

【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 0 7 H 21/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/712 (2006.01)

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

C 1 2 N 15/113 (2010.01)

【 F I 】

C 0 7 H 21/02 C S P

A 6 1 K 31/712

A 6 1 K 49/00 A

C 1 2 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

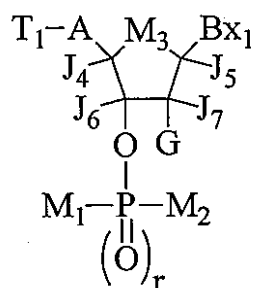
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I c を有する化合物。

【化 1】



I c

[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；

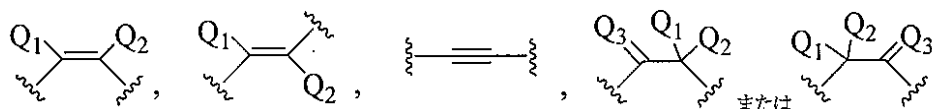
M₂ は、OH、OR₁、または N(R₁)(R₂) であり；

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_{14} 、 $C(R_{15})(R_{16})$ 、 $C(R_{15})(R_{16})C(R_{17})(R_{18})$ 、 $C(R_{15}) = C(R_{17})$ 、 $OC(R_{15})(R_{16})$ 、または $OC(R_{15})(Bx_2)$ であり；

R_{14} 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_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} 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_{19} 、 $C(R_{20})(R_{21})$ 、 $C(R_{20}) = C(R_{21})$ 、 $C[=C(R_{20})(R_{21})]$ 、 $C(=O)$ 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_{19} 、 R_{20} 、および R_{21} 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。

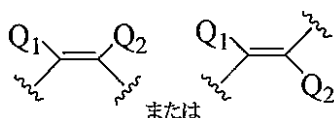
【請求項 5】

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。

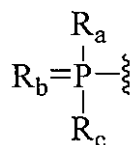
【請求項 9】

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 、 $OCHF_2$ 、 OCF_3 、 OCH_2CH_3 、 $O(CH_2)_2F$ 、 OCH_2CHF_2 、 OCH_2CF_3 、 $OCH_2-CH=CH_2$ 、 $O(CH_2)_2-OCH_3$ 、 $O(CH_2)_2-SCH_3$ 、 $O(CH_2)_2-OCF_3$ 、 $O(CH_2)_3-N(R_{10})(R_{11})$ 、 $O(CH_2)_2-ON(R_{10})(R_{11})$ 、 $O(CH_2)_2-O(CH_2)_2-N(R_{10})(R_{11})$ 、 $OCH_2C(=O)-N(R_{10})(R_{11})$ 、 $OCH_2C(=O)-N(R_{12})-(CH_2)_2-N(R_{10})(R_{11})$ 、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 、 OCF_3 、 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 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。

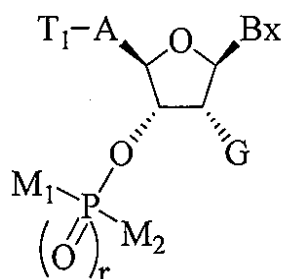
【請求項 18】

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】



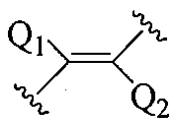
I e

[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、 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。]

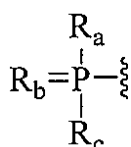
【請求項 2 1】

Q_1 と Q_2 はそれぞれ独立して H、F、 CH_3 、または OCH_3 である、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

T_1 は以下の式を有する、請求項 1 9 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 7】



[式中、

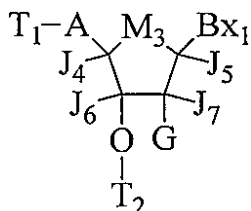
R_b は O であり；

R_a と R_c は、それぞれ独立して、 OCH_3 、 OCH_2CH_3 、または $OCH(CH_3)_2$ である。]

【請求項 2 3】

式 I I c を有する 5' - 末端化合物を含むオリゴマー化合物。

【化 8】



I I c

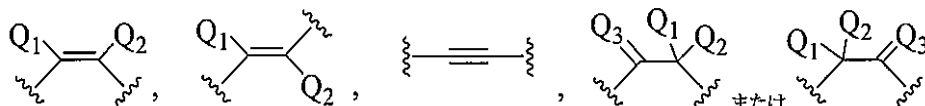
[式中、

T_1 は、任意に保護されるリン部分であり；

T_2 は、前記式 I I c 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】



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_{14} 、 $C(R_{15})(R_{16})$ 、 $C(R_{15})(R_{16})C(R_{17})(R_{18})$ 、 $C(R_{15})=C(R_{17})$ 、 $OC(R_{15})(R_{16})$ 、または O

$C(R_{15})(B \times_2)$ であり；

R_{14} 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_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} 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_{19} 、 $C(R_{20})(R_{21})$ 、 $C(R_{20}) = C(R_{21})$ 、 $C[=C(R_{20})(R_{21})]$ 、 $C(=O)$ 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_{19} 、 R_{20} 、および R_{21} 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】

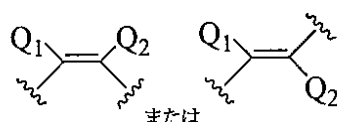
【請求項 25】

【請求項 26】

【請求項 27】

【請求項 28】

【化 1 0】



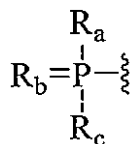
【請求項 29】

【請求項 30】

【請求項 3 1】

【請求項 3 2】

【化 1 1】



R_h は、0 または S である。]

【請求項 33】

【請求項 3 4】

Gはハロゲン、 OCH_3 、 OCH_2F 、 OCHF_2 、 OCF_3 、 OCH_2CH_3 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{F}$ 、 OCH_2CHF_2 、 OCH_2CF_3 、 $\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_3$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2-\text{SCH}_3$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2-\text{OCF}_3$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_3-\text{N}(\text{R}_{10})(\text{R}_{11})$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2-\text{ON}(\text{R}_{10})(\text{R}_{11})$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{R}_{10})(\text{R}_{11})$

$2) 2 - O(CH_2)_2 - N(R_{10})(R_{11})$ 、 $OCH_2C(=O) - N(R_{10})(R_{11})$ 、 $OCH_2C(=O) - N(R_{12}) - (CH_2)_2 - N(R_{10})(R_{11})$ 、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 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、 OCH_3 、 OCF_3 、 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 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、 OCH_3 、または $O(CH_2)_2 - OCH_3$ 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 $O(CH_2)_2 - OCH_3$ 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。

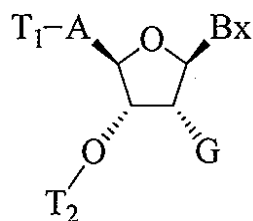
【請求項 39】

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】



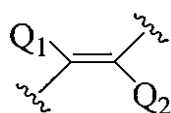
I I d

[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、 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 42】

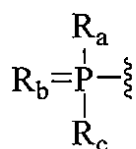
Q_1 と Q_2 はそれぞれ独立して H、F、 CH_3 、または OCH_3 である、請求項 40 に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 43】

T_1 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 1 4】



[式中、

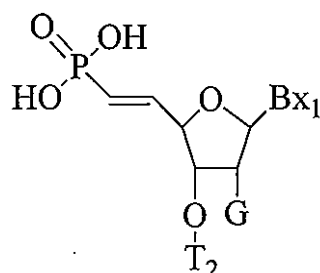
 R_b は O であり；

R_a と R_c は、それぞれ独立して、 OCH_3 、 OCH_2CH_3 、または $OCH(CH_3)_2$ である。]

【請求項 4 4】

前記 5' - 末端化合物は式 I I e を有する、請求項 2 3 に記載のオリゴマー化合物。

【化 1 5】



I I e

[式中、

Bx 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 I I 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 、 OCF_3 、 OCH_2CH_3 、 OCH_2CF_3 、 $OCH_2CH=CH_2$ 、 $O(CH_2)_2-OCH_3$ 、 $O(CH_2)_2-O(CH_2)_2-N(CH_3)_2$ 、 $OCH_2C(=O)-N(H)CH_3$ 、 $OCH_2C(=O)-N(H)-(CH_2)_2-N(CH_3)_2$ 、または $OCH_2-N(H)-C(=NH)NH_2$ である。]

【請求項 4 5】

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 2 3 ~ 4 4 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 4 6】

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 2 3 ~ 4 4 のいずれか一項に記載のオリゴマー化合物。

【請求項 4 7】

請求項 2 3 ~ 4 6 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 4 8】

請求項 2 3 ~ 4 6 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 4 9】

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 2 3 ~ 4 6 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。