(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
18. August 2005 (18.08.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/074993 A2

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: A61K 47/48

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/001252

(22) Internationales Anmeldedatum:
8. Februar 2005 (08.02.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 006 249.8 9. Februar 2004 (09.02.2004) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **NOXXON PHARMA AG** [DE/DE]; Max-Dohrn-Str. 8-10, 10589 Berlin (DE). **SUPRAMOL PARENTERAL COLLOID GMBH** [DE/DE]; Industriestr. 1-3, 61191 Rosbach-Rodheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **SOMMERMEYER, Klaus** [DE/DE]; In der Laubach 26, 61191 Rosbach (DE).

(74) Anwalt: **BOHMANN, Armin, K.**; Bohmann & Loosen, Sonnenstr. 8, 80331 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— *ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts*

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) **Title:** METHOD FOR PRODUCING CONJUGATES OF POLYSACCHARIDES AND POLYNUCLEOTIDES

(54) **Bezeichnung:** VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON KONJUGATEN AUS POLYSACCHARIDEN UND POLYNUKLEOTIDEN

(57) **Abstract:** The invention relates to a method for producing a conjugate of a polynucleotide and a polysaccharide, said method comprising the following steps: a) an aldonic acid of the polysaccharide or a derivative thereof is provided; b) the aldonic acid is reacted with an alcohol derivative, preferably a carbonate derivative of an alcohol, to form an aldonic acid ester, preferably an activated aldonic acid ester; and c) the aldonic acid ester is reacted with the polynucleotide, said polynucleotide comprising a functional amino group. The aldonic acid is reacted with the alcohol derivative in step (b) in a dry aprotic polar solvent.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung eines Konjugates aus einem Polynukleotid und einem Polysaccharid umfassend die Schritte: a) Bereitstellen einer Aldonsäure des Polysaccharides oder eines Derivates davon; b) Umsetzen der Aldonsäure mit einem Alkohol-Derivat, bevorzugterweise einem Carbonat-Derivat eines Alkohols, zu einem Aldonsäure-Ester, bevorzugterweise zu einem aktivierten Aldonsäure-Ester; und c) Umsetzen des Aldonsäure-Esters mit dem Polynukleotid, wobei das Polynukleotid eine funktionale Amino-Gruppe aufweist, wobei das Umsetzen der Aldonsäure mit dem Alkohol-Derivat in Schritt (b) in einem trockenen aprotischen polaren Lösungsmittel erfolgt.

WO 2005/074993 A2