(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2019年11月14日(14.11.2019)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2019/216433 A1

(51) 国際特許分類:
C07F 9/6558 (2006.01) *C07H 21/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号： PCT/JP2019/018828

(22) 国際出願日： 2019年5月10日(10.05.2019)

(25) 国際出願の言語： 日本語

(26) 国際公開の言語： 日本語

(30) 優先権データ：
特願 2018-091231 2018年5月10日(10.05.2018) JP

(71) 出願人: 日本新薬株式会社(**NIPPON SHINYAKU CO., LTD.**) [JP/JP]; 〒6018550 京都府京都市南区吉祥院西ノ庄門口町１４番地 Kyoto (JP).

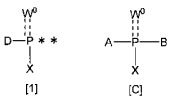
(72) 発明者: 壽 悠太朗 (**KOTOBUKI Yutaro**); 〒3050003 茨城県つくば市桜三丁目１４－１ 日本新薬株式会社内 Ibaraki (JP). 浦辺 郁也 (**URABE Fumiya**); 〒3050003 茨城県つくば市桜三丁目１４－１ 日本新薬株式会社内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 中村 文胤 (**NAKAMURA Ayatsugu**); 〒6018550 京都府京都市南区吉祥院西ノ庄門口町１４番地 日本新薬株式会社知的財産部 Kyoto (JP).

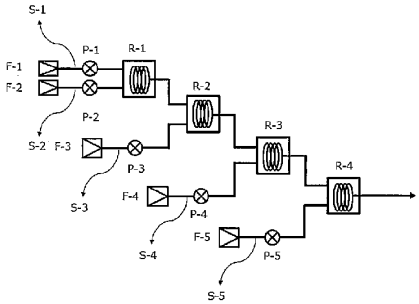
(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO,

(54) **Title:** METHOD FOR PRODUCING OLIGONUCLEIC ACID COMPOUND

(54) 発明の名称： オリゴ核酸化合物の製造方法



[図1]



(57) **Abstract:** The purpose of the present invention is to provide a novel production method with which it is possible to shorten the production time of an oligonucleic acid compound. A method for subjecting a compound [A] having a hydroxyl group or a primary or secondary amino group and a compound [B] having a substituent that contains a phosphorus atom as represented by general formula [1] to a condensation reaction to produce a compound [C] represented by general formula [C], wherein the method is characterized by being carried out in a mixed solvent of a polar solvent and a halogen-based

WO 2019/216433 A1

[続葉有]

DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

一 国際調査報告(条約第21条(3))

solvent as the reaction solvent, can be given as an example of the present invention.

(57) 要約:本発明の目的は、オリゴ核酸化合物の製造期間を短縮しうる、新規な製造方法を提供することにある。本発明としては、例えば、水酸基または1級のもしくは2級のアミノ基を有する化合物[A]と、次の一般式[1]:で表されるリン原子を含む置換基を有する、化合物[B]を縮合反応に付し、次の一般式[C]:で表される化合物[C]を製造するための方法であって、反応溶媒として極性溶媒とハロゲン系溶媒との混合溶媒中において行われることを特徴とする方法を挙げることができる。