

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5612683号
(P5612683)

(45) 発行日 平成26年10月22日 (2014. 10. 22)

(24) 登録日 平成26年9月12日 (2014. 9. 12)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 213/50 (2006. 01)

C O 7 D 213/50 C S P

C O 7 D 405/06 (2006. 01)

C O 7 D 405/06

A 2 3 L 1/226 (2006. 01)

A 2 3 L 1/226 G

請求項の数 8 (全 24 頁)

(21) 出願番号 特願2012-519014 (P2012-519014)
 (86) (22) 出願日 平成22年7月9日 (2010. 7. 9)
 (65) 公表番号 特表2012-532848 (P2012-532848A)
 (43) 公表日 平成24年12月20日 (2012. 12. 20)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2010/059916
 (87) 国際公開番号 W02011/004016
 (87) 国際公開日 平成23年1月13日 (2011. 1. 13)
 審査請求日 平成25年7月9日 (2013. 7. 9)
 (31) 優先権主張番号 61/224, 604
 (32) 優先日 平成21年7月10日 (2009. 7. 10)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)
 (31) 優先権主張番号 61/235, 452
 (32) 優先日 平成21年8月20日 (2009. 8. 20)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(73) 特許権者 501105842
 ジボダン エス エー
 スイス国 1 2 1 4 ヴェルニエ、 シュ
 マン ド ラ パルフュムリー 5 番
 (74) 代理人 100102842
 弁理士 葛和 清司
 (74) 代理人 100135943
 弁理士 三橋 規樹
 (72) 発明者 ワン, イリ
 アメリカ合衆国 オハイオ州 4 5 0 4 0
 、メイソン、ブロッサム コート 3 8 2
 3

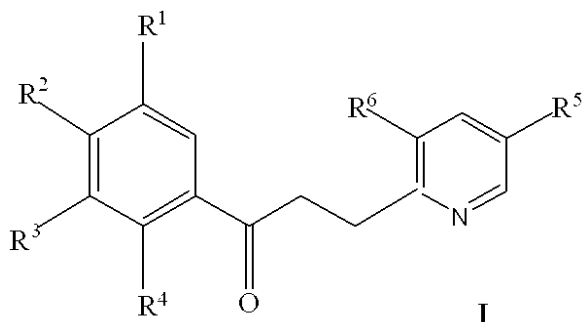
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 うま味フレーバーを有するピリジン誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

【化 1】



式中、

R¹ は、H、メチルおよびエチルから選択され；

R² は、H、OH、フッ素、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝アルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ (ここでアルコキシ中、アルキル基は直鎖または分岐であるか、または C₃ ~ C₅ シクロアルキル部を含む、もしくは C₃ ~ C₅ シクロアルキル部からなる)、から選択される；

R³ は、H、メトキシ、メチルおよびエチルから選択される；または、R² および R³ は一緒に、これらが結合するフェニル炭素原子との間の架橋部 -

O - CH₂ - O - を形成し；

R⁴ は、OHおよびメトキシから選択され；

R⁵ および R⁶ は独立して、Hおよびメチルから選択され；

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁶ は、

(i) R² および R³ 一緒に、これらが結合するフェニル炭素原子との間の架橋部 - O - CH₂ - O - を形成する場合には、R¹、R⁵、R⁶ はHであり、R⁴ はOHである；および

(i i) R⁴ がOHであり、R¹ ~ R³ がHである場合には、R⁵、R⁶ の少なくとも1つがメチルである

となるように選択される、式 I の化合物またはその塩。

10

【請求項 2】

R³ が、Hおよびメトキシから選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 3】

R² が、H、OH、フッ素、メチル、C₁ ~ C₆ アルコキシ (ここで、アルキル基は直鎖または分岐であるか、またはC₃ ~ C₅ シクロアルキル部分を含む、もしくはC₃ ~ C₅ シクロアルキル部からなる)、から選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 4】

R¹ がHおよびメチルであり、R² がメチル、メトキシおよびイソブチルオキシから選択され、R³ がHであり、R⁴ がOHであり、R⁵ および R⁶ がHである、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

20

【請求項 5】

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 , 5 - ジメチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン；

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン；

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン；および

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

30

からなる群から選択される、請求項 4 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物またはその塩を、消費可能な組成物に添加することを含む、消費可能な組成物にうま味フレーバーを付与する方法。

【請求項 7】

製品ベースおよび少なくとも1種の請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物またはその塩を含む、うま味フレーバーを有する消費可能な組成物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩が、0 . 0 1 ~ 1 0 0 p p m の濃度で存在する、請求項 7 に記載の消費可能な組成物。

40

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本開示は、化合物およびそれらのフレーバー付与における使用に関する。

【背景技術】

【0002】

うま味は、アジア料理に一般的に関連する、フレーバー感覚 (sensation) である。さらに、改善された旨味は、低塩製品をより味の良いものとするに役に立つ。うま味フレーバーは、伝統的には、食料品へのグルタミン酸ナトリウム (Monosodium Glutamate ,

50

M S G) の添加により達成されてきた。しかしながら、食料品における M S G の存在は、広く受け入れられず、M S G を用いずに旨味を達成することへの興味が存在する。

【発明の概要】

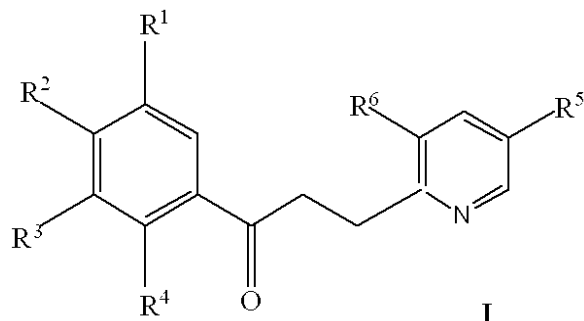
【0003】

特定の化合物が、経口で摂取することが意図される組成物に、望ましい旨味感覚を与えることが見出された。

【0004】

したがって、式 I の化合物（その塩を含む）が提供される。

【化1】



10

【0005】

式中、

20

R^1 は、H、メチルおよびエチルから選択され；

R^2 は、H、OH、フッ素、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ここでアルコキシ中、アルキル基は、直鎖または分岐であるか、または $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル部分を含むか、もしくは $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル部分からなる、から選択され；

R^3 は、H、メトキシ、メチルおよびエチルから選択され；

または、 R^2 および R^3 は一緒に、これらが結合するフェニル炭素原子との間の架橋部 - O - CH₂ - O - を形成し；

R^4 は、OH およびメトキシから選択され；

R^5 および R^6 は独立して、H およびメチルから選択され；

30

【0006】

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、

(i) R^2 および R^3 一緒に、これらが結合するフェニル炭素原子との間の架橋部 - O - CH₂ - O - を形成する場合には、 R^1 、 R^5 、 R^6 は H であり、 R^4 は OH である；および

(ii) R^4 が OH であり、 $R^1 \sim R^3$ が H である場合には、 R^5 、 R^6 の少なくとも 1 つがメチルである、

となるように選択される。

【0007】

特定の態様において、 R^3 は、H およびメトキシから選択される。

40

特定の態様において、 R^2 は、H、OH、フッ素、メチル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ここで、アルコキシ中のアルキル基は、直鎖または分岐であるか、または $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル部を含むか、もしくは $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル部からなる、から選択される。

【0008】

さらなる特定の態様において、 R^2 はメチル、メトキシおよびイソブチルオキシから選択され、 R^3 は H であり、 R^4 は OH であり、 R^5 および R^6 は H である。

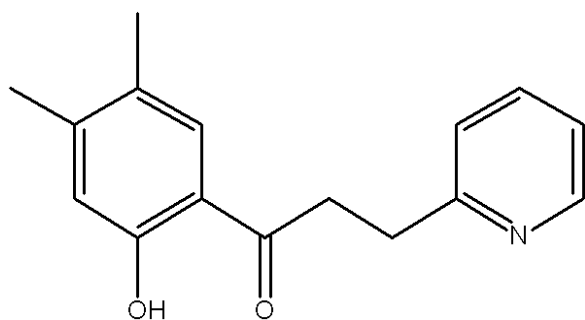
さらなる特定の態様において、式 I の化合物（その塩を含む）は、

【0009】

1 - (2 - ヒドロキシ - 4, 5 - ジメチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン；

50

【化 2】

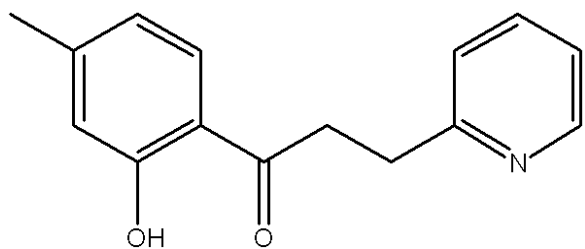


10

【0010】

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン ;

【化 3】

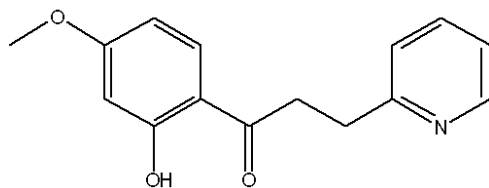


20

【0011】

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン ; および

【化 4】

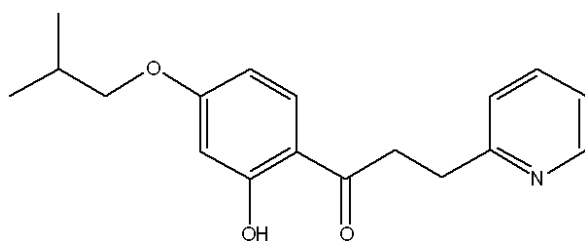


30

【0012】

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソプロトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【化 5】



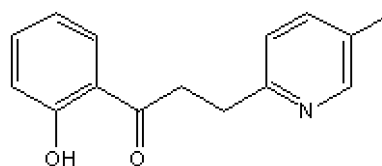
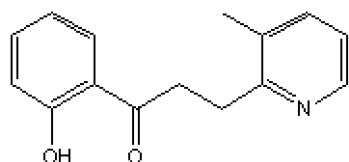
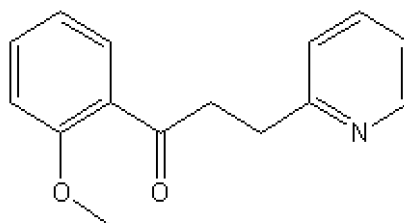
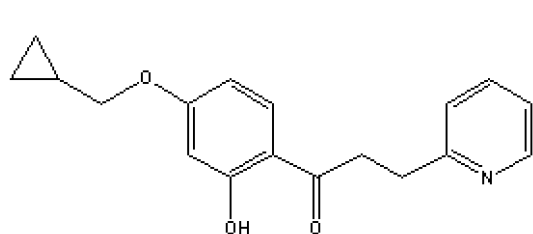
40

からなる群から選択される。

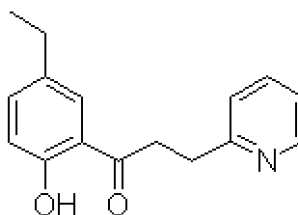
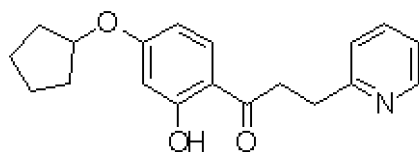
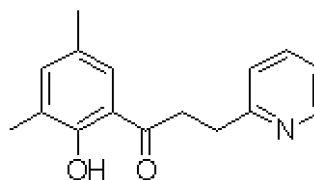
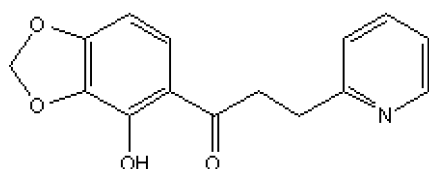
【0013】

他の特定の態様は、(これらに限定されないが)

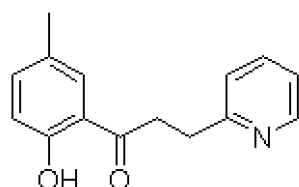
【化 6】



10



20



30

を含む。

【0014】

該化合物は、当該技術分野に周知の方法によって作ることができる。

好適な方法の非限定例は以下を含む：

【0015】

1. 芳香族アルデヒドの、置換アセトフェノンとのクライゼン - シュミット縮合。この縮合のために用いる塩基は、メタノール中のナトリウム・メトキシドである。反応を有機溶媒（特に、THF）において行った。得られた中間体を、水素および炭素上の10%パラジウムを触媒として用い、メタノール中で水素化した。

40

【0016】

2. 置換フェノールの、2 - ピリジニル - プロピオン酸誘導体とのフリーデル・クラフツ アシル化。

3. ジオキサン溶媒における、2 - ヒドロキシアセトフェノンの、ピリジン - 2 - イルメタノールおよび触媒として $\text{RuCl}_2(\text{Me}_2\text{SO})_4$ との1ステップ反応。

【0017】

4. 2 - ヒドロキシアセトフェノンの、isonicotinaldehydeとの、 $\text{RuCl}_2(\text{PPh}_3)_3$ を触媒として用いた、ジオキサン溶媒中での1ステップ反応。

これらの方法の全てが、全ての化合物に対して上手く行くわけではないが、所定の化合

50

物に対する、特定の方法の選択は、当該技術分野における技能において周知である。

【0018】

上述の化合物は、個々に、または、他のかかる化合物、もしくは他のうま味フレーバー付与剤、もしくは両方との組み合わせにおいて用いることができる。他のうま味フレーバー付与剤は、これらに限定されないが、MSG、GMP（グアニシン酸）およびIMP（イノシン酸）を含む。したがって、消費可能な組成物にうま味フレーバーを加える方法であって、組成物に少なくとも1種の式Iの化合物を添加を含む、方法も提供する。

【0019】

「消費可能な組成物」とは、最終的に吐き出すか、飲み込むために、口に投与されるあらゆる組成物を意味する。組成物はあらゆる物理的形状、固体、液体またはガスであり得る。非限定例は、全ての食品、食品添加物、栄養補給食品、医薬品、および（これらに限定されないが）チューインガム、オーラルケア用品、およびオーラル衛生用品を含む、口に置かれるあらゆる製品を含み、これらに限定されないが、穀物製品、米製品、タピオカ製品、サゴ製品、ベーカリー製品、ビスケット製品、ペストリー製品、パン製品、菓子製品、デザート製品、ガム、チューインガム、フレーバーまたはフレーバーコートされた食品/飲料用容器、イースト製品、ベーキングパウダー、塩およびスパイス製品、スナック食品、食欲をそそる風味のある（savoury）製品、マスタード製品、ピネガー製品、ソース（調味料）、スープ、シーズニング、インスタント食品、グレービー、ナッツ&ナッツ製品、

10

20

【0020】

タバコ製品、シガー、シガレット、加工食品、野菜製品、肉および肉製品、卵製品、ミルクおよび乳製品、ヨーグルト、チーズ製品、バターおよびバター代用製品、ミルク代用製品、大豆製品、食用油および油脂製品、薬剤、飲み物、炭酸飲料、ビール、ワイン、スピリッツなどのアルコール飲料、ソフトドリンク（限定されず、飲料用パウダー、ミルクベース飲料用パウダー、無糖飲料用パウダー、飲料用シロップ、飲料用濃縮物、コーヒーおよび茶を含む、還元すること（reconstitution）を要する形状を含む）などのノンアルコール飲料、食物抽出物、植物抽出物、肉抽出物、調味料、ゼラチン、薬用および非薬用ガム、タブレット、トローチ剤、ドロップ、乳剤、エリキシル剤、シロップおよび飲料を作るための他の製剤、ならびにこれらの組み合わせを含む。

30

【0021】

したがって、製品ベースおよび上述の少なくとも1つの化合物を含む、うま味フレーバーが付与された消費可能な組成物が提供される。「製品ベース」とは、特定の消費可能な組成物に必要とされる、一般的に当該技術分野で認識される全ての成分の組み合わせを意味する。

【0022】

上述の化合物が用いられる濃度は、望まれる味、他の成分の本質および望まれる最終的な使用に依存して、当然に異なる。典型的には、濃度は、0.01~100 ppmの間で変化するが、典型的に有益な濃度を示しているだけであることが強調され、この範囲外で処方することも可能である状況が存在し得る。より特別な範囲は0.1~50 ppmおよび0.2~10 ppmである。

40

【0023】

上述の化合物が用いられ得る形状も異なり得る。粉末、液体、固体、分散体または乳化体に加えて、スプレードライまたはカプセル化した形状において用いることもできる。

【0024】

うま味フレーバーが付与された消費可能な組成物は、かかる組成物の製造において、標準的な成分を、当該技術分野で認識される分量において含有することもできる。非限定例は、甘味料、乳化剤、イースト抽出物、植物タンパク質加水分解物、短鎖ペプチド、アミノ酸、発酵製品、酵素消化物、メイラード反応製品および植物の抽出物などの食品添加物を含む。

50

【 0 0 2 5 】

対象の化合物の少なくとも1つに加えて、うま味フレーバーは、当業者に周知のフレーバー付与材料を含有してもよく、これは、FEMA GRASリストおよびE U ポジティブリストの材料を含む。フレーバー材料は一般的にはそれ自体のアロマを提供し、製品の全体的なうま味プロファイルの向上に役立つことができる。しかしながら、いくつかのフレーバー材料は、上述の化合物と共に用いた場合に、味の影響も有し、旨味感覚を向上または増強するか、全体的なプロファイルを向上させる。

【 0 0 2 6 】

さらに、フレーバー材料の承認リストの他の材料は、旨味またはうま味様特性を提供するか、全体的な旨味を増強し得る。対象の化合物と共に用いられ得る、FEMA GRASからのいくつかの例は、N 1 - (2 - メトキシ - 4 - メチルベンジル) - N 2 - (2 - (ピリジン - 2 - イル) エチル) オキサリアミド (FEMA # 4231)、N - (ヘプタン - 4 - イル) ベンゾ [D] [1 , 3] ジオキソール - 5 - カルボキサミド (FEMA # 4232)、N 1 - (2 , 4 - ジメトキシベンジル) - N 2 - (2 - (ピリジン - 2 - イル) エチル) オキサリアミド (FEMA # 4233)、N 1 - (2 - メトキシ - 4 - メチルベンジル) - N 2 - (2 - (5 - メチルピリジン - 2 - イル) エチル) オキサリアミド (FEMA # 4234)、N - グルコニルエタノールアミン (FEMA # 4254)、N - グルコニルエタノールアミンリン酸 (FEMA # 4255)、N - ラクトイルエタノールアミン (FEMA # 4256)、N - ラクトイルエタノールアミンリン酸 (FEMA # 4257)、N - 3 , 7 - ジメチル - 2 , 6 - オクタジエニルシクロプロピルカルボキサミド (FEMA # 4 267) およびガンマアミノ酪酸などの品目を含む。

【 0 0 2 7 】

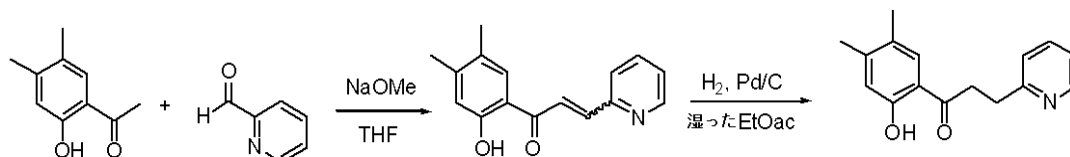
特定の態様を説明する、一連の非限定例が以下に続く。

【 0 0 2 8 】

例 1 :

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 , 5 - ジメチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンの合成

【 化 7 】



【 0 0 2 9 】

THF (5 0 m l) および 7 m l の 2 5 重量 % N a O M e 中のピコリンアルデヒド (1 . 5 2 g 、 1 4 . 1 m m o l) の攪拌した溶液に、5 m l THF 中の 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 , 5 - ジメチルフェニル) エタノン (2 . 3 3 g 、 1 4 . 1 m m o l) を、室温で滴加した。溶液を室温で 5 時間継続して攪拌し、そして反応フラスコに水を添加した。1 N の H C l を用いて水層を p H = 7 に酸性化し、E t O A c で 3 度抽出した。有機層を組み合わせ、乾燥させた (N a ₂ S O ₄) 。溶媒を真空で除去し、残留物をシリカゲルでクロマトグラフにかけ (1 5 % E t O A c / H e x) 、1 . 1 7 g の黄色い生成物 (3 2 %) を得た。

【 0 0 3 0 】

【 化 8 】

¹H NMR (300 MHz, C D C l ₃) : δ 12.64 (s , 1 H) , 8.75 (d , J = 5.1 Hz , 1 H) , 8.29 (d , J = 15.9 Hz , 1 H) , 7.88-7.78 (m , 3 H) , 7.52 (d , J = 8.4 Hz , 1 H) , 7.35 (d , d , d , J = 1.5 , 6.0 , 9.0 Hz , 1 H) , 6.85 (s , 3 H) , 2.31 (s , 3 H) , 2.28 (s , 3 H) .

【 0 0 3 1 】

250 ml の丸底フラスコにおいて、(E)-1-(2-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-2-エン-1-オン(1.17 g、4.62 mmol)および0.18 gの10% Pd/Cを、湿った(wet) EtOAc中で混合した。大気圧において、水素化を行い、そして触媒を濾過した。粗生成物をシリカゲルでのクロマトグラフィ(20% EtOAc/ヘキサン)により精製し0.58 g(47.7%)の最終化合物を得た。

【0032】

【化9】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.12 (s, 1H), 8.55 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 7.62 (d, d, d, $J=2.1, 7.5, 9.6$ Hz, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.27 (d, $J=7.5$ Hz, 1H), 7.14 (d, d, $J=4.5, 5.7$ Hz, 1H), 6.77 (s, 1H), 3.52 (t, $J=7.8$ Hz, 2H), 3.25 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.21 (s, 3H).

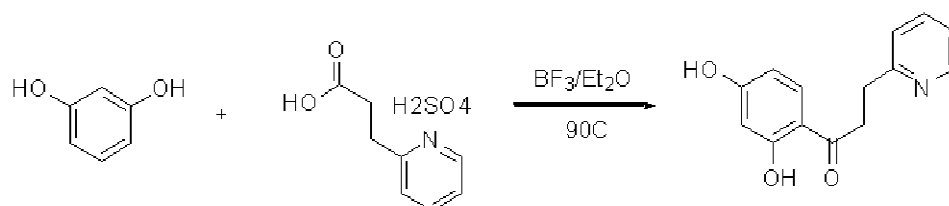
10

【0033】

例2:

1-(2,4-ジヒドロキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンの合成

【化10】



20

【0034】

レゾルシノール(2.2 g、20 mmol)、3-ピリジン-2-イル-プロピオン酸硫酸塩(5 g、20 mmol)および50 mlの三ふっ化ほう素ジエチルエーテラート($\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$)の混合物を、90 で5時間、 N_2 下で撹拌した(TLCによって観察)。反応混合物を10%水性NaOAc溶液に注ぎ、30分放置し、溶液を $\text{pH}=7$ に1 M HClで中和し、EtOAcで抽出した(3 X 50 ml)。組み合わされたEtOAc層を、水、塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥した。溶媒の蒸発後に得られた残留物を、シリカゲルカラムで、ヘキサン-EtOAc混合物(1:1)を溶離液として用いてクロマトグラフにかけ、生成物の混合物を得た。これを熱いMTBE/Hexにおいて再結晶化し、>97%純度を有する最終生成物(24%)を得た。

30

【0035】

【化11】

^1H NMR (300 MHz, CD_3OD) δ 8.46-8.44 (d,d,d, $J=5.1, 1.8, 0.9$ Hz, 1H), 7.78-7.72 (d, d, d, $J=9.9, 7.8, 2.1$ Hz, 1H), 7.78-7.75 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.40-7.37 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.29-7.23 (d,d, d, $J=6.3, 4.8, 1.2$ Hz, 1H), 6.38-6.34 (d, d, $J=9.0, 2.4$ Hz, 1H), 6.26-6.25 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 3.41 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 3.18 (t, $J=8.4$ Hz, 2H).

40

【0036】

例3:

1-(2-ヒドロキシ-4-メチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オン

50

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【化 1 2】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.29 (s, 1H), 8.53 (d, $J=4.5$ Hz, 1H), 7.63 (d, d, d, $J=3.0, 9.6, 11.7$ Hz, 1H), 7.26 (d, $J=7.2$ Hz, 1H), 7.14 (d, d, d, $J=1.2, 5.4, 7.8$ Hz, 1H), 6.79 (s, 1H), 6.71 (d, d, $J=1.8, 8.4$ Hz, 1H), 3.53 (t, $J=7.2$ Hz, 2H), 3.24 (t, $J=7.2$ Hz, 2H), 2.36 (s, 3H).

【0037】

例 4 :

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【化 1 3】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.77 (s, 1H), 8.53 (d, $J=4.8$ Hz, 1H), 7.72 (d, d, $J=2.7, 8.7$ Hz, 1H), 7.60 (d, d, d, $J=2.1, 7.5, 9.6$ Hz, 1H), 7.23 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.12 (d, d, d, $J=1.5, 4.8, 6.3$ Hz, 1H), 6.44-6.41 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.45 (t, $J=7.5$ Hz, 3=2H), 3.22 (t, $J=7.8$ Hz, 2H).

【0038】

例 5 :

1 - (2 - ヒドロキシフェニル) - 3 - (5 - メチルピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【化 1 4】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.25 (s, 1H), 8.36 (d, $J=3.0$ Hz, 1H), 7.85 (d, d, $J=1.8, 8.4$ Hz, 1H), 7.49-7.43 (m, 2H), 7.20 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 6.97 (d, d, $J=2.1, 8.1$ Hz, 1H), 6.89 (d, d, $J=7.5, 8.1$ Hz, 1H), 3.57 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 3.23 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 2.32 (s, 3H).

【0039】

例 6 :

1 - (4 - エトキシ - 2 - ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン .

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【化 1 5】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.71 (s, 1H), 8.53 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 7.73 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 7.63 (d, d, d, $J=1.8, 7.5, 9.6$ Hz, 1H), 7.28 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.15 (d, d, $J=4.8, 6.3$ Hz, 1H), 6.44-6.40 (m, 2H), 4.06 (q, $J=7.5$ Hz, 2H), 3.48 (t, $J=7.8$ Hz, 2H), 3.24 (t, $J=7.8$ Hz, 2H), 1.42 (t, $J=7.5$ Hz, 3H).

10

20

30

40

50

【 0 0 4 0 】

例 7 :

1 - (2 - ヒドロキシ - 3 , 5 - ジメチルフェニル) 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【 化 1 6 】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.40 (s, 1H), 8.55 (bd, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.64 (d, d, d, $J=1.8, 8.1, 10.2$ Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.29 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.18-7.14 (m, 2H), 3.57 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 3.26 (t, $J=7.8$ Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (s, 3H).

10

【 0 0 4 1 】

例 8 :

1 - (2 - ヒドロキシ - 5 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【 化 1 7 】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.09 (s, 1H), 8.52 (d, $J=4.8$ Hz, 1H), 7.62-7.57 (m, 2H), 7.28-7.23 (m, 2H), 7.12 (d, d, $J=4.8, 7.5$ Hz, 1H), 6.86 (d, $J=8.4$ Hz, 1H), 3.54 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 3.23 (t, $J=6.9$ Hz, 2H), 2.28 (s, 3H).

20

【 0 0 4 2 】

例 9 :

1 - (5 - エチル - 2 - ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【 化 1 8 】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.11 (s, 1H), 8.54 (d, $J=3.3$ Hz, 1H), 7.67-7.61 (m, 2H), 7.32 (d, d, $J=2.1, 8.1$ Hz, 1H), 7.16 (d, d, $J=6.3, 8.4$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 3.59 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 3.27 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 2.61 (q, $J=8.7$ Hz, 2H), 1.23 (t, $J=7.5$ Hz, 3H).

30

【 0 0 4 3 】

例 1 0 :

1 - (2 - ヒドロキシフェニル) - 3 - (3 - メチルピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 1 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【 化 1 9 】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.31 (s, 1H), 8.34 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.91 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.49-7.44 (m, 2H), 7.09-7.04 (m, 1H), 6.98 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 6.91 (d, d, $J=7.5, 7.5$ Hz, 1H), 3.61 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 3.23 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 2.39 (s, 3H).

40

【 0 0 4 4 】

例 1 1

1 - (2 - ヒドロキシ - 3 , 5 - ジメチルフェニル) 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 2 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【化 2 0】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): 12.40 (s, 1H), 8.55 (bd, $J=5.2$ Hz, 1H), 7.64 (d, d, d, $J=1.8, 8.1, 10.2$ Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.29 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.18-7.14 (m, 2H), 3.57 (t, $J=7.5$ Hz, 2H), 3.26 (t, $J=7.8$ Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (s, 3H).

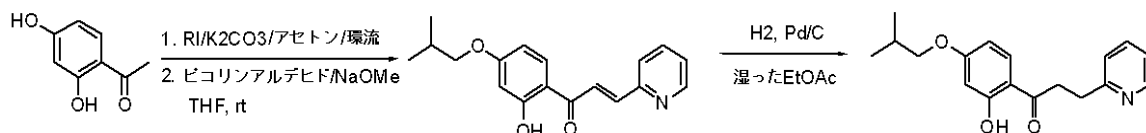
【 0 0 4 5】

例 1 2 :

1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

10

【化 2 1】



【 0 0 4 6】

ステップ 1 : 100 mL アセトン中に 1 - (2 , 4 - ジヒドロキシフェニル) エタノン (3 . 2 g , 21 . 03 mmol) および K_2CO_3 を室温で攪拌した溶液に、1 - ヨード - 2 - メチルプロパン (3 . 6 mL , 21 . 03 mmol) を滴加した。混合物を 8 時間環流し、そして反応物を一晩 54 に維持した。反応物を室温まで冷却し、1 N の HCl で $\text{pH} = 7$ に急冷した。水層を EtOAc で 3 度抽出し、有機層を組み合わせ、水、塩水で洗浄し、乾燥した (Na_2SO_4)。溶媒を真空で除去し、残留物をシリカゲル 5 % $\text{EtOAc} / \text{Hex}$ でクロマトグラフにかけ、1 . 1 g (25 %) の生成物を得た。

20

【 0 0 4 7】

【化 2 2】

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 12.67 (s, 1H), 7.55 (d, $J=8.7$ Hz, 1H), 6.36 (d, d, $J=2.4, 8.7$ Hz, 1H), 6.32 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 3.68 (d, $J=6.6$ Hz, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.09-2.195 (m, 1H), 0.96 (s, 3H), 0.94 (s, 3H).

30

【 0 0 4 8】

ステップ 2 : テトラヒドロフラン (50 mL) 中にピコリンアルデヒド (0 . 6 mL , 5 . 28 mmol) および NaOMe を攪拌した溶液に、5 mL THF 中の 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) エタノンを室温で添加した。混合物を室温で 5 時間攪拌し、1 N の HCl を $\text{pH} = 7$ になるまで添加した。水層を EtOAc で 3 度抽出した。有機層を組み合わせ、水、塩水で洗浄し、乾燥した (Na_2SO_4)。溶媒を真空で除去し、残留物をシリカゲル (Hex 中 25 % EtOAc) でクロマトグラフにかけ、0 . 8 g (51 %) の黄色い固体を得た。

【 0 0 4 9】

【化 2 3】

40

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 13.37 (s, 1H), 8.72 (d, $J=5.1$ Hz, 1H), 8.22 (d, $J=15.0$ Hz, 1H), 7.97 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 7.84 (d, $J=15.0$ Hz, 1H), 7.77 (d, d, $J=1.8, 7.2$ Hz, 1H), 7.50 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.33 (d, d, $J=4.8, 7.8$ Hz, 1H), 6.51 (d, d, $J=2.4, 9.0$ Hz, 1H), 6.47 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 3.80 (d, $J=6.6$ Hz, 2H), 2.20-2.07 (m, 1H), 1.60 (s, 3H), 1.05 (s, 3H).

【 0 0 5 0】

ステップ 3 : 200 mL の丸底フラスコにおいて、(E) - 1 - (2 - ヒドロキシ - 4

50

- イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン (1.08 g、3.63 mmol) および 80 mg の 10% Pd/C を、湿った EtOAc (50 ml) 中で混合した。大気圧室温において、出発材料がなくなるまで、水素化を行った。触媒を濾過し、粗物をシリカゲルでのクロマトグラフィ (25% EtOAc / ヘキサン) によって精製し、0.92 g の最終化合物 (82%) をオフホワイトの固体として得た。

【0051】

【化24】

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 12.73 (s, 1H), 8.52 (d, *J*=4.8 Hz, 1H), 7.72 (d, *J*=9.0 Hz, 1H), 7.61 (d, d, d, *J*=2.4, 7.8, 9.6 Hz, 1H), 7.25 (d, *J*=7.8 Hz, 1H), 7.13 (d, d, d, *J*=1.5, 4.8 6.0 Hz, 1H), 6.43 (d, d, *J*=2.1, 8.4 Hz, 1H), 6.39 (d, *J*=2.7 Hz, 1H), 3.75 (d, *J*=7.2 Hz, 2H), 3.46 (t, *J*=7.2 Hz, 2H), 3.23 (t, *J*=6.9 Hz, 2H), 2.16-2.02 (m, 1H), 1.02 (d, d, *J*=7.2 Hz, 6H).

10

【0052】

例 13:

1 - (4 - シクロプロピルメトキシ) - 2 - ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 11 に記載と同一の手段を用いて合成した。

20

【化25】

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 12.61 (s, 1H), 8.42 (d, *J*=5.7 Hz, 1H), 7.52 (d, d, d, *J*=1.8, 7.8, 9.6 Hz, 1H), 7.16 (d, *J*=7.5 Hz, 1H), 7.04 (d, d, *J*=4.8, 7.2 Hz, 1H), 6.34 (d, d, *J*=2.7, 9.0 Hz, 1H), 6.28 (d, *J*=2.4 Hz, 1H), 3.73 (d, *J*=6.9 Hz, 2H), 3.37 (t, *J*=7.2 Hz, 2H), 3.13 (t, *J*=7.5 Hz, 2H), 1.24-1.11 (m, 1H), 0.59-0.53 (m, 2H), 0.29-0.23 (m, 2H).

【0053】

30

例 14:

1 - (4 - (シクロペンチルオキシ) - 2 - ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

標題の化合物を、例 11 に記載と同一の手段を用いて合成した。

【化26】

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 12.74 (s, 1H), 8.53 (d, *J*=4.8 Hz, 1H), 7.74-7.70 (m, 1H), 7.62 (d, d, d, *J*=2.1, 8.1, 9.9 Hz, 1H), 7.26 (d, *J*=7.8 Hz, 1H), 7.14 (d, d, d, *J*=1.2, 4.8 7.5 Hz, 1H), 6.41-6.37 (m, 2H), 4.80-4.76 (m, 1H), 3.47 (t, *J*=7.5 Hz, 2H), 3.23 (t, *J*=7.5 Hz, 2H), 2.01-1.78 (m, 8 H).

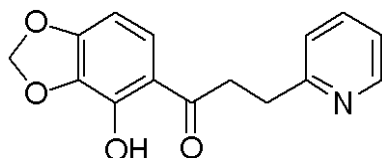
40

【0054】

例 15:

1 - (4 - ヒドロキシベンゾ [d] [1,3] ジオキソール - 5 - イル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【化 27】



【0055】

ステップ 1

1 - (4 - ヒドロキシベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) エタノン (1 . 8 g、9 . 99 mmol) を THF (40 ml) に溶解し、無色の溶液を得た。ナトリウムメタノラート 30 % (5 g、27 . 8 mmol) を添加した。反応混合物は暗い緑色に着色された。15 分の室温での攪拌の後、10 ml THF に溶解した 1 . 1 g (10 mmol) のピコリンアルデヒドを 10 分の間に滴加した。添加は 22 で開始し、わずかに発熱した。室温での攪拌をさらに 3 時間継続した。混合物をジエチルエーテルで希釈し、強く攪拌しながら、pH を濃縮塩酸で pH 5 に調節した。

10

【0056】

色は、濃い緑からオレンジ / 赤に変化した。5 分後、形成した固体を濾過した。固体を 100 ml のメタノールと混合し、残りの固体 (主に NaCl) を再度濾過した。濾液を蒸発させ、残留物をジエチルエーテルおよびメタノールの混合物に取り込んだ。固体を濾過および乾燥、1 . 7 g のオレンジ色の粉末を得た。少量の不純物を除去するために、オレンジ色の生成物をクロロホルムと共に 10 分間攪拌し、濾過および乾燥し、1 . 5 g (47 %) の (E) - 1 - (4 - ヒドロキシベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オンを得た。

20

【化 28】

$^1\text{H-NMR}$ in DMSO- d_6 : 6.17(2H, O-CH₂-O, s), 6.72(1H, CO-CH=, d), 7.60(1H, aromatic m),

7.83(1H, aromatic, d), 7.94(1H, CO-CH=CH-, d), 8.09-8.13(2H, aromatic, m),

30

8.35(1H, aromatic, d), 8.75(1H, aromatic N-CH, d), 9.83(1H, OH, s)

【0057】

1 - (4 - ヒドロキシベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) エタノンを、トリヒドロシアセトフェノンのジヨードメタンとの反応により調製した。

【0058】

ステップ 2

(E) - 1 - (4 - ヒドロキシベンゾ [d] [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパ - 2 - エン - 1 - オン (0 . 5 g、1 . 857 mmol) をメタノール (50 ml) に添加し、黄色の溶液を得た。パラジウム炭素 (0 . 05 g) を添加した。変換が完了するまで攪拌しながら、生成物を水素化した (TLC により確認)。反応混合物を濾過し、蒸発させ、固体残留物をジエチルエーテルで洗浄し、乾燥して、0 . 3 g (57 %) の標記の化合物を得た。

40

【0059】

【化 2 9】

¹H-NMR in DMSO-d₆: 3.11(2H, CH₂-C=N, t), 3.49(2H, CO-CH₂-, t), 6.13(2H, O-CH₂-O, s),
6.64(1H, aromatic, d), 7.19(1H, aromatic, m), 7.33(1H, aromatic, d), 7.67-7.70(2H, aromatic, m),
8.44(1H, aromatic N-CH, d), 9.83(1H, OH, s)

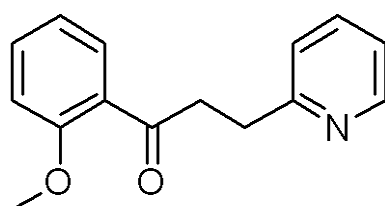
10

【0060】

例 1 6

1 - (2 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【化 3 0】



20

【0061】

1 - (2 - メトキシフェニル) エタノン (3 g、19.98 mmol)、ピリジン - 2 - イルメタノール (2.180 g、19.98 mmol) および水酸化カリウム (1.121 g、19.98 mmol) をジオキサン (50 ml) に添加し、黄色の懸濁液を得た。RuCl₂(Me₂SO)₄ (0.2 g) を添加した。反応混合物を 80 で 1 時間加熱した。

【0062】

触媒および KOH を除去するために、反応混合物をシリカゲルを通して濾過した。濾液を蒸発させ、残留物をカラムクロマトグラフィで精製した。

30

溶離液：酢酸エチル：ヘプタン = 3 : 1。0.2 g (4%) の標記の化合物を得た。

【0063】

【化 3 1】

¹H-NMR in chloroform-d: 3.20(2H, CO-CH₂-, t), 3.47(2H, -CH₂-Ar, t), 3.87(3H, -OCH₃ s),

6.95(2H, aromatic, m), 7.1(1H, aromatic, m), 7.23(1H, aromatic, d), 7.45(1H, aromatic, m)

40

7.58(1H, aromatic, m), 7.70(1H, aromatic, d), 8.50(1H, aromatic N-CH=, d)

【0064】

例 1 7

化合物の試験

上記例において調製された様々な化合物を試験した。

【0065】

2 種類の溶液を調製した：

A : 0.3% NaCl の溶液、

50

B : 0 . 3 % NaCl および 2 ppm の表 1 の化合物の溶液。

30 ~ 60 歳の 20 人の女性で構成される、熟練した官能パネルにより、サンプルを試験した。

【 0066 】

【表 1】

化合物	味の描写
1 - (2-ヒドロキシ-4-メチルフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、甘味、リコリス、食欲をそそる風味のある
1 - (2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、甘味、塩味、長続きする食欲をそそる風味
1 - (2-ヒドロキシフェニル) - 3 - (5-メチルピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	わずかにうま味、いくらかのグリーンな後味、フローラル
1 - (4-エトキシ-2-ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、フローラル
1 - (4-シクロプロピルメトキシ) - 2-ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味
1 - (2-ヒドロキシ-4-イソプロトキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、甘味、塩味、ブイヨン、延々と続く、強烈な
1 - (2-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、甘味、食欲をそそる風味のある、塩味
1 - (2-メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、わずかに苦味
1 - (2-ヒドロキシフェニル) - 3 - (3-メチルピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	僅かにうま味、食欲をそそる風味のある、肉様
1 - (4-ヒドロキシベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	明確なうま味、僅かに酵母様、ブイヨン
1 - (2-ヒドロキシ-3,5-ジメチルフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味
1 - (4-(シクロペンチル) - 2-ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味
1 - (2-ヒドロキシ-5-メチルフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味
1 - (2-メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、わずかに苦味
1 - (5-エチル-2-ヒドロキシフェニル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味、わずかに苦味
1 - (2-ヒドロキシ-3,5-ジメチルフェニル) 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オン	うま味

【 0067 】

例 18

MSG での比較試験

2 種類の溶液を調製した：

A : 0 . 3 % NaCl および 0 . 03 % MSG の溶液、

B : 0 . 3 % NaCl、0 . 03 % MSG および 5 ppm の 1 - (4-ヒドロキシベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル) - 3 - (ピリジン-2-イル) プロパン-1-オンの溶液。

10

20

30

40

50

【 0 0 6 8 】

30 ~ 60 歳の 20 人の女性で構成される、熟練した官能パネルにより、サンプルを試験した。

溶液 A : 塩味、うま味。

溶液 B : 塩味、うま味、よりブイヨン様、より複雑、より少ない甘味。

【 0 0 6 9 】

例 19

トマトスープ処方

トマトスープミックスを、9.4 g の塩化ナトリウム、1 g のMSG、0.08 g のリボヌクレオチド（例えば、酵母）、32 g のトマトパウダー（例えば、Spreada）、25.1 g のグルコース、21 g の澱粉（UltrasperseTM 5例えば、National Starch）、5 g パーム脂質のパウダー、3 g の酵母パウダー、1 g のオニオンパウダー、0.15 g のにんじんパウダー、0.05 g の挽いた白胡椒、0.3 g のセロリ抽出物パウダー、0.05 g の挽いた月桂樹の葉のパウダー、および1.85 g のスクロースから調製した。よく混合した成分25 g を250 g の沸騰水に加え、完全に溶解するまでかき混ぜ、参照スープを得た。

【 0 0 7 0 】

参照スープを1.5 ppmの1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル)プロパン - 1 - オンを含む同一のスープのバッチと比較した。フレーバリストの小グループ（男性2名、女性2名）がスープを試し、参照スープと比較して、試験スープがよりうま味があり、明確に延々と続く効果を有し、より塩味があり、より複雑であることで一致した。

【 0 0 7 1 】

例 20

ポテトチップ

プレーンなポテトチップを調製した。

一部を1.2 % 塩化ナトリウムでフレーバー付与した（サンプルA）、

一部を1.2 % 塩化ナトリウムおよび0.3 % MSGでフレーバー付与した（サンプルB）、

一部を1.2 % 塩化ナトリウムおよび2 ppmの1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル)プロパン - 1 - オンでフレーバー付与した（サンプルC）。

【 0 0 7 2 】

30 ~ 60 歳の 20 人の女性で構成される、熟練した官能パネルにより、サンプルを試験した。

パネルは他の2つのサンプルよりも、サンプルCを好んだ。

サンプルAは、塩味と評価され、サンプルBは塩味およびうま味と評価され、サンプルCは塩味、強いうま味、長続きする、食欲をそそる風味のある、ブイヨンと評価された。

【 0 0 7 3 】

例 21

トマトケチャップ

トマトケチャップを、19 % のトマトペースト（28 ~ 30 % 乾燥重量）、8 % 酢（15 % ）、3 % 塩の化ナトリウム、20 % の砂糖および50 % の水から調製した。

バッチの半分に2 ppmの1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル)プロパン - 1 - オンを加えた。

【 0 0 7 4 】

フレーバリストの小グループ（男性2名、女性2名）がケチャップを試し、当該物質を含まないケチャップと比較して、試験ケチャップが、明らかに、より多いうま味、より多い塩味を呈し、心地よいセイボリーノート(savoury note)を有していることで一致した。

【 0 0 7 5 】

例 2 2 ~ 2 4

以下の組成物を作成し、試験した。ベンチトップテストパネル（10名のパネリスト - フレーバリスト、応用エキスパートから構成される）を用い、パネリストは、サンプル間の官能特質の違い（うま味）を記録することを求められた。全てのサンプルは、ブラインドで試験され、うま味についてランクづけられた。

【 0 0 7 6 】

例 2 2

市販のオーガニックチキンブロス（Swanson's Certified Organic Chicken Broth - MSG添加なし、約0.4%の砂糖を含む）

10

【 0 0 7 7 】

対照

【表 2】

成分	(重量) %
市販のオーガニックチキンブロス (550mg Na / 240mL 1人分)	100

【 0 0 7 8 】

参照

20

【表 3】

成分	(重量) %
MSG	0.05
市販のオーガニックチキンブロス (550mg Na / 240mL 1人分)	100にバランスをとる

【 0 0 7 9 】

成分 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

30

【表 4】

成分	(重量) %
1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン；	0.001
市販のオーガニックチキンブロス (550mg Na / 240mL 1人分)	100にバランスをとる

【 0 0 8 0 】

40

官能的知見：パネリストは、このベースにおける0.001%の1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSGがうま味が最も高く、1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンが2位、対照が5位に終わった。

【 0 0 8 1 】

成分 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【表 5】

成分	(重量) %
1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソプロトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン	0.002
市販のオーガニックチキンブロス (550mg Na / 240mL 1人分)	100にバランスをとる

【0082】

10

官能的知見：パネリストは、このベースにおける0.002%の1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソプロトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSGがうま味が最も高く、1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソプロトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンが3位、対照が5位に終わった。

【0083】

成分 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【表 6】

20

成分	(重量) %
1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン	0.002
市販のオーガニックチキンブロス (550mg Na / 240mL 1人分)	100にバランスをとる

【0084】

官能的知見：パネリストは、このベースにおける0.002%の1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSGがうま味が最も高く、1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンが4位、対照が5位に終わった。

30

【0085】

例 23

モデルチキンブロス - MSG添加なし、砂糖添加なし

モデルチキンブロスパウダーを、11.9gの鶏油、23.81gの塩、14.29gの砂糖、0.95gのオニオンパウダー、49.01gのチキンパウダー、0.04gのターメリックパウダーから調製した。モデルチキンブロスを調製するために、2.0gのパウダーを98.0gの熱湯と混合した。

40

【0086】

対照

【表 7】

成分	(重量) %
モデルチキンブロス (653mg Na / 240mL 1人分)	100

【0087】

参照

50

【表 8】

成分	(重量) %
MSG	0.05
モデルチキンブロス (653mg Na/240mL 1人分)	100にバランスをとる

【0088】

成分 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

10

【表 9】

成分	(重量) %
1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン	0.0005
モデルチキンブロス (653mg Na/240mL 1人分)	100にバランスをとる

【0089】

官能的知見：パネリストは、このベースにおける 0.0005% の 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSG がうま味が最も高く、1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンが 3 位、対照が 5 位に終わった。

20

【0090】

成分 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【表 10】

成分	(重量) %
1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン	0.001
モデルチキンブロス (653mg Na/240mL 1人分)	100にバランスをとる

30

【0091】

官能的知見：パネリストは、このベースにおける 0.001% の 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSG がうま味が最も高く、1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - イソブトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンが 4 位、対照が 5 位に終わった。

40

【0092】

成分 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【表 1 1】

成分	(重量) %
1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン	0. 0 0 1
モデルチキンブロス (6 5 3 m g N a / 2 4 0 m L 1 人 分)	1 0 0 に バ ラ ン ス を と る

【 0 0 9 3 】

官能的知見：パネリストは、このベースにおける 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンを好んだ。6 つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSG がうま味が最も高く、1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オンが 2 位、対照が 5 位に終わった。

【 0 0 9 4 】

例 2 4

モデルチキンブロス - MSG 添加なし、0. 3 % の砂糖添加

モデルチキンブロスパウダーを、1. 9 g の鶏油、2 3. 8 1 g の塩、1 4. 2 9 g の砂糖、0. 9 5 g のオニオンパウダー、4 9. 0 1 g のチキンパウダー、0. 0 4 g のターメリックパウダーから調製した。モデルチキンブロスを調製するため、2. 0 g のパウダーを 9 8. 0 g の熱湯と混合した。

【 0 0 9 5 】

対照

【表 1 2】

成分	(重量) %
モデルチキンブロス - 砂糖添加 (6 5 3 m g N a / 2 4 0 m L 1 人 分)	1 0 0

【 0 0 9 6 】

参照

【表 1 3】

成分	(重量) %
MSG	0. 0 5
モデルチキンブロス - 砂糖添加 (6 5 3 m g N a / 2 4 0 m L 1 人 分)	1 0 0 に バ ラ ン ス を と る

【 0 0 9 7 】

成分 1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン

【表 1 4】

成分	(重量) %
1 - (2 - ヒドロキシ - 4 - メチルフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) プロパン - 1 - オン	0. 0 0 1 0
モデルチキンブロス - 砂糖添加 (6 5 3 m g N a / 2 4 0 m L 1 人 分)	1 0 0 に バ ラ ン ス を と る

【0098】

官能的知見：パネリストは、このベースにおける0.001%の1-(2-ヒドロキシ-4-メチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSGがうま味が最も高く、1-(2-ヒドロキシ-4-メチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンが5位、対照が6位に終わった。

【0099】

成分：1-(2-ヒドロキシ-4-イソブトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オン

【表15】

10

成分	(重量) %
1-(2-ヒドロキシ-4-イソブトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オン	0.002
モデルチキンブロス — 砂糖添加 (653mg Na/240mL 1人分)	100にバランスをとる

【0100】

官能的知見：パネリストは、このベースにおける0.002%の化合物1-(2-ヒドロキシ-4-イソブトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSGがうま味が最も高く、1-(2-ヒドロキシ-4-イソブトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンが4位、対照が6位に終わった。

20

【0101】

成分1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オン

【表16】

30

成分	(重量) %
1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オン	0.002
モデルチキンブロス — 砂糖添加 (653mg Na/240mL 1人分)	100にバランスをとる

【0102】

官能的知見：パネリストは、このベースにおける0.002%の1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSGがうま味が最も高く、1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンが3位、対照が6位に終わった。

40

【0103】

成分1-(2-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オン

【表 17】

成分	(重量) %
1-(2-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オン	0.002
モデルチキンブロス — 砂糖添加 (653mg Na/240mL 1人分)	100 にバランスをとる

【0104】

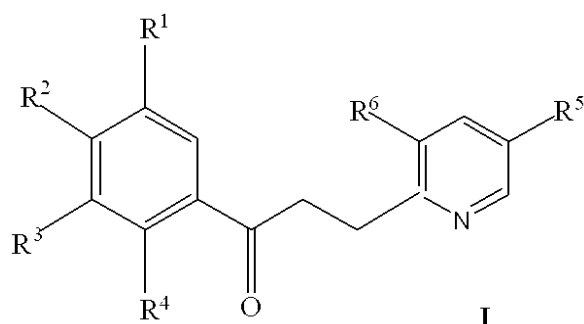
官能的知見：パネリストは、このベースにおける 0.002% of 1-(2-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンを好んだ。6つの異なるサンプルのブラインドランキングにおいて、MSGがうま味が最も高く、1-(2-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンが2位、対照が6位に終わった。(このレベルのこのベースにおいて。)うま味について評価される場合、1-(2-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニル)-3-(ピリジン-2-イル)プロパン-1-オンは良好に機能した。

10

【0105】

ある特定の態様において、式 I の化合物(その塩を含む)が提供される。

【化 32】



20

【0106】

式中

30

R^1 は H、メチルまたはエチルを含み；

R^2 は H、OH、フッ素、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ここでアルコキシ中、アルキル基は、直鎖または分枝であるか、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル部分である、を含み；

R^3 は H、メトキシ、メチルまたはエチルを含み；

または R^2 および R^3 は一緒に、これらが結合するフェニル炭素原子との間の架橋部 - O - CH₂ - O - を形成し；

R^4 は OH または メトキシを含み；および

R^5 および R^6 は独立して、H または メチルを含み；

【0107】

40

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、

(i) R^2 および R^3 一緒に、これらが結合するフェニル炭素原子との間の架橋部 - O - CH₂ - O - を形成する場合には、 R^1 、 R^5 、 R^6 は H であり、 R^4 は OH である；および

(ii) R^4 が OH であり、 $R^1 - R^3$ が H である場合には、 R^5 または R^6 の少なくとも 1 つがメチルである

となる。

【0108】

特定の態様において、 R^3 は、H および メトキシから選択される。

特定の態様において、 R^2 は、H、OH、フッ素、メチル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、こ

50

ここで、アルキル基は、直鎖または分枝であるか、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル部分である、を含む。

【0109】

他の特定の態様において、 R^2 は、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル部分からなる。

他の特定の態様において、 R^1 はHまたはメチルを含み、 R^2 はメチル、メトキシまたはイソブチルオキシを含み、 R^3 は、Hであり、 R^4 はOHであり、 R^5 および R^6 はHである。

【0110】

これらの化合物は、上述の通り、望ましい旨味感覚を、経口で摂取されることが意図される組成物に与える。

【0111】

上記の説明および先行の例を介して、態様を詳細に説明したが、これらの例は、例示のみの目的であって、開示の範囲から、当業者によって変形および改変ができると理解される。上記の態様は、選択肢であるだけでなく、組み合わせることもできると理解されるべきである。

フロントページの続き

- (72)発明者 ダニハー, アンドリュー
アメリカ合衆国 オハイオ州 45208、シンシナティ、アーチャー アベニュー 3605
- (72)発明者 デ クラーク, アドリ
オランダ王国 エヌエル - 4912 フェーカー マーデ、メーウェンラーン 11
- (72)発明者 ウィンケル, コルネリス
オランダ王国 エヌエル - 1402 ヘーエル ブッスム、ロタリウスラーン 40

審査官 東 裕子

- (56)参考文献 特表2011-512790(JP, A)
特表2009-502153(JP, A)
特表2013-506408(JP, A)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
CAplus/REGISTRY(STN)