

【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4年11月29日(2022.11.29)

【公開番号】特開2022-444(P2022-444A)

【公開日】令和4年1月4日(2022.1.4)

【年通号数】公開公報(特許)2022-001

【出願番号】特願2021-152371(P2021-152371)

【国際特許分類】

C 07 H 19/073(2006.01)

10

C 07 H 21/04(2006.01)

【F I】

C 07 H 19/073 C S P

C 07 H 21/04 B

【手続補正書】

【提出日】令和4年11月17日(2022.11.17)

【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

20

【補正方法】変更

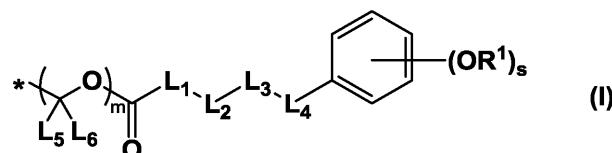
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)

【化1】



30

(式中、*は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの2'位、3'位及び5'位のヒドロキシ基並びに核酸塩基部からなる群から選ばれる少なくとも1か所との結合位置を示し、

R¹は、C10-30アルキル基又はC10-30アルケニル基であり、sは、1から5の整数であり、

L¹は、単結合、C1-6アルキレン基、C2-6アルケニレン基又はC2-6アルキニレン基であり、

L²は、単結合、-COO-、-CON(R²) - (式中R²は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す)、-OCO-、-N(R²)CO- (式中R²は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す)、-C(O)-又は-O-であり、

L³は、単結合、C1-6アルキレン基、C2-6アルケニレン基又はC2-6アルキニレン基であり、

L⁴は、単結合、-COO-、-CON(R²) - (式中R²は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す)、-OCO-、-N(R²)CO- (式中R²は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す)、-C(O)-又は-O-であり、

40

50

L^5 は、水素原子、C 1 - 6 アルキル基、C 1 - 6 ハロアルキル基、C 2 - 6 アルケニル基又はC 2 - 6 ハロアルケニル基であり、

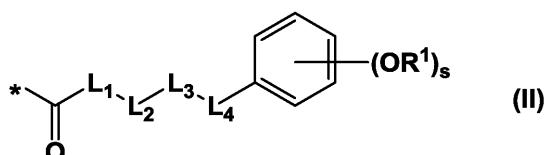
L^6 は、水素原子、C 1 - 6 アルキル基、C 1 - 6 ハロアルキル基、C 2 - 6 アルケニル基又はC 2 - 6 ハロアルケニル基であり、

m は、0 又は1 であり、 m が0 である場合、 L^4 は、単結合ではない) で表される、擬似固相保護基。

【請求項 2】

前記擬似固相保護基が、下記式(II)

【化2】



10

(式中、* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの2' 位、3' 位及び5' 位のヒドロキシ基並びに核酸塩基部からなる群から選ばれる少なくとも1か所との結合位置を示し、

R^1 は、C 10 - 30 アルキル基又はC 10 - 30 アルケニル基であり、 s は、1 から5 の整数であり、

L^1 は、単結合、C 1 - 6 アルキレン基、C 2 - 6 アルケニレン基又はC 2 - 6 アルキニレン基であり、

L^2 は、単結合、-COO-、-CON(R^2)- (式中 R^2 は、水素原子、C 1 - 6 アルキル基、C 1 - 6 ハロアルキル基、C 2 - 6 アルケニル基又はC 2 - 6 ハロアルケニル基を示す)、-OCO-、-N(R^2)CO- (式中 R^2 は、水素原子、C 1 - 6 アルキル基、C 1 - 6 ハロアルキル基、C 2 - 6 アルケニル基又はC 2 - 6 ハロアルケニル基を示す)又は-O- であり、

L^3 は、単結合、C 1 - 6 アルキレン基、C 2 - 6 アルケニレン基又はC 2 - 6 アルキニレン基であり、

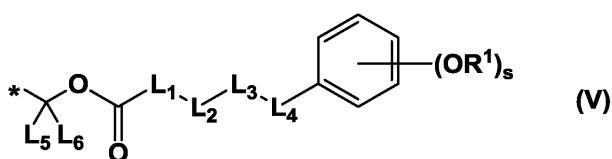
L^4 は、単結合、-COO-、-CON(R^2)- (式中 R^2 は、水素原子、C 1 - 6 アルキル基、C 1 - 6 ハロアルキル基、C 2 - 6 アルケニル基又はC 2 - 6 ハロアルケニル基を示す)、-OCO-、-N(R^2)CO- (式中 R^2 は、水素原子、C 1 - 6 アルキル基、C 1 - 6 ハロアルキル基、C 2 - 6 アルケニル基又はC 2 - 6 ハロアルケニル基を示す)又は-O- であり、

前記擬似固相保護基を核酸塩基部に有する場合、その擬似固相保護基の L^1 、 L^2 、 L^3 及び L^4 のうち、単結合の数は0 から3 である) で表される、請求項1 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 3】

前記擬似固相保護基が、下記式(V)

【化3】



40

(式中、* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの2' 位、3' 位及び5' 位のヒドロキシ基並びに核酸塩基部からなる群から選ばれる少なくとも1か所との結合位置を示し、

R^1 は、C 10 - 30 アルキル基又はC 10 - 30 アルケニル基であり、 s は、1 から5 の整数であり、

L^1 は、単結合、C 1 - 6 アルキレン基、C 2 - 6 アルケニレン基又はC 2 - 6 アルキニ

50

ニレン基であり、

L^2 は、単結合、 $-COO-$ 、 $-CON(R^2)-$ （式中 R^2 は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す）、 $-OCO-$ 、 $-N(R^2)CO-$ （式中 R^2 は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す）、 $-C(O)-$ 又は $-O-$ であり、

L^3 は、単結合、C1-6アルキレン基、C2-6アルケニレン基又はC2-6アルキニレン基であり、

L^4 は、単結合、 $-COO-$ 、 $-CON(R^2)-$ （式中 R^2 は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す）、 $-OCO-$ 、 $-N(R^2)CO-$ （式中 R^2 は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基を示す）、 $-C(O)-$ 又は $-O-$ であり、

L^5 は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基であり、

L^6 は、水素原子、C1-6アルキル基、C1-6ハロアルキル基、C2-6アルケニル基又はC2-6ハロアルケニル基であり、

m は、0 又は 1 であり、 m が 0 である場合、 L^4 は、単結合ではない）で表される、請求項 1 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 4】

R^1 は、C10-30アルキル基である、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 5】

s は、2 から 4 の整数である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 6】

前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドに含まれるヌクレオシド数は、1 から 50 である、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 7】

前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドに含まれるヌクレオシド数は、1 から 30 である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 8】

前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドは、5' 位に H-ホスホネート基、ヒドロキシ基又は一時保護基で保護されたヒドロキシ基を有し、

* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの 2' 位及び 3' 位のヒドロキシ基並びに核酸塩基部からなる群から選ばれる少なくとも 1 か所との結合位置を示す、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 9】

* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの 3' 位のヒドロキシ基との結合位置を示し、

前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドは、2' 位のヒドロキシ基及び核酸塩基部からなる群から選ばれる少なくとも 1 か所に基本保護基を有する、請求項 8 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 10】

* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの核酸塩基部との結合位置を示し、前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドは、2' 位及び 3' 位のヒドロキシ基から選ばれる少なくとも 1 か所に基本保護基を有する、請求項 8 又は 9 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 11】

前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドは、3' 位に H-ホスホネート基、ヒドロキシ基又は一時保護基で保護されたヒドロキシ基を有し、

10

20

40

50

* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの 2' 位及び 5' 位のヒドロキシ基並びに核酸塩基部からなる群から選ばれる少なくとも 1 か所との結合位置を示す、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 1 2】

* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの 5' 位のヒドロキシ基との結合位置を示し、

前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドは、2' 位のヒドロキシ基及び核酸塩基部からなる群から選ばれる少なくとも 1 か所に基本保護基を有する、請求項 1 1 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 1 3】

* は、ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドの核酸塩基部との結合位置を示し、
前記ヌクレオシド又はオリゴヌクレオチドは、2' 位及び 5' 位のヒドロキシ基から選ばれる少なくとも 1 か所に基本保護基を有する、請求項 1 1 又は 1 2 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 1 4】

L¹は、C 1 - 6 アルキレン基である、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 1 5】

L¹は、メチレン基である、請求項 1 4 に記載の擬似固相保護基。

20

【請求項 1 6】

L¹は、エチレン基である、請求項 1 4 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 1 7】

L²は、単結合である、請求項 1 4 から 1 6 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 1 8】

L³は、単結合である、請求項 1 4 から 1 7 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 1 9】

L⁴は、-COO- である、請求項 1 4 から 1 8 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

—

【請求項 2 0】

L⁴は、-OCO- である、請求項 1 4 から 1 8 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

30

—

【請求項 2 1】

L¹は、単結合である、請求項 1 から 1 3 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

【請求項 2 2】

L²は、単結合である、請求項 2 1 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 2 3】

L³は、C 1 - 6 アルキレン基である、請求項 2 1 又は 2 2 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 2 4】

L³は、メチレン基である、請求項 2 3 に記載の擬似固相保護基。

【請求項 2 5】

L³は、エチレン基である、請求項 2 3 に記載の擬似固相保護基。

40

【請求項 2 6】

L⁴は、-COO- である、請求項 2 1 から 2 5 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

—

【請求項 2 7】

L⁴は、-OCO- である、請求項 2 1 から 2 5 のいずれか一項に記載の擬似固相保護基。

—

50