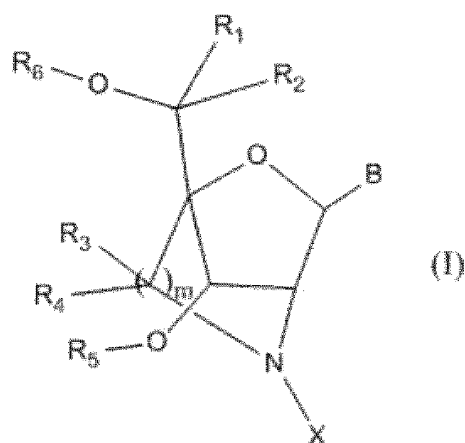


請求の範囲

[請求項1] 一般式 I :

[化1]



[式中、

Bは、1つ以上の置換基で置換されていてもよい核酸の塩基部分であり；

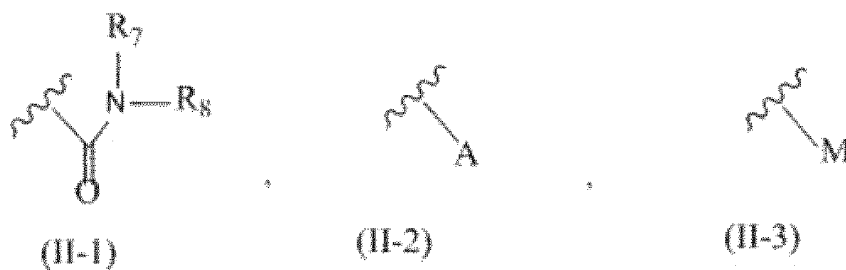
R₁、R₂、R₃およびR₄は各々独立して、水素原子、または1つ以上の置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基であり；

R₅およびR₆は各々独立して、水素原子、水酸基の保護基、または置換されてもよいリン酸基であり；

mは、1または2であり；

Xは、下記式 (II-1)、(II-2)、または (II-3) :

[化2]



で示される基であり；

式 (I I - 1)、(I I - 2)、または (I I - 3) 中に記載の記号 :

[化3]



は、2'-アミノ基との結合点を示し ;

R_7 および R_8 は各々独立して、水素原子、1つ以上の置換基で置換されてもよい C_{1-6} アルキル基、1つ以上の置換基で置換されてもよい C_{2-6} アルケニル基、1つ以上の置換基で置換されてもよい C_{2-6} アルキニル基、または1つ以上の置換基で置換されていてもよい芳香族基であり ;

A は芳香族基であり ;

M は、1つ以上の置換基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基および1つ以上の置換基で置換されていてもよい芳香族基からなる群から選ばれる1つの置換基で置換された、スルホニル基である。]
で示される化合物、またはその塩。

[請求項2] B が、1つ以上の保護基を有してもよいアデニル、1つ以上の保護基を有してもよいグアニル、1つ以上の保護基を有してもよいシトシニル、1つ以上の保護基を有してもよい5-メチルシトシニルまたは1つ以上の保護基を有してもよいウラシルである、請求項1記載の化合物、またはその塩。

[請求項3] R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 が各々独立して、水素原子であり ;
m が、1である、

請求項1または2に記載の化合物、またはその塩。

[請求項4] X が、式 (I I - 1) で示される基であり ; そして、

R_7 および R_8 が各々独立して、水素原子、1つ以上の置換基で置換されてもよい C_{1-6} アルキル基、または1つ以上の置換基で置換されていてもよい芳香族基である、

請求項1~3のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

- [請求項5] R_7 および R_8 が各々独立して、水素原子、1つ以上の置換基で置換されてもよい C_{1-3} アルキル基である、請求項4に記載の化合物、またはその塩。
- [請求項6] R_7 および R_8 の一方が水素原子であり、他方がメチル基である、請求項5に記載の化合物、またはその塩。
- [請求項7] R_7 および R_8 の一方が水素原子であり、他方がイソプロピル基である、請求項5に記載の化合物、またはその塩。
- [請求項8] X が、式(11-2)で示される基であり；そして、
 A が、1つ以上の置換基で置換されていてもよい、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる1つ以上のヘテロ原子を含む、5または6員環のヘテロアリール基である、
請求項1～3のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。
- [請求項9] A が、1つ以上の置換基で置換されていてもよい、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも2つの窒素原子を含めた2または3つのヘテロ原子を含む5または6員環のヘテロアリール基であって、該置換基が各々独立して、1つ以上のハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-3} アルキル基、ハロゲン原子、および1つ以上の C_{1-3} アルキル基で置換されていてもよいアミノ基からなる群から選ばれる、請求項8に記載の化合物、またはその塩。
- [請求項10] 5または6員環のヘテロアリール基が、1つ以上の置換基で置換されていてもよい、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、ピリミジニル基、およびピラジニル基からなる群から選ばれる、請求項9に記載の化合物、またはその塩。
- [請求項11] 1つ以上の置換基で置換されていてもよいトリアゾリル基が、1,5-ジメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル基である、請求項10に記載の化合物、またはその塩。
- [請求項12] 1つ以上の置換基で置換されていてもよいオキサジアゾリル基が、5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル基である、請

求項10記載の化合物、またはその塩。

[請求項13] 1つ以上の置換基で置換されていてもよいチアジアゾール基が、3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル基である、請求項10記載の化合物、またはその塩。

[請求項14] Xが、式(11-3)で示される基であり；そして、
Mが、1つ以上の置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基および1つ以上の置換基で置換されていてもよいアリール基からなる群から選ばれる1つの置換基で置換されたスルホニル基である、
請求項1～3のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

[請求項15] Mが、メチル基およびフェニル基からなる群から選ばれる1つの置換基で置換された、スルホニル基である、請求項14記載の化合物、またはその塩。

[請求項16] R₆が水素原子またはDMTr基であり、そしてR₅が水素原子または-P(O(CH₂)₂CN)(N(iPr)₂)である、請求項1～15のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

[請求項17] 以下の化合物：

3-[[(1R, 4R, 6R, 7S)-4-[[ビス(4-メトキシフェニル)-フェニル-メトキシ]メチル]-6-(5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル)-2-メチルスルホニル-5-オキサ-2-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-7-イル]オキシ-(ジイソプロピルアミノ)ホスファニル]オキシプロパンニトリル

N- [1- [(1R, 3R, 4R, 7S)-1- [[ビス(4-メトキシフェニル)-フェニル-メトキシ]メチル]-7- [2-シアノエトキシ-(ジイソプロピルアミノ)ホスファニル]オキシ-5-メチルスルホニル-2-オキサ-5-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-3-イル]-5-メチル-2-オキソ-ピリミジン-4-イル]ベンズアミド；

[9-[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス(4-メトキシフェニル)-フェニルメトキシ]メチル]-7-[2-シアノエトキシ-(ジイソプロピルアミノ)ホスファニル]オキシ-5-メチルスルホニル-2-オキサ-5-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-3-イル]-2-(2-メチルプロパノイルアミノ)プリン-6-イル] N, N-ジフェニルカルバメート;

N-[9-[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス(4-メトキシフェニル)-フェニルメトキシ]メチル]-7-[2-シアノエトキシ-(ジイソプロピルアミノ)ホスファニル]オキシ-5-メチルスルホニル-2-オキサ-5-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-3-イル]-プリン-6-イル]ベンズアミド;

3-[[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 5 - (ベンゼンスルホニル) - 1 - [[ビス(4-メトキシフェニル)-フェニルメトキシ]メチル]-3-(5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル)-2-オキサ-5-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-7-イル]オキシ-(ジイソプロニルアミノ)ホスファニル]オキシプロパンニトリル;

N-[1-[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 5 - (ベンゼンスルホニル) - 1 - [[ビス(4-メトキシフェニル)-フェニルメトキシ]メチル]-7-[2-シアノエトキシ-(ジイソプロピルアミノ)ホスファニル]オキシ-2-オキサ-5-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-3-イル]-5-メチル-2-オキソ-ピリミジン-4-イル]ベンズアミド;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス(4-メトキシフェニル)-フェニルメトキシ]メチル]-7-[2-シアノエトキシ-(ジイソプロピルアミノ)ホスファニル]オキシ-N-メチル-3-(5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル)-2-オキサ-5-アザビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-5-カルボキサミド

;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 3 - (4 - ベンズアミド - 5 - メチル - 2 - オキソ - ピリミジン - 1 - イル) - 1 - [[ビス (4 - メトキシフェニル) - フェニルメトキシ] メチル] - 7 - [2 - シアノエトキシ - (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ - N - メチル - 2 - オキサ - 5 - アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン - 5 - カルボキサミド ;

[9 - [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス (4 - メトキシフェニル) - フェニルメトキシ] メチル] - 7 - [2 - シアノエトキシ - (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ - 5 - (メチルカルバモイル) - 2 - オキサ - 5 - アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン - 3 - イル] - 2 - (2 - メチルプロパノイルアミノ) プリン - 6 - イル] N, N - ジフェニルカルバメート ;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 3 - (6 - ベンズアミドプリン - 9 - イル) - 1 - [[ビス (4 - メトキシフェニル) フェニルメトキシ] メチル] - 7 - [2 - シアノエトキシ - (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ - N - メチル - 2 - オキサ - 5 - アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン - 5 - カルボキサミド ;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス (4 - メトキシフェニル) フェニルメトキシ] メチル] - 7 - [2 - シアノエトキシ - (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ - N - イソプロピル - 3 - (5 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - ピリミジン - 1 - イル) - 2 - オキサ - 5 - アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン - 5 - カルボキサミド ;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 3 - (4 - ベンズアミド - 5 - メチル - 2 - オキソピリミジン - 1 - イル) - 1 - [[ビス (4 - メトキシフェニル) フェニルメトキシ] メチル] - 7 - [2 - シアノエトキシ - (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ - N - イソプロ

ピル-2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-5-カルボキサミド;

[9- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5- (イソプロピルカルバモイル) -2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-イル] -2- (2-メチルプロパノイルアミノ) プリン-6-イル] N, N-ジフェニルカルバメート;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -3- (6-ベンズアミドプリン-9-イル) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-N-イソプロピル-2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-5-カルボキサミド;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-N, N-ジメチル-3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) -2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-5-カルボキサミド;

(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -3- (4-ベンズアミド-5-メチル-2-オキソ-ピリミジン-1-イル) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-N, N-ジメチル-2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-5-カルボキサミド;

3- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) -5-ピリミジン-2-イル

－2－オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン－7－イル
] オキシ－ (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシプロパン
ニトリル；

1－ [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S)－1－ [[ビス (4－メトキシ
フェニル)－フェニルメトキシ] メチル]－7－ [2－シアノエトキシ
－ (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ－5－ピリミジン
－2－イル－2－オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタ
ン－3－イル]－5－メチル－2－オキソ－ピリミジン－4－イル]
ベンズアミド；

N'－ [9－ (1 R, 3 R, 4 R, 7 S)－1－ [[ビス (4－メ
トキシフェニル)－フェニルメトキシ] メチル]－7－ [2－シアノ
エトキシ－ (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ－5－ピ
リミジン－2－イル－2－オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1]
ヘプタン－3－イル]－6－オキソ－1 H－プリン－2－イル]－N
, N－ジメチル－6－ホルムアミジン；

N'－ [9－ (1 R, 3 R, 4 R, 7 S)－1－ [[ビス (4－メ
トキシフェニル)－フェニルメトキシ] メチル]－7－ [2－シアノ
エトキシ－ (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ－5－ピ
リミジン－2－イル－2－オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1]
ヘプタン－3－イル] プリン－6－イル] ベンズアミド；

3－ [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S)－1－ [[ビス (4－メトキシ
フェニル)－フェニルメトキシ] メチル]－3－ (5－メチル－2
, 4－ジオキソ－ピリミジン－1－イル)－5－ピリミジン－4－イ
ル－2－オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン－7－イ
ル] オキシ－ (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシプロパ
ンニトリル；

N－ [1－ [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S)－1－ [[ビス (4－メ
トキシフェニル)－フェニルメトキシ] メチル]－7－ [2－シア

ノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5-
ピリミジン-4-イル-2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1
] ヘプタン-3-イル] -5-メチル-2-オキソ-ピリミジン-4-
イル] ベンズアミド;

3- [[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシ
フェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] -3- (5-メチル-
2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) -5- [4- (トリフル
オロメチル) ピリミジン-2-イル] -2-オキサ-5-アザビシク
ロ [2. 2. 1] ヘプタン-7-イル] オキシ- (ジイソプロピルア
ミノ) ホスファニル] オキシプロパンニトリル;

N- [1- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メ
トキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] -7- [2-シア
ノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5-
[4- (トリフルオロメチル) ピリミジン-2-イル] -2-オキサ
-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-イル] -5-メチ
ル-2-オキソ-ピリミジン-4-イル] ベンズアミド;

3- [[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシ
フェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] -5- (5-クロロピ
リミジン-2-イル) -3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリ
ミジン-1-イル) -2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1]
ヘプタン-7-イル] オキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニ
ル] オキシプロパンニトリル;

N- [1- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メ
トキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] -5- (5-クロ
ロピリミジン-2-イル) -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプ
ロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-2-オキサ-5-アザビシク
ロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-イル] -5-メチル-ピリミジン-
4-イル] ベンズアミド;

3- [[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] - 5 - [6- (ジメチルアミノ) ピリミジン-4-イル] - 3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) - 2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-7-イル] オキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシプロパンニトリル ;

N- [1- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] - 7- [2-シアノトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5- [(6-ジメチルアミノ) ピリミジン-4-イル] - 2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-イル] - 5-メチル-2-オキソ-ピリミジン-4-イル] ベンズアミド ;

3- [[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] - 5 - [2- (ジメチルアミノ) ピリミジン-4-イル] - 3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) - 2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-7-イル] オキシ- (ジイソプロピルアミノ) オキシプロパンニトリル ;

N- [1- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] - 7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5- [2- (ジメチルアミノ) ピリミジン-4-イル] - 7-ヒドロキシ-2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-イル] - 5-メチル-2-オキソ-ピリミジン-4-イル] ベンズアミド ;

3- [1- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) - 1 - [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] - 3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) - 5-ピラジン-2

－イル－2－オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン－7
－イル] オキシ－（ジイソプロピルアミノ）ホスファニル] オキシプロ
ロパンニトリル；

N－[1－[(1R, 3R, 4R, 7S)－1－[[ビス(4－メ
トキシフェニル)－フェニル－メトキシ]メチル]－7－[2－シア
ノエトキシ－（ジイソプロピルアミノ）ホスファニル] オキシ－5－
ピラジン－2－イル－2－オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1]
ヘプタン－3－イル]－5－メチル－2－オキソ－ピリミジン－4－
イル] ベンズアミド；

3－[[(1R, 3R, 4R, 7S)－1－[[ビス(4－メトキ
シフェニル)－フェニル－メトキシ]メチル]－5－(1, 5－ジメ
チル－1, 2, 4－トリアゾール－3－イル)－3－(5－メチル－2
, 4－ジオキソ－ピリミジン－1－イル)－2－オキサ－5－アザビ
シクロ [2. 2. 1] ヘプタン－7－イル] オキシ－（ジイソプロピ
ルアミノ）ホスファニル] オキシプロパンニトリル；

N－[1－[(1R, 3R, 4R, 7S)－1－[[ビス(4－メ
トキシフェニル)－フェニル－メトキシ]メチル]－7－[2－シア
ノエトキシ－（ジイソプロピルアミノ）ホスファニル] オキシ－5－
(1, 5－ジメチル－1, 2, 4－トリアゾール－3－イル)－2－オ
キサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン－3－イル]－5－
メチル－2－オキソ－ピリミジン－4－イル] ベンズアミド；

N'－[9－[(1R, 3R, 4R, 7S)－1－[[ビス(4－
メトキシフェニル)－フェニル－メトキシ]メチル]－7－[2－シア
ノエトキシ－（ジイソプロピルアミノ）ホスファニル] オキシ－5
－(1, 5－ジメチル－1, 2, 4－トリアゾール－3－イル)－2－
オキサ－5－アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン－3－イル]－6
－オキソ－1H－プリン－2－イル]－N, N－ジメチル－ホルムア
ミジン

N- [9- (1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5- (1, 5-ジメチル-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル) -2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-イル] プリン-6-イル] ベンズアミド;

3- [[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) -5- (5-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) -2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-7-イル] オキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシプロパンニトリル;

N- [1- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニルメトキシ] メチル] -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5- (5-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル) -2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-イル] -5-メチル-2-オキソ-ピリミジン-4-イル] ベンズアミド;

3- [[(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] -3- (5-メチル-2, 4-ジオキソ-ピリミジン-1-イル) -5- (3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) -2-オキサ-5-アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-7-イル] オキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシプロパンニトリル;

N- [1- [(1 R, 3 R, 4 R, 7 S) -1- [[ビス (4-メトキシフェニル) -フェニル-メトキシ] メチル] -7- [2-シアノエトキシ- (ジイソプロピルアミノ) ホスファニル] オキシ-5- (3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) -2-オキサ-

－5－アザビシクロ〔2. 2. 1〕ヘプタン－3－イル〕－5－メチル－2－オキソ－ピリミジン－4－イル〕ベンズアミド；

N－〔1－〔（1 R, 3 R, 4 R, 7 S）－1－〔〔ビス（4－メトキシフェニル）－フェニル－メトキシ〕メチル〕－7－ヒドロキシ－5－メチルスルホニル－2－オキサ－5－アザビシクロ〔2. 2. 1〕ヘプタン－3－イル〕－5－メチル－2－オキソ－ピリミジン－4－イル〕ジヒドロピリミジン－2－オン；

N'－〔9－〔（1 R, 3 R, 4 R, 7 S）－1－〔〔ビス（4－メトキシフェニル）－フェニル－メトキシ〕メチル〕－7－〔2－シアオノエトキシー（ジイソプロピルアミノ）ホスファニル〕オキシ－5－メチルスルホニル－2－オキサ－5－アザビシクロ〔2. 2. 1〕ヘプタン－3－イル〕－6－オキソ－1 H－プリン－2－イル〕－N, N－ジメチルホルムアミジン；

N－〔9－〔（1 R, 3 R, 4 R, 7 S）－1－〔〔ビス（4－メトキシフェニル）－フェニル－メトキシ〕メチル〕－7－〔2－シアオノエトキシー（ジイソプロピルアミノ）ホスファニル〕オキシ－5－メチルスルホニル－2－オキサ－5－アザビシクロ〔2. 2. 1〕ヘプタン－3－イル〕－6－オキソ－1 H－プリン－2－イル〕－2－メチル－プロパンアミド；および

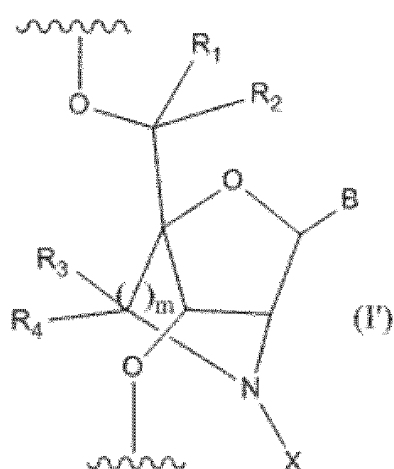
N－〔9－〔（1 R, 3 R, 4 R, 7 S）－1－〔〔ビス（4－メトキシフェニル）－フェニル－メトキシ〕メチル〕－7－ヒドロキシ－5－メチルスルホニル－2－オキサ－5－アザビシクロ〔2. 2. 1〕ヘプタン－3－イル〕－6－オキソ－1 H－プリン－2－イル〕－2－メチル－プロパンアミド、

からなる群から選ばれる化合物。

[請求項18]

一般式（I'）：

[化4]



[式中、

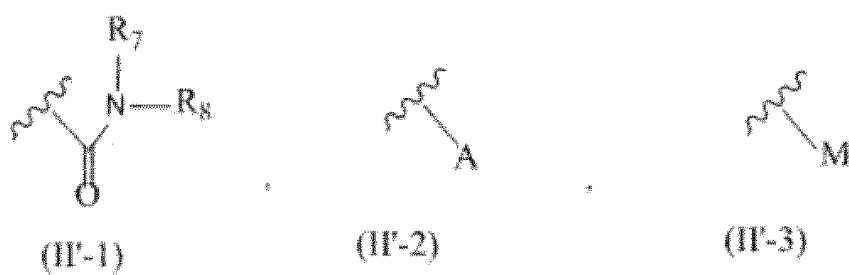
Bは、1つ以上の置換基で置換されていてもよい核酸の塩基部分であり；

R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は各々独立して、水素原子、または1つ以上の置換基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基であり；

m は、1または2であり；

Xは、下記式(II'-1)、(II'-2)、または(II'-3)：

[化5]



で示される基であり；

式(II'-1)、(II'-2)、または(II'-3)中に記載の記号：

[化6]



は2'-アミノ基との結合点を示し；

Aは、1つ以上の置換基で置換されていてもよい、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる1つ以上のヘテロ原子を含む、芳香族基であり；

Mは、1つ以上の置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基および1つ以上の置換基で置換されていてもよい芳香族基からなる群から選ばれる1つの置換基で置換された、スルホニル基である。]

で示されるヌクレオシドを1つ以上有しているオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。

[請求項19] Bが、1つ以上の保護基を有してもよいアデニル、1つ以上の保護基を有してもよいグアニル、1つ以上の保護基を有してもよいシトシニル、1つ以上の保護基を有してもよい5-メチルシトシニルまたは1つ以上の保護基を有してもよいウラシルである、請求項18記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。

[請求項20] R₁、R₂、R₃およびR₄が各々独立して、水素原子であり；
mが、1である、
請求項18または19に記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。

[請求項21] Xが、式(II'-1)で示される基であり；そして、
R₇およびR₈が各々独立して、水素原子、1つ以上の置換基で置換されてもよいC₁₋₆アルキル基、または1つ以上の置換基で置換されていてもよい芳香族基である、
請求項18～20のいずれか1つに記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。

[請求項22] R₇およびR₈が各々独立して、水素原子、1つ以上の置換基で置換されてもよいC₁₋₃アルキル基である、請求項21に記載のオリゴ

ヌクレオチド化合物、またはその塩。

- [請求項23] R_7 および R_8 の一方が水素原子であり、他方がメチル基である、請求項22に記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。
- [請求項24] R_7 および R_8 の一方が水素原子であり、他方がイソプロピル基である、請求項23に記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。
- [請求項25] Xが、式(11'-2)で示される基であり；そして、
Aが、1つ以上の置換基で置換されていてもよい、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる1つ以上のヘテロ原子を含む、5または6員環のヘテロアリール基である、
請求項18～20のいずれか1つに記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。
- [請求項26] Aが、1つ以上の置換基で置換されていてもよい、窒素原子、酸素原子および硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも2つの窒素原子を含めた2または3つのヘテロ原子を含む5または6員環のヘテロアリール基であって、該置換基が各々独立して、1つ以上のハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-3} アルキル基、ハロゲン原子、および1つ以上の C_{1-3} アルキル基で置換されていてもよいアミノ基からなる群から選ばれる、請求項25に記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。
- [請求項27] 5または6員環のヘテロアリール基が、1つ以上の置換基で置換されていてもよい、トリアゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、ピリミジニル基、およびピラジニル基からなる群から選ばれる、請求項26に記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。
- [請求項28] 1つ以上の置換基で置換されていてもよいトリアゾリル基が、1,5-ジメチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル基である、請求項27に記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。
- [請求項29] 1つ以上の置換基で置換されていてもよいオキサジアゾリル基が、

5-メチル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル基である、請求項27記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。

[請求項30] 1つ以上の置換基で置換されていてもよいチアジアゾリル基が、3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル基である、請求項27記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。

[請求項31] Xが、式(I I' -3)で示される基であり；そして、
Mが、1つ以上の置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキル基および1つ以上の置換基で置換されていてもよいアリール基からなる群から選ばれる1つの置換基で置換されたスルホニル基である、請求項18~20のいずれか1つに記載のオリゴヌクレオチド化合物、またはその塩。

[請求項32] Mが、メチル基およびフェニル基からなる群から選ばれる1つの置換基で置換された、スルホニル基である、請求項18~31のいずれか1つに記載の化合物、またはその塩。

[請求項33] ヌクレオチド間のリン酸結合の少なくとも1つ以上が、ホスホロチオエート結合である、硫黄化された請求項1~32のいずれかに記載のオリゴヌクレオチド、またはその塩。