

【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22年6月24日(2010.6.24)

【公表番号】特表2009-544660(P2009-544660A)

【公表日】平成21年12月17日(2009.12.17)

【年通号数】公開・登録公報2009-050

【出願番号】特願2009-521246(P2009-521246)

【国際特許分類】

C 07 D 403/14 (2006.01)

C 12 N 9/10 (2006.01)

C 12 Q 1/48 (2006.01)

C 07 D 495/04 (2006.01)

C 07 D 407/12 (2006.01)

C 07 D 493/10 (2006.01)

【F I】

C 07 D 403/14 C S P

C 12 N 9/10

C 12 Q 1/48 Z

C 07 D 495/04 1 0 3

C 07 D 407/12

C 07 D 493/10 B

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月7日(2010.5.7)

【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

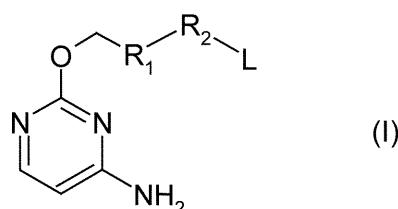
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化17】



(式中、

R₁は、芳香族もしくはヘテロ芳香族基であるか、または場合により置換されている不飽和アルキル、場合により置換されているシクロアルキルもしくは場合により置換されているOCH₂-に連結された二重結合を有する、ヘテロサイクリル基であり；

R₂は、リンカーであり、そして

Lは、標識または複数の同じまたは異なる標識である)

の化合物。

【請求項2】

R₁が、フェニルである、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項3】

R_1 が、パラ - 置換されたフェニルである、請求項2に記載の式(I)の化合物。

【請求項4】

R_2 が、1~300個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキレン基であって、場合により

(a) 1個以上の炭素原子が、酸素で置き換えられている、特に3番目毎の炭素原子が、酸素で置き換えられている、例えば1~100のエチレンオキシ単位を有するポリエチレンオキシ基；

(b) 1個以上の炭素原子が、水素原子を有する窒素で置き換えられており、そして隣接炭素原子が、オキソにより置換されており、アミド官能基-NH-CO-を示す；

(c) 1個以上の炭素原子が、酸素で置き換えられており、そして隣接炭素原子が、オキソにより置換されており、エステル官能基-O-CO-を示す；

(d) 2つの隣接炭素原子間の結合が、二重結合または三重結合であり、官能基-CH=CH-または-C=C-を示す；

(e) 1個以上の炭素原子が、フェニレン、飽和もしくは不飽和シクロアルキレン、飽和もしくは不飽和ビシクロアルキレン、橋かけヘテロ芳香族または橋かけ飽和もしくは不飽和ヘテロサイクリル基で置き換えられている；

(f) 2個の隣接炭素原子が、ジスルフィド結合-S-S-で置き換えられている；1~300個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキレン基、または2つ以上の、特に2つもしくは3つの、アルキレンおよび/または前記(a)~(f)下に定義された改変されたアルキレン基の組み合わせであり、これらの基は場合により置換基を含有する、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項5】

R_2 が、炭素原子が場合によりアミド官能基-NH-CO-で置き換えられている、1~25個の炭素原子を有する直鎖アルキレン基である、請求項4に記載の式(I)の化合物。

【請求項6】

Lが、分光学的プローブ、特異的結合ペアの1つの部分を表す分子、または固体支持体に共有結合により結合した分子である、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項7】

Lが、発蛍光団である、請求項6に記載の式(I)の化合物。

【請求項8】

請求項7に記載の化合物N-[4-(4-アミノピリミジン-2-イルオキシメチル)-ベンジル]-テトラメチルローダミン-5-もしくは6-カルボキサミドまたはその混合物。

【請求項9】

請求項7に記載の化合物N-[4-(4-アミノピリミジン-2-イルオキシメチル)-ベンジル]-フルオレセイン-5もしくは6-カルボキサミドまたはその混合物。

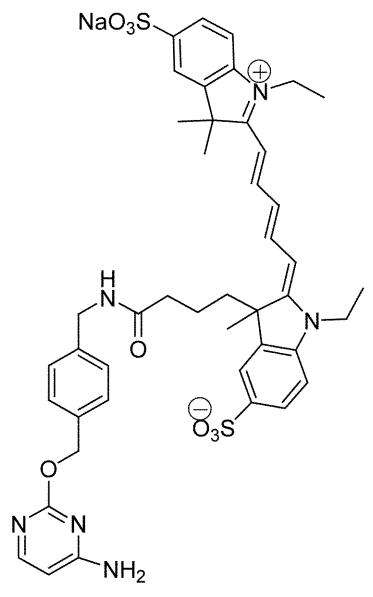
【請求項10】

請求項7に記載の化合物N-[4-(4-アミノピリミジン-2-イルオキシメチル)-ベンジル]-ジアセチルフルオレセイン-5もしくは6-カルボキサミドまたはその混合物。

【請求項11】

式8

【化18】



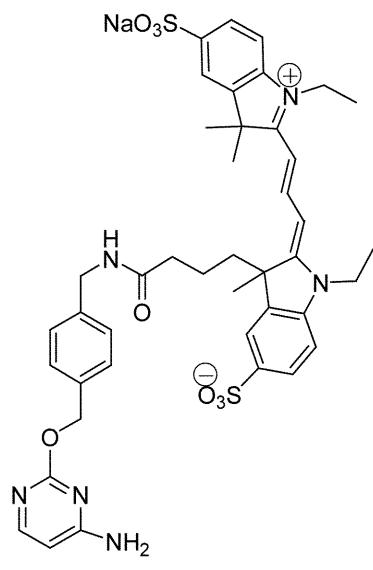
(8)

の N - [4 - (4 - アミノピリミジン - 2 - イルオキシメチル) - ベンジル] - D Y 6 4
7 - カルボキサミドである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項12】

式9

【化19】



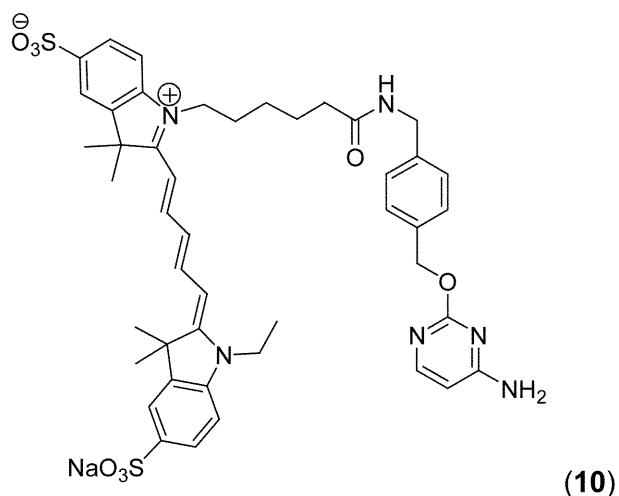
(9)

の N - [4 - (4 - アミノピリミジン - 2 - イルオキシメチル) - ベンジル] - D Y 5 4
7 - カルボキサミドである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項13】

式10

【化20】

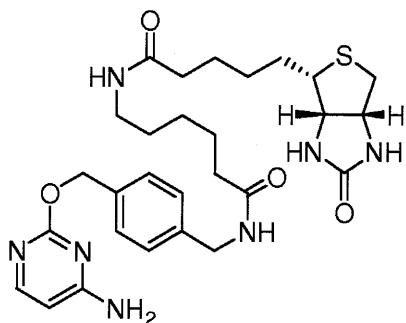


の N - [4 - (4 - アミノピリミジン - 2 - イルオキシメチル) - ベンジル] - C y 5 - カルボキサミドである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 14】

式 1 2

【化21】

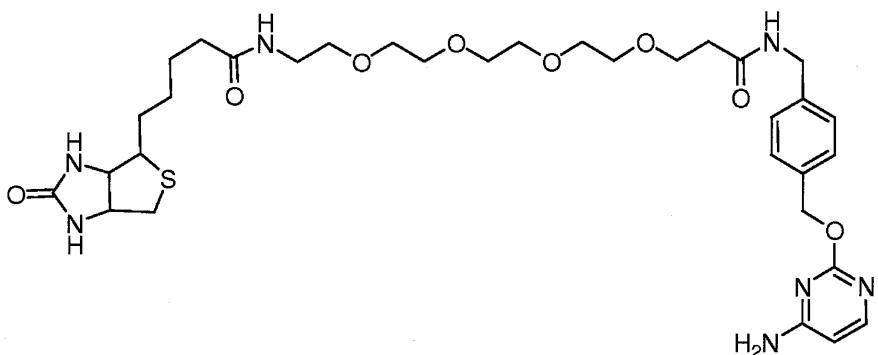


の請求項 7 に記載の化合物 B C - ビオチン。

【請求項 15】

式 1 3

【化22】

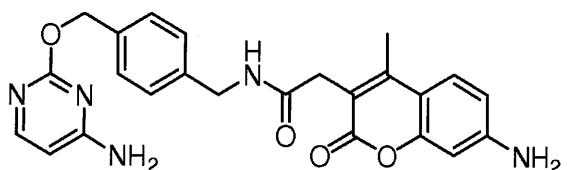


の請求項 7 に記載の化合物 B C - P E G - ビオチン。

【請求項 16】

式 1 4

【化23】

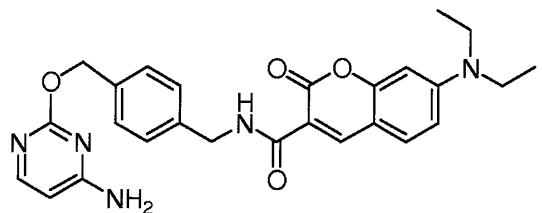


の請求項7に記載の化合物BC-360。

【請求項17】

式15

【化24】

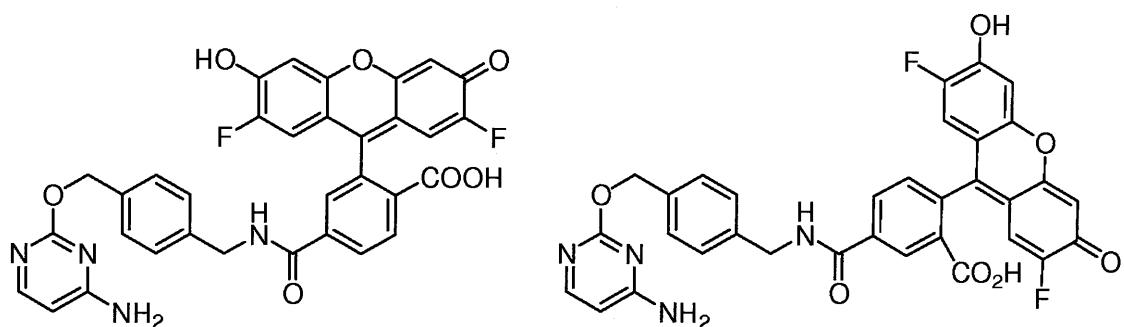


の請求項7に記載の化合物BC-430。

【請求項18】

式16

【化25】

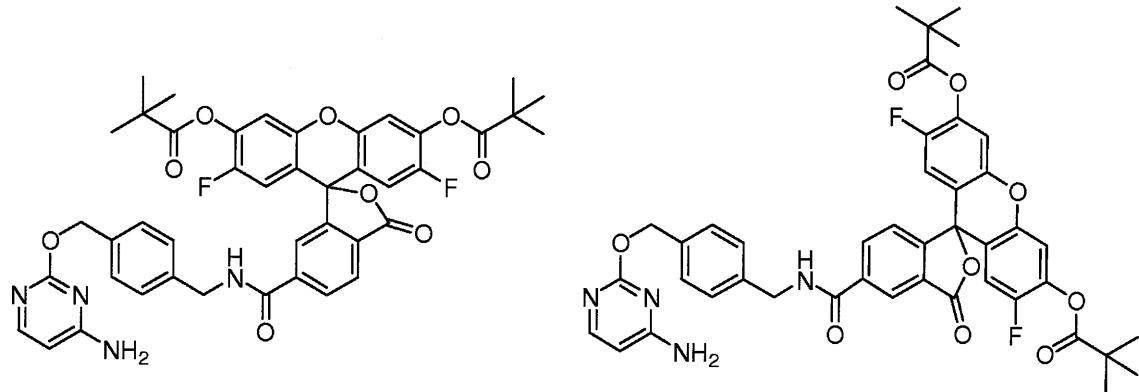


の1つの請求項7に記載の化合物BC-Oregon Greenまたはその混合物。

【請求項19】

式17

【化26】

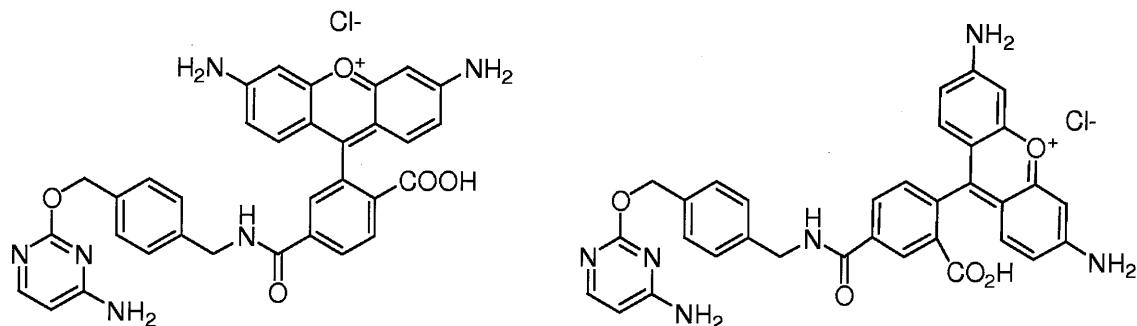


の 1 つ の 請 求 項 7 に 記 載 の 化 合 物 B C - O r e g o n G r e e n ジ ピ バ ロ イ ル エ ス テ または そ の 混 合 物。

【 請 求 項 2 0 】

式 1 8

【 化 2 7 】



の 1 つ の 請 求 項 7 に 記 載 の 化 合 物 B C - 5 0 5 または そ の 混 合 物。

【 請 求 項 2 1 】

- (a) 1 7 0 ~ 2 2 0 アミノ酸からなり；
- (b) 少なくとも 1 つ の システイン を 含み；
- (c) O² - ベンジルシトシンと反応し、それによって同じ条件下に O⁶ - ベンジルグアニンとの反応における場合と少なくとも同じに速く (b) の システイン の メルカプト官能基にベンジル置換基を移行させる、

タンパク質である アルキルシトントラ nsフェラーゼ (A C T)。

【 請 求 項 2 2 】

配列番号 1 に 記 載 の タンパク質；

下記の 置換、

R 1 1 4 A 、 S 1 3 1 V 、 E 1 4 8 Q 、 G 1 5 7 W お よび M 1 5 9 R ;
 R 1 1 4 S 、 S 1 3 1 T 、 D 1 3 5 T 、 E 1 4 8 D 、 G 1 5 7 P お よび M 1 5 9 E ;
 R 1 1 4 N 、 S 1 3 1 N 、 G 1 5 7 A お よび M 1 5 9 S ;
 R 1 1 4 A 、 S 1 3 1 T 、 D 1 3 5 S 、 G 1 5 7 K お よび M 1 5 9 E ;
 R 1 1 4 E 、 S 1 3 1 R 、 D 1 3 5 A 、 G 1 5 7 E お よび M 1 5 9 E ;
 R 1 1 4 S 、 S 1 3 1 V 、 E 1 4 8 Q 、 G 1 5 7 L お よび M 1 5 9 R ;
 R 1 1 4 E 、 S 1 3 1 N 、 D 1 3 5 N 、 G 1 5 7 T お よび M 1 5 9 F ;

により 配列番号 1 と は 異なる タンパク質；

お よび 位 置 1 1 4 、 1 3 1 、 1 3 5 、 1 4 8 、 1 5 7 お よび 1 5 9 以 外 の 位 置 で 1 個 、 2 個 ま た は 3 個 の アミノ酸 が 異なる この ような タンパク質；

からなる 群より 選ばれる、 請 求 項 2 1 に 記 載 の アルキルシトントラ nsフェラーゼ (A C T)。

【 請 求 項 2 3 】

配列番号 1 2 に 記 載 の タンパク質；

位 置 6 0 の アミノ酸 が、 M ま た は I で あ り、

位 置 1 1 4 の アミノ酸 が、 A 、 E 、 N 、 R ま た は S で あ り、

位 置 1 2 1 の アミノ酸 が、 A ま た は V で あ り、

位 置 1 3 1 の アミノ酸 が、 N 、 S 、 T ま た は V で あ り、

位 置 1 3 5 の アミノ酸 が、 D 、 N ま た は T で あ り、

位 置 1 4 8 の アミノ酸 が、 D 、 E 、 Q ま た は V で あ り、

位 置 1 5 3 の アミノ酸 が、 L ま た は S で あ り、

位 置 1 5 7 の アミノ酸 が、 A 、 G 、 L 、 T 、 P ま た は W で あ り、 そ し て

位 置 1 5 9 の アミノ酸 が、 E 、 F 、 M 、 R 、 S ま た は L で あ る、

配列番号 1 2 のタンパク質；

および位置 6 0、 1 1 4、 1 2 1、 1 3 1、 1 3 5、 1 4 8、 1 5 3、 1 5 7 および 1 5 9 以外の位置で 1 個、 2 個または 3 個のアミノ酸が異なるこのようなタンパク質；
からなる群より選ばれる、請求項 2 1 に記載のアルキルシトシントランスフェラーゼ (A C T)。

【請求項 2 4】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物から、標識 L を、請求項 2 1 に記載のアルキルシトシントランスフェラーゼ、または請求項 2 1 に記載のアルキルシトシントランスフェラーゼを含む融合タンパク質に移行させる方法。

【請求項 2 5】

関心のあるタンパク質を請求項 2 1 に記載のアルキルシトシントランスフェラーゼを含む融合タンパク質に組み込み、該アルキルシトシントランスフェラーゼ融合タンパク質を請求項 1 に記載の式 (I) の化合物と接触させ、そして標識 L を認識および / または処理するためにデザインされたシステムにおいて標識 L を使用して、前記アルキルシトシントランスフェラーゼ融合タンパク質を検出しそして場合により更に操作する、関心のあるタンパク質を検出および / または操作するための方法。