

【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】令和2年11月12日(2020.11.12)

【公表番号】特表2020-504074(P2020-504074A)

【公表日】令和2年2月6日(2020.2.6)

【年通号数】公開・登録公報2020-005

【出願番号】特願2018-566875(P2018-566875)

【国際特許分類】

C 07 D 491/052 (2006.01)

C 07 D 491/16 (2006.01)

C 07 H 19/10 (2006.01)

C 07 H 19/20 (2006.01)

C 12 N 15/09 (2006.01)

C 12 Q 1/6816 (2018.01)

【F I】

C 07 D 491/052 C S P

C 07 D 491/16

C 07 H 19/10

C 07 H 19/20

C 12 N 15/09 Z

C 12 Q 1/6816 Z

【手続補正書】

【提出日】令和2年9月18日(2020.9.18)

【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

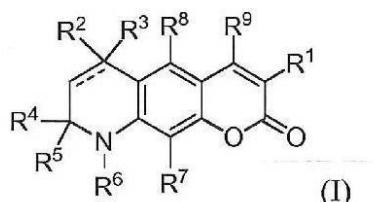
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

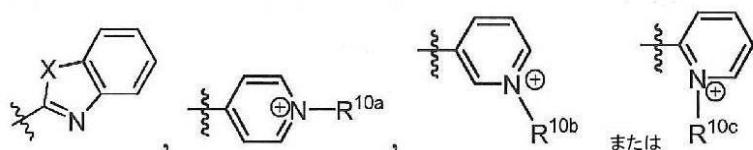
【請求項1】

式(I)の化合物、またはその塩、メソメリ一形態:

【化1】

[式中、R<sup>1</sup>は

【化2】

であり、ここで、R<sup>1</sup>は、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アミノ、アミノアルキル、ハロ

、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、ヘテロアルキル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、ニトロ、スルホニル、スルホ、スルフィノ、スルホネート、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたシクロアルキル、および任意に置換されたヘテロシクリルからなる群より選択される1つ以上の置換基で任意に置換され；

各R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、およびR<sup>5</sup>は、独立して、H、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アミノ、アミノアルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、ヘテロアルキル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、ニトロ、スルホニル、スルホ、スルフィノ、スルホネート、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、任意に置換されたカルボシクリル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群より選択され；

R<sup>6</sup>は、カルボキシル、-C(O)OR<sup>12</sup>、または-C(O)NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>で置換されたアルキルであり；

R<sup>9</sup>はHであり；

各R<sup>10a</sup>、R<sup>10b</sup>およびR<sup>10c</sup>は、独立して、アルキル、置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アミノアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシアルキル、およびスルホニルヒドロキシドからなる群より選択され；

各R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は、独立して、H、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アミノ、アミノアルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、ヘテロアルキル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、ニトロ、スルホニル、スルホ、スルフィノ、スルホネート、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、任意に置換されたカルボシクリル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群より選択され；

Xは、O、S、NR<sup>11</sup>、およびSeからなる群より選択され；

R<sup>11</sup>は、H、アルキル、置換アルキル、アルケニル、アルキニル、アミノアルキル、カルボキシアルキル、スルホナトアルキル、ハロアルキル、ヘテロアルキル、アルコキシアルキル、スルホ、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたカルボシクリル、および任意に置換されたヘテロシクリルからなる群より選択され；

R<sup>12</sup>は、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、および任意に置換された3~7員シクロアルキルからなる群より選択され；

各R<sup>13</sup>およびR<sup>14</sup>は、独立して、H、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換された3~7員シクロアルキルから選択され；ならびに

実線と破線とで表される結合

-----

は、単結合および二重結合からなる群より選択されるが、ただし、

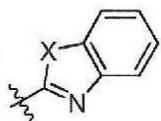
-----

が二重結合の場合、R<sup>3</sup>は存在しない】。

【請求項2】

R<sup>1</sup>が

## 【化 3】



である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

XがOである、請求項 2 に記載の化合物。

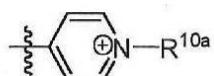
## 【請求項 4】

XがSである、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

R<sup>1</sup>が

## 【化 4】

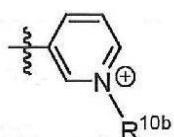


である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

R<sup>1</sup>が

## 【化 5】

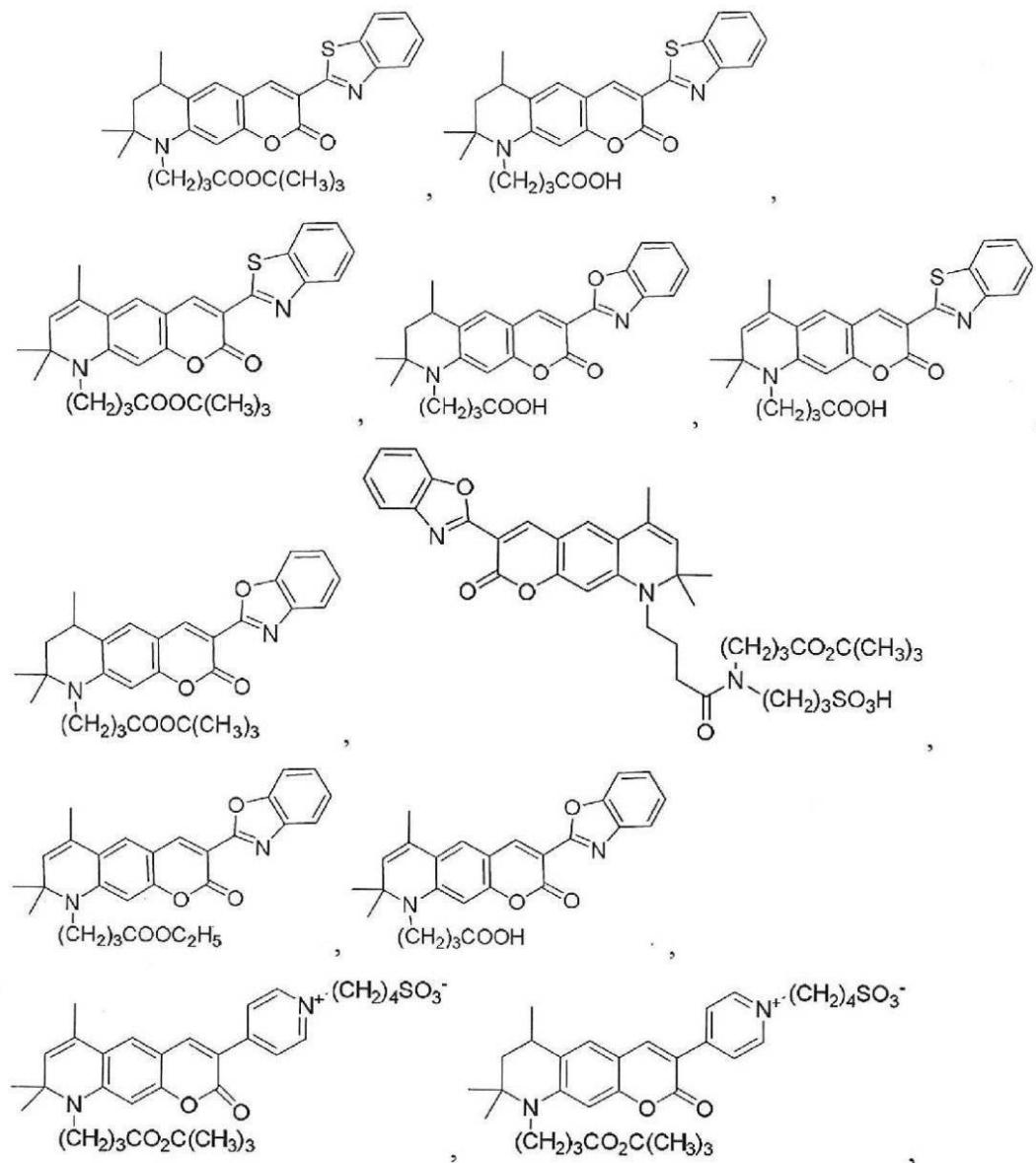


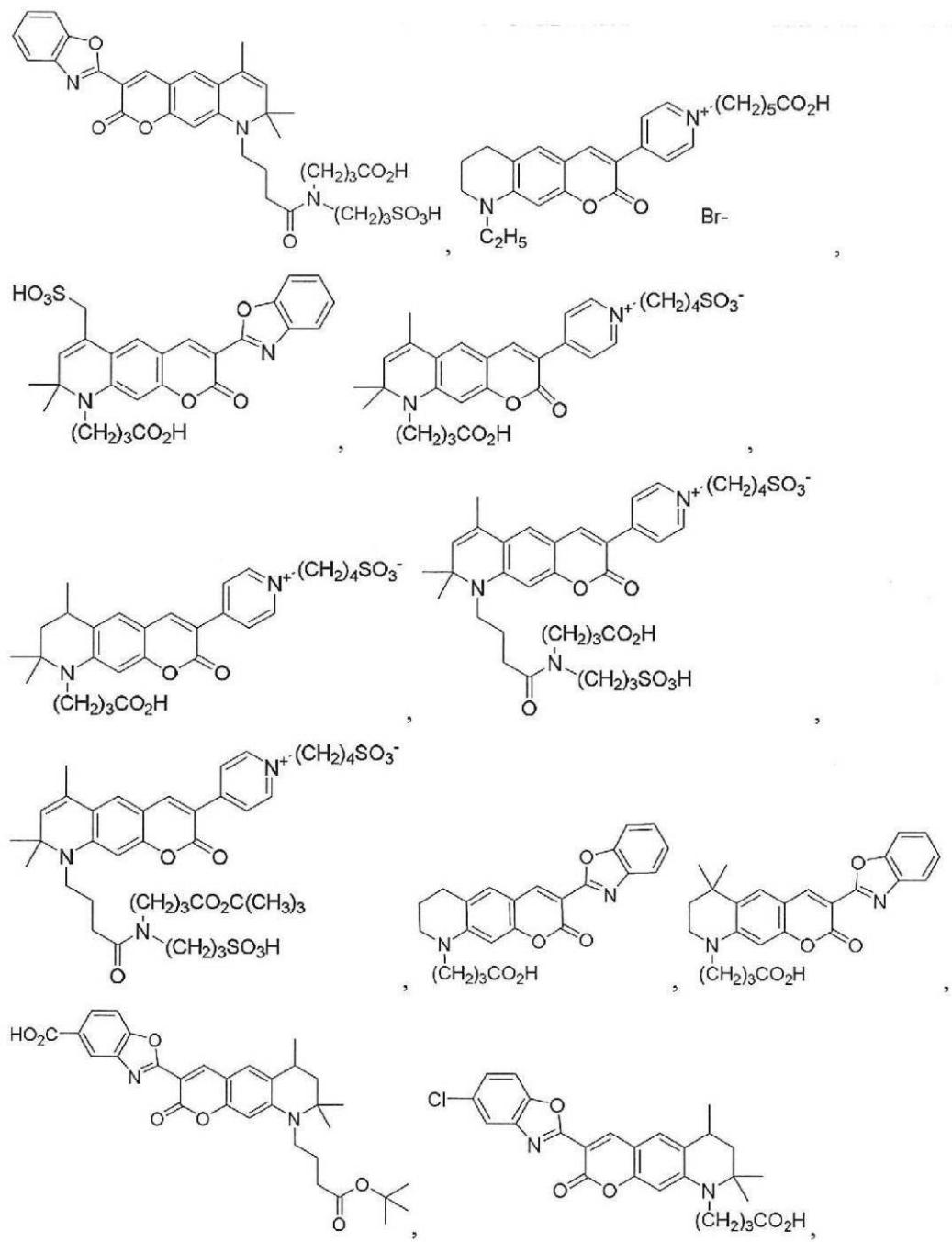
である、請求項 1 に記載の化合物。

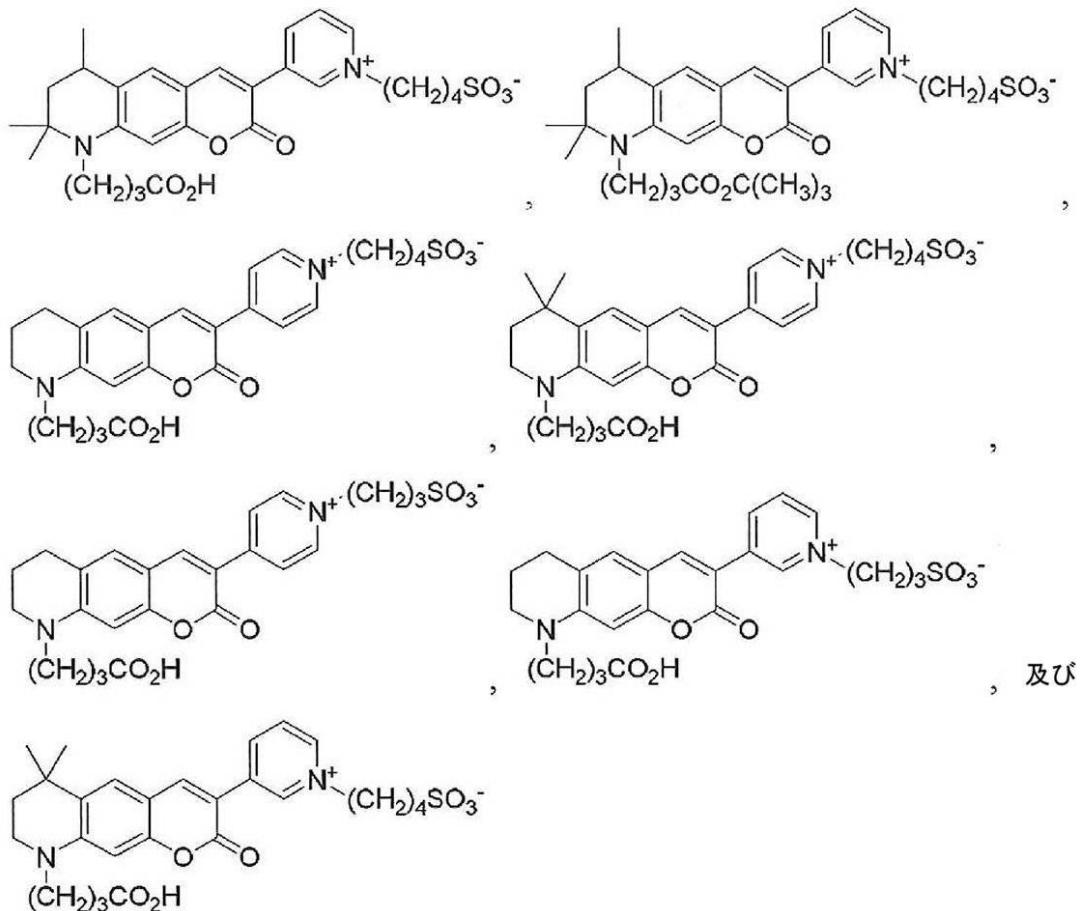
## 【請求項 7】

以下からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物：

【化 6】







、ならびにそれらの塩、メソメリーフォーム。

**【請求項 8】**

請求項1に記載の化合物で標識されたヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチド。

**【請求項 9】**

前記化合物が、R<sup>6</sup>を介して前記ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチドに共有結合している、請求項8に記載の標識ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチド。

**【請求項 10】**

前記化合物が、R<sup>10a</sup>、R<sup>10b</sup>またはR<sup>10c</sup>を介して前記ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチドに共有結合しており、ここでR<sup>10a</sup>、R<sup>10b</sup>またはR<sup>10c</sup>が置換アルキルである、請求項8に記載の標識ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチド。

**【請求項 11】**

前記化合物が、リンカーポジションを介して、前記ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチドのピリミジン塩基のC5位もしくは7-デアザプリン塩基のC7位に結合している、請求項8に記載の標識ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチド。

**【請求項 12】**

前記ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチドのリボースもしくはデオキシリボース糖に共有結合している3'-OHプロッキング基をさらに含む、請求項8に記載の標識ヌクレオチドまたはオリゴヌクレオチド。

**【請求項 13】**

1つ以上のヌクレオチドを含むキットであって、ここで少なくとも1つのヌクレオチドが請求項8に記載の標識ヌクレオチドである、キット。

【請求項14】

2つ以上の標識ヌクレオチドを含む、請求項13に記載のキット。

【請求項15】

前記標識ヌクレオチドのうちの2つが、単一レーザーを使用して励起される、請求項13に記載のキット。

【請求項16】

請求項8に記載のヌクレオチドを配列決定アッセイに組み込む工程を含む、配列決定方法。

【請求項17】

前記ヌクレオチドを検出する工程をさらに含む、請求項16に記載の方法。

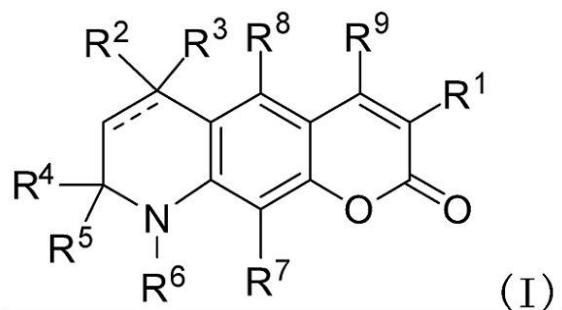
【請求項18】

各R<sup>10a</sup>、R<sup>10b</sup>およびR<sup>10c</sup>は、カルボキシル、カルボキシレート、スルホ、またはスルホネートで置換されたアルキルである、請求項1に記載の方法。

【請求項19】

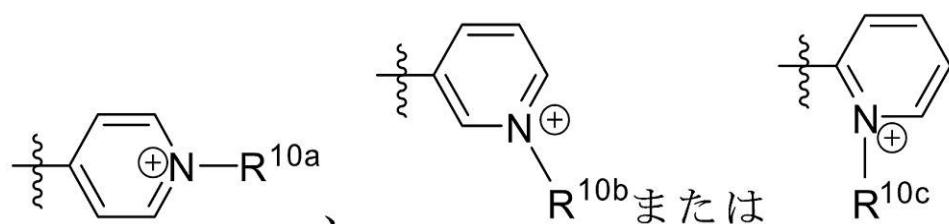
式(I)の化合物、またはその塩、メソメリーフорм:

【化7】



〔式中、R<sup>1</sup>は

【化8】



であり、ここで、R<sup>1</sup>は、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アミノ、アミノアルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、ヘテロアルキル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、ニトロ、スルホニル、スルホ、スルフィノ、スルホネート、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたシクロアルキル、および任意に置換されたヘテロシクリルからなる群より選択される1つ以上の置換基で任意に置換され;

各R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、およびR<sup>5</sup>は、独立して、H、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アミノ、アミノアルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、ヘテロアルキル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、ニトロ、スルホニル、スルホ、スルフィノ、スルホネート、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、任意に置換されたカルボシクリル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群より選択され;

各R<sup>10a</sup>、R<sup>10b</sup>およびR<sup>10c</sup>は、独立して、カルボキシル、カルボキシレート、スルホ、またはスルホネートで置換されたアルキルであり；

各R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は、それらが結合する分子とともに任意に置換された5～10員ヘテロシリルを形成し；

R<sup>8</sup>は、H、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルキル、アミノ、アミノアルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、ヘテロアルキル、Cカルボキシ、Oカルボキシ、C

アミド、Nアミド、ニトロ、スルホニル、スルホ、スルフィノ、スルホネート、Sスルホンアミド、Nスルホンアミド、任意に置換されたカルボシクリル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群より選択され；ならびに

実線と破線とで表される結合

は、単結合および二重結合からなる群より選択されるが、ただし、

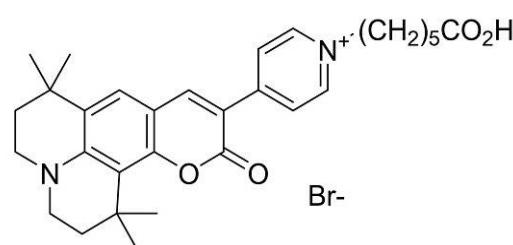
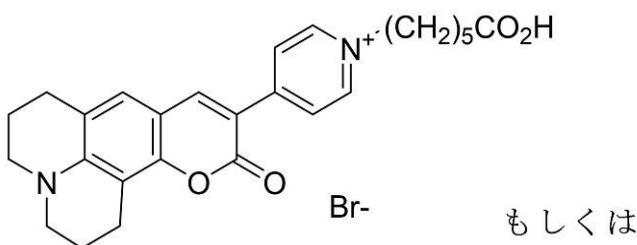
が二重結合の場合、R<sup>3</sup>は存在しない]。

【請求項20】

各R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は、ともに、それらが結合する分子とともに任意に置換された6員ヘテロシリルを形成する、請求項19に記載の方法。

【請求項21】

【化9】



の構造を有する、請求項19に記載の化合物、またはそれらの塩、メソメリ一形態。

【請求項22】

実線と破線とで表される結合

は、単結合であり、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>のうち少なくとも1つはアルキルである、請求項2に記載の化合物。

【請求項23】

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のうち少なくとも1つはアルキルである、請求項22に記載の化合物。

【請求項24】

R<sup>10a</sup>は、カルボキシル、カルボキシレート、スルホ、またはスルホネートで置換されたアルキルである、請求項5に記載の化合物。

【請求項25】

実線と破線とで表される結合

は、単結合であり、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>のうち少なくとも1つはアルキルである、請求項24に記載の化合物。

【請求項26】

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>のうち少なくとも1つはアルキルである、請求項25に記載の化合物。