

【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10月8日(2020.10.8)

【公表番号】特表2019-526576(P2019-526576A)

【公表日】令和1年9月19日(2019.9.19)

【年通号数】公開・登録公報2019-038

【出願番号】特願2019-511909(P2019-511909)

【国際特許分類】

C 0 7 H 19/213 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 21/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 33/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 33/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 11/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 5/14 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/60 (2017.01)  
 A 6 1 K 31/708 (2006.01)  
 C 0 7 H 19/04 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/7052 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 19/213 C S P  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 37/02  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 21/02  
 A 6 1 P 35/04  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 33/06  
 A 6 1 P 33/00  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 19/10  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 5/14  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 K 47/60  
 A 6 1 K 31/708

C 0 7 H 19/04  
A 6 1 K 31/7052

## 【手続補正書】

【提出日】令和2年8月28日(2020.8.28)

## 【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

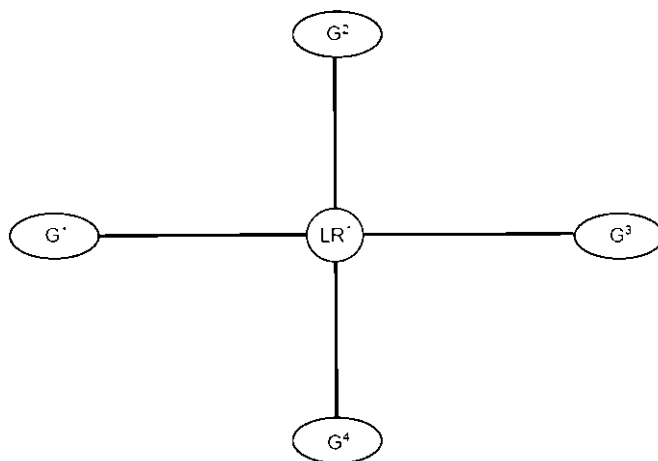
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)または(II)

【化1】



(I)



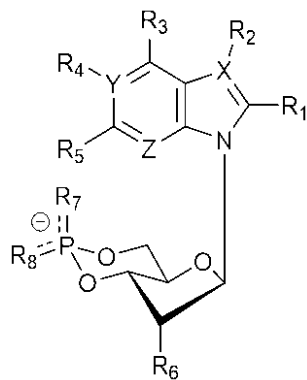
(II)

を有する化合物であって、

式中、

G 単位 G¹ および G² は、独立して、式 (III)

【化2】



(III)

の化合物であり、G 単位  $G^3$  および  $G^4$  は、 $G^1$  および  $G^2$  とは独立してかつ互いに独立して式 ( I I I ) の化合物でありまたは存在せず、式 ( I I ) の場合に  $G^4$  は、 $G^3$  が存在しない場合に常に存在せず、

式 ( I I I ) 中、

X、Y、および Z は、N であり、

$R_1$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_7$ 、および  $R_8$  は、同じであってもよく、または各 G 単位 ( $G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、および  $G^4$ ) ごとに別々であってもよく、

一方、

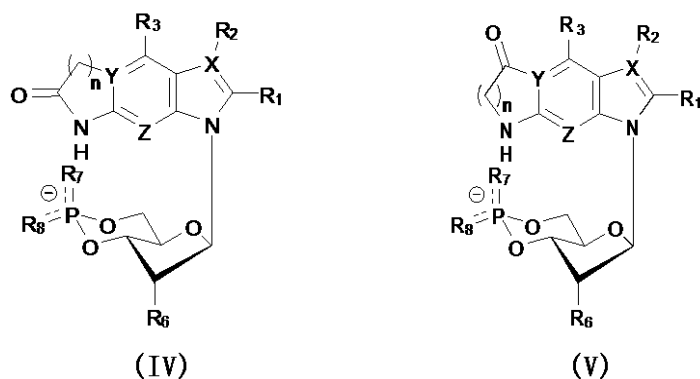
$R_1$  は、独立して、H、ハロゲン、アジド、シアノ、アシル、アラシル、ニトロ、アルキル、アリール、アラルキル、OH、O - アルキル、O - アリール、O - アラルキル、O - アシル、O - アラシル、SH、S - アルキル、S - アリール、S - アラルキル、S - アシル、S - アラシル、S(O) - アルキル、S(O) - アリール、S(O) - アラルキル、S(O) - アシル、S(O) - アラシル、S(O)<sub>2</sub> - アルキル、S(O)<sub>2</sub> - アリール、S(O)<sub>2</sub> - アラルキル、S(O)<sub>2</sub> - アシル、S(O)<sub>2</sub> - アラシル、SeH、Se - アルキル、Se - アリール、Se - アラルキル、NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>、SiR<sub>13</sub>R<sub>14</sub>R<sub>15</sub> であってもよく、ここで、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{13}$ 、 $R_{14}$ 、 $R_{15}$  は、互いに独立して、H、アルキル、アリール、アラルキルであってもよく、

$R_2$  は、存在せず、

$R_3$  は、OH であり、

$R_4$  は、独立して、非存在、H、アミノ、アルキル、アラルキル、ニトロ、N - オキシドであってもよく、または  $R_3$ 、Y、ならびに Y および  $R_3$  を架橋する炭素と一緒にあって、置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよいイミダゾール環を形成することができ、または Y および  $R_5$ 、ならびに Y および  $R_5$  を架橋する炭素と一緒にあって、置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよいイミダゾール環を形成することができ、または Y および  $R_5$ 、ならびに Y および  $R_5$  を架橋する炭素と一緒にあって、それぞれが置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよい ( 図示せず )、示されるようなイミダゾリノン ( 構造 I V、V、 $n = 1$  ) または同族環 ( $n = 2 \sim 8$  ) を形成することができ、

【化 3】



$R_5$  は、独立して、H、ハロゲン、NR<sub>30</sub>R<sub>31</sub>、NH - カルバモイル R<sub>32</sub>R<sub>33</sub> であってもよく、ここで、 $R_{30}$ 、 $R_{31}$ 、 $R_{32}$ 、 $R_{33}$  は、互いに独立して、H、アルキル、アリール、アラルキルであってもよく、または  $R_4$ 、Y、ならびに Y および  $R_5$  を架橋する炭素と一緒にあって、置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよいイミダゾール環を形成することができ、または  $R_4$ 、Y、ならびに Y および  $R_5$  を架橋する炭素と一緒にあって、それぞれが置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよい ( 図示せず )、示されるようなイミダゾリノン環 ( 構造 I V、V、 $n = 1$  ) または同族環 ( $n = 2 \sim 8$  ) を形成することができ、

$R_6$  は、OHであり、

$R_7$  は、O - カルバモイル - アルキル、O - カルバモイル - アリール、O - カルバモイル - アラルキル、OH、O - アルキル、O - アリール、O - アラルキル、O - アシル、SH、S - アルキル、S - アリール、S - アラルキル、ボラノ ( $BH_3$ )、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ ( $BH_2CN$ )、S - PAP、O - PAP、S - BAP、またはO - BAPであり、

式中、PAPは、光活性化可能な保護基であり、PAP = o - ニトロ - ベンジル、1 - (o - ニトロフェニル) - エチリデン、4, 5 - ジメトキシ - 2 - ニトロ - ベンジル、7 - ジメチルアミノ - クマリン - 4 - イル (DMA CM ケージド)、7 - ジエチルアミノ - クマリン - 4 - イル (DEACM ケージド)、および6, 7 - ビス (カルボキシメトキシ) クマリン - 4 - イル) メチル (BCMCM ケージド) であってもよく、

BAPは、生物活性化可能な保護基であり、BAP = メチル、アセトキシメチル、ピバロイルオキシメチル、メトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、ブチリルオキシメチル、シアノエチル、フェニル、ベンジル、4 - アセトキシベンジル、4 - ピバロイルオキシベンジル、4 - イソブチリルオキシベンジル、4 - オクタノイルオキシベンジル、4 - ベンゾイルオキシベンジルであってもよく、

$R_8$  は、O - カルバモイル - アルキル、O - カルバモイル - アリール、O - カルバモイル - アラルキル、OH、O - アルキル、O - アリール、O - アラルキル、O - アシル、O - PAP、またはO - BAPであり、

式中、PAPは、光活性化可能な保護基であり、その非限定的な例は、PAP = o - ニトロ - ベンジル、1 - (o - ニトロフェニル) - エチリデン、4, 5 - ジメトキシ - 2 - ニトロ - ベンジル、7 - ジメチルアミノ - クマリン - 4 - イル (DMA CM ケージド)、7 - ジエチルアミノ - クマリン - 4 - イル (DEACM ケージド)、および6, 7 - ビス (カルボキシメトキシ) クマリン - 4 - イル) メチル (BCMCM ケージド) であってもよく、

BAPは、生物活性化可能な保護基であり、その非限定的な例は、BAP = メチル、アセトキシメチル、ピバロイルオキシメチル、メトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、ブチリルオキシメチル、シアノエチル、フェニル、ベンジル、4 - アセトキシベンジル、4 - ピバロイルオキシベンジル、4 - イソブチリルオキシベンジル、4 - オクタノイルオキシベンジル、4 - ベンゾイルオキシベンジルであってもよく、

式中、

連結残基  $LR^1$ 、 $LR^2$ 、 $LR^3$ 、および $LR^4$ は、独立して、それらが接続するG単位 ( $G^{1-4}$ ) の特定の残基  $R_1$ 、 $R_4$ 、および/または $R_5$ のいずれかと置き換えることができ、または共有結合することができる、

特定の連結残基 ( $LR^{1-4}$ ) が、残基  $R_1$ 、 $R_4$ 、および/または $R_5$ のいずれかに共有結合する場合、上記にて定義された特定の残基 ( $R_1$ 、 $R_4$ 、および/または $R_5$ ) のエンドスタンディング基は、アセンブルされた化合物内で変換されまたは置き換えられ、次いでアセンブルされた化合物中の特定の連結残基 ( $LR^{1-4}$ ) の部分としてさらに定義され、

ここで、

$LR^1$ は、それぞれ、ヘテロ原子O、N、S、Si、Se、Bであってもよいヘテロ原子が組み込まれているまたは組み込まれていない、(a) 3価もしくは4価の分岐状炭化水素部分または(b) 2価の炭化水素部分であり、骨格は、好ましくは1 ~ 28個の炭素原子を含有し、飽和または不飽和、置換または非置換であってもよく、

ここで、

各結合点は、独立して、置換または非置換の炭素またはヘテロ原子であってもよく、ポリエチレングリコール (PEG) 部分が定義により組み込まれる場合、炭素原子の好ましい数は、PEG部分に存在する数が上回ることができ、全てのPEG部分は一緒になって、

2価の連結残基 ( $LR^1$ ) の場合、1 ~ 500個のエチレングリコール基 ( $-(CH_2CH_2O)_n-$ 、式中、 $n = 1 \sim 500$ )

または

3 価の連結残基 ( $LR^1$ ) の場合、1 ~ 750 個のエチレングリコール基 ( $-(CH_2CH_2O)_n-$ 、式中、 $n = 1 \sim 750$ )

または

4 価の連結残基 ( $LR^1$ ) の場合、1 ~ 1000 個のエチレングリコール基 ( $-(CH_2CH_2O)_n-$ 、式中、 $n = 1 \sim 1000$ )

の総量を含むことができ、

置換される場合、

置換基は、1 個または複数個のアルキル基、ハロゲン原子、ハロアルキル基、(非)置換アリール基、(非)置換ヘテロアリール基、アミノ、オキソ、ニトロ、シアノ、アジド、ヒドロキシ、メルカプト、ケト、カルボキシ、カルバモイル、エポキシ、メトキシ、エチニルを含んでもよく、

かつ/または置換基はさらに、互いに接続されて、ヘテロ原子が組み込まれているまたは組み込まれていない、飽和または不飽和の、置換または非置換の、脂肪族または芳香族の、1 ~ 4 個の環を有する環系を形成することができ、

$LR^2$ 、 $LR^3$ 、および  $LR^4$  は、ヘテロ原子 O、N、S、Si、Se、B であってもよいヘテロ原子が組み込まれているまたは組み込まれていない 2 価の炭化水素部分であって、骨格が好ましくは 1 ~ 28 個の炭素原子を含有し、飽和または不飽和、置換または非置換であってもよく、

一方、

各結合点は、独立して、置換または非置換の炭素またはヘテロ原子であってもよく、

ポリエチレングリコール (PEG) 部分が定義により組み込まれる場合、炭素原子の好ましい数は、PEG 部分に存在する数が上回ることができ、全ての PEG 部分は一緒になって、総量で 1 ~ 500 個のエチレングリコール基 ( $-(CH_2CH_2O)_n-$ 、式中、 $n = 1 \sim 500$ ) を含有することができ、

置換される場合、

置換基は、1 個または複数個のアルキル基、ハロゲン原子、ハロアルキル基、(非)置換アリール基、(非)置換ヘテロアリール基、アミノ、オキソ、ニトロ、シアノ、アジド、ヒドロキシ、メルカプト、ケト、カルボキシ、カルバモイル、エポキシ、メトキシ、エチニルを含んでもよく、

かつ/または置換基はさらに、互いに接続されて、ヘテロ原子が組み込まれているまたは組み込まれていない、飽和または不飽和の、置換または非置換の、脂肪族または芳香族の、1 ~ 4 個の環を有する環系を形成することができ、

式 (II) の場合、 $G^4$  が存在しない場合、 $LR^4$  も存在せず、

式 (II) の場合、 $G^3$  および  $G^4$  が存在しない場合、 $LR^3$  および  $LR^4$  も存在せず、式中、

$G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、および  $G^4$  はさらに、塩および/または水和物であってもよく、

ここで、特定のリン酸部分の適切な塩は、リチウム、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、亜鉛、またはアンモニウム、およびトリアルキルアンモニウム、ジアルキルアンモニウム、アルキルアンモニウム、例えばトリエチルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、ジエチルアンモニウム、およびオクチルアンモニウムであってもよく、式中、

$G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、および  $G^4$  は、同位体によりもしくは放射能により標識されてもよく、PEG 化されてもよく、固定化されてもよく、または色素もしくは別のレポーター基で標識されてもよく、

ここで、

レポーター基および/または色素は、

(a) 各 G 単位 ( $G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、および/または  $G^4$ ) ごとに独立して、特定の残基  $R_1$ 、 $R_4$ 、および/または  $R_5$  のいずれかに共有結合している、あるいはそのいずれかに置き換えられた、連結残基 ( $LR^5$ ) を介して、 $G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、および/または  $G^4$  にカ

ップリングされ、

ここで  $LR^5$  は、 $LR^2$  に関して定義した通りとすることができ、

あるいは、

(b) 式 (I) の場合、 $G^3$  および / または  $G^4$  に取って代わることができ、

ここで、

適切な色素は、蛍光色素、例えばフルオレセイン、アントラニロイル、N - メチルアントラニロイル、ダンシル、またはニトロ - ベンゾフラザニル (NBD) 系、ローダミンベース色素、例えば Texas Red または TAMRA、シアニン色素、例えば Cy (商標) 3、Cy (商標) 5、Cy (商標) 7、EVOblue (商標) 10、EVOblue (商標) 30、EVOblue (商標) 90、EVOblue (商標) 100 (EVOblue (商標) - ファミリー)、BODIPY (商標) - ファミリー、Alexa Fluor (商標) - ファミリー、DY - 547P1、DY - 647P1、クマリン、アクリジン、オキサゾン、フェナレノン、蛍光タンパク質、例えば GFP、BFP、および YFP、ならびに近赤外および遠赤外色素を含んでもよく、

ここで、

レポーター基は、量子ドット、ビオチン、およびチロシルメチルエステルを含んでもよく、

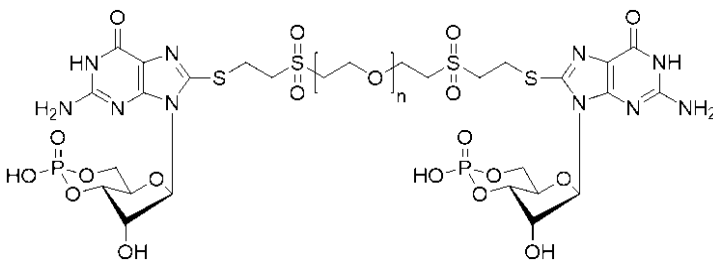
PEG化は、独立して、単数または複数の  $LR^{PEG}$  基の結合を指し、 $LR^{PEG}$  は、 $LR^2$  に関して定義された通りとすることができ、但し、この場合 (i)  $LR^2$  の一方の末端のみが、各 G 単位 ( $G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、および / または  $G^4$ ) ごとに独立して、特定の残基  $R_1$ 、 $R_4$ 、および / または  $R_5$  のいずれかに共有結合する、またはそのいずれかに置き換えられることにより、G 単位 ( $G^1$ 、 $G^2$ 、 $G^3$ 、および / または  $G^4$ ) に接続され、(ii)  $LR^2$  の他方の末端が、共役反応および / または水素結合を可能にするアルキル基または反応性基のいずれかであり、

ここで、反応性基の非限定的な例は、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、 $-N_3$ 、 $-NHS$  - エステル、ハロゲン基、エポキシド、エチニル、アリルであってもよく、

但し、(iii)  $LR^{PEG}$  は、組み込まれたエチレングリコール部分 ( $-(CH_2CH_2O)_n-$ 、式中、 $n = 2 \sim 500$ ) を有し、

但し、式 (I) および / または式 (II) の化合物は、

【化 4】



グアノシン - 3', 5' - 環状 - リン酸 - [ 8 - チオエチルスルホニル - (エチルオキシ) $_n$  - エチルスルホニルエチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3', 5' - 環状 - リン酸 ( $M_w$  が  $800 \text{ g/mol}$ 、 $1.2 \text{ kg/mol}$ 、 $3.4 \text{ kg/mol}$ 、もしくは  $20 \text{ kg/mol}$  の多分散性ビスビニルスルホニル - PEG $_n$  との合成から生じる多分散性化合物、または  $n = 6$  の単分散性化合物) からは選択されない、化合物。

【請求項 2】

少なくとも 2 個の G 単位が不均等に置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

(a) 式 (I) の場合、 $G^3$  および  $G^4$  が存在せず、

または

式 (II) の場合、 $G^3$ 、 $G^4$ 、 $LR^3$ 、および  $LR^4$  が存在せず、

式中、

$R_4$  が H ではなく、かつ / または  $R_5$  が  $NH_2$  ではなく、

または

(b) 式 (I) の場合、 $G^3$  および  $G^4$  が存在せず、

または

式 (II) の場合、 $G^3$ 、 $G^4$ 、 $LR^3$ 、および  $LR^4$  が存在しない、

請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

全ての  $R_7$  が SH であり、全ての  $R_8$  が O であり、

または

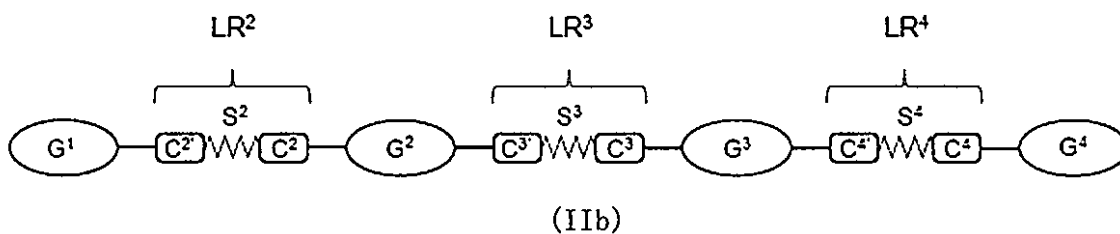
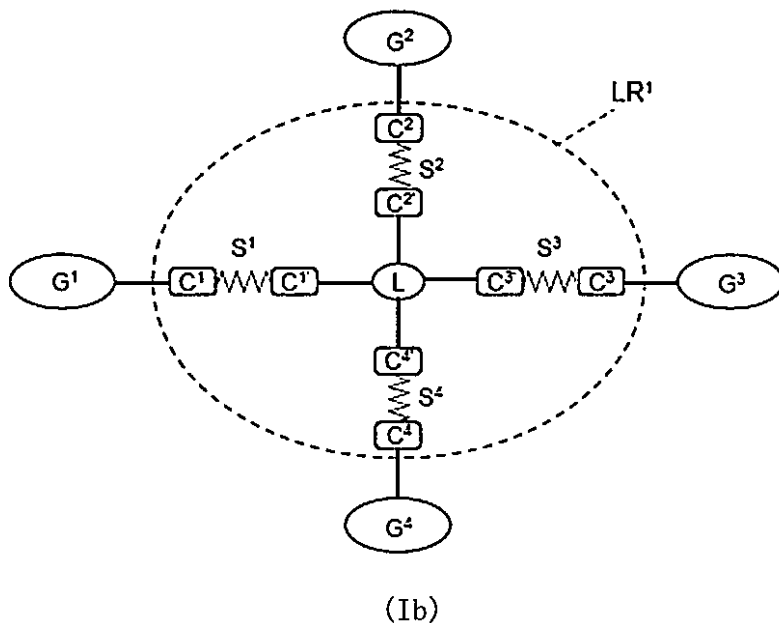
全ての  $R_7$  が O であり、全ての  $R_8$  が OH である、

請求項 1 から 3 までのいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

連結残基  $LR^1$ 、 $LR^2$ 、 $LR^3$ 、および  $LR^4$  がさらに式、(Ib) および (IIb) に示されるように細分され、

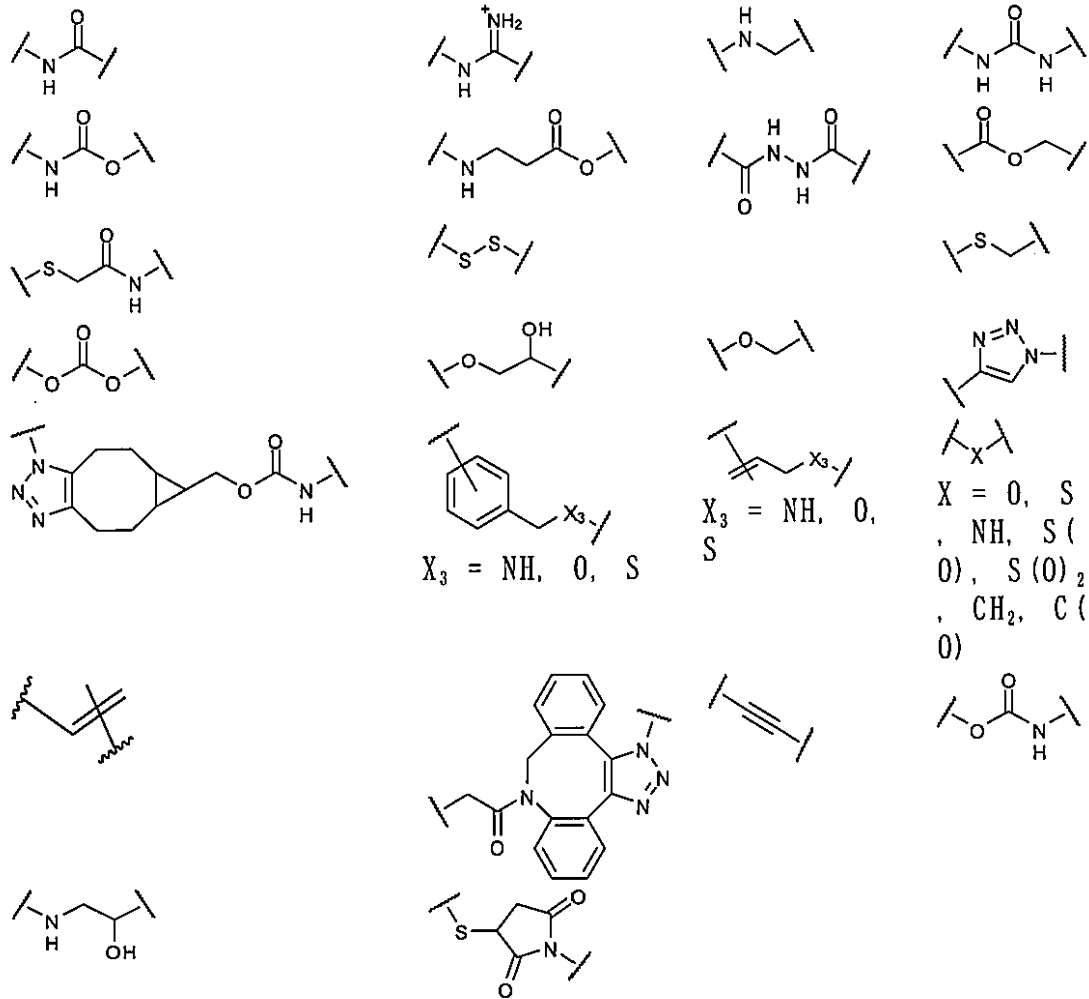
【化 5】



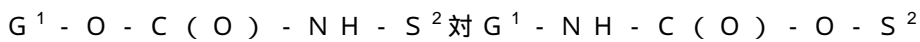
式中、

カップリング官能基  $C^1$ 、 $C^{1'}$ 、 $C^2$ 、 $C^{2'}$ 、 $C^3$ 、 $C^{3'}$ 、 $C^4$ 、および  $C^{4'}$  は、互いに独立して、存在しなくてもよく、または

## 【化6】



からなる群から選択される構造によって定義された通りであってもよく、  
ここで、接続性は、



により例示されるように示されまたは反転させることができ、

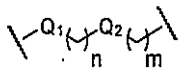
式中、カップリング官能基 ( $C^1$ 、 $C^{1'}$ 、 $C^2$ 、 $C^{2'}$ 、 $C^3$ 、 $C^{3'}$ 、 $C^4$ 、および/または  $C^{4'}$ ) が G 単位 ( $G^{1-4}$  の  $R_1$ 、 $R_4$ 、および/または  $R_5$ ) の残基と置き換わらずにそこに結合する場合、互いに独立して、G 単位 (または、色素もしくは他のレポーター基を有する G 単位) のカップリングに関わる特定の残基 ( $R_1$ 、 $R_4$ 、および/または  $R_5$ ) は、

請求項 1 から 4 までのいずれか 1 項に定義された通りであり、エンドスタンディング基は、カップリング官能基によって置き換えられまたはそれに変換され、

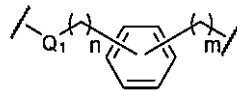
または

以下に示される基

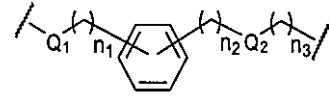
## 【化7】



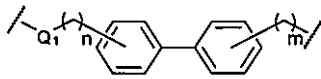
$n=0-6$ ;  $m=0-6$ ;  
 $Q_1 =$  非存在, S, NH, O,  
 C(O), S(O), S(O)<sub>2</sub>;  
 $Q_2 =$  NH, S, O, C(O), CH<sub>2</sub>,  
 OC(O), NC(O);



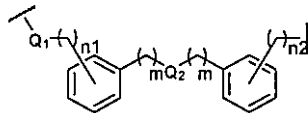
$n = 0-4$ ,  $m = 0-4$   
 $Q_1 =$  非存在, S, NH, O,  
 C(O), S(O), S(O)<sub>2</sub>;



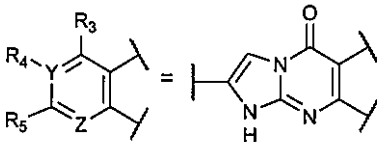
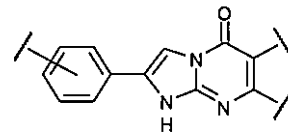
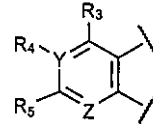
$n_1 = 0-4$ ,  $n_2 = 0-4$ ,  $n_3 = 0-4$ ,  
 $Q_1 =$  非存在, S, NH, O,  
 C(O), S(O), S(O)<sub>2</sub>;  
 $Q_2 =$  NH, S, O, C(O), CH<sub>2</sub>,  
 OC(O), NC(O);



$n = 0-4$ ;  $m = 0-4$ ;  
 $Q_1 =$  非存在, S, NH, O,  
 C(O), S(O), S(O)<sub>2</sub>;



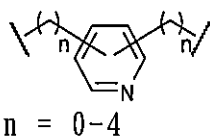
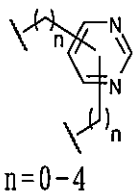
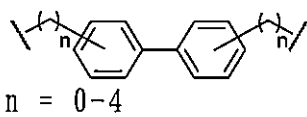
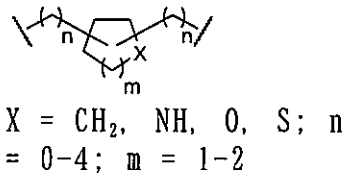
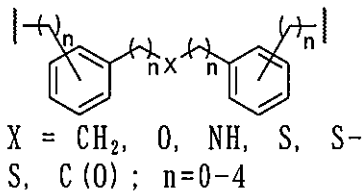
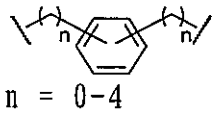
$n_1=0-4$ ,  $n_2=0-4$ ;  $m = 0-4$ ;  
 $Q_1 =$  非存在, S, NH, O,  
 C(O), S(O), S(O)<sub>2</sub>;  
 $Q_2 =$  CH<sub>2</sub>, O, NH, S;



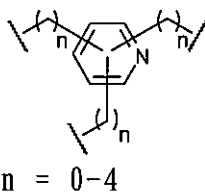
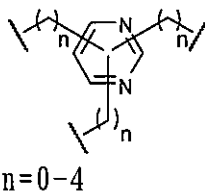
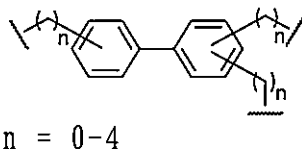
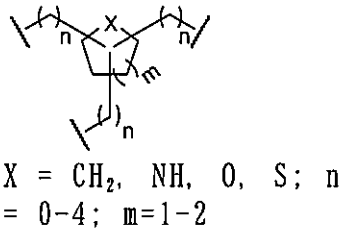
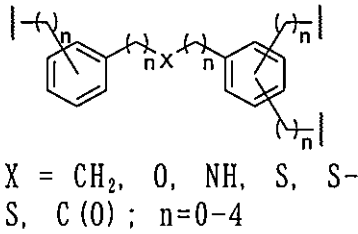
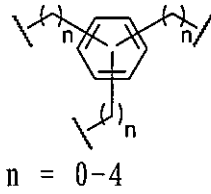
から選択され（存在する場合、Q1はG単位に接続する）、  
 式中、  
 リンカー（L）は、

【化 8】

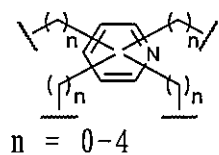
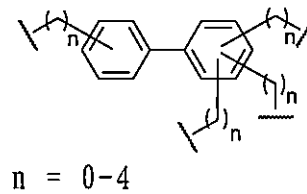
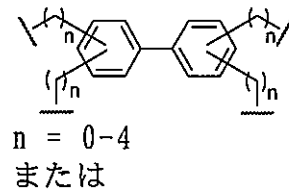
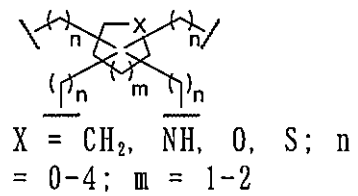
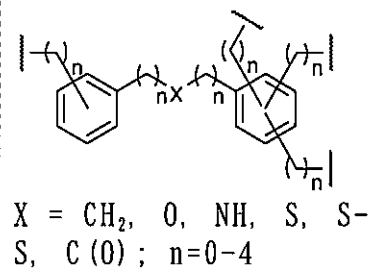
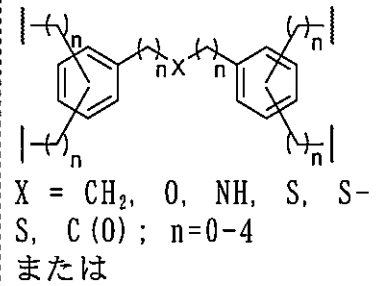
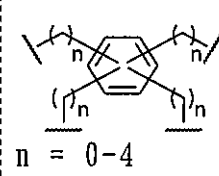
ダイマーリンカー

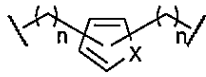


トリマーリンカー

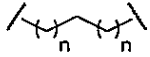


テトラマーリンカー

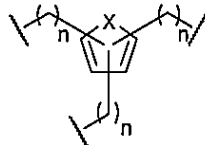




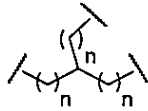
$X = \text{NH}, \text{O}, \text{S}; n = 0-4$   
;



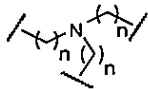
$n=0-6$



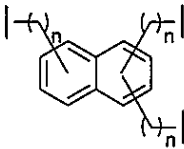
$X = \text{NH}, \text{O}, \text{S}; n = 0-4$   
;



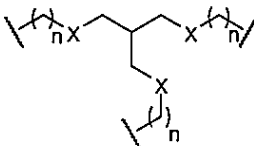
$n=0-12$



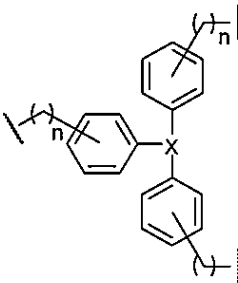
$n=0-6$



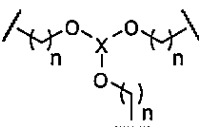
$n = 0-4$



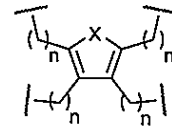
$X = \text{O}, \text{S}; n = 1-4$



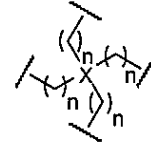
$X = \text{CH}, \text{P}; n = 0-4$



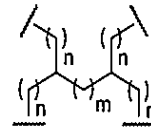
$X = \text{B}, \text{Si}; n = 1-4$



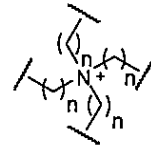
$X = \text{NH}, \text{O}, \text{S}; n = 0-4$   
;



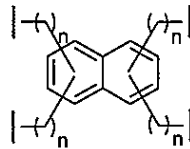
$X = \text{C}, \text{Si}; n = 0-6$   
または



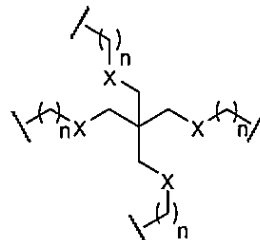
$m = 0-24, n = 0-6$



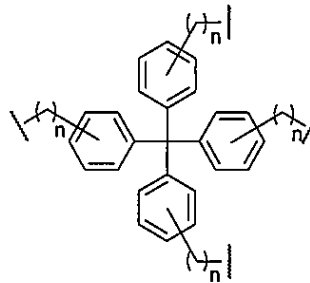
$n=0-6$



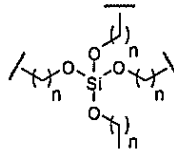
$n = 0-4$



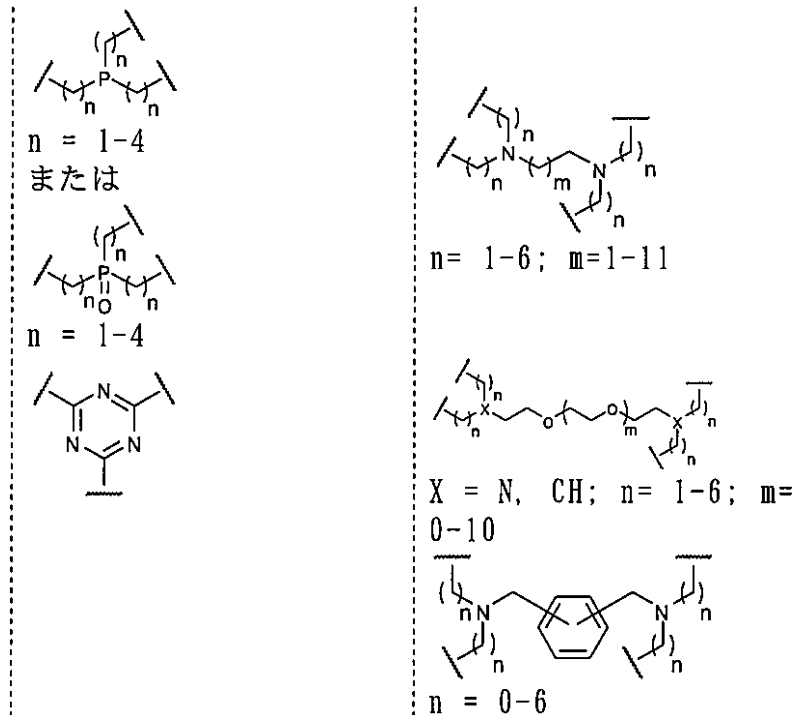
$X = \text{O}, \text{S}; n = 1-4$



$n = 0-4$



$n = 1-4$



からなる群から選択され、  
 ここで、

前述のリストの特定のリンカー内の各側鎖ごとの  $n$  は、定義された通り同じまたは別々の値を有することができ、

かつ

前述のリストのリンカー (L) の全てのキラル、ジアステレオマー、ラセミ、エピマー、および全ての幾何異性体の形は、明示しないがここに含まれ、

かつ

アンモニウム誘導体などのカチオン性リンカー (L) は、塩化物イオン、臭化物イオン、ヨウ化物イオン、リン酸イオン、炭酸イオン、硫酸イオン、酢酸イオン、または任意の他の生理学的に許容される対イオンを含有する塩であり、

式中、

スペーサー ( $S^1$ 、 $S^2$ 、 $S^3$ 、および  $S^4$ ) は、特定の化合物中で同じまたは別々であってもよく、存在しなくてもよく、または  $-(CH_2)_{n_1}-(CH_2CH_2)_m-(CH_2)_{n_2}$  (式中、 $m = 0$ 、 $S$ 、または  $NH$ ;  $m = 1 \sim 500$ 、 $n_1 = 0 \sim 8$ 、 $n_2 = 0 \sim 8$  であり、ここで、 $n_1$  および  $n_2$  は共に独立して、同じであってもよく、または別々であってもよい) であってもよく、または  $-(CH_2)_n$  (式中、 $n = 1 \sim 24$ ) であってもよい、請求項 1 から 4 までのいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

$R_1$  は、独立して、H、ハロゲン、アジド、ニトロ、アルキル、アシル、アリール、OH、O-アルキル、O-アリール、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、S(O)-アルキル、S(O)-アリール、S(O)-アラルキル、S(O)-ベンジル、S(O)<sub>2</sub>-アルキル、S(O)<sub>2</sub>-アリール、S(O)<sub>2</sub>-アラルキル、アミノ、NH-アルキル、NH-アリール、NH-アラルキル、NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>、SiR<sub>13</sub>R<sub>14</sub>R<sub>15</sub> であってもよく、ここで、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>13</sub>、R<sub>14</sub>、R<sub>15</sub> はアルキルであり、

かつ/または

$R_4$  は、独立して、非存在、H、アミノ、アルキル、アラルキル、ニトロ、N-オキシ

ドであってもよく、またはYおよびR<sub>5</sub>、ならびにYおよびR<sub>5</sub>を架橋する炭素と一緒にあって、置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよいイミダゾール環を形成することができ、またはYおよびR<sub>5</sub>、ならびにYおよびR<sub>5</sub>を架橋する炭素と一緒にあって、それぞれが置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよい（図示せず）、上記にて示されるようなイミダゾリノン（構造IV、V、n = 1）または同族環（n = 2 ~ 8）を形成することができ、

かつ/または

R<sub>5</sub>は、独立して、H、ハロゲン、NH-カルバモイル-アルキル、NH-カルバモイル-アリール、NH-カルバモイル-アラルキル、アミノ、NH-アルキル、NH-アリール、NH-アラルキル、NR<sub>30</sub>R<sub>31</sub>であってもよく、ここで、R<sub>30</sub>およびR<sub>31</sub>はアルキルであり、またはR<sub>4</sub>、Y、ならびにYおよびR<sub>5</sub>を架橋する炭素と一緒にあって、置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよいイミダゾール環を形成することができ、またはR<sub>4</sub>、Y、ならびにYおよびR<sub>5</sub>を架橋する炭素と一緒にあって、それぞれが置換されていなくてもよく、またはアルキル、アリール、もしくはアラルキルで置換されていてもよい（図示せず）、上記にて示されるようなイミダゾリノン環（構造IV、V、n = 1）または同族環（n = 2 ~ 8）を形成することができ、

かつ/または

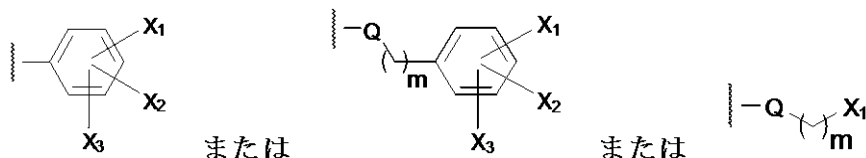
R<sub>7</sub>は、OH、O-アルキル、O-アリール、O-アラルキル、O-アシル、SH、S-アルキル、S-アリール、S-アラルキル、ボラノ（BH<sub>3</sub>）、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ（BH<sub>2</sub>CN）であり、

R<sub>8</sub>は、OH、O-アルキル、O-アリール、O-アラルキル、O-アシルである、請求項1から5までのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

R<sub>1</sub>が、H、Cl、Br、I、F、N<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、OH、SH、NH<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、2-フリル、3-フリル、2-プロモ-5-フリル、（2-フリル）チオ、（3-（2-メチル）フリル）チオ、（3-フリル）チオ、2-チエニル、3-チエニル、（5-（1-メチル）テトラゾリル）チオ、1,1,2-トリフルオロ-1-ブテンチオ、（2-（4-フェニル）イミダゾリル）チオ、（2-ベンゾチアゾリル）チオ、（2,6-ジクロロフェノキシプロピル）チオ、2-（N-（7-ニトロベンゾ-2-オキサ-1,3-ジアゾール-4-イル）アミノ）エチルチオ、（4-プロモ-2,3-ジオキサプロチル）チオ、[2-[(フルオレセイニルチオウレイド)アミノ]エチル]チオ、2,3,5,6-テトラフルオロフェニルチオ、（7-（4-メチル）クマリニル）チオ、（4-（7-メトキシ）クマリニル）チオ、（2-ナフチル）チオ、（2-（1-プロモ）ナフチル）チオ、ベンゾイミダゾリル-2-チオベンゾチアゾリルチオ、4-ピリジル、（4-ピリジル）チオ、2-ピリジルチオ、5-アミノ-3-オキサペンチルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、19-アミノ-4,7,10,13,16-ペンタオキサノナデシルアミノ、17-アミノ-9-アザ-ヘプタデシルアミノ、4-（N-メチルアントラノイル）アミノブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、4-モルホリノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノ、トリフェニルイミノホスホラニルであり、または残基R<sub>1</sub>が、残基エントリー1もしくは2として以下に示される通りであり、

【化9】



であり、

式中、

$m = 0 \sim 6$  であり、

$Q = S, S(O), S(O)_2, O, NH, Se, CH_2, C(O)$  であり、

$X_1, X_2$ 、および  $X_3$  は、同じであってもよく、または独立して、 $H, OH, NH_2, N_3, SH, CN, NO_2, F, Cl, Br, I, (CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $i-Pr, t-Bu$ 、

【化 1 0】

$(CH_2)_nC \equiv CH$

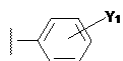
(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、

【化 1 1】

$(CH_2)_nC = CH_2$

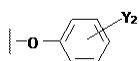
(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $CH_2OH, (CH_2)_nOCH_3$  (式中、 $n = 1 \sim 2$ )、 $CH_2N(CH_3)_2, O(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $Oi-Pr, OCy, OCyp, OBn, OC(O)CH_3, OC(O)Ph, OCF_3, N(CH_3)_2, NH(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $NHC(O)t-Bu, NHC(O)Ph, NHC(O)Ot-Bu, NHC(O)CH_3, NHC(O)CH_2N_3, B(OH)_2, CF_3, C(O)OH, C(O)OCH_3, C(O)Oi-Pr, C(O)Ot-Bu, C(O)OPh, C(O)OBn, C(O)NH_2, C(O)N(CH_3)_2, C(O)NHPh, C(O)NHBn, C(O)CF_3, CH_2C(O)OH, CH_2C(O)OCH_3, CH_2C(O)Oi-Pr,  $CH_2C(O)Ot-Bu, CH_2C(O)OBn$ ,  $S(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $S(CH_2)_nOEt$  (式中、 $n = 1 \sim 4$ )、 $SBn, SO_2CH_3, SO_2CF_3$ 、$

【化 1 2】



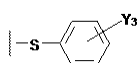
(式中、 $Y_1 = H, SH, CN, Ph, F, CH_3, OCH_3, SCH_3, 4$ -チオフェニル、 $NO_2$ 、ペンチルである)

【化 1 3】



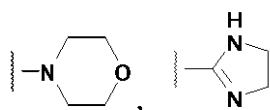
(式中、 $Y_2 = H, SH, F$  である)

【化 1 4】



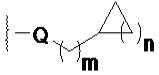
(式中、 $Y_3 = H, SH$  である)

【化 1 5】



であってもよく、  
残基エントリー 2 が、

## 【化 1 6】



であり、

式中、

$m = 0 \sim 6$  であり、

$n = 1 \sim 6$  であり、

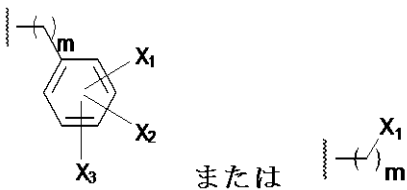
$Q = S, S(O), S(O)_2, O, NH, Se$  であり、

かつ/または

$R_4$  が、非存在、アミノ、 $N$ -オキッドであり、または残基  $R_4$  が、残基エントリー 1、2、3、もしくは 4 として以下に示される通りであり、

残基エントリー 1 が、

## 【化 1 7】



であり、

式中、

$m = 1 \sim 6$  であり、

$X_1, X_2$ 、および  $X_3$  は、同じであってもよく、または独立して、 $H, N_3, CN, NO_2, F, Cl, Br, I, (CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $i-Pr, t-Bu$ 、

## 【化 1 8】

$(CH_2)_nC \equiv CH$

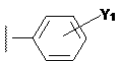
(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、

## 【化 1 9】

$(CH_2)_nC = CH_2$

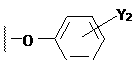
(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $(CH_2)_nOCH_3$  (式中、 $n = 1 \sim 2$ )、 $CH_2N(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $Oi-Pr, OBn, OC(O)CH_3, OC(O)Ph, OCF_3, N(CH_3)_2, NHC(O)t-Bu, NHC(O)Ph, NHC(O)Ot-Bu, NHC(O)CH_3, NHC(O)CH_2N_3, CF_3, C(O)OCH_3, C(O)Oi-Pr, C(O)Ot-Bu, C(O)OPh, C(O)OBn, C(O)NH_2, C(O)N(CH_3)_2, C(O)NHPh, C(O)NHBn, C(O)CF_3, CH_2C(O)OCH_3, CH_2C(O)Oi-Pr, CH_2C(O)Ot-Bu, CH_2C(O)OBn, S(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $S(CH_2)_nOEt$  (式中、 $n = 1 \sim 4$ )、 $SBn, SPh, SO_2CF_3$ 、

## 【化 2 0】



(式中、 $Y_1 = H, CN, Ph, F, CH_3, OCH_3, SCH_3, NO_2$ 、ペンチルである)

## 【化 2 1】



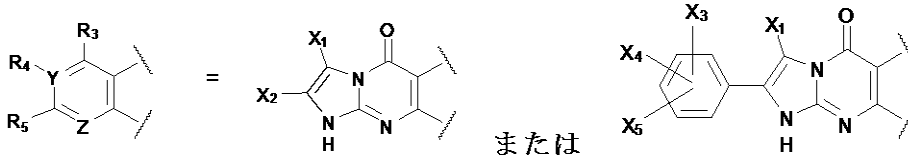
(式中、 $Y_2 = H, F$  である)

## 【化 2 2】



であってもよく、  
残基エントリー 2 が、

## 【化 2 3】



であり、

式中、

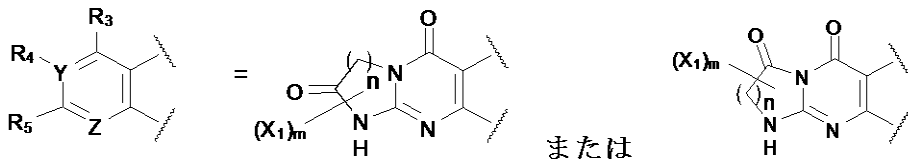
$X_1$  は、H、 $CH_3$ 、Ph であってもよく、

$X_2$  は、H、Ph、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、ジベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、 $C(Ph)_3$ 、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジニル、5-クロロ-2-チエニル、1-ベンゾフラン-2-イル、であってもよく、

$X_3$ 、 $X_4$ 、および  $X_5$  は、独立して、H、OH、NH、 $CH_3$ 、Cl、Br、F、CN、 $N_3$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $NO_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $OCH_3$ 、OBn、O-ベンゾイル、 $SCH_3$ 、t-Bu、 $N(CH_3)_2$ 、S-フェニル、Ph、 $S(O)_2CH_3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $NHS(O)_2CH_3$  であってもよく、

残基エントリー 3 が、

## 【化 2 4】



であり、

式中、上記定義から外れて、示され、示唆され、もしくは明確に定義された水素を含む、環炭素原子のいずれかに結合された任意の水素原子、または、同じ特定の炭素原子に結合された両方の水素原子 ( $m = 2$ ) は、安定な構造が形成される限り、それぞれ 1 個または 2 個の (同じ) 「位置不定の基」  $X_1$  により置き換えることができ、

ここで、 $m = 1$  または 2 であり、

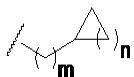
$n = 1 \sim 4$  であり、

$X_1$  は、H、 $CH_3$ 、Et、Pr、i-Pr、Bu、F、Ph、 $(CH_2)_2OH^*$  であってもよく、

\* は、最初の場合のみであり、

残基エントリー 4 が、

## 【化 2 5】



であり、

式中、

m = 1 ~ 6 であり、

n = 1 ~ 6 であり、

かつ/または

R<sub>5</sub>は、H、NH<sub>2</sub>、F、Cl、Br、I、メチルアミノ、NH-ベンジル、NH-フェニル、NH-4-アジドフェニル、NH-フェニルエチル、NH-フェニルプロピル、2-アミノエチルアミノ、n-ヘキシルアミノ、6-アミノ-n-ヘキシルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、ジメチルアミノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノであり、またはR<sub>4</sub>、Y、ならびにYおよびR<sub>5</sub>を架橋する炭素と一緒にあって、上述のリストに示したような環系を形成することができ(エントリー2および3)、

かつ/または

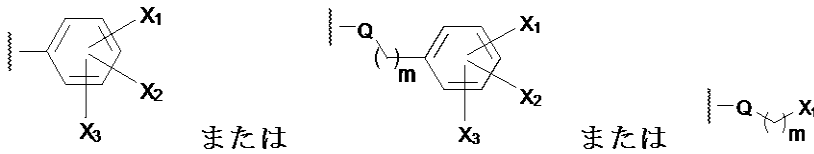
R<sub>7</sub>は、OH、メチルオキシ、エチルオキシ、シアノエチルオキシ、アセトキシメチルオキシ、ピバロイルオキシメチルオキシ、メトキシメチルオキシ、プロピオニルオキシメチルオキシ、ブチリルオキシメチルオキシ、アセトキシエチルオキシ、アセトキシブチルオキシ、アセトキシイソブチルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、4-アセトキシベンジルオキシ、4-ピバロイルオキシベンジルオキシ、4-イソブチリルオキシベンジルオキシ、4-オクタノイルオキシベンジルオキシ、4-ベンゾイルオキシベンジルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシ、SH、メチルチオ、アセトキシメチルチオ、ピバロイルオキシメチルチオ、メトキシメチルチオ、プロピオニルオキシメチルチオ、ブチリルオキシメチルチオ、シアノエチルチオ、フェニルチオ、ベンジルチオ、4-アセトキシベンジルチオ、4-ピバロイルオキシベンジルチオ、4-イソブチリルオキシベンジルチオ、4-オクタノイルオキシベンジルチオ、4-ベンゾイルオキシベンジルチオ、ボラノ(BH<sub>3</sub>)、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ(BH<sub>2</sub>CN)であり、

R<sub>8</sub>は、OH、メチルオキシ、エチルオキシ、シアノエチルオキシ、アセトキシメチルオキシ、ピバロイルオキシメチルオキシ、メトキシメチルオキシ、プロピオニルオキシメチルオキシ、ブチリルオキシメチルオキシ、アセトキシエチルオキシ、アセトキシブチルオキシ、アセトキシイソブチルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、4-アセトキシベンジルオキシ、4-ピバロイルオキシベンジルオキシ、4-イソブチリルオキシベンジルオキシ、4-オクタノイルオキシベンジルオキシ、4-ベンゾイルオキシベンジルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシである、請求項1から6までのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

R<sub>1</sub>が、H、Cl、Br、I、F、N<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、OH、SH、NH<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、2-フリル、3-フリル、(2-フリル)チオ、(3-(2-メチル)フリル)チオ、(3-フリル)チオ、2-チエニル、3-チエニル、(5-(1-メチル)テトラゾリル)チオ、1,1,2-トリフルオロ-1-ブテンチオ、(2-(4-フェニル)イミダゾリル)チオ、(2-ベンゾチアゾリル)チオ、(2,6-ジクロロフェノキシプロピル)チオ、2-(N-(7-ニトロベンゾ-2-オキサ-1,3-ジアゾール-4-イル)アミノ)エチルチオ、(4-プロモ-2,3-ジオキソブチル)チオ、[2-[(フルオレセイニルチオウレイド)アミノ]エチル]チオ、2,3,5,6-テトラフルオロフェニルチオ、(7-(4-メチル)クマリニル)チオ、(4-(7-メトキシ)クマリニル)チオ、(2-ナフチル)チオ、(2-(1-プロモ)ナフチル)チオ、ベンゾイミダゾリル-2-チオ、ベンゾチアゾリルチオ、4-ピリジル、(4-ピリジル)チオ、2-ピリジルチオ、5-アミノ-3-オキソペンチルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、19-アミノ-4,7,10,13,16-ペンタオキサノナデシルアミノ、17-アミノ-9-アザ-ヘプタデシルアミノ、4-(N-メチルアントラノイル)アミノブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、4-モルホリノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノ、トリフェニルイミノホスホラニルであり、または残基R<sub>1</sub>が、残基エントリー1もしくは2として以下に示される通りであり、  
残基エントリー1が、

## 【化 2 6】



であり、

式中、

$m = 0 \sim 6$  であり、

$Q = S, S(O), S(O)_2, NH$  であり、

$X_1, X_2$ 、および  $X_3$  は、同じであってもよく、または独立して、 $H, OH, NH_2, N_3, SH, CN, NO_2, F, Cl, Br, I, (CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $i-Pr, t-Bu, Ph$ 、

## 【化 2 7】



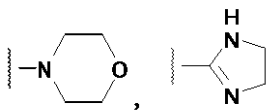
(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、

## 【化 2 8】



(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $CH_2OH, (CH_2)_n OCH_3$  (式中、 $n = 1 \sim 2$ )、 $CH_2N(CH_3)_2, O(CH_2)_n CH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $Oi-Pr, OCy, OCyp, OPh, OBn, OC(O)CH_3, OC(O)Ph, OCF_3, N(CH_3)_2, NH(CH_2)_n CH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $NHC(O)t-Bu, NHC(O)Ph, NHC(O)Ot-Bu, NHC(O)CH_3, NHC(O)CH_2N_3, B(OH)_2, CF_3, C(O)OH, C(O)OCH_3, C(O)Oi-Pr, C(O)Ot-Bu, C(O)OPh, C(O)OBn, C(O)NH_2, C(O)N(CH_3)_2, C(O)NHPh, C(O)NHBn, C(O)CF_3, CH_2C(O)OH, CH_2C(O)OCH_3, CH_2C(O)Oi-Pr,  $CH_2C(O)Ot-Bu, CH_2C(O)OBn, S(CH_2)_n CH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $S(CH_2)_n OEt$  (式中、 $n = 1 \sim 4$ )、 $SBn, SP_h$ 、$

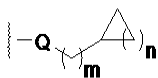
## 【化 2 9】



であってもよく、

残基エントリー 2 が、

## 【化 3 0】



であり、

式中、

$m = 0 \sim 6$  であり、

$n = 1 \sim 6$  であり、

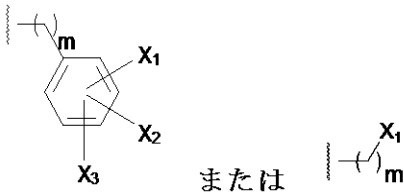
$Q = S, S(O), S(O)_2, NH$  であり、

かつ/または

$R_4$  が、非存在、アミノ、 $N$ -オキシドであり、または残基  $R_4$  が、残基エントリー 1、2、3、もしくは 4 として以下に示される通りであり、

残基エントリー 1 が、

## 【化 3 1】



であり、

$m = 1 \sim 3$  であり、

$X_1$ 、 $X_2$ 、および  $X_3$  は、同じであってもよく、または独立して、 $H$ 、 $N_3$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $i-Pr$ 、 $t-Bu$ 、 $Ph$ 、

## 【化 3 2】

$(CH_2)_nC \equiv CH$

(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、

## 【化 3 3】

$(CH_2)_nC = CH_2$

(式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $(CH_2)_nOCH_3$  (式中、 $n = 1 \sim 2$ )、 $CH_2N(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $Oi-Pr$ 、 $OPh$ 、 $OBn$ 、 $OC(O)CH_3$ 、 $OC(O)Ph$ 、 $OCF_3$ 、 $N(CH_3)_2$ 、 $NHC(O)t-Bu$ 、 $NHC(O)Ph$ 、 $NHC(O)Ot-Bu$ 、 $NHC(O)CH_3$ 、 $NHC(O)CH_2N_3$ 、 $CF_3$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $C(O)Oi-Pr$ 、 $C(O)Ot-Bu$ 、 $C(O)OPh$ 、 $C(O)OBn$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)N(CH_3)_2$ 、 $C(O)NHPh$ 、 $C(O)NHBn$ 、 $C(O)CF_3$ 、 $CH_2C(O)OCH_3$ 、 $CH_2C(O)Oi-Pr$ 、 $CH_2C(O)Ot-Bu$ 、 $CH_2C(O)OBn$ 、 $S(CH_2)_nCH_3$  (式中、 $n = 0 \sim 5$ )、 $S(CH_2)_nOEt$  (式中、 $n = 1 \sim 4$ )、 $SBn$ 、 $SPh$ 、 $SO_2CF_3$ 、

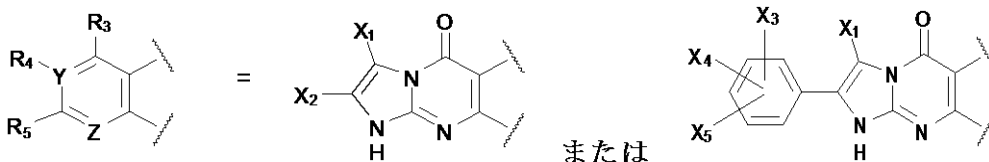
## 【化 3 4】



であってもよく、

残基エントリー 2 が、

## 【化 3 5】



であり、

式中、

$X_1$  は、 $H$ 、 $CH_3$ 、 $Ph$  であってもよく、

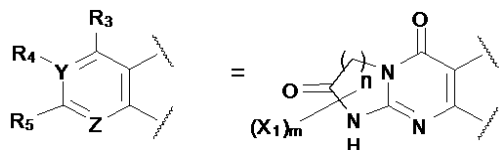
$X_2$  は、 $H$ 、 $Ph$ 、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、ジベンゾ[*b*,*d*]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、 $C(Ph)_3$ 、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジニル、1-ベンゾフラン-2-イル、であってもよく、

$X_3$ 、 $X_4$ 、および  $X_5$  は、独立して、 $H$ 、 $OH$ 、 $NH$ 、 $CH_3$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $F$ 、 $CN$ 、 $N_3$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $NO_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OBn$ 、 $O-ベ$

ンゾイル、 $SCH_3$ 、 $t-Bu$ 、 $N(CH_3)_2$ 、 $S$ -フェニル、 $Ph$ 、 $S(O)_2CH_3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $NHS(O)_2CH_3$ であってもよく、

残基エントリー 3 が、

【化 3 6】



であり、

式中、上記定義から外れて、示され、示唆され、もしくは明確に定義された水素を含む、環炭素原子のいずれかに結合された任意の水素原子、または、同じ特定の炭素原子に結合された両方の水素原子 ( $m = 2$ ) は、安定な構造が形成される限り、それぞれ 1 個または 2 個の (同じ) 「位置不定の基」  $X_1$  により置き換えることができ、

ここで、 $m = 1$  または  $2$  であり、

$n = 1 \sim 4$  であり、

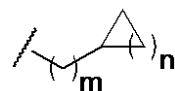
$X_1$  は、 $H$ 、 $CH_3$ 、 $Et$ 、 $Pr$ 、 $i-Pr$ 、 $Bu$ 、 $F$ 、 $Ph$ 、 $(CH_2)_2OH^*$  であってもよく、

\* は、最初の場合のみであり、

残基エントリー 4 が、

または

【化 3 7】



であり、

式中、

$m = 1 \sim 6$  であり、

$n = 1 \sim 6$  であり、

かつ / または

$R_5$  は、 $H$ 、 $NH_2$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、メチルアミノ、 $NH$ -ベンジル、 $NH$ -フェニル、 $NH$ -4-アジドフェニル、 $NH$ -フェニルエチル、 $NH$ -フェニルプロピル、2-アミノエチルアミノ、 $n$ -ヘキシルアミノ、6-アミノ- $n$ -ヘキシルアミノ、8-アミノ-3,6-ジオキサオクチルアミノ、ジメチルアミノ、1-ピペリジノ、1-ピペラジノであり、または  $R_4$ 、 $Y$ 、ならびに  $Y$  および  $R_5$  を架橋する炭素原子と一緒にあって、上述のリストに示したような環系を形成することができ (エントリー 2 および 3)、

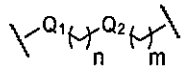
かつ / または

$G$  単位と別の  $G$  単位もしくは色素もしくは別のレポーター基との接続に関わる残基は、 $R_1$ 、 $R_4$ 、および / または  $R_5$  であってもよく、その場合、特定の残基は、直前に定義された通りであり (特定の残基に関して)、エンドスタンディング基は、カップリング官能基に変換されまたはそれによって置き換えられ、

または

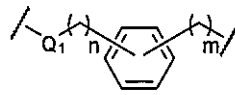
下記のリストに示される通りであり (存在する場合に  $Q_1$  は、 $G$  単位に接続する)、

## 【化 3 8】



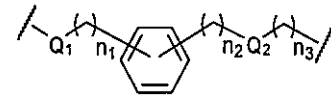
$$n=0-6; m=0-6;$$

Q1 = 非存在, S, NH, O;  
Q2 = NH, S, O, C(O), CH<sub>2</sub>, OC(O), NC(O);



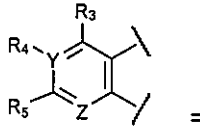
$$n = 0-4, m = 0-4$$

Q1 = 非存在, S, NH, O;

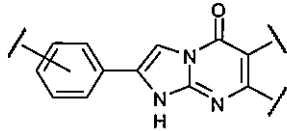
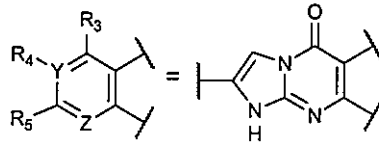


$$n1 = 0-4, n2 = 0-4, n3 = 0-4,$$

Q1 = 非存在, S, NH, O;  
Q2 = NH, S, O, C(O), CH<sub>2</sub>, OC(O), NC(O);



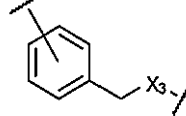
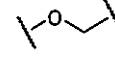
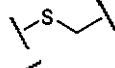
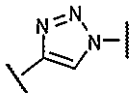
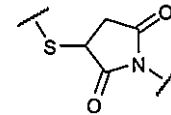
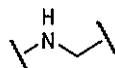
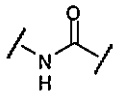
=



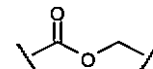
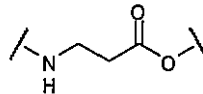
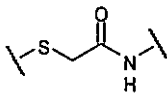
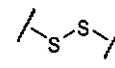
かつ/または

カップリング官能基 (C<sup>1-4</sup>およびC<sup>1'-4'</sup>) は、

## 【化 3 9】



X<sub>3</sub> = NH, O, S



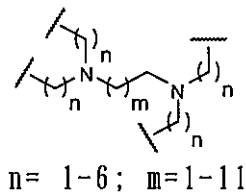
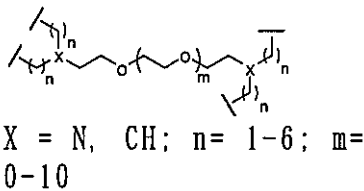
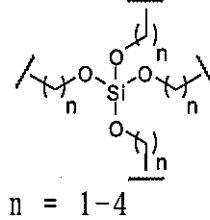
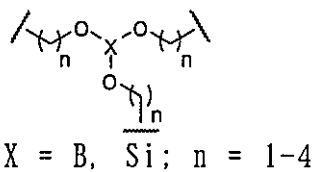
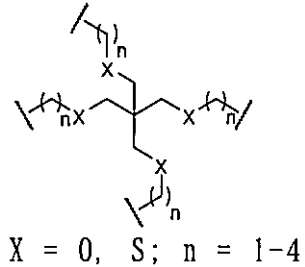
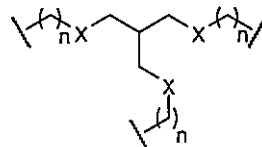
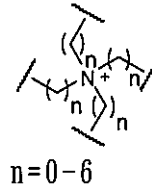
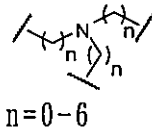
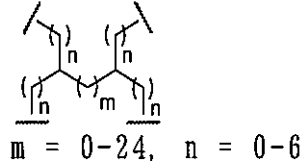
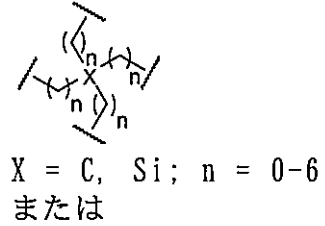
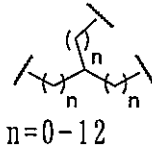
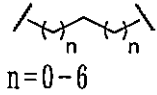
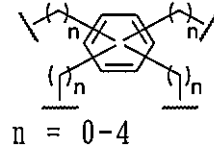
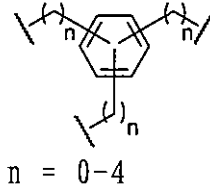
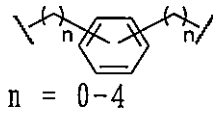
X = O, S, NH, S(O), S(O)<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>, C(O)

からなる群から選択され、

かつ/または、

リンカー (L) は、存在しないか、またはリンカー (L) の下記のリストに示される通りであってもよく、

## 【化 4 0】



ここで、特定のリンカー内の各側鎖ごとの  $n$  は、定義された通り同じまたは別々の値を有することができる、

かつ/または

$R_7$  は、OH、メチルオキシ、エチルオキシ、シアノエチルオキシ、アセトキシメチルオキシ、ピバロイルオキシメチルオキシ、メトキシメチルオキシ、プロピオニルオキシメチルオキシ、ブチリルオキシメチルオキシ、アセトキシエチルオキシ、アセトキシブチルオキシ、アセトキシイソブチルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、4-アセトキシベンジルオキシ、4-ピバロイルオキシベンジルオキシ、4-イソブチリルオキシベンジルオキシ、4-オクタノイルオキシベンジルオキシ、4-ベンゾイルオキシベンジルオキシ

シ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシ、SH、メチルチオ、アセトキシメチルチオ、ピパロイルオキシメチルチオ、メトキシメチルチオ、プロピオニルオキシメチルチオ、ブチリルオキシメチルチオ、シアノエチルチオ、フェニルチオ、ベンジルチオ、4-アセトキシベンジルチオ、4-ピパロイルオキシベンジルチオ、4-イソブチリルオキシベンジルチオ、4-オクタノイルオキシベンジルチオ、4-ベンゾイルオキシベンジルチオ、ボラノ(BH<sub>3</sub>)、メチルボラノ、ジメチルボラノ、シアノボラノ(BH<sub>2</sub>CN)であり、かつ

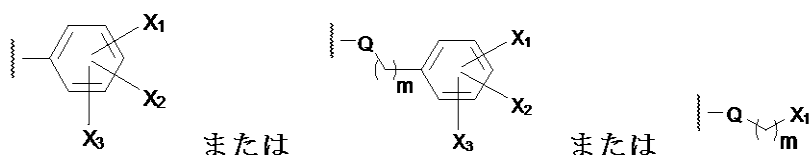
R<sub>8</sub>は、OH、メチルオキシ、エチルオキシ、シアノエチルオキシ、アセトキシメチルオキシ、ピパロイルオキシメチルオキシ、メトキシメチルオキシ、プロピオニルオキシメチルオキシ、ブチリルオキシメチルオキシ、アセトキシエチルオキシ、アセトキシブチルオキシ、アセトキシイソブチルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、4-アセトキシベンジルオキシ、4-ピパロイルオキシベンジルオキシ、4-イソブチリルオキシベンジルオキシ、4-オクタノイルオキシベンジルオキシ、4-ベンゾイルオキシベンジルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシである、請求項1から7までのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

R<sub>1</sub>が、H、Cl、Br、SH、2-フリル、3-フリル、(2-フリル)チオ、(3-(2-メチル)フリル)チオ、(3-フリル)チオ、2-チエニル、3-チエニル、(5-(1-メチル)テトラゾリル)チオ、1,1,2-トリフルオロ-1-ブテンチオ、(2-(4-フェニル)イミダゾリル)チオ、(2-ベンゾチアゾリル)チオ、(2,6-ジクロロフェノキシプロピル)チオ、2-(N-(7-ニトロベンゾ-2-オキサ-1,3-ジアゾール-4-イル)アミノ)エチルチオ、(4-プロモ-2,3-ジオキソブチル)チオ、[2-[(フルオレセイニルチオウレイド)アミノ]エチル]チオ、2,3,5,6-テトラフルオロフェニルチオ、(7-(4-メチル)クマリニル)チオ、(4-(7-メトキシ)クマリニル)チオ、(2-ナフチル)チオ、(2-(1-プロモ)ナフチル)チオ、ベンゾイミダゾリル-2-チオ、ベンゾチアゾリルチオ、4-ピリジル、(4-ピリジル)チオ、2-ピリジルチオ、トリフェニルイミノホスホラニルであり、または残基R<sub>1</sub>は、残基エントリー1もしくは2として以下に示される通りであり、

残基エントリー1が、

【化41】



であり、

式中、

m = 0 ~ 3 であり、

Q = S であり、

X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は、同じであってもよく、または独立して、H、OH、NH<sub>2</sub>、N<sub>3</sub>、SH、CN、NO<sub>2</sub>、F、Cl、Br、I、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub> (式中、n = 0 ~ 5)、i-Pr、t-Bu、Ph、

【化42】



(式中、n = 0 ~ 5)、

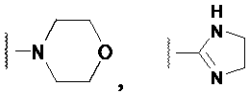
【化43】



(式中、n = 0 ~ 5)、CH<sub>2</sub>OH、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OCH<sub>3</sub> (式中、n = 1 ~ 2)、CH<sub>2</sub>N

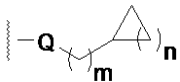
(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub> (式中、n = 0 ~ 5)、Oi-Pr、OCy、OCyp、OPh、OBn、OC(O)CH<sub>3</sub>、OC(O)Ph、OCF<sub>3</sub>、N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、NH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub> (式中、n = 0 ~ 5)、NHC(O)t-Bu、NHC(O)Ph、NHC(O)Ot-Bu、NHC(O)CH<sub>3</sub>、NHC(O)CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>、B(OH)<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、C(O)OH、C(O)OCH<sub>3</sub>、C(O)Oi-Pr、C(O)Ot-Bu、C(O)OPh、C(O)OBn、C(O)NH<sub>2</sub>、C(O)N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、C(O)NHPh、C(O)NHBn、C(O)CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>C(O)OH、CH<sub>2</sub>C(O)OCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>C(O)Oi-Pr、CH<sub>2</sub>C(O)Ot-Bu、CH<sub>2</sub>C(O)OBn、S(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub> (式中、n = 0 ~ 5)、S(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OEt (式中、n = 1 ~ 4)、SBn、SPh、

【化 4 4】



であってよく、  
残基エントリー 2 が、

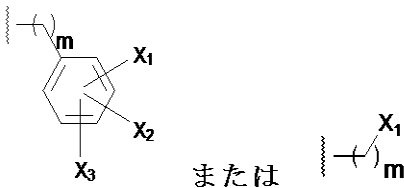
【化 4 5】



であり、  
式中、  
m = 0 ~ 6 であり、  
n = 1 ~ 6 であり、  
Q = S であり、  
かつ / または

R<sub>4</sub> が、存在しないか、または残基エントリー 1、2、3、もしくは 4 として以下に示される通りであって、  
残基エントリー 1 が、

【化 4 6】



であり、  
式中、

m = 1 ~ 3 であり、  
X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、および X<sub>3</sub> は、同じであってよく、または独立して、H、N<sub>3</sub>、CN、NO<sub>2</sub>、F、Cl、Br、I、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub> (式中、n = 0 ~ 5)、i-Pr、t-Bu、Ph、

【化 4 7】

(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C≡CH

(式中、n = 0 ~ 5)、

【化 4 8】

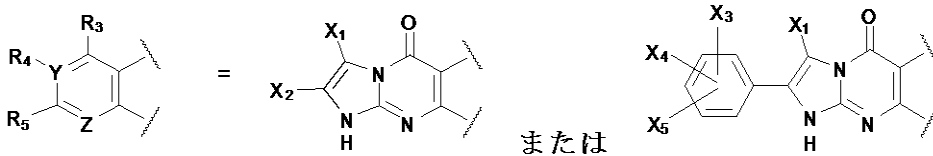
(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C=CH<sub>2</sub>

(式中、n = 0 ~ 5)、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OCH<sub>3</sub> (式中、n = 1 ~ 2)、CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub> (式中、n = 0 ~ 5)、Oi-Pr、OPh、OBn、OC(O)CH<sub>3</sub>、OC(O)Ph、OCF<sub>3</sub>、N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、NHC(O)t-Bu、NHC(O)P

h、NHC(O)Ot-Bu、NHC(O)CH<sub>3</sub>、NHC(O)CH<sub>2</sub>N<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、C(O)OCH<sub>3</sub>、C(O)Oi-Pr、C(O)Ot-Bu、C(O)OPh、C(O)OBn、C(O)NH<sub>2</sub>、C(O)N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、C(O)NHPh、C(O)NHBn、C(O)CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>C(O)OCH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>C(O)Oi-Pr、CH<sub>2</sub>C(O)Ot-Bu、CH<sub>2</sub>C(O)OBn、S(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CH<sub>3</sub> (式中、n = 0 ~ 5)、S(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OEt (式中、n = 1 ~ 4)、SBn、SPh、SO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、  
【化 49】



であってもよく、  
残基エントリー 2 が、  
【化 50】



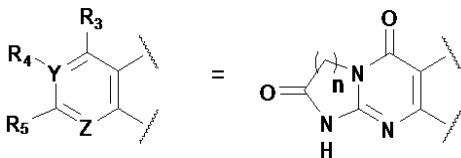
であり、  
式中、

X<sub>1</sub>は、H、CH<sub>3</sub>、Phであってもよく、

X<sub>2</sub>は、H、Ph、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、ジベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、C(Ph)<sub>3</sub>、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジニル、1-ベンゾフラン-2-イル、であってもよく、

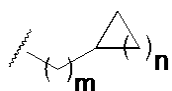
X<sub>3</sub>、X<sub>4</sub>、およびX<sub>5</sub>は、独立して、H、OH、NH、CH<sub>3</sub>、Cl、Br、F、CN、N<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、C(O)OH、C(O)OCH<sub>3</sub>、OCH<sub>3</sub>、OBn、O-ベンゾイル、SCH<sub>3</sub>、t-Bu、N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、S-フェニル、Ph、S(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、C(O)NH<sub>2</sub>、NHS(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>であってもよく、

残基エントリー 3 が、  
【化 51】



であり、  
式中、

n = 1 ~ 4 であり、  
残基エントリー 4 が、  
【化 52】



であり、  
式中、

m = 1 ~ 3 であり、  
n = 1 ~ 6 であり、

かつ/または

$R_5$ は、 $NH_2$ であり、または $R_4$ 、 $Y$ 、ならびに $Y$ および $R_5$ を架橋する炭素原子と一緒に  
なって、上述のリストに示したような環系（エントリー-2 および 3）を形成することができ、

かつ/または

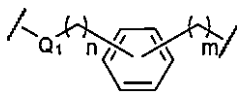
G単位と別のG単位もしくは色素もしくは別のレポーター基との接続に関わる残基は、  
 $R_1$ 、 $R_4$ 、および $R_5$ であってもよく、その場合、特定の残基は、  
直前に定義された通りであり（特定の残基に関して）、エンドスタンディング基は、カップ  
リング官能基に変換されまたはそれによって置き換えられ、

または

下記のリストに示される通りであり（存在する場合に $Q_1$ は、G単位に接続する）、

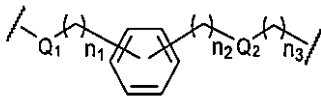
【化53】

$R_1$



$$n = 0-4, m = 0-4$$

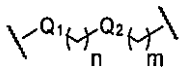
$Q_1 =$  非存在, S;



$$n_1 = 0-4, n_2 = 0-4, n_3 = 0-4,$$

$Q_1 =$  非存在 (for  $n_1=0$ ), S;

$Q_2 = NH, S, O, CH_2, NC(0)$ ;



$$n=0-6; m=0-6;$$

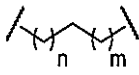
$Q_1 = S$ ;

$Q_2 = NH, S, O, CH_2, NC(0)$ ;

$R_4$

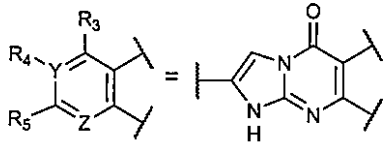
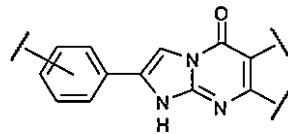
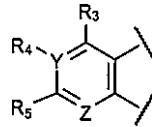


$$n = 0-4, m = 0-4$$



$$n=0-6, m=0-6$$

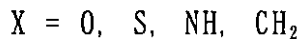
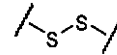
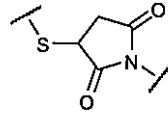
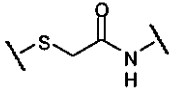
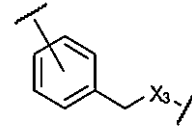
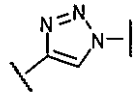
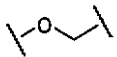
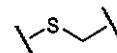
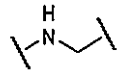
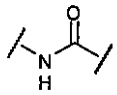
$R_4 + R_5$



かつ/または

カップリング官能基（ $C^{1-4}$ および $C^{1'-4'}$ ）は、

## 【化 5 4】



からなる群から選択される構造によって示され、  
かつ/または、

R<sub>7</sub>は、OH、メチルオキシ、エチルオキシ、シアノエチルオキシ、アセトキシメチルオキシ、ピバロイルオキシメチルオキシ、メトキシメチルオキシ、プロピオニルオキシメチルオキシ、ブチリルオキシメチルオキシ、アセトキシエチルオキシ、アセトキシブチルオキシ、アセトキシイソブチルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、4 - アセトキシベンジルオキシ、4 - ピバロイルオキシベンジルオキシ、4 - イソブチリルオキシベンジルオキシ、4 - オクタノイルオキシベンジルオキシ、4 - ベンゾイルオキシベンジルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシ、SH、メチルチオ、アセトキシメチルチオ、ピバロイルオキシメチルチオ、メトキシメチルチオ、プロピオニルオキシメチルチオ、ブチリルオキシメチルチオ、シアノエチルチオ、フェニルチオ、ベンジルチオ、4 - アセトキシベンジルチオ、4 - ピバロイルオキシベンジルチオ、4 - イソブチリルオキシベンジルチオ、4 - オクタノイルオキシベンジルチオ、4 - ベンゾイルオキシベンジルチオであり、かつ

R<sub>8</sub>は、OH、メチルオキシ、エチルオキシ、シアノエチルオキシ、アセトキシメチルオキシ、ピバロイルオキシメチルオキシ、メトキシメチルオキシ、プロピオニルオキシメチルオキシ、ブチリルオキシメチルオキシ、アセトキシエチルオキシ、アセトキシブチルオキシ、アセトキシイソブチルオキシ、フェニルオキシ、ベンジルオキシ、4 - アセトキシベンジルオキシ、4 - ピバロイルオキシベンジルオキシ、4 - イソブチリルオキシベンジルオキシ、4 - オクタノイルオキシベンジルオキシ、4 - ベンゾイルオキシベンジルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシである、請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 10】

(1) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオ - (ペンタエトキシ) - エチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート

(2) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオメチルアミドメチル - (ペンタエトキシ) - プロピルアミドメチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート

(3) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオメチルアミド - (オクタエトキシ) - エチルアミドメチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート

(4) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート - [ 8 - (4 - チオフェニルチオ) - (ペンタエトキシ) - エチル - (4 - チオフェニルチオ) - 8 ] - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート

(5) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェー

- ト - [ 8 - チオメチルアミド - ( オクタエトキシ ) - エチルアミドメチルチオ - 8 ] -  
 - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 6 ) 8 - プロモグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 1 ,  $N^2$  - エテ  
 ノ - フェニル - 4 - イル - ( 1 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 4 - イル ) - メト  
 キシ - ( ヘキサエトキシ ) - メチル - ( 4 - ( 4 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 1 -  
 イル ) - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノ ) ] - 8 - プロモグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環  
 状モノホスフェート
- ( 7 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオメチルアミド - ( オ  
 クタエトキシ ) - エチルアミドメチルチオ - 8 ] - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグ  
 アノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 8 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオメチルアミド - ( ノ  
 ナデカエトキシ ) - エチルアミドメチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モ  
 ノホスフェート
- ( 9 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - ( 1 - [ 1 , 2 , 3 ]  
 - トリアゾール - 4 - イル ) - メトキシ - ( ヘキサエトキシ ) - メチル - ( 4 - [ 1 , 2  
 , 3 ] - トリアゾール - 1 - イル ) - 8 ] - グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェ  
 ート
- ( 10 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオメチルアミド -  
 ( PEG pd 2000 ) - アミドメチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状  
 モノホスフェート
- ( 11 ) - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェ  
 ート - [ 8 - チオメチルアミド - ( ノナデカエトキシ ) - エチルアミドメチルチオ - 8 ]  
 - グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 12 ) - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェ  
 ート - [ 8 - チオメチルアミド - ( ノナデカエトキシ ) - エチルアミドメチルチオ - 8 ]  
 - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 13 ) - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェ  
 ート - [ 8 - チオメチルアミド - ( PEG pd 2000 ) - アミドメチルチオ - 8 ]  
 - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 14 ) ベンゼン - 1 , 3 , 5 - トリ - [ ( 8 - アミドメチル - ( ペンタエトキシ ) -  
 プロピルアミドメチルチオ ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート ]
- ( 15 ) エチレングリコール - ビス ( 2 - アミノエチルエテル ) - N , N , N ' , N '  
 - テトラ - [ ( 8 - メチルアミドエチルチオ ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフ  
 ェート ]
- ( 16 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオ - ( ドデカニル  
 ) - チオ - 8 ] - グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 17 ) - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェ  
 ート - [ 8 - チオ - ( ドデカニル ) - チオ - 8 ] - フェニル - 1 ,  $N^2$  - エテノグア  
 ノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート、トリエチルアンモニウム塩
- ( 18 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオエチルアミドメ  
 チル - ( 1 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 4 - イル ) - メトキシ - ( ヘキサエトキシ )  
 ) - メチル - ( 4 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 1 - イル ) - メチルアミドエチルチ  
 オ - 8 ] - グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 19 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオエチルチオ - 8  
 ] - グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 20 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオエチル - ( 1 -  
 [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 4 - イル ) - メトキシ - ( ヘキサエトキシ ) - メチル -  
 ( 4 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 1 - イル ) - エチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3  
 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート
- ( 21 ) グアノシン - 3 ' , 5 ' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオ - ( ドデカニル

- ) - (4 - チオフェニル - 4' - チオフェニルチオ) - (ドデカニル) - チオ - 8 ] -  
 グアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート
- (22) グアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート - [ 8 - チオエチルアミドメ  
 チル - (1 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 4 - イル) - メトキシ - (ヘキサエトキシ  
 ) - メチル - (4 - (4 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 1 - イル) - フェニル -  
 1 , N<sup>2</sup> - エテノ) ] - 8 - プロモグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート
- (23) - フェニル - 1 , N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェ  
 ート - [ 8 - チオエチル - (1 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 4 - イル) - メトキシ  
 - (ヘキサエトキシ) - メチル - (4 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 1 - イル) - エ  
 チルチオ - 8 ] - フェニル - 1 , N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホ  
 スフェート
- (24) 8 - プロモグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート - [ 1 - プロピル  
 アミドメチル - (ペンタエトキシ) - プロピルアミドメチルチオ - 8 ] - フェニル -  
 1 , N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート
- (25) 8 - プロモグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート - [ 1 - (ペンタ  
 エトキシ) - エチル - 1 ] - 8 - プロモグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート
- (26) 8 - プロモグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート - [ 1 - プロピル  
 アミドメチル - (ペンタエトキシ) - プロピルアミドプロピル - 1 ] - 8 - プロモグア  
 ノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート
- (27) 8 - プロモグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート - [ 1 - プロピル  
 アミドメチル - (ペンタエトキシ) - プロピルアミドメチルチオ - 8 ] - グアノシン - 3  
 ' , 5' - 環状モノホスフェート
- (28) グアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート - [ 8 - (フェニル - 4 - チ  
 オ) - (ペンタエトキシ) - エチル - (4 - チオフェニル) - 8 ] - グアノシン - 3' ,  
 5' - 環状モノホスフェート
- (29) - 1 , N<sup>2</sup> - アセチル - グアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート -  
 [ 8 - チオメチルアミド - (オクタエトキシ) - エチルアミドメチルチオ - 8 ] - 1  
 , N<sup>2</sup> - アセチル - グアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート
- (30) 8 - フェニルグアノシン - 3' , 5' - 環状モノホスフェート - [ 1 , N<sup>2</sup> -  
 エテノ - フェニル - 4 - イル - (1 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール - 4 - イル) -  
 メトキシ - (ヘキサエトキシ) - メチル - (4 - (4 - [ 1 , 2 , 3 ] - トリアゾール -  
 1 - イル) - フェニル - 1 , N<sup>2</sup> - エテノ) ] - 8 - フェニルグアノシン - 3' , 5  
 ' - 環状モノホスフェート

からなる群から選択される、請求項 1 から 9 までのいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

請求項 1 から 10 までのいずれか 1 項に記載の化合物の、式 ( I I I ) のモノマー化合  
 物および/または式 ( I I I ) のモノマー前駆体であって、式 ( I I I ) のモノマー化合  
 物および/または式 ( I I I ) のモノマー前駆体は、請求項 1 から 10 までのいずれか 1  
 項に記載の通りに定義され、好ましくは、式 ( I I I ) のモノマー化合物および/または  
 式 ( I I I ) のモノマー前駆体は、下記の条件：

R<sub>7</sub>はOであり、R<sub>8</sub>はOHである

ことを満たし、

さらに、下記の条件：

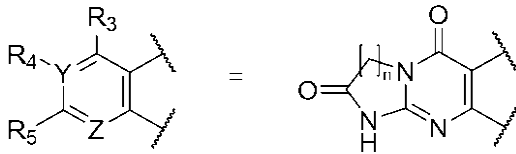
R<sub>4</sub>はHではなく、R<sub>5</sub>はNH<sub>2</sub>であり、

式中、R<sub>4</sub>は、R<sub>4</sub>の部分である - CH<sub>2</sub> - 架橋を介して結合しており、  
 または

R<sub>5</sub>は、R<sub>4</sub>、Y、ならびにYおよびR<sub>5</sub>を架橋する炭素と一緒にあって、

a) 以下に示されるイミダゾリノン環 ( n = 1 ) または同族環 ( n = 2 ~ 8 )

## 【化 5 5】

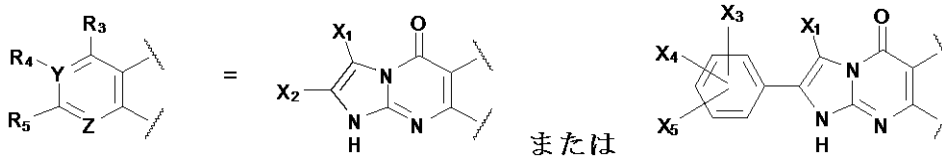


または

b) 残基エントリー 1 および 2 として以下に示される、置換されていなくてもよく、または置換されていてもよいイミダゾール環

残基エントリー 1 :

## 【化 5 6】



(式中、

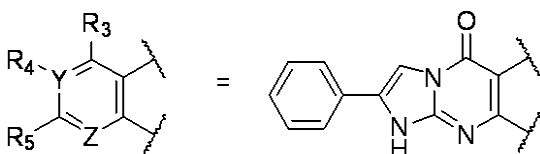
$X_1$  は、H であり、

$X_2$  は、H、2-ナフチル、9-フェナントリル、1-ピレニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、ジベンゾ[b,d]フラン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、1-ベンゾチエン-5-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、シクロプロピル、1-アダマンチル、 $C(Ph)_3$ 、2-チエニル、3-クロロ-2-チエニル、3-チエニル、1,3-チアゾール-2-イル、2-ピリジニル、5-クロロ-2-チエニル、1-ベンゾフラン-2-イルであってもよく、

$X_3$ 、 $X_4$ 、および  $X_5$  は、独立して、OH、NH、 $CH_3$ 、Cl、Br、F、CN、 $N_3$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $NO_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $OCH_3$ 、OBn、O-ベンゾイル、 $SCH_3$ 、t-Bu、 $N(CH_3)_2$ 、S-フェニル、Ph、 $S(O)_2CH_3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $NHS(O)_2CH_3$  であってもよく、ここで、 $X_4$  および  $X_5$  は、独立して、H であってもよい)、

残基エントリー 2 :

## 【化 5 7】



(ここで、 $R_1$  は、化合物 31 ~ 107 のいずれかの場合の通りである) であってもよい環系を形成し、

または

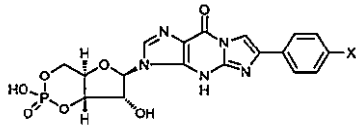
$R_1$  は、-S(O)- もしくは -S(O)<sub>2</sub>- 架橋を介してまたはそれぞれの場合に  $R_1$  の部分である芳香環系の炭素原子を介して結合しており、

ここで、 $R_4$  は H であり、 $R_5$  は  $NH_2$  である

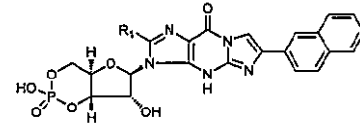
このの少なくとも 1 つを満たし、

さらに、式 (III) のモノマー化合物および / または式 (III) のモノマー前駆体化合物は、

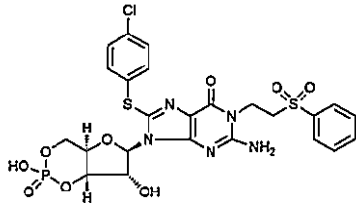
## 【化58】



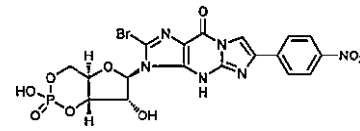
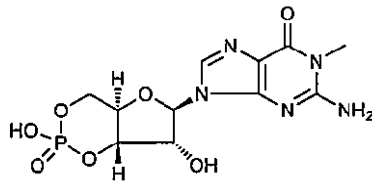
式中、X = OMeまたはCl



式中、R<sub>1</sub> = HまたはBr



式中、X = O, SまたはSe



からなる化合物の群から選択されず、  
かつ/または

式(III)のモノマー化合物および/または式(III)のモノマー前駆体は、

(31) 8-アミドメチルチオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(32) 8-(4-ボロネートフェニルチオ)-グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(33) 8-(4-シアノベンジルチオ)グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(34) 8-(4-(2-シアノフェニル)-ベンジルチオ)グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(35) 8-シクロヘキシルメチルチオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(36) 8-(2,4-ジクロロフェニルチオ)グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(37) 8-ジエチルホスホノエチルチオ-グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(38) 8-エチルチオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(39) 8-ヘキシルチオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(40) 8-(4-イソプロピルフェニルチオ)グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(41) 8-(3-(2-メチル)フラニル)チオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(42) 8-(5-(1-メチル)テトラゾリル)チオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(43) 8-(4-メトキシベンジルチオ)グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(44) 8-(7-(4-メチル)クマリニル)チオ-グアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(45) 8-メチルアセチルチオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(46) 8-(5-(1-フェニル)テトラゾリル)チオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(47) 8-(2-フェニルエチル)チオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(48) 8-(2-(4-フェニル)イミダゾリル)チオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

(49) 8-(2-チオフェニル)チオグアノシン-3', 5'-環状モノホスフェート

ト

- (50) 8 - (1, 1, 2 - トリフルオロ - 1 - プテンチオ) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (51) 8 - アミドプロピルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (52) 8 - アミドエチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (53) 8 - アミドブチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (54) 8 - アセトアミドエチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (55) 8 - (2 - ベンゾチアゾリル) チオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (56) 8 - (2 - ボロネートベンジルチオ) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (57) 8 - (4 - ボロネートブチルチオ) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (58) 8 - (4 - ボロネートベンジルチオ) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (59) 8 - (3 - ボロネートベンジルチオ) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (60) 8 - アジドメチルアミドエチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (61) 8 - (3 - ボロネートフェニル) アミドブチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (62) 8 - ベンジルアミドブチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (63) 8 - ベンズアミドエチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (64) 8 - (3 - ボロネートフェニル) アミドメチル - チオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (65) 8 - ベンジルアミドメチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (66) 8 - (3 - ボロネートフェニル) アミドエチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (67) 8 - (3 - ボロネートフェニル) アミドプロピルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (68) 8 - カルボキシプロピルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (69) 8 - カルボキシブチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (70) 8 - (2, 6 - ジクロロフェノキシプロピル) チオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (71) 8 - (4 - ジメチルアミノフェニル) アミド - メチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (72) 8 - (4 - ジメチルアミノフェニル) アミド - ブチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (73) 8 - エチルブチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (74) 8 - メチルプロピオニルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (75) 8 - メチルバレリアニルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (76) 8 - メトキシエチルアミドブチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (77) 8 - メトキシエチルアミドメチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (78) 8 - メトキシエチルアミドエチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (79) 8 - フェニルアミドメチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート

ート

- (80) 8 - フェニルプロピルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (81) 8 - (3 - ブチルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (82) 8 - (4 - アセトアミドフェニルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (83) 8 - (4 - クロロフェニルスルホニル)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (84) 8 - (4 - クロロフェニルスルホキシド) - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (85) 8 - ((2 - エトキシエチル) - 4 - チオフェニルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (86) 8 - (4 - チオフェニル - 4' - チオフェニルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (87) 8 - (2 - アジドエチルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (88) 8 - (3 - アミノプロピル) - (ペンタエトキシ) - メチルアミドメチルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (89) 8 - (2 - アミノエチル) - (オクタエトキシ) - アミドメチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (90) 8 - (2 - プロモエチル) - (ペンタエトキシ) - (4 - チオフェニルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (91) 8 - (4 - (プロパルギルオキシ - (ヘキサエトキシ) - メチル) - [1, 2, 3] - トリアゾール - 1 - イル) - メチルアミドエチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (92) 8 - (4 - カルボキシフェニルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (93) 8 - (4 - ヒドロキシフェニルスルホニル) - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (94) 8 - (4 - イソプロピルフェニルスルホニル) - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (95) 8 - (4 - メチルカルボキシフェニルチオ) - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (96) 8 - メチルスルホニルグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (97) 8 - (1 - プロモ - 2 - ナフチル)メチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (98) 8 - (2 - (1 - ベンジル - [1, 2, 3] - トリアゾール - 4 - イル) - エチルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (99) 8 - (3 - フルオロ - 5 - メトキシベンジルチオ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (100) 8 - ペンタフルオロベンジルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (101) 8 - トリフェニルイミノホスホラニル - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (102) 8 - (4 - クロロフェニル)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (103) 8 - (4 - フルオロフェニル)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (104) 8 - (2 - フリル)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (105) 8 - (4 - ヒドロキシフェニル)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート

- (106) 8 - (4 - イソプロピルフェニル) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (107) 8 - フェニルグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (108) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - チオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (109) 8 - (2 - アミノフェニルチオ) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (110) 8 - シクロヘキシルチオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (111) 8 - シクロペンチルチオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (112) 8 - (4 - メチルフェニルチオ) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (113) 8 - (4 - メトキシフェニルチオ) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (114) 8 - (3 - (2 - メチル)フラニル)チオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (115) 8 - (7 - (4 - メチル)クマリニル)チオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (116) 8 - (2 - ナフチル)チオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (117) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - (2 - チオフェニル)チオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (118) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - (2 - フェニルエチル)チオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (119) 8 - アミドメチルチオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (120) 8 - カルボキシメチルチオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (121) 8 - (4 - ボロネートフェニルチオ) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (122) 8 - エチルチオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (123) 8 - (4 - フルオロフェニルチオ) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (124) 8 - メチルチオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (125) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - プロピルチオ - グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (126) 8 - アジドエチルチオ - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (127) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - (4 - トリフルオロメチルフェニルチオ) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (128) 8 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (129) 8 - (4 - イソプロピルフェニルチオ) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (130) 8 - (4 - イソプロピルフェニルスルホニル) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (131) 8 - (4 - クロロフェニル) - - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン

- 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (132) 8 - (4 - ヒドロキシフェニル) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (133) 8 - (4 - イソプロピルフェニル) - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (134) 8 - ブロモ - (4 - メトキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (135) 8 - ブロモ - (4 - メチル - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (136) - ベンゾイル - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - ブロモグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (137) 8 - ブロモ - (4 - クロロ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (138) 8 - ブロモ - (3 - ニトロ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (139) 8 - ブロモ - (tert. - ブチル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (140) 8 - ブロモ - (2 - メトキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (141) 8 - ブロモ - (3 - メトキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (142) 8 - ブロモ - (2, 4 - ジメトキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (143) 8 - ブロモ - (4 - ピリジニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (144) 8 - ブロモ - (3 - チオフェン - イル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (145) 8 - ブロモ - (4 - フルオロ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (146) 8 - ブロモ - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (147) 8 - ブロモ - (3 - ヒドロキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (148) 8 - ブロモ - (4 - ヒドロキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (149) 8 - ブロモ - ( (2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシン) - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (150) 8 - ブロモ - (4 - メチルスルホンアミド - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (151) 8 - ブロモ - (4 - シアノ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (152) 8 - ブロモ - (フェニル - メチル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (153) - (4 - アミノフェニル) - 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - ブロモグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (154) 8 - ブロモ - (6 - メトキシ - 2 - ナフチル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (155) 8 - ブロモ - (9 - フェナントレニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ)グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート
- (156) 8 - ブロモ - (4 - トリフルオロメチル - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ

- ) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (157) (4 - フルオロ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ) - 8 - メチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (158) (4 - メトキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ) - 8 - メチルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (159) 1, N<sup>2</sup> - エテノ - 8 - (2 - フェニルエチル) チオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (160) (4 - メトキシ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノ) - 8 - プロピルチオグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (161) - 1, N<sup>2</sup> - アセチル - 8 - プロモグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (162) 8 - プロモ - 1, N<sup>2</sup> - ブチリルグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (163) 8 - プロモ - 1 - (3 - カルボキシプロピル) グアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (164) 1 - [アミノメチル - (ペンタエトキシ) - プロピルアミドプロピル] - 8 - プロモグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (165) 1 - ベンジル - 8 - プロモグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート  
 (166) 2' - O - (2 - アジドアセチル) - 8 - プロモ - フェニル - 1, N<sup>2</sup> - エテノグアノシン - 3', 5' - 環状モノホスフェート

からなる群から選択されるという条件を満たす、式 ( I I I ) のモノマー化合物および / または式 ( I I I ) のモノマー前駆体。

【請求項 1 2】

疾患または障害、好ましくは、がん、心血管疾患もしくは障害、または自己免疫疾患もしくは障害、または神経変性疾患もしくは障害からなる群から選択される疾患または障害の治療において使用するための、請求項 1 から 10 までのいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 1 1 に記載の式 ( I I I ) のモノマー化合物。

【請求項 1 3】

- a) 不十分なシナプス機能ならびに学習および記憶障害を伴う神経変性疾患、  
 b) 運動ニューロン病 (筋萎縮性側索硬化症 (ALS)、原発性側索硬化症を含む) を含む神経筋接合部欠陥、さらにはある特定の感染性疾患により引き起こされた形態 (麻痺性ポリオを含む)、  
 c) がん細胞アポトーシスの開始および転移の予防を含む、がん、  
 d) 高血圧、心臓肥大、狭心症、虚血、および卒中を含む、心血管疾患、  
 e) マラリア、シャーガス、アフリカ睡眠病を含む、トリパノソーマによって引き起こされる寄生虫病、  
 f) ボレリア (ライム病)、  
 g) 肺線維症および肺高血圧症などの肺疾患および状態、  
 h) 骨粗しょう症、  
 i) 多発性硬化症、クローン病、橋本病、若年性関節炎、心筋炎、およびリウマチを含む、B および T 細胞の過剰増殖を伴う自己免疫疾患
- の少なくとも 1 つの治療において使用するための、請求項 1 から 10 までのいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 1 1 に記載の式 ( I I I ) のモノマー化合物。

【請求項 1 4】

研究ツール化合物としての、好ましくは疾患または障害、好ましくはがん、心血管疾患もしくは障害、または自己免疫疾患もしくは障害、または神経変性疾患もしくは障害からなる群から選択される疾患または障害に関する研究ツール化合物としての、請求項 1 から 10 までのいずれか 1 項に記載の化合物または請求項 1 1 に記載の式 ( I I I ) のモノマー化合物の使用。