

【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 3 区分

【発行日】令和 2 年 12 月 17 日 (2020.12.17)

【公表番号】特表 2019-536860 (P2019-536860A)

【公表日】令和 1 年 12 月 19 日 (2019.12.19)

【年通号数】公開・登録公報 2019-051

【出願番号】特願 2019-524042 (P2019-524042)

【国際特許分類】

C 08 G 77/26 (2006.01)

C 23 C 16/44 (2006.01)

G 01 N 33/53 (2006.01)

G 01 N 33/543 (2006.01)

C 07 F 7/18 (2006.01)

【F I】

C 08 G 77/26

C 23 C 16/44 A

G 01 N 33/53 N

G 01 N 33/543 5 0 1 A

C 07 F 7/18 M

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 11 月 6 日 (2020.11.6)

【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

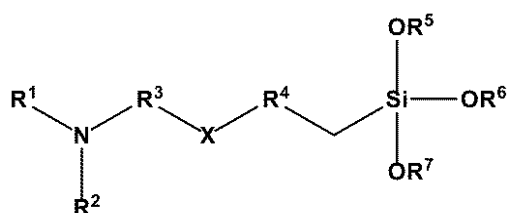
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の構造を有する分子またはその塩であって、

【化 1】



式中、 R^1 及び R^2 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^8$ であり、 R^8 はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合される N は環を形成し；または R^1 若しくは R^2 のうちの少なくとも 1 つはヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含み；

N から X に配向される R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロ

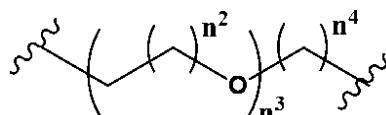
アルキルであり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^3 は

【化 2】



であり、 n は 1 から 100 であり、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、及び R^{12} は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり；または R^3 は、

【化 3】



であり、式中、 n^2 及び n^4 は同一であり、若しくは異なり、独立して、1、2、若しくは 3 であり、 n^3 は 1 から 20 であり；または R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノヘテロアルキル、及びアミドアルキルを含むポリマーであり；

X は O、 NR^{13} 、若しくは S であり、 R^{13} は水素若しくはアルキルであり；

R^4 は X から C へ配向され、アルキル、アルキルエーテル、及びアルキルチオエーテルであり、アルキル、アルキルエーテル、及びアルキルチオエーテルのそれぞれは任意選択でヒドロキシル、チオール、アミノ、若しくはハロと置換され；

R^5 、 R^6 、及び R^7 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであり；ならびに

R^5 、 R^6 、若しくは R^7 のうちの少なくとも 1 つは任意選択で固相をさらに含む、前記分子またはその塩。

【請求項 2】

固相を含む、請求項 1 に記載の分子またはその塩。

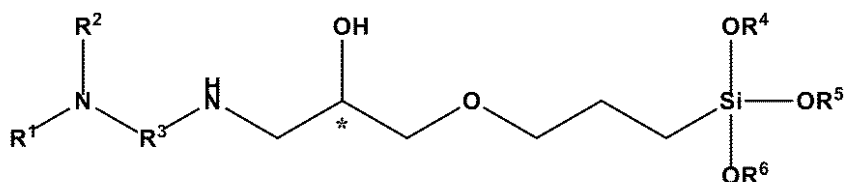
【請求項 3】

前記固相は、シリコン原子を含む、請求項 2 に記載の分子またはその塩。

【請求項 4】

以下の構造を有する分子またはその塩であって、

【化 4】

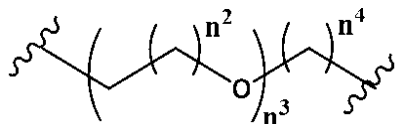


式中、 R^1 及び R^2 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^8$ であり、 R^8 はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合される N は環を形成し；または、 R^1 若しくは R^2 のうちの少なくとも 1 つはヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含み；

NR^1R^2 から NH に配向される R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換ア

ミドヘテロアルキルであり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^3 は $-(C R^7 R^8 C R^9 R^{10})_n-$ であり、 n は 1 から 100 であり、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} は同一であり、若しくは異なり、水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり；または R^3 は、

【化 5】



であり、

式中、 n^2 及び n^4 は同一であり、若しくは異なり、独立して、1、2、若しくは3であり、 n^3 は 1 から 20 であり；または R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、及びアミノ置換アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルを含むポリマー若しくはデンドリマーであり；

R^4 、 R^5 、及び R^6 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであり；

(*) は炭素中心であり、前記炭素中心は R - 立体配置若しくは S - 立体配置にあり；ならびに

R^4 、 R^5 、若しくは R^6 のうちの少なくとも 1 つは任意選択で固相をさらに含む、前記分子またはその塩。

【請求項 5】

前記炭素中心は、R - 立体配置にある、請求項 4 に記載の分子またはその塩。

【請求項 6】

前記炭素中心は、S - 立体配置にある、請求項 4 に記載の分子またはその塩。

【請求項 7】

前記固相を含む、請求項 4 に記載の分子またはその塩。

【請求項 8】

前記固相は、シリコン原子を含む、請求項 7 に記載の分子または塩。

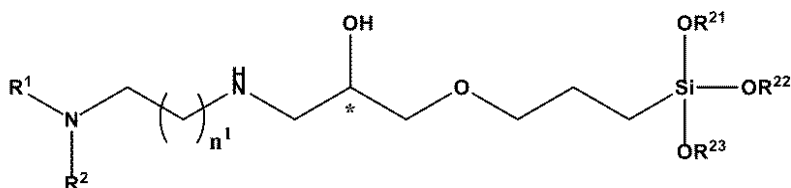
【請求項 9】

R^3 は、アルキル、アミノヘテロアルキル、ポリアミドアミノアルキル、またはポリアミノアルキルである、請求項 4 に記載の分子または塩。

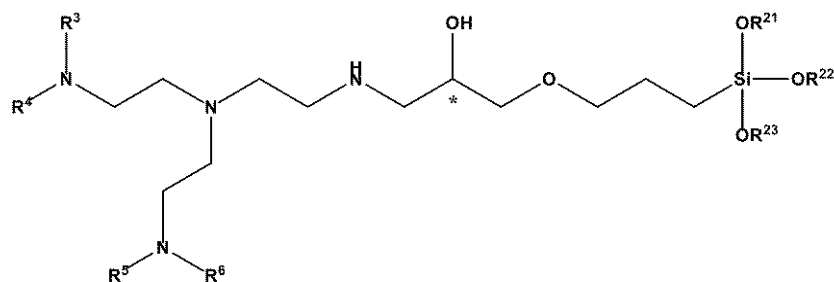
【請求項 10】

以下の構造を有する分子またはその塩であって、

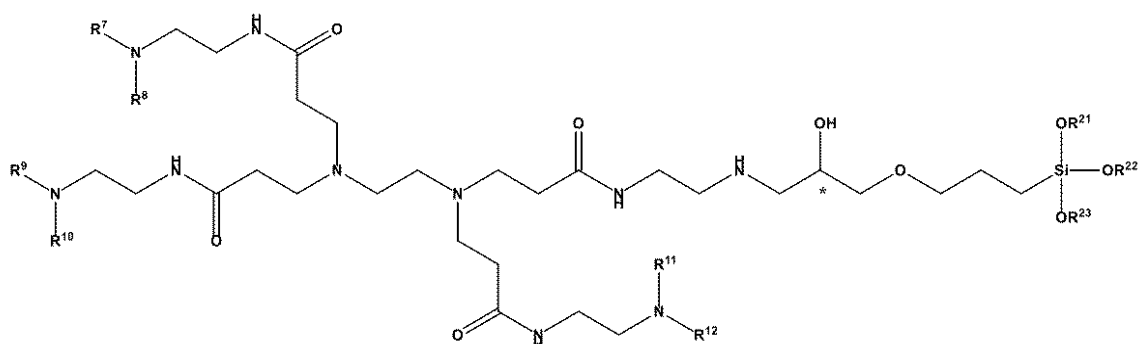
【化 6】



【化 7】

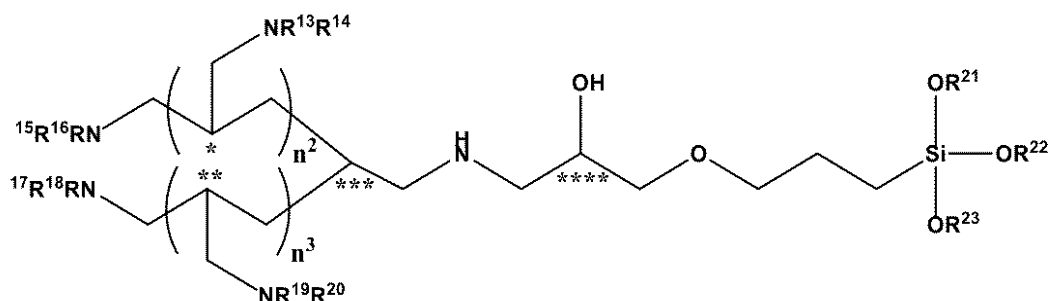


【化 8】



または

【化 9】



式中、 $n^1 = 1、2、3、4、5、6、$ 若しくは 7 であり；

n^2 及び n^3 は同一であり、若しくは異なり、独立して、約 1 から約 1000 であり；

$R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、R^8、R^9、R^{10}、R^{11}、R^{12}、R^{13}、R^{14}、R^{15}、R^{16}、R^{17}、R^{18}、R^{19}$ 、及び R^{20} は同一であり、若しくは異なり、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^{24}$ であり、 R^{24} はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合されるNは、 R^3 及び R^4 、及びそれらが結合されるNは、 R^5 及び R^6 、及びそれらが結合されるNは、 R^7 及び R^8 、及びそれらが結合されるNは、 R^9 及び R^{10} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{11} 及び R^{12} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{13} 及び R^{14} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{15} 及び R^{16} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{17} 及び R^{18} 、及びそれらが結合されるNは、ならびに R^{19} 及び R^{20} 、及びそれらが結合されるNは独立して任意選択で環を形成し；

$R^3、R^4$ 、及び R^5 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであり；

(*)、(**)、及び(***)は炭素中心であり、前記炭素中心はR-立体配置若しくはS-立体配置にあり、若しくはアキラル中心であることが可能であり；

R²⁻¹、R²⁻²、若しくはR²⁻³のうちの少なくとも1つは任意選択で固相をさらに含む、
前記分子またはその塩。

前記炭素中心は、R - 立体配置にある、請求項 10 に記載の分子。

前記炭素中心は、S - 立体配置にある、請求項 10 に記載の分子。

固相を含む、請求項 10 に記載の分子または塩。

前記固相は、シリコン原子を含む、請求項 13 に記載の分子または塩。

請求項 1 に記載の少なくとも 2 個の分子または塩類を含むアレイ。

前記アレイは、約 1×10^{10} 基 / cm^2 から約 1×10^{14} 基 / cm^2 の前記アミノ基の比重を有する、請求項 15 に記載のアレイ。

前記分子または塩類は、立体濃縮される、またはラセミ体である、請求項15に記載のアレイ。

前記分子または塩類は、少なくとも約 10 %、20 %、30 %、40 %、50 %、60 %、70 %、80 %、85 %、90 %、95 %、96 %、97 %、98 %、99 %、または 100 % の不斉収率を有する、請求項 15 に記載のアレイ。

前記分子またはそれらの塩類の少なくともいくつかは、コーティングを形成し、前記コーティングは、約 1 オングストロームから約 25 オングストロームの厚さを有する、請求項 15 に記載のアレイ。

前記分子またはそれらの塩類は、架橋される、請求項 15 に記載のアレイ。

【補正対象書類名】明細書

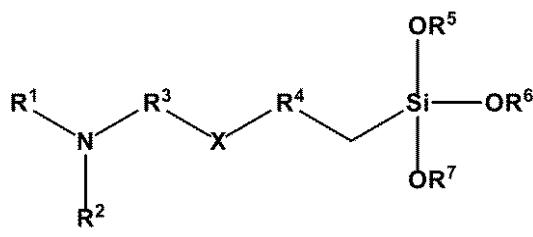
【補正方法】変更

【 0 0 0 2 】

発明の概要

本明細書に開示されるのは、以下の構造を有する分子またはそれらの塩類であり、

【化 1】



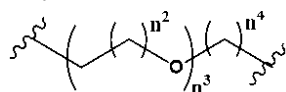
I.

式中、 R^1 及び R^2 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジ

ル、アシル、若しくは $-CO_2R^8$ であることが可能であり、 R^8 はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合される N は環を形成することが可能であり；または、 R^1 若しくは R^2 のうちの少なくとも 1 つはヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含むことが可能であり；

N から X に配向される R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであることが可能であり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^3 は $-(CR^9R^{10}CR^{11}R^{12})_n-$ であることが可能であり、 n は 1 から 100 であることが可能であり、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、及び R^{12} は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであることが可能であり；または R^3 は、

【化 2】



であることが可能であり、式中、 n^2 及び n^4 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、1、2、若しくは 3 であることが可能であり、 n^3 は 1 から 20 であることが可能であり；または R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノヘテロアルキル、及びアミドアルキルを含むポリマーであることが可能であり；

X は O、 NR^{13} 、若しくは S であることが可能であり、 R^{13} は水素若しくはアルキルであり；

R^4 は X から C へ配向され、アルキル、アルキルエーテル、及びアルキルチオエーテルであることが可能であり、アルキル、アルキルエーテル、及びアルキルチオエーテルのそれぞれは任意選択でヒドロキシル、チオール、アミノ、若しくはハロと置換されることが可能であり；

R^5 、 R^6 、及び R^7 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであることが可能であり；ならびに

R^5 、 R^6 、若しくは R^7 のうちの少なくとも 1 つは固相を任意選択でさらに含む。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

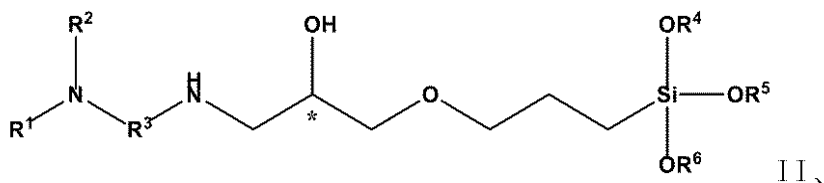
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0004】

また本明細書に開示されるのは、以下の構造を有する分子またはそれらの塩類であり、

【化 3】



式中、 R^1 及び R^2 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^8$ であることが可能であり、 R^8 はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合される N は環を形成することが可能であり；または、 R^1 若しくは R^2 のうちの少なくとも 1 つはヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含むことが可能であり；

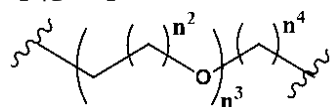
NR^1R^2 から NH に配向される R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであることが可能であり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^3 は

【化 4】



であることが可能であり、 n は 1 から 100 であることが可能であり、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであることが可能であり；または、式中、 R^3 は、

【化 5】



であることが可能であり、式中、 n^2 及び n^4 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、1、2、若しくは 3 であることが可能であり、 n^3 は 1 から 20 であることが可能であり；または R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、及びアミノ置換アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルを含むポリマー若しくは dendrimer であることが可能であり；

R^4 、 R^5 、及び R^6 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであることが可能であり；

(*) は炭素中心であり、当該炭素中心は R - 立体配置若しくは S - 立体配置にあることが可能であり；ならびに

R^4 、 R^5 、若しくは R^6 のうちの少なくとも 1 つは任意選択で固相をさらに含む。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0006

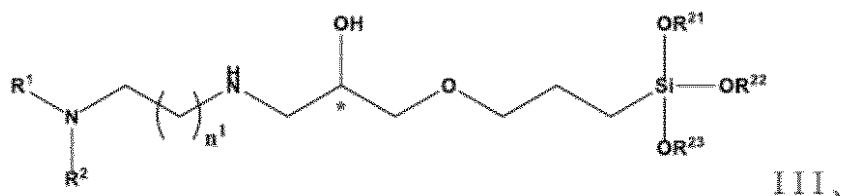
【補正方法】変更

【補正の内容】

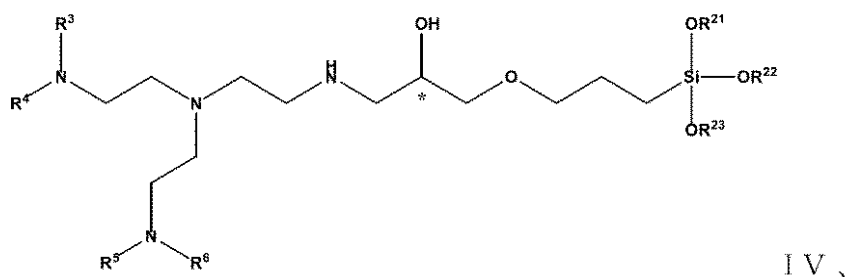
【 0 0 0 6 】

また本明細書に開示されるのは、以下の構造、

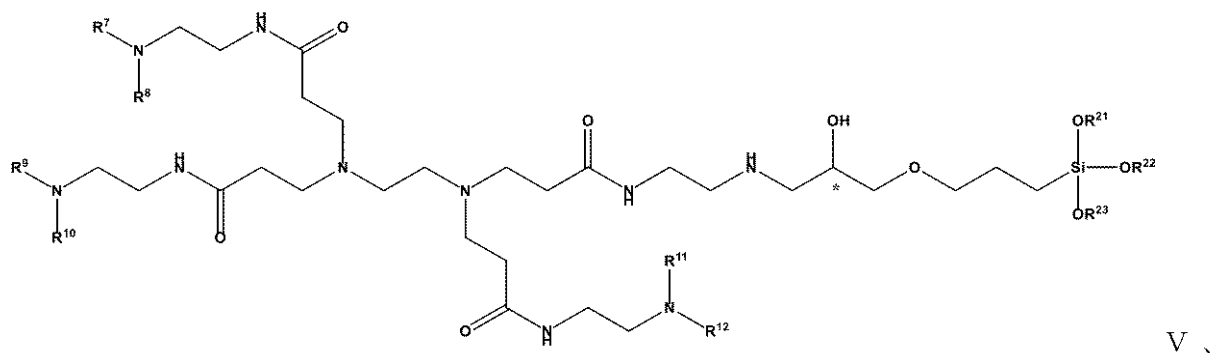
【 化 6 】



【 化 7 】

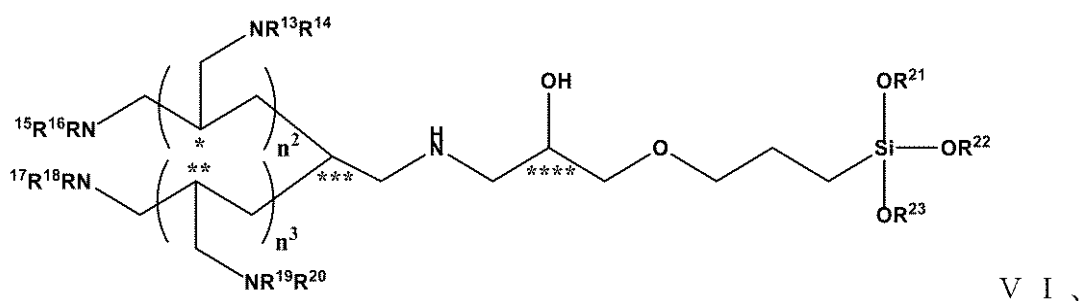


【 化 8 】



または

【 化 9 】



を有する分子またはそれらの塩類であり、式中、

 $n^1 = 1, 2, 3, 4, 5, 6$ 、若しくは7であることが可能であり； n^2 及び n^3 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、約1から約1000であることが可能であり；

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}$ 、及び R^{20} は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^{24}$ であることが可能であり、 R^{24} はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリール

シクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合される N は、 R^3 及び R^4 、及びそれらが結合される N は、 R^5 及び R^6 、及びそれらが結合される N は、 R^7 及び R^8 、及びそれらが結合される N は、 R^9 及び R^{10} 、及びそれらが結合される N は、 R^{11} 及び R^{12} 、及びそれらが結合される N は、 R^{13} 及び R^{14} 、及びそれらが結合される N は、 R^{15} 及び R^{16} 、及びそれらが結合される N は、 R^{17} 及び R^{18} 、及びそれらが結合される N は、ならびに R^{19} 及び R^{20} 、及びそれらが結合される N は環を独立して任意選択で形成し；

R^3 、 R^4 、及び R^5 は同一であることが可能であり、若しくは異なることが可能であり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであり；

(*)、(**)、及び(***)は炭素中心であり、当該炭素中心は、独立して R - 立体配置若しくは S - 立体配置にあることが可能である、若しくはアキラル中心であることが可能であり；

(****)は第二炭素中心であり、当該第二炭素中心は R - 立体配置若しくは S - 立体配置にあることが可能であり；ならびに

R^{21} 、 R^{22} 、若しくは R^{23} のうちの少なくとも 1 つは任意選択で固相をさらに含む。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

【補正の内容】

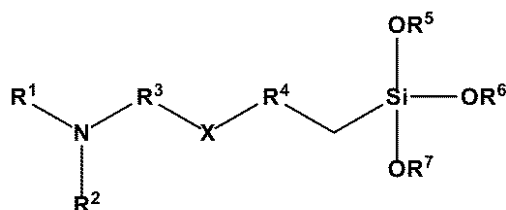
【0011】

本発明の態様をさらに記載する：

[項 1]

以下の構造を有する分子またはその塩であって、

【化 10】



式中、 R^1 及び R^2 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^8$ であり、 R^8 はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合される N は環を形成し；または R^1 若しくは R^2 のうちの少なくとも 1 つはヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプトイド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含み；

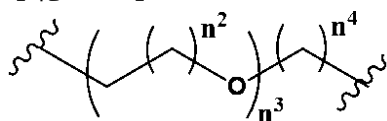
N から X に配向される R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^3 は

【化 11】



であり、 n は1から100であり、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、及び R^{12} は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり；または R^3 は、

【化12】



であり、式中、 n^2 及び n^4 は同一であり、若しくは異なり、独立して、1、2、若しくは3であり、 n^3 は1から20であり；または R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノヘテロアルキル、及びアミドアルキルを含むポリマーであり；

X はO、 NR^{13} 、若しくはSであり、 R^{13} は水素若しくはアルキルであり；

R^4 は X からCへ配向され、アルキル、アルキルエーテル、及びアルキルチオエーテルであり、アルキル、アルキルエーテル、及びアルキルチオエーテルのそれぞれは任意選択でヒドロキシル、チオール、アミノ、若しくはハロと置換され；

R^5 、 R^6 、及び R^7 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであり；ならびに

R^5 、 R^6 、若しくは R^7 のうちの少なくとも1つは任意選択で固相をさらに含む、前記分子またはその塩。

[項2]

固相を含む、上記項1に記載の分子またはその塩。

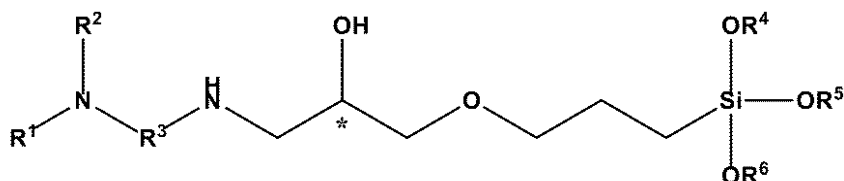
[項3]

前記固相は、シリコン原子を含む、上記項2に記載の分子またはその塩。

[項4]

以下の構造を有する分子またはその塩であって、

【化13】

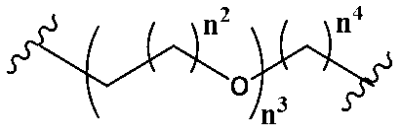


式中、 R^1 及び R^2 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^8$ であり、 R^8 はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合されるNは環を形成し；または、 R^1 若しくは R^2 のうちの少なくとも1つはヌクレオシド、ヌクレオチド、ポリヌクレオチド、ペプチド、ペプチド、サッカライド、ポリサッカライド、アプタマー若しくは抗体、若しくはそのフラグメントを含み；

NR^1R^2 からNHに配向される R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテロアルキルであり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換され；または R^3 は $-(CR^7R^8CR^9R^{10})_n-$ であり、 n は1から100であり、 R^7 、 R^8 、 R^9 、及び R^{10} は同一であり、若しくは異なり、水素、ハロ、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、アミノ置換アミドヘテ

ロアルキルであり；または R^3 は、

【化 1 4】



であり、

式中、 n^2 及び n^4 は同一であり、若しくは異なり、独立して、1、2、若しくは3であり、 n^3 は1から20であり；または R^3 はアルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、及びアミノ置換アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、若しくはアミノ置換アミドヘテロアルキルを含むポリマー若しくはデンドリマーであり；

R^4 、 R^5 、及び R^6 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであり；

(*) は炭素中心であり、前記炭素中心は R - 立体配置若しくは S - 立体配置にあり；ならびに

R^4 、 R^5 、若しくは R^6 のうちの少なくとも1つは任意選択で固相をさらに含む、前記分子またはその塩。

[項 5]

前記炭素中心は、R - 立体配置にある、上記項 4 に記載の分子またはその塩。

[項 6]

前記炭素中心は、S - 立体配置にある、上記項 4 に記載の分子またはその塩。

[項 7]

前記固相を含む、上記項 4 から 6 のいずれか 1 項に記載の分子またはその塩。

[項 8]

前記固相は、シリコン原子を含む、上記項 7 に記載の分子または塩。

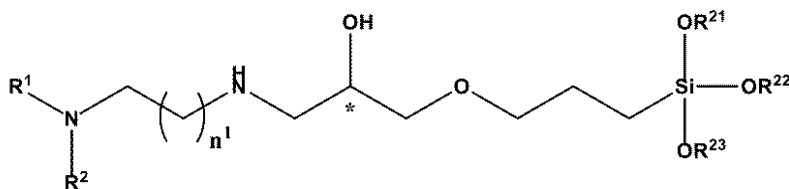
[項 9]

R^3 は、アルキル、アミノヘテロアルキル、ポリアミドアミノアルキル、またはポリアミノアルキルである、上記項 4 から 8 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

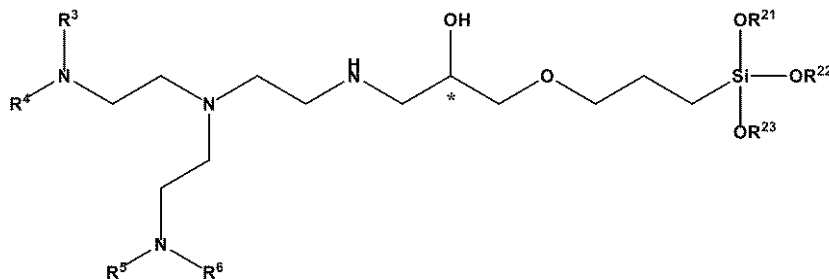
[項 1 0]

以下の構造を有する分子またはその塩であって、

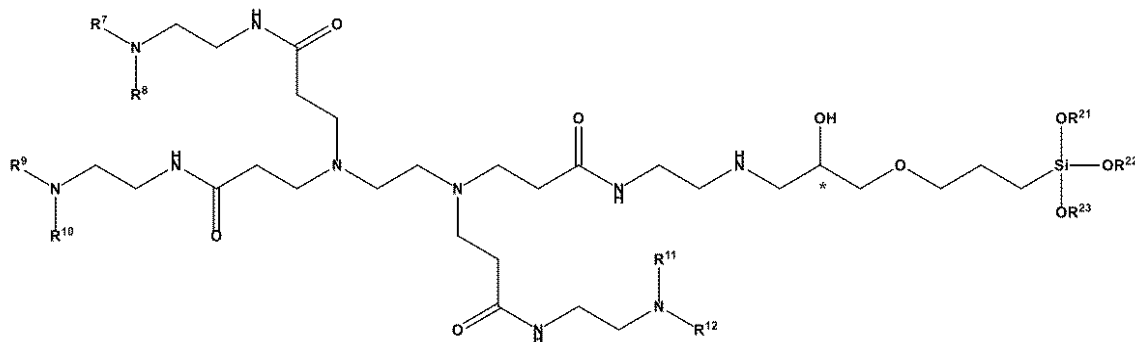
【化 1 5】



【化 1 6】

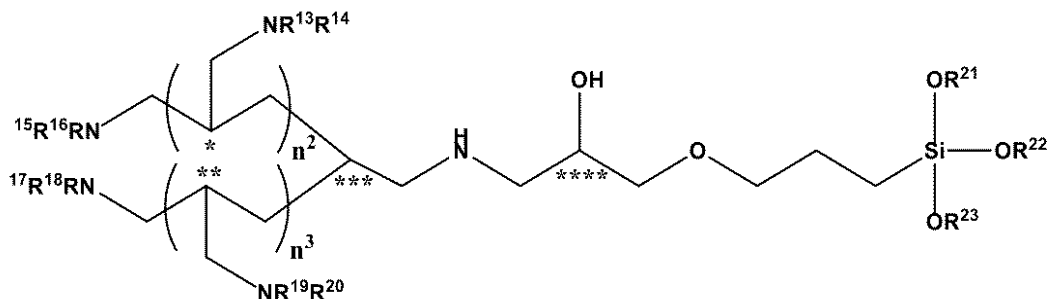


【化 1 7】



または

【化 1 8】



式中、 $n^1 = 1, 2, 3, 4, 5, 6$ 、若しくは7であり；

n^2 及び n^3 は同一であり、若しくは異なり、独立して、約1から約1000であり；

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}$ 、及び R^{20} は同一であり、若しくは異なり、水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アルキニル、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、スルホンアミジル、アシル、若しくは $-CO_2R^{24}$ であり、 R^{24} はアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、ハロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、若しくはアリールシクロアルキルアルキルであり；または R^1 及び R^2 、及びそれらが結合されるNは、 R^3 及び R^4 、及びそれらが結合されるNは、 R^5 及び R^6 、及びそれらが結合されるNは、 R^7 及び R^8 、及びそれらが結合されるNは、 R^9 及び R^{10} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{11} 及び R^{12} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{13} 及び R^{14} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{15} 及び R^{16} 、及びそれらが結合されるNは、 R^{17} 及び R^{18} 、及びそれらが結合されるNは、ならびに R^{19} 及び R^{20} 、及びそれらが結合されるNは独立して任意選択で環を形成し；

R^3, R^4 、及び R^5 は同一であり、若しくは異なり、独立して、水素、アルキル、シリル、若しくはシロキシであり；

(*)、(**)、及び(***)は炭素中心であり、前記炭素中心はR-立体配置若しくはS-立体配置にあり、若しくはアキラル中心であることが可能であり；

(****)は第二炭素中心であり、前記第二炭素中心はR-立体配置若しくはS-立体配置にあり；ならびに

R^{21}, R^{22} 、若しくは R^{23} のうちの少なくとも1つは任意選択で固相をさらに含む、

前記分子またはその塩。

[項 1 1]

前記炭素中心は、R-立体配置にある、上記項10に記載の分子。

[項 1 2]

前記炭素中心は、S-立体配置にある、上記項10に記載の分子。

[項 1 3]

固相を含む、上記項 1 0 から 1 2 のいずれか 1 項に記載の分子または塩。

[項 1 4]

前記固相は、シリコン原子を含む、上記項 1 3 に記載の分子または塩。

[項 1 5]

上記項 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の分子または塩を合成する方法であって、

a . 固体基質と第一分子との間に酸素 - シリコン共有結合を形成することであって、

i . 第一末端に前記シリコン、及び第二末端にエポキシド、イソシアネート、またはチオイソシアネート、

を含む、前記酸素 - シリコン共有結合を形成すること、

b . 前記エポキシド、イソシアネート、またはチオイソシアネートの炭素原子と、アミノ基を含む第二分子との間に Y - 炭素共有結合を形成すること、

を備え、

Y は窒素、酸素、硫黄、またはセレンであり、

前記エポキシド、イソシアネート、またはイソチオシアネート及び前記シリコンはアルキル、アルキルエーテル、またはアルキルチオエーテルを含む基により結合され、アルキル、アルキルエーテル、またはアルキルチオエーテルのそれぞれはヒドロキシル、チオール、アミノ、またはハロと任意選択で置換される、

前記方法。

[項 1 6]

前記第二分子は、アルキルアミン、ヘテロアルキルアミン、アミノ置換アルキルアミン、アミノ置換ヘテロアルキルアミン、アミドアルキルアミン、アミドヘテロアルキルアミン、アミノ置換アミドヘテロアルキルアミンであり、アルキル、ヘテロアルキル、アミノ置換アルキル、アミノ置換ヘテロアルキル、アミドアルキル、アミドヘテロアルキル、またはアミノ置換アミドヘテロアルキルとそれぞれ任意選択で置換される、上記項 1 5 に記載の方法。

[項 1 7]

前記酸素 - シリコン結合を形成することは、堆積反応を含む、上記項 1 5 または 1 6 に記載の方法。

[項 1 8]

前記堆積反応は、気相において実施される、上記項 1 7 に記載の方法。

[項 1 9]

前記堆積反応は、化学蒸着反応を含む、上記項 1 8 に記載の方法。

[項 2 0]

前記化学蒸着反応は、昇温した温度で起こる、上記項 1 9 に記載の方法。

[項 2 1]

前記昇温した温度は、少なくとも約 1 0 0 、 1 1 0 、 1 2 0 、 1 3 0 、 1 4 0 、または 1 5 0 である、上記項 2 0 に記載の方法。

[項 2 2]

ステップ b は、希釈液の使用をさらに備える、上記項 1 5 から 2 1 のいずれか 1 項に記載の方法。

[項 2 3]

前記希釈液は、アルコールである、上記項 2 2 に記載の方法。

[項 2 4]

前記アルコールは、イソプロピルアルコールである、上記項 2 3 に記載の方法。

[項 2 5]

前記第一分子は、3 - グリシドキシプロピルトリメトキシシラン (G P T M S) である、上記項 1 5 または 2 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

[項 2 6]

前記第二分子は、エチレンジアミン (E D A) 、 (エチレンジオキシ) ビス (エチルア

ミン) (EDBA)、トリス(2-アミノエチル)アミン(TAEA)、ポリアミドアミン(PAAM)、またはポリアリルアミン(PAAm)である、上記項15から25のいずれか1項に記載の方法。

[項27]

前記第二分子は、PAAmである、上記項26に記載の方法。

[項28]

前記PAAmは、約1KDaから約100KDaの平均分子量を有する、上記項27に記載の方法。

[項29]

前記第二分子は、約100 から300 の沸点を有する、上記項15から28のいずれか1項に記載の方法。

[項30]

前記アミノ基を保護アミノ酸またはその塩にカップリングすることをさらに備える、上記項15から29のいずれか1項に記載の方法。

[項31]

前記保護アミノ酸は、tert-ブチルカルバメート(Boc)-、または9-フルオレニルメチルカルバメート(Fmoc)-保護アミノ酸である、上記項30に記載の方法。

[項32]

前記アミノ酸は、グリシンである、上記項30または31に記載の方法。

[項33]

上記項1から14のいずれか1項に記載の2個以上の分子または塩類を含むアミノコーティング。

[項34]

上記項33に記載のアミノコーティングのアミノ基比重を調整する方法。

[項35]

上記項1から14のいずれか1項に記載の少なくとも2個の分子または塩類を含むアレイ。

[項36]

前記アレイは、約 1×10^{10} 基/cm²から約 1×10^{14} 基/cm²の前記アミノ基の比重を有する、上記項35に記載のアレイ。

[項37]

前記分子または塩類は、立体濃縮される、またはラセミ体である、上記項35または36に記載のアレイ。

[項38]

前記分子または塩類は、少なくとも約10%、20%、30%、40%、50%、60%、70%、80%、85%、90%、95%、96%、97%、98%、99%、または100%の不斉収率を有する、上記項35から37のいずれか1項に記載のアレイ。

[項39]

前記分子またはそれらの塩類の少なくともいくつかは、コーティングを形成し、前記コーティングは、約1オングストロームから約25オングストロームの厚さを有する、上記項35から38のいずれか1項に記載のアレイ。

[項40]

前記分子またはそれらの塩類は、架橋される、上記項35から39のいずれか1項に記載のアレイ。

[項41]

使用のための説明書をさらに有する、上記項35から40のいずれか1項に記載のアレイ。

[項42]

上記項1から14のいずれか1項に記載の分子または塩を基質と会合させることを備え

る、アレイを作製する方法。

[項 4 3]

上記項 2 0 から 3 2 のいずれか 1 項に記載の方法を備える、アレイを作製する方法。

[項 4 4]

前記アレイは、約 1×10^{10} 基 / cm^2 から約 1×10^{14} 基 / cm^2 の前記アミノ基の比重を有する、上記項 4 2 または 4 3 に記載の方法。

[項 4 5]

前記アミノ基の前記比重を前記アレイ上で調整することを備える、上記項 4 2 から 4 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

[項 4 6]

上記項 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の分子または塩、及び使用のための説明書を有する、キット。

[項 4 7]

上記項 3 5 から 4 1 のいずれか 1 項に記載のアレイ、及び使用のための説明書を有する、前記キット。

[項 4 8]

結合部分をさらに含む、上記項 4 6 または 4 7 に記載のキット。

[項 4 9]

前記結合部分は、抗体を含む、上記項 4 8 に記載のキット。

[項 5 0]

前記結合部分は、シグナルを発する、上記項 4 8 または 4 9 に記載のキット。

[項 5 1]

上記項 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の分子または塩によってキットを形成することを備える、前記キットを作製する方法。

[項 5 2]

上記項 1 5 から 3 2 のいずれか 1 項に記載のプロセスによって作製される分子またはその塩。

[項 5 3]

上記項 4 2 から 4 5 のいずれか 1 項に記載のプロセスによって作製されるアレイ。

参照による援用

本明細書におけるすべての刊行物、特許、及び特許出願は、参照によりそれらの全体が援用される。本明細書における用語と、援用された参照における用語との間に抵触がある場合には、本明細書における用語を優先する。

【 手続補正 6 】

【 補正対象書類名 】 明細書

【 補正対象項目名 】 0 0 3 5

【 補正方法 】 変更

【 補正の内容 】

【 0 0 3 5 】

別段に示されない限り、本明細書に定義されるような、それ自体によって、または別の基の部分として、本明細書に用いられる用語としての「アシル」は、カルボニル

【 化 1 9 】



基に連結される有機ラジカルを指すことが可能である。アシル基の例は、アルカノイル、アルケノイル、アロイル、アラルカノイル (aralkanoyl)、ヘテロアロイル、シクロアルカノイル、シクロヘテロアルカノイル及び同様のものなどの、カルボニルに付着する R 基のいずれかを含む。