[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 930220

(51) Kv.lk.5 - Int.cl.5

C 07H 21/00, C 12Q 1/68 // C 07F 9/24

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 20.01.93

(24) Alkupäivä - Löpdag 20.01.93

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 23.07.93

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

22.01.92 DE 4201662 P

(71) Hakija - Sökande

1. **Hoechst Aktiengesellschaft**, 6230 Frankfurt/Main 80, BRD, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. **Uhlmann, Eugen**, Zum Talblick 31, 6246 Glashütten/Taunus, BRD, (DE)
2. **Peyman, Anuschirwan**, In den Bleichwiesen 9, 6233 Kelkheim (Taunus), BRD, (DE)
3. **O'Malley, Gerard**, 523 East Penn Street, Newtown, Pa. 18940, USA, (US)
4. **Helsberg, Matthias**, Am Rosengarten 3, 6233 Kelkheim (Taunus), BRD, (DE)
5. **Winkler, Irvin**, In den Eichen 40, 6237 Liederbach, BRD, (DE)

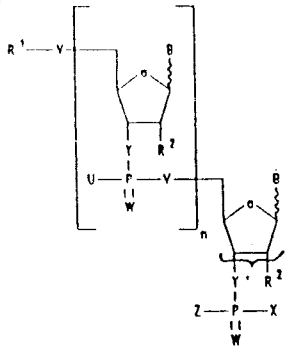
(74) Asiamies - Ombud: **Oy Kolster Ab**

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Oligonukleotidianalogeja, niiden valmistus ja käyttö
Oligonukleotidsanaloger, deras framställning och användning

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee mentelmää oligonukleotidianalogien valmistamiseksi, joiden kaava on I:



(I)

jossa R^1 on H, alkyyli, asyyli, aryyli tai fosfaattitähde; R^2 on H, OH, alkoksi, NH_2 tai halogeeni; B on nukleotidikemiassa tavanomainen emäs; a on O tai CH_2; n on kokonaisluku 1 - 100; W = O, S tai Se; V = O, S tai NH; Y = O, S, NH tai CH_2; Y' = O, S, NH tai alkyleeni; X = OH tai SH; U = OH, SH, SeH, alkyyli, aryyli tai amiini ja Z = OH, SH, SeH, mahdollisesti substituoitu tähde ryhmästä alkyyli, aryyli, heteroaryyli, alkoksi tai amino tai ryhmä, joka edistää ottoa solun sisään tai joka toimii DNA-koettimen leimana tai joka vaikuttaa hybridisaatiossa kohdenukleiinihappoon. Kaavan (I) mukaiset yhdisteet ovat käyttökelpoisia geeni-ilmennyksen inhibiittoreina, koettimina nukleiinihappojen osoittamiseksi ja apuvälineinä molekyylibiologiassa.

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av föreningar med formeln I, vari R^1 betyder H, alkyl, acyl, aryl eller en fosfatrest; R^2 betecknar H, OH, alkoxi, NH_2 eller halogen; B står för en i nukleotidkemin sedvanlig bas; a står för O eller CH_2; n står för ett heltal 1 - 100; W = O, S eller Se; V = O, S eller NH; Y = O, S, NH eller CH_2; Y' = O, S, NH eller alkylen; X = OH eller SH; U = OH, SH, SeH, alkyl, aryl eller amin och Z = OH, SH, SeH, en eventuellt substituerad rest ur serien alkyl, aryl, heteroaryl, alkoxi eller amino eller betyder en grupp som befrämjar den intracellulära upptagningen eller tjänstgör som markering på en DNA-sond, eller vid hybridisering angriper målnukleinsyran. Föreningarna med formeln I är användbara som inhibitorer av genexpressionen, som sonder för påvisning av nukleinsyror och som hjälpmedel i molekulärbiologin.