

【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 17 年 6 月 16 日 (2005.6.16)

【公表番号】 特表 2001-502673(P2001-502673A)

【公表日】 平成 13 年 2 月 27 日 (2001.2.27)

【出願番号】 特願 平 10-518106

【国際特許分類第 7 版】

C 07 K 5/06

C 07 D 207/16

C 07 D 401/04

C 07 D 473/18

C 07 D 473/34

C 07 H 21/00

C 07 K 7/06

C 07 K 7/08

【F I】

C 07 K 5/06

C 07 D 207/16

C 07 D 401/04

C 07 D 473/18

C 07 D 473/34 3 2 1

C 07 H 21/00

C 07 K 7/06

C 07 K 7/08

【手続補正書】

【提出日】 平成 16 年 10 月 12 日 (2004.10.12)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 補正の内容のとおり

【補正方法】 変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成16年10月12日 ✓

特許庁長官 殿



1. 事件の表示

平成10年特許願第518106号 ✓

(PCT / GB 97 / 02820)

2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名 称 アイシス イノベーション リミテッド

3. 代 理 人

住 所 〒550-0001 大阪市西区土佐堀1丁目6番20号

新栄ビル6階 TEL(06)6441-1816

氏 名 A381 (10381) 弁理士 風 早 信 昭

方 式 審 査



4. 補正対象書類名

明 細 書

請求の範囲

5. 補正対象項目名

明 細 書

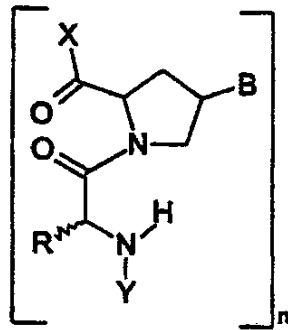
請求の範囲



6. 補正の内容

(1) 補正書の翻訳文提出書（特許法第184条の8第1項）第1頁（明細書原文第2頁訂正分）の式（I）

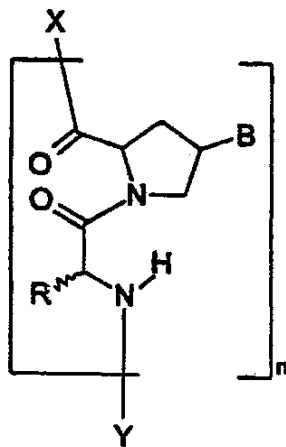
「



(I)

」を

「



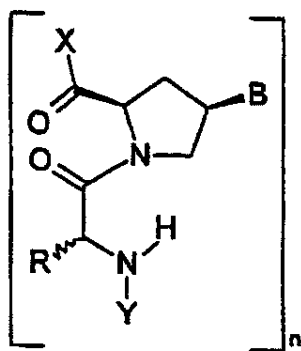
(I)

」

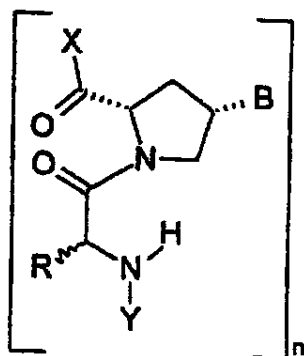
と訂正する。

(2) 明細書第4頁の式（I I）, （I I I）

「

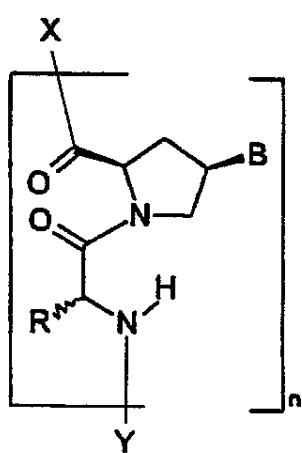


(II)

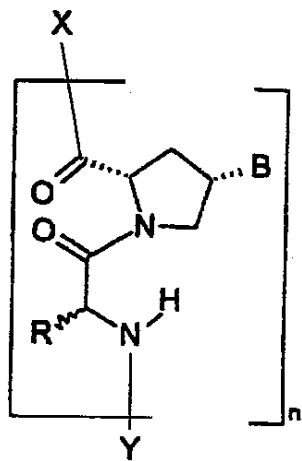


(III)

」を



(II)



(III)

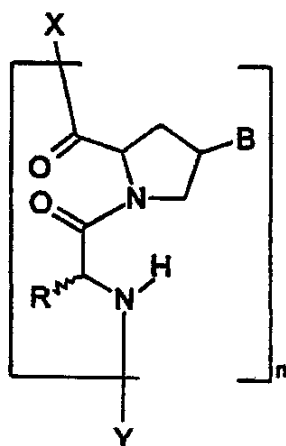
と訂正する。

(3) 請求の範囲を別紙の通り訂正する。

以 上

別 紙
請 求 の 範 囲

1. 式 (I) の化合物 :



(I)

式中、 n は 1 又は 2 - 200 であり、

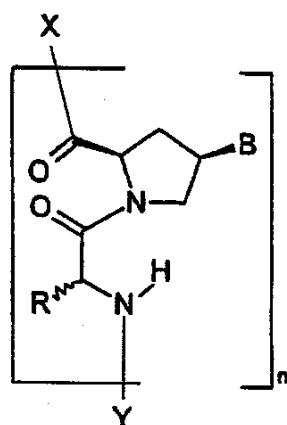
B はワトソン・クリック型塩基対合又はフーグスティーン型塩基対合することができる保護又は未保護塩基であり、

R は H 、 $C_1 - C_{12}$ アルキル、 $C_6 - C_{12}$ アラルキル、又は $C_6 - C_{12}$ ヘテロアリールであり (ただしそれはヒドロキシル、カルボキシル、アミン、アミド、チオール、チオエーテル、又はフェノールから選択されることが好ましい一以上の置換基を有していてもよい)、

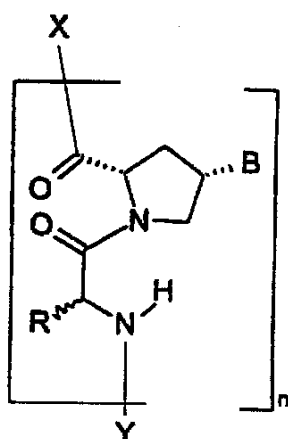
X は OH 又は OR' であり (ただし R' は保護基又は活性化基又は親油性基又はアミノ酸又はアミノアミド又はヌクレオシドである)、

Y は H 又は保護基又は親油性基又はアミノアシル基又はヌクレオシドである。

2. 構造が (II) 又は (III) であることを特徴とする請求の範囲 1 の化合物 (ただし式中、 n 、 B 、 R 、 X 、及び Y は請求の範囲 1 で規定される通りである)。



(II)



(III)

3. Bがアデニン、シトシン、グアニン、チミン、及びウラシルから選択される天然に存在するヌクレオ塩基であることを特徴とする請求の範囲1又は2の化合物。

4. $-\text{CO}-\text{CHR}-\text{NH}-$ が天然に存在するアミノ酸の残基であることを特徴とする請求の範囲1-3のいずれか一つの化合物。

5. Rが CH_2OH 又は $(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$ 又はHであることを特徴とする請求の範囲1-4のいずれか一つの化合物。

6. nが1であり、

Bがアデニン、シトシン、グアニン、チミン、及びウラシルから選択される天然に存在するヌクレオ塩基であり、

RがH又は CH_2OH 又は $(\text{CH}_2)_4\text{NH}_2$ であり、

XがOH又はOR'であり、

R'が例えばペンタフルオロフェニルの活性化基であり、

YがH又は例えばFmocの保護基である

ことを特徴とする請求の範囲1の化合物。

7. nが2-200、好ましくは5-30であることを特徴とする請求の範囲1-5のいずれか一つの化合物。

8. 第一の鎖が請求の範囲7の化合物であり、第二の鎖がオリゴ又はポリヌクレオチド、又は核酸である二本鎖を含むハイブリッド。

9. 二本鎖が塩基特異的ワトソン・クリック型塩基対合によって1:1のモル比で相互に対してハイブリダイズしていることを特徴とする請求の範囲8のハイブリッド。

10. 以下のステップを含む、式(I)のペプチドヌクレオチド類似物の製造方法:

a) N-保護C-保護4-ヒドロキシプロリンをN₃-保護チミン、N₆-保護アデニン、N₄-保護シトシン、N₂-O₆-保護グアニン、及びN₃-保護ウラシルから選択される塩基と反応させ、

b) a)の生成物のプロリンアミノ基を脱保護し、

c) b)の生成物をN-保護アミノ酸と反応させ、

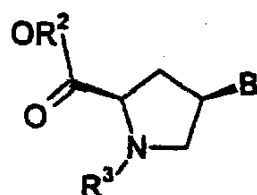
d) c)の生成物から保護基を所望により除去する。

11. a)においてN-Boc/Dpmエステルの形態の4-ヒドロキシプロリンをN₃-ベンゾイルチミン、N₆-ベンゾイルアデニン、N₄-ベンゾイルシトシン、N₂-ベンゾイル-O₆-(4'-ニトロフェニルエチル)グアニン、又はN₃-ベンゾイルウラシルと反応させること、及びc)においてFmocアミノ酸エステルが用いられることを特徴とする請求の範囲10の方法。

12. N-保護C-保護トランス-4-ヒドロキシプロリンがa)において用いられることを特徴とする請求の範囲10又は11の方法。

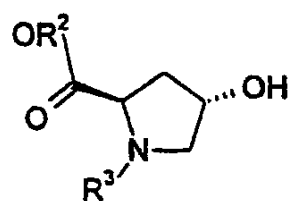
13. 以下のステップを含む、nが1である式(I)のペプチドヌクレオチド類似物をnが2-200である式(I)のペプチドオリゴヌクレオチドへ変換する方法:

- i) 第一アミン基を持つ支持体を準備し、
 - ii) 式 (I) の N-保護ペプチドヌクレオチド類似物を支持体に結合させ、
 - iii) N-保護基を除去し、
 - iv) 式 (I) の N-保護ヌクレオチド類似物をかくして誘導体化された支持体に結合させ、
 - v) ステップ iii) 及び iv) を一回以上繰返し、そして
 - vi) 生ずるペプチドオリゴヌクレオチドを支持体から所望により除去する。
14. ペプチドヌクレオチド類似物のペンタフルオロフェニルエステルがステップ ii) 及び iii) において用いられることを特徴とする請求の範囲 13 の方法。
15. 式 (IV) の化合物：



(IV)

- 式中、R²はH又は保護基であり、
- R³はH又はR²に適合する保護基であり、及び
- Bはワトソン・クリック型塩基対合又はフーグスティーン型塩基対合することができる保護又は未保護複素環塩基である。
16. R²がジフェニルメチルであり、R³が α -ブトキシカルボニルであることを特徴とする請求の範囲 15 の化合物。
17. Bがアデニン、シトシン、グアニン、チミン、及びウラシルから選択される保護又は未保護ヌクレオ塩基であることを特徴とする請求の範囲 15 又は 16 の化合物。
18. 式 (V) の化合物：



(V)

式中、 R^2 はジフェニルメチルであり、

R^3 は *t*-ブトキシカルボニルである。

19. B, R, X, 及びYの少なくとも一つがシグナル成分であることを特徴とする請求の範囲1-7のいずれか一つの化合物。