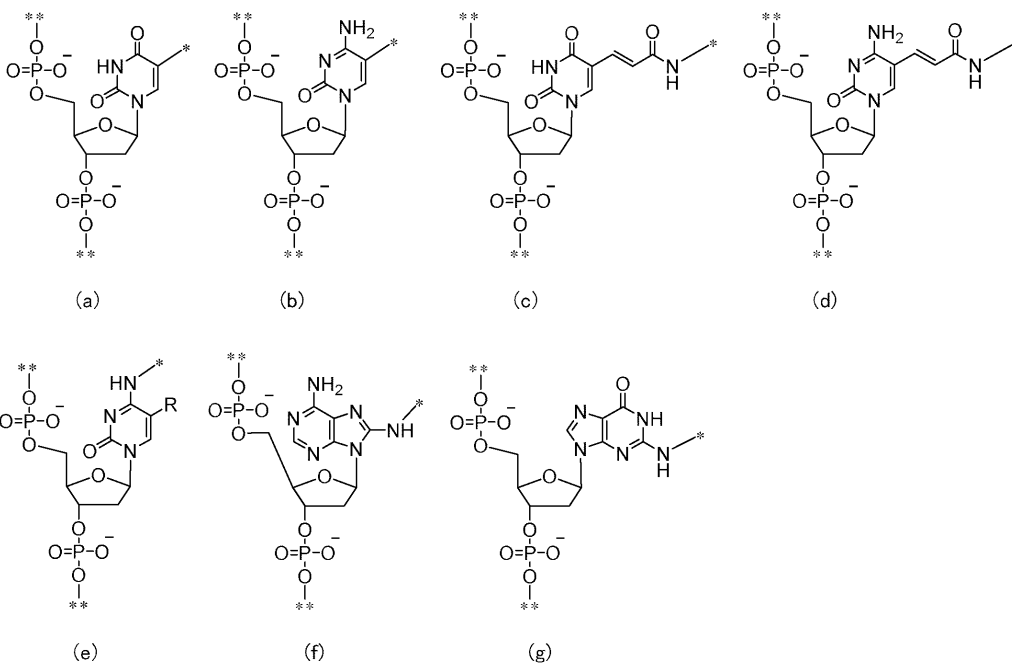
【請求項 15】

LP1 および LP2 が、それぞれヌクレオチドである、請求項 1 ～ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 16】

LS が、式 (a) ～ 式 (g) :

【化 3】



20

30

(式中、*はリンカーとの結合位置を意味し、**はLP1又はLP2との結合位置を意味し、Rは、水素原子またはメチル基である。)

のいずれかである、請求項 1 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

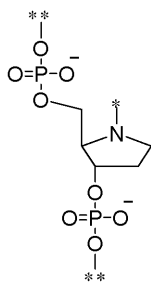
【請求項 17】

LS が、式 (h) :

40

50

【化 4】



(h)

10

(式中、*はリンカーとの結合位置を意味し、**はLP1又はLP2との結合位置を意味する)

である、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

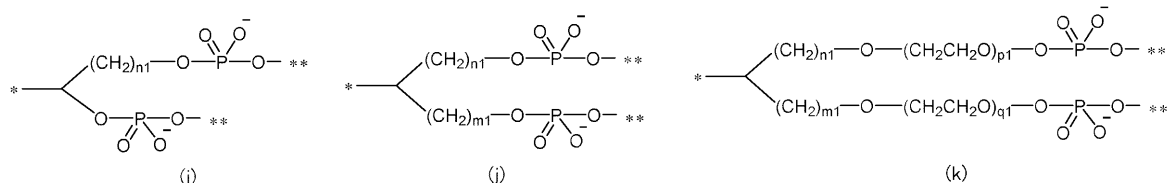
【請求項18】

LSが、ポリアルキレングリコールリン酸エステルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項19】

LSが、式(i)～式(k)：

【化5】



(i)

(j)

(k)

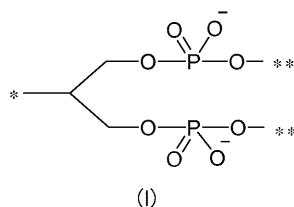
20

(式中、n1、m1、p1、及びq1はそれぞれ独立して、1～20の整数であり、*はリンカーとの結合位置を意味し、**はLP1又はLP2との結合位置を意味する。)である、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項20】

LSが、式(l)：

【化6】



(l)

30

(式中、*はリンカーとの結合位置を意味し、**はLP1又はLP2との結合位置を意味する)

である、請求項1～15いずれか1項に記載の化合物。

【請求項21】

LSが、(B42)、(B43)又は(B44)：

(B42) Amino C6 dT

(B43) mdC (TEG-Amino)

(B44) Uni-Link (商標登録) Amino Modifier

のいずれかである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項22】

LSが、ヌクレオチドである、

40

50

請求項 1 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 23】

L S が、(C) 置換基を有してもよい C 1 ～ 14 の 3 価の基であり、(C) が以下の構造：

- (1) 置換基を有してもよく、1 ～ 3 個のヘテロ原子で置き換えられてもよい C 1 ～ 10 脂肪族炭化水素、
- (2) 置換基を有してもよい C 6 ～ 14 芳香族炭化水素、
- (3) 置換基を有してもよい C 2 ～ 9 芳香族複素環、または
- (4) 置換基を有してもよい C 2 ～ 9 非芳香族複素環

のいずれかである、請求項 1 ～ 7 及び 11 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

【請求項 24】

L S が、(C) 置換基を有してもよい C 1 ～ 14 の 3 価の基であり、(C) が以下の構造：

- (1) 置換基を有してもよい C 1 ～ 6 脂肪族炭化水素、
- (2) 置換基を有してもよい C 6 ～ 10 芳香族炭化水素、または
- (3) 置換基を有してもよい C 2 ～ 5 芳香族複素環

のいずれかである請求項 1 ～ 7 及び 11 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 25】

L S が、(C) 置換基を有してもよい C 1 ～ 14 の 3 価の基であり、(C) が以下の構造：

20

- (1) C 1 ～ 6 脂肪族炭化水素、
- (2) ベンゼン、または
- (3) C 2 ～ 5 含窒素芳香族複素環

ここで、前記 (1) ～ (3) は無置換であるか、または置換基群 S T 1 から単独もしくは異なって選ばれる 1 ～ 3 個の置換基で置換されてもよく、置換基群 S T 1 は、C 1 ～ 6 アルキル基、C 1 ～ 6 アルコキシ基、フッ素原子および塩素原子により構成される群であり、ただし、置換基群 S T 1 が脂肪族炭化水素に置換する場合、置換基群 S T 1 からアルキル基は選択されない、

のいずれかである請求項 1 ～ 7 及び 11 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 26】

30

L S が、(C) 置換基を有してもよい C 1 ～ 14 の 3 価の基であり、(C) が以下の構造：

- (1) C 1 ～ 6 アルキル基、または
- (2) 無置換であるか 1 つまたは 2 つの C 1 ～ 3 アルキル基若しくは C 1 ～ 3 アルコキシ基で置換されたベンゼン

のいずれかである請求項 1 ～ 7 及び 11 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

L S が、(C) 置換基を有してもよい C 1 ～ 14 の 3 価の基であり、(C) が以下の構造：

40

- (1) C 1 ～ 6 アルキル基

である、請求項 1 ～ 7 及び 11 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 28】

E および F が、それぞれ独立してヌクレオチド又は核酸アナログにより構成されるオリゴマーであり、

E および F の鎖長が、それぞれ 3 乃至 40 である、

請求項 1 ～ 27 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 29】

E および F が、それぞれ独立してヌクレオチド又は核酸アナログにより構成されるオリゴマーであり、

E および F の鎖長が、それぞれ 4 乃至 30 である

50

請求項 1 ～ 2 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 0】

E および F が、それぞれ独立してヌクレオチド又は核酸アナログにより構成されるオリゴマーであり、

E および F の鎖長が、それぞれ 6 乃至 2 5 である

請求項 1 ～ 2 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 1】

E および F が、それぞれ独立してヌクレオチド又は核酸アナログにより構成されるオリゴマーであり、

E と F が互いに相補的な塩基配列を含み、二重鎖オリゴヌクレオチドを形成し、

E と F の二重鎖オリゴヌクレオチドが突出末端である、

請求項 1 ～ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

【請求項 3 2】

前記突出末端の突出部が、2 塩基以上の長さである、請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 3 3】

E および F が、それぞれ独立してヌクレオチド又は核酸アナログにより構成されるオリゴマーであり、

E と F が互いに相補的な塩基配列を含み、二重鎖オリゴヌクレオチドを形成し、

E と F の二重鎖オリゴヌクレオチドが平滑末端である、

請求項 1 ～ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

20

【請求項 3 4】

E と F に含まれる、互いに相補的な塩基配列の鎖長が、それぞれ 3 塩基以上 である

請求項 1 ～ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 5】

E と F に含まれる、互いに相補的な塩基配列の鎖長が、それぞれ 4 塩基以上である

請求項 1 ～ 3 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 6】

E と F に含まれる、互いに相補的な塩基配列の鎖長が、それぞれ 6 塩基以上である

請求項 1 ～ 3 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

30

【請求項 3 7】

E および F が、それぞれ独立してヌクレオチドにより構成されるオリゴマーである、

請求項 1 ～ 3 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 8】

ヌクレオチドが、リボヌクレオチド又はデオキシリボヌクレオチドである請求項 1 ～ 3 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 9】

ヌクレオチドが、デオキシリボヌクレオチドである請求項 1 ～ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

40

【請求項 4 0】

ヌクレオチドが、デオキシアデノシン、デオキシグアノシン、チミジン、又はデオキシシチジンである請求項 1 ～ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 1】

E および F が、それぞれ独立して核酸アナログにより構成されるオリゴマーである、請求項 1 ～ 3 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 2】

L が、

(1) 置換基を有しても良く、1 ～ 3 個のヘテロ原子で置き換えられても良い C 1 ～ 2 0 脂肪族炭化水素、
又は

(2) 置換基を有してもよい C 6 ～ 1 4 芳香族炭化水素

50

である、請求項 1 ～ 4 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 3】

L が、置換基を有しても良い C 1 ～ 6 脂肪族炭化水素、1 若しくは 2 個の酸素原子で置き換えられても良い C 1 ～ 6 脂肪族炭化水素、又は置換基を有しても良い C 6 ～ 1 0 芳香族炭化水素である、請求項 1 ～ 4 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 4】

L が、置換基群 S T 1 で置換可能な C 1 ～ 6 脂肪族炭化水素、又は置換基群 S T 1 で置換可能なベンゼンであり、ここで、置換基群 S T 1 は、C 1 ～ 6 アルキル基、C 1 ～ 6 アルコキシ基、フッ素原子および塩素原子により構成される群である（ただし、置換基群 S T 1 が脂肪族炭化水素に置換する場合、置換基群 S T 1 からアルキル基は選択されない。）、請求項 1 ～ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

【請求項 4 5】

L が、C 1 ～ 6 アルキル基、又は無置換であるか 1 つまたは 2 つの C 1 ～ 3 アルキル基若しくは C 1 ～ 3 アルコキシ基で置換されたベンゼンである、請求項 1 ～ 4 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 6】

L が、C 1 ～ 6 アルキル基である、請求項 1 ～ 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 7】

D の反応性官能基が、C — C、アミノ、エーテル、カルボニル、アミド、エステル、ウレア、スルフィド、ジスルフィド、スルホキシド、スルホンアミド、又はスルホニル結合を構成しうる反応性官能基である、請求項 1 ～ 4 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

20

【請求項 4 8】

D の反応性官能基が、脱離基を有する C 1 炭化水素、アミノ基、水酸基、カルボニル基の前駆体、チオール基、又はアルデヒド基である、請求項 1 ～ 4 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 9】

D の反応性官能基が、ハロゲン原子を有する C 1 炭化水素、スルホン酸系脱離基を有する C 1 炭化水素、アミノ基、水酸基、カルボキシ基、ハロゲン化カルボキシ基、チオール基、又はアルデヒド基である、請求項 1 ～ 4 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

30

【請求項 5 0】

D の反応性官能基が、 $-CH_2Cl$ 、 $-CH_2Br$ 、 $-CH_2OSO_2CH_3$ 、 $-CH_2OSO_2CF_3$ 、アミノ基、水酸基、又はカルボキシ基である、請求項 1 ～ 4 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 1】

D の反応性官能基が、第 1 級アミノ基である、請求項 1 ～ 5 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 2】

選択的に切断可能な部位が、デオキシアデノシン、デオキシグアノシン、チミジン、及びデオキシシチジンのいずれでもないデオキシリボヌクレオシドである、請求項 1 ～ 5 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

40

【請求項 5 3】

選択的に切断可能な部位が、デオキシウリジン、プロモデオキシウリジン、デオキシイノシン、8-ヒドロキシデオキシグアノシン、3-メチル-2'-デオキシアデノシン、N6-エテノ-2'-デオキシアデノシン、7-メチル-2'-デオキシグアノシン、2'-デオキシキサントシン、又は 5, 6-ジヒドロキシ-5, 6-ジヒドロデオキシチミジンである、請求項 1 ～ 5 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 4】

選択的に切断可能な部位が、デオキシウリジン、又はデオキシイノシンである、

50

請求項 1 ～ 5 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 5】

選択的に切断可能な部位が、デオキシウリジンである、

請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 6】

選択的に切断可能な部位が、デオキシイノシンである、

請求項 1 ～ 5 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 7】

選択的に切断可能な部位が、デオキシイノシンから 3' 方向に 2 番目のホスホジエステル結合である、

請求項 1 ～ 5 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 8】

選択的に切断可能な部位が、リボヌクレオシドである、

請求項 1 ～ 5 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5 9】

選択的に切断可能な部位が、1 つである、

請求項 1 ～ 5 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 0】

少なくとも 1 つの切断可能な部位を、E 又は (L P 1) p に含み、かつ少なくとも 1 つの切断可能な部位を、F 又は (L P 2) q に含む、

請求項 1 ～ 5 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 1】

E 又は (L P 1) p に含まれる切断可能な部位と、F 又は (L P 2) q に含まれる切断可能な部位が異なる条件で切断可能である、

請求項 6 0 に記載の化合物。

【請求項 6 2】

A n が、n 個のビルディングブロック $\alpha 1 \sim \alpha n$ (n は、1 ～ 10 の整数である。) により構築される部分構造である、

請求項 1 ～ 6 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 3】

A n が、低分子有機化合物である、請求項 1 ～ 6 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 4】

A n のビルディングブロックが、分子量 500 以下の化合物である、請求項 1 ～ 6 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 5】

A n のビルディングブロックが、分子量 300 以下の化合物である、請求項 1 ～ 6 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 6】

A n のビルディングブロックが、分子量 150 以下の化合物である、請求項 1 ～ 6 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 7】

A n が、H、B、C、N、O、Si、P、S、F、Cl、Br 及び I からなる元素群より単独又は異なって選ばれる元素により構成される有機化合物である、請求項 1 ～ 6 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 8】

A n が、アリール基、非芳香族シクリル基、ヘテロアリール基及び非芳香族ヘテロシクリル基からなる置換基群より単独又は異なって選ばれる置換基を有する低分子有機化合物である、請求項 1 ～ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 9】

A n が、分子量 5000 以下である、請求項 1 ～ 6 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

20

30

40

50

【請求項 70】

A n が、分子量 800 以下である、請求項 1～69 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 71】

A n が、分子量 500 以下である、請求項 1～70 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 72】

A n が、ポリペプチドである、

請求項 1～62 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 73】

S p が結合である、請求項 1～72 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 74】

S p が 2 官能性スペーサーであり、

該 2 官能性スペーサーが S p D－S p L－S p X であり、

S p D が、C－C、アミノ、エーテル、カルボニル、アミド、エステル、ウレア、スルフィド、ジスルフィド、スルホキシド、スルホンアミド、又はスルホニル結合を構成しうる反応性基由来の 2 価の基であり、

S p L が、ポリアルキレングリコール、ポリエチレン、任意にヘテロ原子で置き換えられても良い C 1～20 脂肪族炭化水素、ペプチド、オリゴヌクレオチド、またはこれらの組み合わせあり、

S p X が、アミノ、カルボニル、アミド、エステル、ウレア、又はスルホンアミド結合を形成する反応基由来の 2 価の基である、

請求項 1～72 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 75】

S p が 2 官能性スペーサーであり、

該 2 官能性スペーサーが S p D－S p L－S p X であり、

S p D が、第一級アミノ基由来の 2 価の基であり、

S p L が、ポリエチレングリコール、またはポリエチレンであり、

S p X が、カルボキシ基由来の 2 価の基である、

請求項 1～72 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 76】

オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とが、二重鎖を形成可能な配列である、請求項 1～75 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 77】

オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とが、相補的な塩基配列を含む、請求項 1～76 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 78】

オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とが、それぞれ 1～200 塩基の長さである、請求項 1～77 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 79】

オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とが、それぞれ 3～150 塩基の長さである、請求項 1～78 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 80】

オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とが、それぞれ 30～150 塩基の長さである、請求項 1～79 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 81】

オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とが、平滑末端を有する、請求項 1～80 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 82】

オリゴヌクレオチド鎖 X とオリゴヌクレオチド鎖 Y とが、突出末端を有する、請求項 1～80 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 83】

10

20

30

40

50

突出末端の突出部が、1～30塩基の長さである、請求項82に記載の化合物。

【請求項84】

突出末端の突出部が、2～5塩基の長さである、請求項82又は83に記載の化合物。

【請求項85】

オリゴヌクレオチド鎖Xとオリゴヌクレオチド鎖Yとが、突出末端を有し、当該突出末端に、さらに特定分子識別配列が結合する、請求項82～84のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項86】

XおよびYのいずれか一方に、機能性分子が結合した、請求項1～85のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項87】

XおよびYのいずれか一方に、ビオチンが結合した、請求項1～85のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項88】

請求項1～87のいずれか1項に記載の化合物を含む化合物ライブラリ。

【請求項89】

請求項1～87のいずれか1項に記載の化合物を含むDNAコード化ライブラリ。

【請求項90】

1000以上の異なる化合物により構成される、請求項88又は89に記載のライブラリ。

【請求項91】

化合物 $A_n - S_p - C - B_n$ の製造方法であって、

A_n は、 n 個のビルディングブロック $\alpha_1 \sim \alpha_n$ (n は、2～10の整数である。) により構築される部分構造であり、

S_p は、結合または2官能性スペーサーであり、

C は、少なくとも一つの「選択的に切断可能な部位」を有するヘアピン型のヘッドピースであり、

B_n は、 A_n の構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドを含む部分構造であり、

C に対し、以下の工程；

(a) $\alpha_1 - S_p$ を結合させること、または S_p および α_1 を結合させること、及び

(b) α_1 の構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドタグを結合させること、

により化合物 $A_1 - S_p - C - B_1$ を得ること、

次いで、 $A_{(m-1)} - S_p - C - B_{(m-1)}$ (m は、2～ n の整数である) に対し、以下の工程 (c) 及び (d) を、 m が2～ n まで昇順で繰り返すこと；

(c) A 部分に α_n を結合させること、及び

(d) B 部分の末端に α_n の構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドタグを結合させること

により化合物 $A_m - S_p - C - B_m$ を得ることを含み、

工程 (a) 及び (b)、工程 (c) 及び (d) は、任意の順序で行うことができる、方法。

【請求項92】

請求項2～87のいずれか1項に記載の化合物である $A_n - S_p - C - B_n$ の製造方法であって、

A_n は、 n 個のビルディングブロック $\alpha_1 \sim \alpha_n$ (n は、2～10の整数である。) により構築される部分構造であり、

S_p は、結合又は2官能性スペーサーであり、

C は、少なくとも一つの「選択的に切断可能な部位」を有するヘアピン型のヘッドピースであり、

10

20

30

40

50

B_nは、A_nの構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドを含む部分構造であり、

Cに対し、以下の工程；

- (a) α₁ - S_pを結合させること、またはS_pおよびα₁を結合させること、及び
- (b) α₁の構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドタグを結合させること、

により化合物A₁ - S_p - C - B₁を得ること、

次いで、A_(m-1) - S_p - C - B_(m-1) (mは、2～nの整数である)に対し、以下の工程(c)及び(d)を、mが2～nまで昇順で繰り返すこと；

- (c) A部分にα_nを結合させること、及び

- (d) B部分の末端にα_nの構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドタグを結合させること

により化合物A_m - S_p - C - B_mを得ることを含み、

工程(a)及び(b)、工程(c)及び(d)は、任意の順序で行うことができる、方法。

10

【請求項93】

請求項2～87のいずれか1項に記載の化合物であるA_n - S_p - C - B_n (A_n、S_p、CおよびB_nは前記と同じ意味を表す)の製造方法であって、Cに対し、以下の工程；

- (a) α₁ - S_pを結合させること、またはS_pおよびα₁を結合させること、及び
- (b) α₁の構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドタグを結合させること、

20

により化合物A₁ - S_p - C - B₁を得ること、

次いで、A_(m-1) - S_p - C - B_(m-1) (mは、2～nの整数である)に対し、以下の工程(c)及び(d)を、mが2～nまで昇順で繰り返すこと；

- (c) A部分にα_nを結合させること、及び

- (d) B部分の末端にα_nの構造を同定することができる塩基配列を含むオリゴヌクレオチドタグを結合させること

により化合物A_m - S_p - C - B_mを得ることを含み、

工程(a)及び(b)、工程(c)及び(d)は、任意の順序で行うことができる、方法。

30

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】配列表

【補正方法】追加

【補正の内容】

【配列表】

2021241528000001.app

40

50