



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3345915 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07H 21/04 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
A61P 17/04 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)
A61P 37/08 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
C07H 19/06 (2006.01)
C07H 19/10 (2006.01)
C12N 15/115 (2010.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.03.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.11.24
(86)	European Application Nr.	17200661.1
(86)	European Filing Date	2011.04.12
(87)	The European Application's Publication Date	2018.07.11
(30)	Priority	2010.04.12, US, 323145 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(62)	Divided application	EP2558478, 2011.04.12
(73)	Proprietor	SomaLogic Operating Co., Inc., 2945 Wilderness Place, Boulder, CO 80301, USA
(72)	Inventor	ROHLOFF, John, 605 Meadowbrook Drive, Boulder, CO Colorado 80303, USA JANJIC, Nebojsa, 6973 Carter Trail, Boulder, CO Colorado 80301, USA CARTER, Jeffrey D., 7318 Mt. Sherman Road, Longmont, CO Colorado 80503, USA FOWLER, Catherine, 3340 Dover Dr., Boulder, CO Colorado 80305, USA

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **5-POSITION MODIFIED PYRIMIDINES AND THEIR USE**

(56) References

Cited:

WO-A1-90/15065

WO-A1-2012/061810

US-A- 5 945 527

US-A1- 2008 194 502

US-A1- 2009 004 667

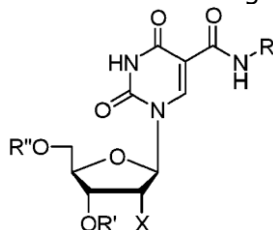
US-A1- 2009 098 549

VAUGHT, J. V. ET AL.: J. AM. CHEM. SOC., vol. 132, 3 April 2010 (2010-04-03), pages 4141-4151, XP55047152,

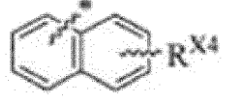
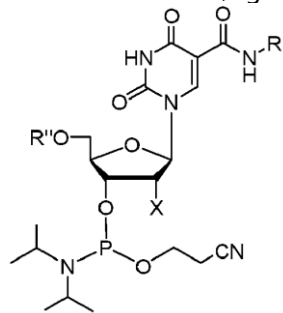
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

[EP3345915]

1

Patentkrav**1.** Forbindelse valgt fra forbindelser med følgende struktur eller et salt derav:

5 hvori

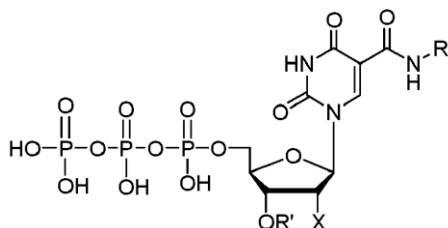
R er $-(CH_2)_n-R^{X1}$; R^{X1} er:*angir R^{X1} -gruppens festepunkt til $(CH_2)_n$ -forbindelsesgruppen10 R^{X4} er et halogen valgt fra F, Cl, Br, I; $n = 0-10$;X er valgt fra gruppen bestående av -H, -OH, -OMe, -O-allyl, -F, -OEt, -OPr, -OCH₂CH₂OCH₃ og -azido;15 R' er valgt fra gruppen bestående av -Ac; -P(N(iPr)₂(O(CH₂)₂CN); -Bz og -SiMe₂tBu;R'' er valgt fra gruppen bestående av H, DMT og trifosfat (-P(O)(OH)-OP(O)(OH)-O-P(O)(OH)₂) eller et salt derav.**2.** Forbindelse ifølge krav 1 med følgende struktur eller et salt derav:

20

eller

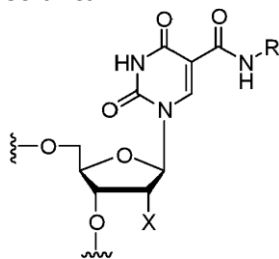
[EP3345915]

2



3. Forbindelsen ifølge krav 1 eller krav 2 hvori R^{X4} er Cl.

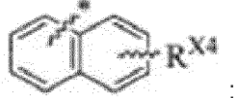
5 **4.** Oligonukleotid omfattende minst ett modifisert nukleotid med følgende struktur:



hvor

R er $-(CH_2)_n-R^{X1}$;

R^{X1} er:



*angir R^{X1} -gruppens festepunkt til $(CH_2)_n$ -forbindelsesgruppen

R^{X4} er et halogen valgt fra F, Cl, Br, I; $n = 0-10$;

X er valgt fra gruppen bestående av -H, -OH, -OMe, -O-allyl, -F, -OEt, -OPr, -OCH₂CH₂OCH₃ og -azido.

5. Oligonukleotidet ifølge krav 4, hvori R^{X4} er Cl.

6. Oligonukleotid ifølge krav 4 eller krav 5, hvori oligonukleotidet er valgt fra en ribonukleinsyre eller en deoksyribonukleinsyre.

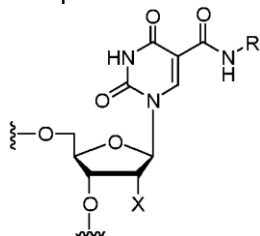
7. Oligonukleotid ifølge krav 4 eller krav 5, hvori oligonukleotidet ytterligere omfatter minst én kjemisk modifikasjon omfattende en kjemisk substitusjon på én

[EP3345915]

3

eller flere posisjoner uavhengig valgt fra en riboseposisjon, en deoksyriboseposisjon, en fosfatposisjon og en baseposisjon, eventuelt hvori den kjemiske modifikasjonen er uavhengig valgt fra gruppen bestående av en sukkermodifikasjon i 2'-posisjon, en 2'-amino (2'-NH₂), en 2'-fluor (2'-F), en 2'-O-metyl (2'-OMe), 2'-O-etyl (2'-OEt), 2'-O-propyl (2'-OPr), 2'-O-CH₂CH₂OCH₃, en pyrimidinmodifikasjon i 5-posisjon, en hovedkjedemodifikasjon, metylering, en 3'-kap og en 5'-kap.

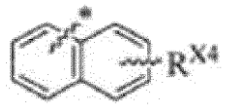
8. Aptamer omfattende minst ett modifisert nukleotid med følgende struktur:



hvori

R er $-(CH_2)_n-R^{X1}$;

R^{X1} er:



*angir R^{X1}-gruppens festepunkt til (CH₂)_n-forbindelsesgruppen

R^{X4} er et halogen valgt fra F, Cl, Br, I;

n = 0-10;

X er valgt fra gruppen bestående av -H, -OH, -OMe, -O-allyl, -F, -OEt, -OPr, -OCH₂CH₂OCH₃ og -azido.

9. Aptamer ifølge krav 8, hvori R^{X4} er Cl.

10. Aptamer ifølge krav 8 eller krav 9, hvori aptameren er valgt fra en ribonukleinsyre eller en deoksyribonukleinsyre.

11. Aptamer ifølge hvilke som helst av kravene 8 til 10, hvori aptameren ytterligere omfatter minst én kjemisk modifikasjon omfattende en kjemisk

[EP3345915]

4

5 substitusjon i én eller flere posisjoner uavhengig valgt fra en riboseposisjon, en deoksyriboseposisjon, en fosfatposisjon og en basertposisjon, eventuelt hvori den kjemiske modifikasjonen er uavhengig valgt fra gruppen bestående av en sukkermodifikasjon i 2'-posisjon, en 2'-amino (2'-NH₂), en 2'-fluor (2'-F), en 2'-O-metyl (2'-OMe), 2'-O-etyl (2'-OEt), 2'-O-propyl (2'-OPr), 2'-O-CH₂CH₂OCH₃, en pyrimidinmodifikasjon i 5-posisjon, en hovedkjedemodifikasjon, metylering, en 3'-kap og en 5'-kap.