

【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】平成26年6月19日(2014.6.19)

【公表番号】特表2013-532122(P2013-532122A)

【公表日】平成25年8月15日(2013.8.15)

【年通号数】公開・登録公報2013-043

【出願番号】特願2013-508162(P2013-508162)

【国際特許分類】

C 07 H 21/02 (2006.01)

A 61 K 31/712 (2006.01)

A 61 K 49/00 (2006.01)

C 12 N 15/113 (2010.01)

【F I】

C 07 H 21/02 C S P

A 61 K 31/712

A 61 K 49/00 A

C 12 N 15/00 Z N A G

【手続補正書】

【提出日】平成26年4月24日(2014.4.24)

【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

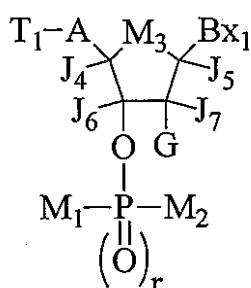
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Icを有する化合物。

【化1】



Ic

[式中、

T₁は、任意に保護されるリン部分であり；

M₁は、H、OH、またはOR₁であり；

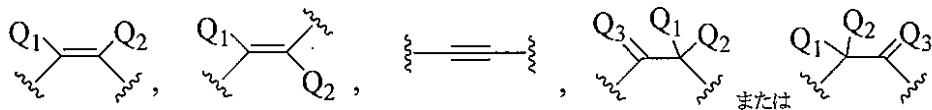
M₂は、OH、OR₁、またはN(R₁)(R₂)であり；

R₁とR₂は、それぞれ独立して、C₁-C₆アルキルまたは置換C₁-C₆アルキルであり；

rは、0または1であり；

Aは、以下の式のいずれか1つを有し；

【化2】



Q_1 と Q_2 は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換 $C_2 - C_6$ アルキニル、または $N(R_3)(R_4)$ であり；

Q_3 は、O、S、 $N(R_5)$ 、または $C(R_6)(R_7)$ であり；

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、および R_7 は、それぞれ独立して、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、または $C_1 - C_6$ アルコキシであり；

M_3 は、O、S、 NR_{1-4} 、 $C(R_{1-5})(R_{1-6})$ 、 $C(R_{1-5})(R_{1-6})C(R_{1-7})(R_{1-8})$ 、 $C(R_{1-5}) = C(R_{1-7})$ 、 $OC(R_{1-5})(R_{1-6})$ 、または $OC(R_{1-5})(Bx_2)$ であり；

R_{1-4} は、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、または置換 $C_2 - C_6$ アルキニルであり；

R_{1-5} 、 R_{1-6} 、 R_{1-7} 、および R_{1-8} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、または置換 $C_2 - C_6$ アルキニルであり；

Bx_1 は、ヘテロ環塩基部分であり；

または Bx_2 が存在する場合、 Bx_2 はヘテロ環塩基部分であり、 Bx_1 はH、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、もしくは置換 $C_2 - C_6$ アルキニルであり；

J_4 、 J_5 、 J_6 、および J_7 は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、もしくは置換 $C_2 - C_6$ アルキニルであり；

または、 J_4 は J_5 と J_7 のいずれか一方と架橋を形成し、ここで該架橋は、O、S、 NR_{1-9} 、 $C(R_{2-0})(R_{2-1})$ 、 $C(R_{2-0}) = C(R_{2-1})$ 、 $C [= C(R_{2-0})(R_{2-1})]$ 、 $C (= O)$ から選ばれる1~3個の結合ビラジカル基を含み、 J_5 、 J_6 、 J_7 のうち他の2つは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、または置換 $C_2 - C_6$ アルキニルであり；

R_{1-9} 、 R_{2-0} 、および R_{2-1} は、それぞれ独立して、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、または置換 $C_2 - C_6$ アルキニルであり；

G は、H、OH、ハロゲン、または $O - [C(R_8)(R_9)]_n - [(C = O)_m - X_1]_j - Z$ であり；

R_8 と R_9 は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、または置換 $C_1 - C_6$ アルキルであり；

X_1 は、O、S、または $N(E_1)$ であり；

Z は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、置換 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、置換 $C_2 - C_6$ アルキニル、または $N(E_2)(E_3)$ であり；

E_1 、 E_2 、および E_3 は、それぞれ独立して、H、 $C_1 - C_6$ アルキル、または置換

$C_1 - C_6$ アルキルであり；

n は、1 ~ 約 6 であり；

m は、0 または 1 であり；

j は、0 または 1 であり；

各置換基は、ハロゲン、 OJ_1 、 $N(J_1)(J_2)$ 、 $=NJ_1$ 、 SJ_1 、 N_3 、 CN 、 $OC(=X_2)J_1$ 、 $OC(=X_2)N(J_1)(J_2)$ 、および $C(=X_2)N(J_1)(J_2)$ からそれぞれ独立して選ばれる 1 つ以上の任意に保護された置換基を含み； X_2 は、O、S、または NJ_3 であり； J_1 、 J_2 、および J_3 は、それぞれ独立して、H または $C_1 - C_6$ アルキルであり； j が 1 のとき、Z は、ハロゲンおよび $N(E_2)(E_3)$ 以外である。】

【請求項 2】

M_3 は O、 $CH=CH$ 、 OCH_2 、または $OC(H)(BX_2)$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

M_3 は O である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

J_4 、 J_5 、 J_6 、および J_7 はそれぞれ H である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

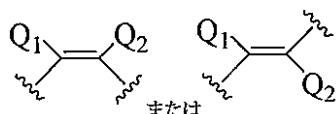
【請求項 5】

J_4 は J_5 と J_7 のいずれか一方と架橋を形成する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

A は以下の式のいずれか 1 つを有する、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 3】



[式中、

Q_1 と Q_2 は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、または置換 $C_1 - C_6$ アルコキシである。】

【請求項 7】

Q_1 と Q_2 はそれぞれ H である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

Q_1 と Q_2 はそれぞれ独立して H またはハロゲンである、請求項 6 に記載の化合物。

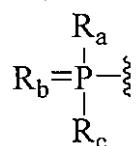
【請求項 9】

Q_1 と Q_2 のいずれか一方は H であり、 Q_1 と Q_2 の他方は F、 CH_3 、または OCH_3 である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 10】

T_1 は以下の式を有する、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 4】



[式中、

R_a と R_c は、それぞれ独立して、保護されたヒドロキシル、保護されたチオール、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、保護されたアミノ、または置換アミノであり；

R_b は、O または S である。】

【請求項 11】

R_b は O であり、 R_a と R_c は、それぞれ独立して OCH_3 、 OCH_2CH_3 、または $OCH(CH_3)_2$ である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

r は 0 であり、 M_1 は $O(CH_2)_2CN$ であり、 M_2 は $N[CH(CH_3)_2]_2$ である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 13】

G はハロゲン、 OCH_3 、 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 $OClF_3$ 、 OCH_2CH_3 、 $O(CH_2)_2F$ 、 OCH_2CHF_2 、 OCH_2CF_3 、 $OCH_2-CH=CH_2$ 、 $O(CH_2)_2-OCH_3$ 、 $O(CH_2)_2-SCH_3$ 、 $O(CH_2)_2-OClF_3$ 、 $O(CH_2)_3-N(R_{10})(R_{11})$ 、 $O(CH_2)_2-ON(R_{10})(R_{11})$ 、 $O(CH_2)_2-O(CH_2)_2-N(R_{10})(R_{11})$ 、 $OCH_2C(=O)-N(R_{12})-(CH_2)_2-N(R_{10})(R_{11})$ 、または $O(CH_2)_2-N(R_{12})-C(=NR_{13})[N(R_{10})(R_{11})]$ であり、ここで R_{10} 、 R_{11} 、 R_{12} 、および R_{13} は、それぞれ独立して、 H または C_1-C_6 アルキルである、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

G はハロゲン、 OCH_3 、 $OClF_3$ 、 OCH_2CH_3 、 OCH_2CF_3 、 $OCH_2-C(H)=CH_2$ 、 $O(CH_2)_2-OCH_3$ 、 $O(CH_2)_2-O(CH_2)_2-N(CH_3)_2$ 、 $OCH_2C(=O)-N(H)CH_3$ 、 $OCH_2C(=O)-N(H)-(CH_2)_2-N(CH_3)_2$ 、または $OCH_2-N(H)-C(=NH)NH_2$ である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 15】

G は F 、 OCH_3 、または $O(CH_2)_2-OCH_3$ である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 16】

G は $O(CH_2)_2-OCH_3$ である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

前記ヘテロ環塩基部分はピリミジン、置換ピリミジン、プリン、または置換プリンである、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

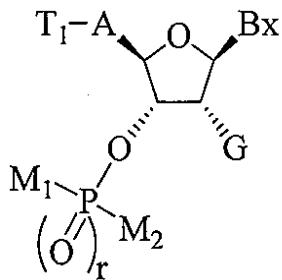
【請求項 18】

前記ヘテロ環塩基部分はウラシル、チミン、シトシン、5-メチルシトシン、アデニン、またはグアニンである、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 19】

式 I e を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【化 5】



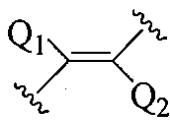
I e

[式中、 B_x は、ピリミジン、置換ピリミジン、プリン、または置換プリンから選ばれるヘテロ環塩基部分である。]

【請求項 20】

A は以下の式を有する、請求項 19 に記載の化合物。

【化6】



[式中、Q₁とQ₂は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、C₁ - C₆アルキル、置換C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルコキシ、または置換C₁ - C₆アルコキシである。]

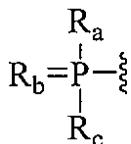
【請求項21】

Q₁とQ₂はそれぞれ独立してH、F、CH₃、またはOCH₃である、請求項20に記載の化合物。

【請求項22】

T₁は以下の式を有する、請求項19～21のいずれか一項に記載の化合物。

【化7】



[式中、

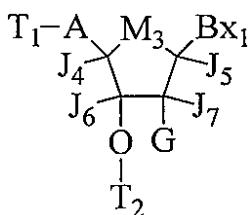
R_bはOであり；

R_aとR_cは、それぞれ独立して、OCH₃、OCH₂CH₃、またはOCH(CH₃)₂である。]

【請求項23】

式IIcを有する5' - 末端化合物を含むオリゴマー化合物。

【化8】



IIc

[式中、

T₁は、任意に保護されるリン部分であり；

T₂は、前記式IIcの化合物を前記オリゴマー化合物と結合するヌクレオシド間連結基であり；

Aは、以下の式のいずれか1つを有し；

【化9】



Q₁とQ₂は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、C₁ - C₆アルキル、置換C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルコキシ、置換C₁ - C₆アルコキシ、C₂ - C₆アルケニル、置換C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、置換C₂ - C₆アルキニル、またはN(R₃)(R₄)であり；

Q₃は、O、S、N(R₅)、またはC(R₆)(R₇)であり；

R₃、R₄、R₅、R₆、およびR₇は、それぞれ独立して、H、C₁ - C₆アルキル、置換C₁ - C₆アルキル、またはC₁ - C₆アルコキシであり；

M₃は、O、S、NR₁ - R₄、C(R₁ - R₅)(R₁ - R₆)、C(R₁ - R₅)(R₁ - R₆)C(R₁ - R₇)(R₁ - R₈)、C(R₁ - R₅) = C(R₁ - R₇)、OC(R₁ - R₅)(R₁ - R₆)、またはO

$C(R_{1-5}) (B \times_2)$ であり；

R_{1-4} は、H、 C_1-C_6 アルキル、置換 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、置換 C_1-C_6 アルコキシ、 C_2-C_6 アルケニル、置換 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、または置換 C_2-C_6 アルキニルであり；

R_{1-5} 、 R_{1-6} 、 R_{1-7} 、および R_{1-8} は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、置換 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、置換 C_1-C_6 アルコキシ、 C_2-C_6 アルケニル、置換 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、または置換 C_2-C_6 アルキニルであり；

$B \times_1$ は、ヘテロ環塩基部分であり；

または $B \times_2$ が存在する場合、 $B \times_2$ はヘテロ環塩基部分であり、 $B \times_1$ はH、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、置換 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、置換 C_1-C_6 アルコキシ、 C_2-C_6 アルケニル、置換 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、もしくは置換 C_2-C_6 アルキニルであり；

J_4 、 J_5 、 J_6 、および J_7 は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、置換 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、置換 C_1-C_6 アルコキシ、 C_2-C_6 アルケニル、置換 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、もしくは置換 C_2-C_6 アルキニルであり；

または、 J_4 は J_5 と J_7 のいずれか一方と架橋を形成し、ここで該架橋は、O、S、 NR_{1-9} 、 $C(R_{2-0})(R_{2-1})$ 、 $C(R_{2-0})=C(R_{2-1})$ 、 $C[=C(R_{2-0})(R_{2-1})]$ 、 $C(=O)$ から選ばれる1～3個の結合ビラジカル基を含み、 J_5 、 J_6 、 J_7 のうち他の2つは、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、置換 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、置換 C_1-C_6 アルコキシ、 C_2-C_6 アルケニル、置換 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、または置換 C_2-C_6 アルキニルであり；

R_{1-9} 、 R_{2-0} 、および R_{2-1} は、それぞれ独立して、H、 C_1-C_6 アルキル、置換 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルコキシ、置換 C_1-C_6 アルコキシ、 C_2-C_6 アルケニル、置換 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、または置換 C_2-C_6 アルキニルであり；

G は、H、OH、ハロゲン、または $O-[C(R_8)(R_9)]_n-[C(=O)_m-X_1]_j-Z$ であり；

R_8 と R_9 は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、または置換 C_1-C_6 アルキルであり；

X_1 は、O、S、または $N(E_1)$ であり；

Z は、H、ハロゲン、 C_1-C_6 アルキル、置換 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、置換 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、置換 C_2-C_6 アルキニル、または $N(E_2)(E_3)$ であり；

E_1 、 E_2 、および E_3 は、それぞれ独立して、H、 C_1-C_6 アルキル、または置換 C_1-C_6 アルキルであり；

n は、1～約6 であり；

m は、0 または1 であり；

j は、0 または1 であり；

各置換基は、ハロゲン、 OJ_1 、 $N(J_1)(J_2)$ 、 $=NJ_1$ 、 SJ_1 、 N_3 、 CN 、 $OC(=X_2)J_1$ 、 $OC(=X_2)N(J_1)(J_2)$ 、および $C(=X_2)N(J_1)(J_2)$ からそれぞれ独立して選ばれる1つ以上の任意に保護された置換基を含み；

X_2 は、O、S、または NJ_3 であり；

J_1 、 J_2 、および J_3 は、それぞれ独立して、H または C_1-C_6 アルキルであり；

j が1のとき、 Z はハロゲンおよび $N(E_2)(E_3)$ 以外であり；

前記オリゴマー化合物は8～40個のモノマーサブユニットを含み、標的核酸の少なくとも一部分とハイブリダイズ可能である。】

【請求項24】

M_3 は O 、 $CH = CH$ 、 OCH_2 、 または $OCH(H)(BX_2)$ である、請求項 2 3 に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 2 5】

M_3 は O である、請求項 2 3 に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 2 6】

J_4 、 J_5 、 J_6 、 および J_7 はそれぞれ H である、請求項 2 3 ~ 2 5 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

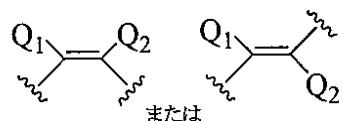
【請求項 2 7】

J_4 は J_5 と J_7 のいずれか一方と架橋を形成する、請求項 2 3 ~ 2 5 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 2 8】

A は以下の式のいずれか 1 つを有する、請求項 2 3 ~ 2 7 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【化 1 0】



[式中、

Q_1 と Q_2 は、それぞれ独立して、 H 、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、または置換 $C_1 - C_6$ アルコキシである。]

【請求項 2 9】

Q_1 と Q_2 はそれぞれ H である、請求項 2 8 に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 3 0】

Q_1 と Q_2 はそれぞれ独立して H またはハロゲンである、請求項 2 8 に記載のオリゴマー化合物。

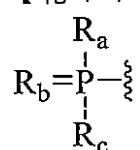
【請求項 3 1】

Q_1 と Q_2 のいずれか一方は H であり、 Q_1 と Q_2 の他方は F 、 CH_3 、または OCH_3 である、請求項 2 8 に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 3 2】

T_1 は以下の式を有する、請求項 2 3 ~ 3 1 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【化 1 1】



[式中、

R_a と R_c は、それぞれ独立して、保護されたヒドロキシル、保護されたチオール、 $C_1 - C_6$ アルキル、置換 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換 $C_1 - C_6$ アルコキシ、保護されたアミノ、または置換アミノであり；

R_b は、 O または S である。]

【請求項 3 3】

R_b は O であり、 R_a と R_c は、それぞれ独立して OCH_3 、 OCH_2CH_3 、または $OCH(CH_3)_2$ である、請求項 3 2 に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 3 4】

G はハロゲン、 OCH_3 、 OCH_2F 、 $OCHF_2$ 、 OCH_2F_2 、 OCH_2 、 OCH_2CH_3 、 $O(CH_2)_2F$ 、 $OCH_2CH_2CHF_2$ 、 $OCH_2CH_2CF_3$ 、 $OCH_2 - CH = CH_2$ 、 $O(CH_2)_2 - OCH_3$ 、 $O(CH_2)_2 - SCH_3$ 、 $O(CH_2)_2 - OCF_3$ 、 $O(CH_2)_3 - N(R_{10})(R_{11})$ 、 $O(CH_2)_2 - ON(R_{10})(R_{11})$ 、 $O(CH_2)_3$

R_{10})₂ - O (C H₂)₂ - N (R₁₀) (R₁₁) 、 O C H₂ C (= O) - N (R₁₀) (R₁₁) 、 O C H₂ C (= O) - N (R₁₂) - (C H₂)₂ - N (R₁₀) (R₁₁) 、 または O (C H₂)₂ - N (R₁₂) - C (= N R₁₃) [N (R₁₀) (R₁₁)] であり、ここで R₁₀ 、 R₁₁ 、 R₁₂ 、 および R₁₃ は、それぞれ独立して、 H または C₁ - C₆ アルキルである、請求項 23 ~ 33 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 35】

G はハロゲン、 O C H₃ 、 O C F₃ 、 O C H₂ C H₃ 、 O C H₂ C F₃ 、 O C H₂ - C H = C H₂ 、 O (C H₂)₂ - O C H₃ 、 O (C H₂)₂ - O (C H₂)₂ - N (C H₃)₂ 、 O C H₂ C (= O) - N (H) C H₃ 、 O C H₂ C (= O) - N (H) - (C H₂)₂ - N (C H₃)₂ 、 または O C H₂ - N (H) - C (= N H) N H₂ である、請求項 23 ~ 33 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 36】

G は F 、 O C H₃ 、 または O (C H₂)₂ - O C H₃ である、請求項 23 ~ 33 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 37】

G は O (C H₂)₂ - O C H₃ である、請求項 23 ~ 33 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 38】

前記ヘテロ環塩基部分はピリミジン、置換ピリミジン、プリン、または置換プリンである、請求項 23 ~ 37 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

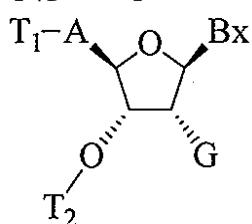
【請求項 39】

前記ヘテロ環塩基部分はウラシル、チミン、シトシン、5 - メチルシトシン、アデニン、またはグアニンである、請求項 23 ~ 38 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 40】

前記 5' - 末端化合物は式 I I d を有する、請求項 23 に記載のオリゴマー化合物。

【化 12】



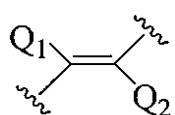
I I d

[式中、 B x は、ピリミジン、置換ピリミジン、プリン、または置換プリンから選ばれるヘテロ環塩基部分である。]

【請求項 41】

A は以下の式を有する、請求項 40 に記載のオリゴマー化合物。

【化 13】



[式中、 Q₁ と Q₂ は、それぞれ独立して、 H 、ハロゲン、 C₁ - C₆ アルキル、置換 C₁ - C₆ アルキル、 C₁ - C₆ アルコキシ、または置換 C₁ - C₆ アルコキシである。]

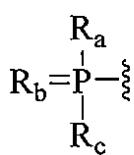
【請求項 42】

Q₁ と Q₂ はそれぞれ独立して H 、 F 、 C H₃ 、 または O C H₃ である、請求項 40 に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 43】

T₁ は以下の式を有する、請求項 40 ~ 42 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物

【化14】



[式中、

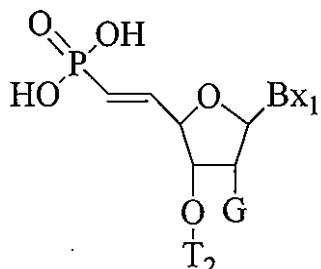
R_b は O であり；

R_a と R_c は、それぞれ独立して、 OCH_3 、 OCH_2CH_3 、または $OCH(C_2H_3)_2$ である。]

【請求項44】

前記 5' - 末端化合物は式 II e を有する、請求項 23 に記載のオリゴマー化合物。

【化15】



II e

[式中、

B_x は、ウラシル、チミン、シトシン、5' - メチルシトシン、アデニン、またはグアニンであり；

T_2 は、前記式 II e の化合物を前記オリゴマー化合物と結合するホスホロチオエートヌクレオシド間連結基であり；

G は、ハロゲン、 OCH_3 、 OCH_2F 、 OCH_2CH_3 、 OCH_2CF_3 、 $OCH_2-CH=CH_2$ 、 $O(CH_2)_2-OCH_3$ 、 $O(CH_2)_2-O(CH_2)_2-N(CH_3)_2$ 、 $OCH_2C(=O)-N(H)CH_3$ 、 $OCH_2C(=O)-N(H)-(CH_2)_2-N(CH_3)_2$ 、または $OCH_2-N(H)-C(=NH)NH_2$ である。]

【請求項45】

各ヌクレオシド間連結基は、独立して、ホスホジエステルヌクレオシド間連結基またはホスホロチオエートヌクレオシド間連結基である、請求項 23 ~ 44 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項46】

実質的に各々のヌクレオシド間連結基はホスホロチオエートヌクレオシド間連結基である、請求項 23 ~ 44 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項47】

請求項 23 ~ 46 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物を含む医薬。

【請求項48】

請求項 23 ~ 46 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物を含む、遺伝子発現を阻害するための医薬。

【請求項49】

インビトロで1つ又は複数の細胞若しくは組織を請求項 23 ~ 46 のいずれか1項記載のオリゴマー化合物と接触することを含む、遺伝子発現の阻害方法。