

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 1 部門第 1 区分

【発行日】平成22年10月7日(2010.10.7)

【公表番号】特表2010-501180(P2010-501180A)

【公表日】平成22年1月21日(2010.1.21)

【年通号数】公開・登録公報2010-003

【出願番号】特願2009-525610(P2009-525610)

【国際特許分類】

A 2 3 L	1/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
C 0 7 D	277/82	(2006.01)
A 6 1 K	31/428	(2006.01)
C 0 7 D	235/28	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
C 0 7 D	409/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4436	(2006.01)
C 0 7 D	487/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4196	(2006.01)
C 0 7 D	513/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/433	(2006.01)
C 0 7 D	417/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
C 0 7 D	233/56	(2006.01)
A 6 1 K	31/4164	(2006.01)
C 0 7 D	277/20	(2006.01)
C 0 7 D	277/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/426	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
C 0 7 D	277/42	(2006.01)
C 0 7 D	495/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4188	(2006.01)
C 0 7 D	231/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/415	(2006.01)
C 0 7 D	239/52	(2006.01)
A 6 1 K	31/505	(2006.01)
C 0 7 D	403/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/517	(2006.01)
A 6 1 K	31/194	(2006.01)
A 6 1 K	31/197	(2006.01)
A 6 1 K	31/275	(2006.01)
A 6 1 K	31/513	(2006.01)
A 2 3 L	1/03	(2006.01)
A 2 3 L	2/60	(2006.01)

【 F I 】

A 2 3 L	1/22	1 0 1 Z
A 6 1 K	47/26	

C 0 7 D 277/82 C S P
A 6 1 K 31/428
C 0 7 D 235/28 C
A 6 1 K 31/4184
C 0 7 D 409/12
A 6 1 K 31/4436
C 0 7 D 487/04 1 3 9
A 6 1 K 31/4196
C 0 7 D 513/04 3 2 5
A 6 1 K 31/433
C 0 7 D 417/04
A 6 1 K 31/551
C 0 7 D 401/12
A 6 1 K 31/4439
C 0 7 D 233/56
A 6 1 K 31/4164
C 0 7 D 277/40
A 6 1 K 31/426
C 0 7 D 471/04 1 0 5 E
A 6 1 K 31/437
C 0 7 D 277/42
C 0 7 D 495/04 1 1 1
A 6 1 K 31/4188
C 0 7 D 231/12 D
A 6 1 K 31/415
C 0 7 D 239/52
A 6 1 K 31/505
C 0 7 D 403/06
A 6 1 K 31/517
A 6 1 K 31/194
A 6 1 K 31/197
A 6 1 K 31/275
A 6 1 K 31/513
A 2 3 L 1/03
A 2 3 L 2/00 C

【手続補正書】

【提出日】平成22年8月20日(2010.8.20)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

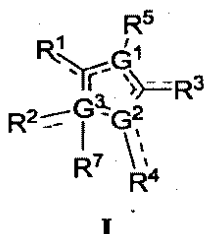
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

甘味を増強する方法であって、甘味物質および式 I

【化 8 1】



(式中、

G¹、G²、およびG³は、N、S、およびCから独立して選択され、

R¹およびR²は、独立して、存在しないか、C₁～6アルキルカルボニル、水素、C₁～6アルキル、ハロゲン、ニトロ、任意に置換されたC₆～14アリール、任意に置換された5～14員のヘテロアリール、Ar-Q、任意に置換された(CH₂)_nC(=O)-O-R^{2a}、および任意に置換された(CH₂)_nC(=O)アリールからなる群から選択されるか、R¹およびR²は、G³およびR¹に結合される炭素原子と一緒にあって、それぞれが、アミノ、ヒドロキシ、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオール、オキソ、C₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₁～6ハロアルキル、C₁～6アルコキシ、C₁～6アルケニルオキシ、および任意に置換されたC₆～14アリールからなる群から独立して選択される1～3個の置換基で任意に置換された、C₆～14アリールまたは5～14員の複素環を形成するか、R¹および/またはR²への結合が二重結合である場合、R¹およびR²は=NHおよび=Oから独立して選択され、

R³は、H、C₁～6ハロアルキル、C₁～6アルキル、オキソ、=NH、任意に置換されたC₆～14アリール、任意に置換された5～14員の複素環、およびL¹-R³¹からなる群から選択され、

R⁴は、存在しないか、H、C₁～6アルキル、C₁～6アルケニル、C₁～6アルコキシ、C₁～6ヒドロキシアルキル、任意に置換されたC₆～14アリール、および任意に置換された(CH₂)_nC(=O)アリールからなる群から選択されるか、R⁴への結合が二重結合である場合、R⁴は=Oであり、

R⁵は、存在しないか、水素、C₁～6アルキル、および任意に置換されたフェニルアミドからなる群から選択され、

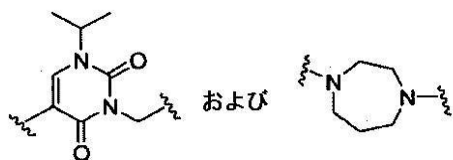
R⁷は、存在しないか、HおよびC₁～6アルキルからなる群から選択され、

R^{2a}は、C₁～6アルキルであり、

R³¹は、H、C₁～6アルキル、C₁～6アルケニル、任意に置換されたフェニル、アミノ、C₁～6アルキルアミノ、またはC₁～6ジアルキルアミノであり、

L¹は、=Z¹-(CH₂)_n-Z²-、-(Het)-C(O)-NH-、=N-(CH₂)_n-C(=Z³)-Z⁴-、-NH-C(=O)-(CH₂)_n-、

【化 5 A】



からなる群から選択されるリンカーであり、

Z¹は、=N、-NH、OおよびSからなる群から選択され、

Z²は、存在しないか、O、S、C(=O)、C(=S)、-C(=O)-O、C(=S)-O、-C(=O)-NH-、または-C(=S)-NHであり、

Z³は、OまたはSであり、

Z⁴は、O、SまたはNHであり、

Hetは5～7員の窒素含有複素環であり、

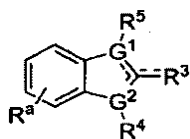
Qは、CH₂、O、NH、またはSであり、

Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、
n は 0 ~ 10 である) の化合物またはその生理学的に許容可能な塩を被験体に投与する
工程を含む、方法。

【請求項 2】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 2】



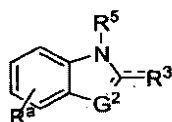
(式中、

R³ は L¹ - R^{3 1} であり、R⁴ は、存在しないか、H、C₁ ~ 6 アルキル、または C₁ ~ 6 ヒドロキシアルキルであり、R⁵ は、存在しないか、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、R^a は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、G¹ および G² は、独立して、C、N、または S である) である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 3】



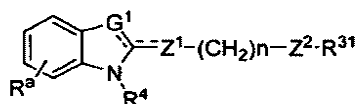
(式中、

R³ は L¹ - R^{3 1} であり、R⁵ は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、
G は、N または S であり、R^a は、H または C₁ ~ 6 アルキルである) である、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 4】



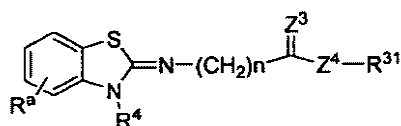
(式中、

G¹ は、S または N であり、
R⁴ は、H、C₁ ~ 6 アルキル、または C₁ ~ 6 ヒドロキシアルキルであり、
R^{3 1} は、H、C₁ ~ 6 アルキル、C₁ ~ 6 アルケニル、または任意に置換されたフェニルであり、
R^a は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、
Z¹ は、S または N であり、
Z² は、-C(=O)-O-、-C(=S)-O-、-O-、-S-、-C(=O)-NH-、または -C(=S)-NH- であり、
n は、0 ~ 4 である) である、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 5】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 5】



(式中、

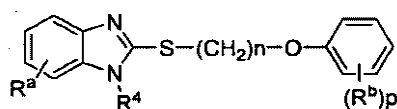
R⁴ は、H、C₁ ~ 6 アルキル、または C₁ ~ 6 ヒドロキシアルキルであり、R^a は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、R³¹ は、H、C₁ ~ 6 アルキル、および C₁ ~ 6 アルケニルから なる群から 選択され、Z³ は、O または S であり、Z⁴ は、O、S、または NH であり、

n は、0 ~ 3 である) である、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 6】



(式中、

R⁴ は、H、C₁ ~ 6 アルキル、および C₁ ~ 6 ヒドロキシアルキルから なる群から 選択され、R^a は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、R^b は、C₁ ~ 6 アルキル、C₁ ~ 6 アルキルオキシ、またはヒドロキシであり、

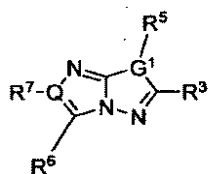
n は、0 ~ 3 であり、

p は、0 ~ 5 である) である、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 7】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 7】



(式中、

G¹ は、N または S であり、

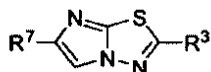
Q は、N または C であり、

R³ は、H または任意に置換されたフェニルであり、R⁵ は、G¹ が N である場合は H であり、そうでなければ存在せず、R⁶ は、H および C₁ ~ 6 アルキルから なる群から 選択され、R⁷ は、H、C₁ ~ 6 アルキル、および任意に置換されたフェニルから なる群から 選択されるか、Q が N である場合、R⁷ は存在しない) である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 8】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 8】



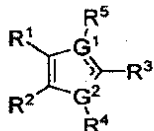
(式中、

R^3 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または任意に置換されたフェニルであり、 R^7 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、および任意に置換されたフェニルからなる群から選択される)である、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

前記式 I の化合物またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 8 9】



(式中、

R^1 および R^2 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシカルボニル、および $Ar-Q$ からなる群から独立して選択され、ここで、Q は、O、NH、S、または CH_2 であり、Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

R^3 は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

R^4 は、存在しないか、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

R^5 は、存在しないか、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

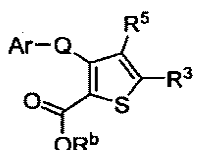
G^1 は、C または N であり、

G^2 は、N または S である)である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 10】

前記式 I の化合物またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 9 0】



(式中、

R^3 は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

R^5 は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

Ar は、 NO_2 、ハロゲン、 $C_1 \sim 6$ アルキル、および $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキルからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基と任意に置換された 5 ~ 10 員のアリール基またはヘテロアリール基であり、

Q は、O または NH であり、

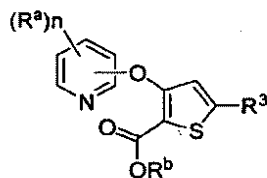
R^b は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

n は、0 ~ 3 である)である、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

前記式 I の化合物またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 9 1】



(式中、

R^3 は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

各 R^a は、 NO_2 、ハロゲン、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキルからなる群から独立して選択され、

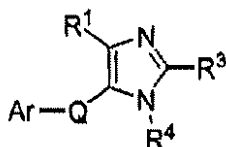
R^b は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

n は、0 ~ 3 である) である、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

前記式 I の化合物またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 9 2 A】



(式中、

R^1 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、ハロゲン、または NO_2 であり、

R^3 および R^4 は、独立して、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

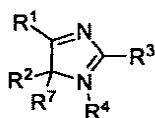
Q は、S、N、または O であり、

Ar は、ニトロおよびハロゲンからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の置換基と任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリールである) である、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 13】

前記式 I の化合物またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 9 3】



(式中、

R^1 および R^3 は、独立して、任意に置換されたフェニルであり、

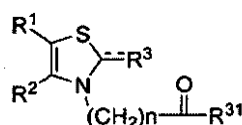
R^4 は、存在しないか、または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

R^2 および R^7 は、独立して、 $C_1 \sim 6$ アルキルである) である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 14】

前記式 I の化合物またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 9 4】



(式中、

R^1 は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

R^2 は H であり、

R^3 は、 C_{1-6} アルキル、H、オキソ、または =NH であり、

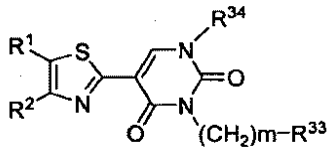
R^{31} は任意に置換されたフェニルであり、

n は、0 ~ 3 である) である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 15】

前記式 I の化合物またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 95】



(式中、

R^1 は、H または C_{1-6} アルキルであり、

R^2 は、H または C_{1-6} アルキルであり、

R^{33} は、任意に置換されたフェニルであり、

R^{34} は、H または C_{1-6} アルキルであり、

m は、1 である) である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 16】

前記式 I の化合物が、

エチル 2 - (3 - メチルベンゾ [d] チアゾール - 2 (3H) - イリデンアミノ) アセタート；

2 - (2 - (2 - メトキシフェノキシ) エチルチオ) - 1H - ベンゾ [d] イミダゾール；

メチル 3 - (5 - ニトロピリジン - 2 - イルオキシ) チオフェン - 2 - カルボキシラート；

6 - (4 - クロロ - 3 - ニトロフェニル) - 3 - エチル - 5H - [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3 - b] [1, 2, 4] トリアゾール；

6 - p - トリルイミダゾ [2, 1 - b] [1, 3, 4] チアジアゾール；

N - フェニル - 4 - (3 - フェニル - 1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル) - 1, 4 - ジアゼパン - 1 - カルボキサミド；

2 - (2 - (2 - (2, 6 - ジメトキシフェノキシ) エチルチオ) - 1H - ベンズイミダゾール - 1 - イル) エタノール；

1 - エチル - 2 - メチル - 4 - ニトロ - 5 - (5 - クロロピリジン - 2 - イルチオ) イミダゾール；

2, 4 - ジフェニル - 5, 5 - ジメチルイミダゾール - 1 - オキシド；

1 - アリル - 3 - (3 - メチルベンゾ [d] チアゾール - 2 - (3H) - イリデン) チオ尿素；

2 - (2 - イミノチアゾール - 3 (2H) - イル) - 1 - (3 - ニトロフェニル) エタノン；

3 - ベンジル - 1 - イソプロピル - 5 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン；

2 - (3 - クロロ - 2 - メトキシフェニル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン；

N - (4 - (4 - エチルフェニル) チアゾール - 2 - イル) - 3, 5 - ジメトキシベンズアミド；

1 - フェニルチオクロメノ [4, 3 - d] イミダゾール - 4 (1H) - オン；

N - (4 - (4 - クロロフェニル) チアゾール - 2 - イル) - 2 - (ジメチルアミノ) アセトアミド；

5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド；および

その生理学的に許容可能な塩からなる群から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 17】

前記甘味物質が、スクロース、フルクトース、およびその混合物からなる群から選択され、前記甘味物質および式 I の化合物を食品中に投与する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 18】

前記食品が飲料である、請求項 17 に記載の方法。

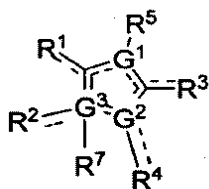
【請求項 19】

前記式 I の化合物および甘味物質の比が、約 $1 : 10^6$ ~ 約 $1 : 10^3$ の範囲である、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 20】

(a) 甘味物質および (b) 式 I :

【化 96】



I

(式中、

G^1 、 G^2 、および G^3 は、N、S、および C から独立して選択され、

R^1 および R^2 は、独立して、存在しないか、 C_{1-6} アルキルカルボニル、水素、 C_{1-6} アルキル、ハロゲン、ニトロ、任意に置換された C_{6-14} アリール、任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリール、 $Ar-Q$ 、任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)-O-R^2$ ^a、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールからなる群から選択されるか、 R^1 および R^2 は、 G^3 および R^1 に結合される炭素原子と一緒にあって、それぞれが、アミノ、ヒドロキシ、ニトロ、ハロゲン、シアノ、チオール、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルケニルオキシ、および任意に置換された C_{6-14} アリールからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で、任意に置換された C_{6-14} アリールまたは 5 ~ 14 員の複素環を形成するか、 R^1 および / または R^2 への結合が二重結合である場合、 R^1 および R^2 は $=NH$ および $=O$ から独立して選択され、

R^3 は、H、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルキル、オキソ、 $=NH$ 、任意に置換された C_{6-14} アリール、任意に置換された 5 ~ 14 員の複素環、および L^1-R^{31} からなる群から選択され、

R^4 は、存在しないか、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、任意に置換された C_{6-14} アリール、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールからなる群から選択されるか、 R^4 への結合が二重結合である場合、 R^4 は $=O$ であり、

R^5 は、存在しないか、水素、 C_{1-6} アルキル、および任意に置換されたフェニルアミドからなる群から選択され、

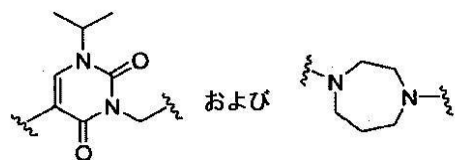
R^7 は、存在しないか、H および C_{1-6} アルキルからなる群から選択され、

R^2 ^a は、 C_{1-6} アルキルであり、

R^{31} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、任意に置換されたフェニル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、または C_{1-6} ジアルキルアミノであり、

L^1 は、 $=Z^1-(CH_2)_n-Z^2-$ 、 $-Het-C(O)-NH-$ 、 $=N-(CH_2)_n-C(=Z^3)-Z^4-$ 、 $-NH-C(=O)-(CH_2)_n-$ 、

【化 5 A】



からなる群から選択されるリンカーであり、

Z^1 は、 $=N$ 、 $-NH$ 、 O および S からなる群から選択され、

Z^2 は、存在しないか、 O 、 S 、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $-C(=O)-O$ 、 $C(=S)-O$ 、 $-C(=O)-NH-$ 、または $-C(=S)-NH$ であり、

Z^3 は、 O または S であり、

Z^4 は、 O 、 S または NH であり、

Het は 5 ~ 7 員の窒素含有複素環であり、

Q は、 CH_2 、 O 、 NH 、または S であり、

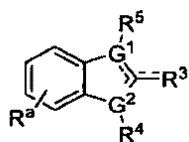
Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

n は 0 ~ 10 である) の化合物またはその生理学的に許容可能な塩を含む組成物。

【請求項 21】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 97】



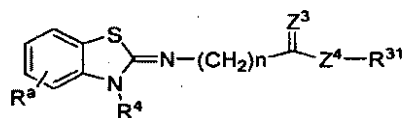
(式中、

R^3 は $L^1 - R^{31}$ であり、 R^4 は、存在しないか、 H 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキルであり、 R^5 は、存在しないか、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 R^a は、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 G^1 および G^2 は、独立して、 C 、 N 、または S である) である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 98】



(式中、

R^4 は、 H 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキルであり、

R^a は、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

R^{31} は、 H 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、および $C_1 \sim 6$ アルケニルから なる群から選択され

Z^3 は、 O または S であり、

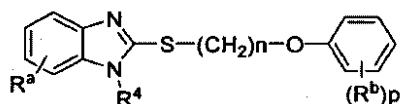
Z^4 は、 O 、 S 、または NH であり、

n は、0 ~ 3 である) である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 9 9】



(式中、

R^4 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、および $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキルから なる群から選択され、

R^a は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

R^b は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキルオキシ、またはヒドロキシであり、

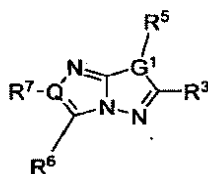
n は、0 ~ 3 であり、

p は、0 ~ 5 である) である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 100】



(式中、

G^1 は、N または S であり、

Q は、N または C であり、

R^3 は、H または任意に置換されたフェニルであり、

R^5 は、 G^1 が N である場合に H であり、そうでなければ存在せず、

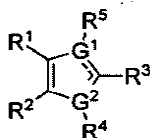
R^6 は、H および $C_1 \sim 6$ アルキルから なる群から選択され、

R^7 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、および任意に置換されたフェニルから なる群から選択されるか、Q が N である場合に R^7 は存在しない) である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 25】

前記式 I の化合物 またはその生理学的に許容可能な塩が、

【化 101】



(式中、

R^1 および R^2 は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシカルボニル、および Ar-Q からなる群から独立して選択され、ここで、Q は、O、NH、S、または CH_2 であり、Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、 R^3 は、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 R^4 は、存在しないか、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 R^5 は、存在しないか、H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 G^1 は、C または N であり、 G^2 は、N または S である) である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 26】

Ar-Q は、任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリールオキシまたは任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリールチオである、請求項 1 に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

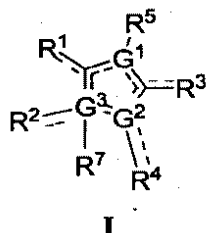
【0022】

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目 1)

甘味を増強する方法であって、甘味物質および式 I

【化 8 1】



(式中、

R^1 および R^2 は、独立して、存在しないか、水素、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、ハロゲン、ニトロ、任意に置換された $C_{6 \sim 14}$ アリール、任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリール、 $Ar-Q$ (任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリールオキシおよび任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリールチオなど)、任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)-O-R^a$ 、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールから選択されるか、 R^1 および R^2 は、 G^3 および R^1 に結合される炭素原子と一緒に、それぞれが任意に置換された $C_{6 \sim 14}$ アリールまたは 5 ~ 14 員の複素環を形成するか、 R^1 および / または R^2 への結合が二重結合である場合、 R^1 および R^2 は $=NH$ および $=O$ から独立して選択され、

R^3 は、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、任意に置換された $C_{6 \sim 14}$ アリール、任意に置換された 5 ~ 14 員の複素環、および $L^1-R^{3'}$ からなる群から選択され、

R^4 は、存在しないか、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ アルケニル、 $C_{1 \sim 6}$ アルコキシ、 $C_{1 \sim 6}$ ヒドロキシアルキル、任意に置換された $C_{6 \sim 14}$ アリール、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールからなる群から選択されるか、 R^4 への結合が二重結合である場合、 R^4 は $=O$ であり、

R^5 は、存在しないか、水素、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、および任意に置換されたフェニルアミドから選択され、

R^7 は、存在しないか、 H および $C_{1 \sim 6}$ アルキルから選択され、

$R^{3'}$ は、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ アルケニル、任意に置換されたフェニル、アミノ、 $C_{1 \sim 6}$ アルキルアミノ、または $C_{1 \sim 6}$ ジアルキルアミノであり、

Z^1 は、 $=N$ 、 $-NH$ 、 O 、および S から選択され、

Z^2 は、存在しないか、 O 、 S 、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $-C(=O)-O$ 、 $C(=S)-O$ 、 $-C(=O)-NH-$ 、または $-C(=S)-NH$ であり、

L^1 は、1 ~ 30 個の炭素原子および / またはヘテロ原子を含むリンカーであり、

Q は、 CH_2 、 O 、 NH 、または S であり、

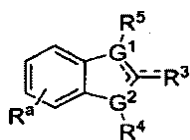
Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

n は 0 ~ 10 である) の化合物またはその生理学的に許容可能な塩を被験体に投与する工程を含む、方法。

(項目 2)

前記式 I の化合物が、

【化 8 2】



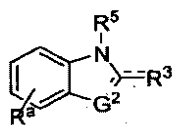
(式中、

R^3 は $L^1 - R^{31}$ であり、 R^4 は、存在しないか、 H 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキルであり、 R^5 は、存在しないか、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 R^a は、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 G^1 および G^2 は、独立して、 C 、 N 、または S である) である、項目 1 に記載の方法。

(項目 3)

前記化合物が、

【化 8 3】



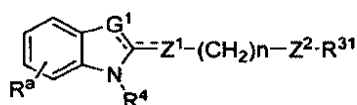
(式中、

R^3 は $L^1 - R^{31}$ であり、 R^5 は、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 G は、 N または S であり、 R^a は、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルである) である、項目 2 に記載の方法。

(項目 4)

前記式 I の化合物が、

【化 8 4】

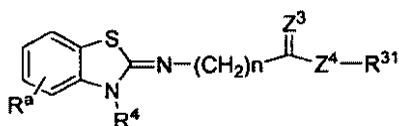


(式中、

G^1 は、 S または N であり、
 R^4 は、 H 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、または $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキルであり、
 R^{31} は、 H 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルケニル、または任意に置換されたフェニルであり、
 R^a は、 H または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、
 Z^1 は、 S または N であり、
 Z^2 は、 $-C(=O)-O-$ 、 $-C(=S)-O-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(=O)-N$ 、 $H-$ 、または $-C(=S)-NH-$ であり、
 n は、 $0 \sim 4$ である) である、項目 2 に記載の方法。

(項目 5)

【化 8 5】



(式中、

R^4 は、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、または $C_{1 \sim 6}$ ヒドロキシアルキルであり、

R^a は、H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり、

R^{31} は、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、および $C_{1 \sim 6}$ アルケニルから選択され、

Z^3 は、O または S であり、

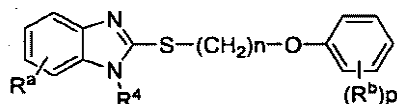
Z^4 は、O、S、または NH であり、

n は、0 ~ 3 である) である、項目 4 に記載の方法。

(項目 6)

前記化合物が、

【化 8 6】



(式中、

R^4 は、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、および $C_{1 \sim 6}$ ヒドロキシアルキルから選択され、

R^a は、H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり、

R^b は、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ アルキルオキシ、またはヒドロキシであり、

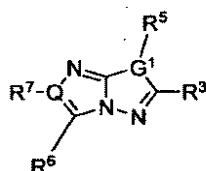
n は、0 ~ 3 であり、

p は、0 ~ 5 である) である、項目 4 に記載の方法。

(項目 7)

前記式 I の化合物が、

【化 8 7】



(式中、

G^1 は、N または S であり、

Q は、N または C であり、

R^3 は、H または任意に置換されたフェニルであり、

R^5 は、 G^1 が N である場合は H であり、そうでなければ存在せず、

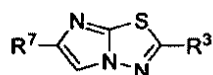
R^6 は、H および $C_{1 \sim 6}$ アルキルから選択され、

R^7 は、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、および任意に置換されたフェニルから選択されるか、Q が N である場合、 R^7 は存在しない) である、項目 1 に記載の方法。

(項目 8)

前記化合物が、

【化 8 8】



(式中、

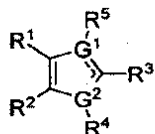
R^3 は、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、または任意に置換されたフェニルであり、 R^7 は、H、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、および任意に置換されたフェニルから選択される) である、項目 7

に記載の方法。

(項目9)

前記式Iの化合物が、

【化89】



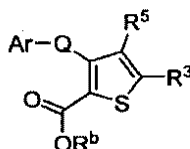
(式中、

R^1 および R^2 は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、および Ar-Q からなる群から独立して選択され、ここで、Q は、O、NH、S、または CH_2 であり、Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、 R^3 は、H または C_{1-6} アルキルであり、 R^4 は、存在しないか、H または C_{1-6} アルキルであり、 R^5 は、存在しないか、H または C_{1-6} アルキルであり、 G^1 は、C または N であり、 G^2 は、N または S である) である、項目1に記載の方法。

(項目10)

前記化合物が、

【化90】



(式中、

R^3 は、H または C_{1-6} アルキルであり、

R^5 は、H または C_{1-6} アルキルであり、

Ar は、 NO_2 、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、および C_{1-6} ヒドロキシアルキルからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基と任意に置換された5～10員のアリール基またはヘテロアリール基であり、

Q は、O または NH であり、

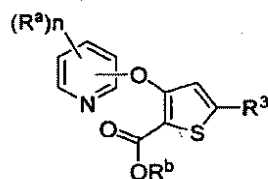
R^b は、H または C_{1-6} アルキルであり、

n は、0～3 である) である、項目9に記載の方法。

(項目11)

前記化合物が、

【化91】



(式中、

R^3 は、H または C_{1-6} アルキルであり、

各 R^a は、 NO_2 、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ヒドロキシアルキルからなる群から独立して選択され、

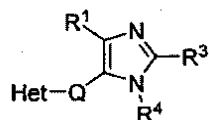
R^b は、H または C_{1-6} アルキルであり、

n は、0 ~ 3 である) である、項目 10 に記載の方法。

(項目 12)

前記化合物が、

【化 9 2】



(式中、

R^1 は、H、 C_{1-6} アルキル、ハロゲン、または NO_2 であり、

R^3 および R^4 は、独立して、H または C_{1-6} アルキルであり、

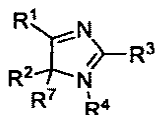
Q は、S、N、または O であり、

Het は、ニトロおよびハロゲンからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の置換基と任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリールである) である、項目 9 に記載の方法。

(項目 13)

前記式 I の化合物が、

【化 9 3】



(式中、

R^1 および R^3 は、独立して、任意に置換されたフェニルであり、

R^4 は、存在しないか、O または C_{1-6} アルキルであり、

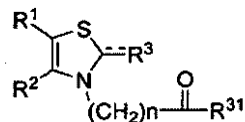
R^2 および R^7 は、独立して、 C_{1-6} アルキルである) である、項目 1 に記載の方法

。

(項目 14)

前記化合物が、

【化 9 4】



(式中、

R^1 は、H または C_{1-6} アルキルであり、

R^2 は H であり、

R^3 は、 C_{1-6} アルキル、H、オキソ、または =NH であり、

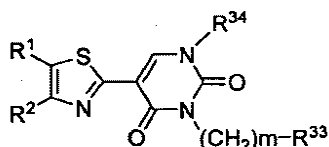
R^{31} は任意に置換されたフェニルであり、

n は、0 ~ 3 である) である、項目 1 に記載の方法。

(項目 15)

前記化合物が、

【化 9 5】



(式中、

R¹ は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、R² は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、R³³ は、任意に置換されたフェニルであり、R³⁴ は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、m は、0 ~ 3 である) である、項目 1 に記載の方法。

(項目 1 6)

前記化合物が、エチル 2 - (3 - メチルベンゾ [d] チアゾール - 2 (3 H) - イリデンアミノ) アセタート ;2 - (2 - (2 - メトキシフェノキシ) エチルチオ) - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール ;メチル 3 - (5 - ニトロピリジン - 2 - イルオキシ) チオフエン - 2 - カルボキシラート ;6 - (4 - クロロ - 3 - ニトロフェニル) - 3 - エチル - 5 H - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - b] [1 , 2 , 4] トリアゾール ;6 - p - トリルイミダゾ [2 , 1 - b] [1 , 3 , 4] チアジアゾール ;N - フェニル - 4 - (3 - フェニル - 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル) - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - カルボキサミド ;2 - (2 - (2 - (2 , 6 - ジメトキシフェノキシ) エチルチオ) - 1 H - ベンズイミダゾール - 1 - イル) エタノール ;1 - エチル - 2 - メチル - 4 - ニトロ - 5 - (5 - クロロピリジン - 2 - イルチオ) イミダゾール ;2 , 4 - ジフェニル - 5 , 5 - ジメチルイミダゾール - 1 - オキシド ;1 - アリル - 3 - (3 - メチルベンゾ [d] チアゾール - 2 - (3 H) - イリデン) チオ尿素 ;2 - (2 - イミノチアゾール - 3 (2 H) - イル) - 1 - (3 - ニトロフェニル) エタノン ;3 - ベンジル - 1 - イソプロピル - 5 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イル) ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;2 - (3 - クロロ - 2 - メトキシフェニル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン ;N - (4 - (4 - エチルフェニル) チアゾール - 2 - イル) - 3 , 5 - ジメトキシベンズアミド ;1 - フェニルチオクロメノ [4 , 3 - d] イミダゾール - 4 (1 H) - オン ;N - (4 - (4 - クロロフェニル) チアゾール - 2 - イル) - 2 - (ジメチルアミノ) アセトアミド ;5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド ; およびその生理学的に許容可能な塩からなる群から選択される、項目 1 に記載の方法。

(項目 1 7)

前記甘味物質が、スクロース、フルクトース、およびその混合物からなる群から選択され、前記甘味物質および式 I の化合物を食品中に投与する、項目 1 に記載の方法。

(項目 1 8)

前記食品が飲料である、項目 17 に記載の方法。

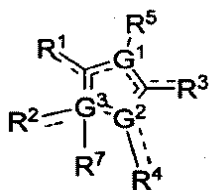
(項目 19)

前記式 I の化合物および甘味物質の比が、約 $1 : 10^6$ ~ 約 $1 : 10^3$ の範囲である、
項目 18 に記載の方法。

(項目 20)

(a) 甘味物質および (b) 式 I :

【化 96】



I

(式中、

R^1 および R^2 は、独立して、存在しないか、水素、 C_{1-6} アルキル、ハロゲン、ニトロ、任意に置換された C_{6-14} アリール、任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリール、 $Ar-Q$ (任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリールオキシおよび任意に置換された 5 ~ 14 員のヘテロアリールチオなど)、任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)-O-R^a$ 、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールから選択されるか、 R^1 および R^2 は、 G^3 および R^1 に結合される炭素原子と一緒にあって、それぞれが任意に置換された C_{6-14} アリールまたは 5 ~ 14 員の複素環を形成するか、 R^1 および / または R^2 への結合が二重結合である場合、 R^1 および R^2 は $=NH$ および $=O$ から独立して選択され、

R^3 は、 H 、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルキル、任意に置換された C_{6-14} アリール、任意に置換された 5 ~ 14 員の複素環、および $L^1-R^{3'}$ からなる群から選択され、

R^4 は、存在しないか、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、任意に置換された C_{6-14} アリール、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールからなる群から選択されるか、 R^4 への結合が二重結合である場合、 R^4 は $=O$ であり、

R^5 は、存在しないか、水素、 C_{1-6} アルキル、および任意に置換されたフェニルアミドから選択され、

R^7 は、存在しないか、 H および C_{1-6} アルキルから選択され、

$R^{3'}$ は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、任意に置換されたフェニル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、または C_{1-6} ジアルキルアミノであり、

Z^1 は、 $=N$ 、 $-NH$ 、 O 、および S から選択され、

Z^2 は、存在しないか、 O 、 S 、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $-C(=O)-O$ 、 $C(=S)-O$ 、 $-C(=O)-NH-$ 、または $-C(=S)-NH$ であり、

L^1 は、1 ~ 30 個の炭素原子および / またはヘテロ原子を含むリンカーであり、

Q は、 CH_2 、 O 、 NH 、または S であり、

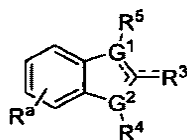
Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

n は 0 ~ 10 である) の化合物またはその生理学的に許容可能な塩を含む組成物。

(項目 21)

前記式 I の化合物が、

【化 9 7】



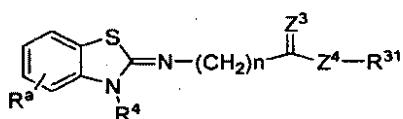
(式中、

R^3 は $L^1 - R^{31}$ であり、 R^4 は、存在しないか、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、または $C_{1 \sim 6}$ ヒドロキシアルキルであり、 R^5 は、存在しないか、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり、 R^a は、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり、 G^1 および G^2 は、独立して、 C 、 N 、または S である) である、項目 20 に記載の組成物。

(項目 22)

前記式 I の化合物が、

【化 9 8】



(式中、

R^4 は、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、または $C_{1 \sim 6}$ ヒドロキシアルキルであり、

R^a は、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり、

R^{31} は、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、および $C_{1 \sim 6}$ アルケニルから選択され、

Z^3 は、 O または S であり、

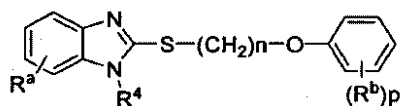
Z^4 は、 O 、 S 、または NH であり、

n は、 $0 \sim 3$ である) である、項目 20 に記載の組成物。

(項目 23)

前記式 I の化合物が、

【化 9 9】



(式中、

R^4 は、 H 、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、および $C_{1 \sim 6}$ ヒドロキシアルキルから選択され、

R^a は、 H または $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり、

R^b は、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ アルキルオキシ、またはヒドロキシであり、

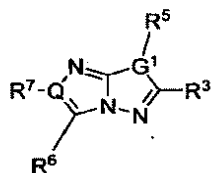
n は、 $0 \sim 3$ であり、

p は、 $0 \sim 5$ である) である、項目 20 に記載の組成物。

(項目 24)

前記式 I の化合物が、

【化 1 0 0】



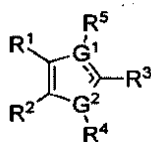
(式中、

G¹ は、N または S であり、Q は、N または C であり、R³ は、H または任意に置換されたフェニルであり、R⁵ は、G¹ が N である場合に H であり、そうでなければ存在せず、R⁶ は、H および C₁ ~ 6 アルキルから選択され、R⁷ は、H、C₁ ~ 6 アルキル、および任意に置換されたフェニルから選択されるか、Q が N である場合に R⁷ は存在しない) である、項目 2 0 に記載の組成物。

(項目 2 5)

前記式 I の化合物が、

【化 1 0 1】



(式中、

R¹ および R² は、H、C₁ ~ 6 アルキル、C₁ ~ 6 アルコキシカルボニル、および Ar - Q からなる群から独立して選択され、ここで、Q は、O、NH、S、または CH₂ であり、Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、R³ は、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、R⁴ は、存在しないか、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、R⁵ は、存在しないか、H または C₁ ~ 6 アルキルであり、G¹ は、C または N であり、G² は、N または S である) である、項目 2 0 に記載の組成物。

本発明のこれらの態様およびさらなる態様を、以下に詳述する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

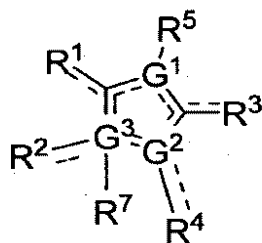
【補正対象項目名】0 0 2 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 8】

【化 1】



I

(式中、

G^1 、 G^2 、および G^3 は、N、S、およびCから独立して選択され、

R^1 および R^2 は、独立して、存在しないか、水素、 C_{1-6} アルキル、ハロゲン、ニトロ、任意に置換された C_{6-14} アリール、任意に置換された5～14員のヘテロアリール、任意に置換された5～14員のヘテロアリールオキシ、任意に置換された5～14員のヘテロアリールチオ、Ar-Q、任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)-O-R^{2a}$ 、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールから選択されるか、 R^1 および R^2 は、 G^3 および R^1 に結合される炭素原子と一緒にあって、それぞれが任意に置換された C_{6-14} アリールまたは5～14員の複素環を形成するか、 R^1 および/または R^2 への結合が二重結合である場合、 R^1 および R^2 は=NHおよび=Oから独立して選択され、

R^3 は、H、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルキル、オキシ、=NH、任意に置換された C_{6-14} アリール、任意に置換された5～14員の複素環から選択されるか、 R^3 は L^1-R^{31} 、 $(=Z^1-(CH_2)_n-Z^2-R^{31})$ であるか、

R^4 は、存在しないか、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、任意に置換された C_{6-14} アリール、および任意に置換された $(CH_2)_n C(=O)$ アリールからなる群から選択されるか、 R^4 への結合が二重結合である場合、 R^4 は=Oであり、

R^5 は、存在しないか、水素、 C_{1-6} アルキル、および任意に置換されたフェニルアミドから選択され、

R^{2a} は、 C_{1-6} アルキルであり、

R^7 は、存在しないか、Hおよび C_{1-6} アルキルから選択され、

R^{31} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルケニル、任意に置換されたフェニル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、または C_{1-6} ジアルキルアミノであり、

Z^1 は、=N、-NH、O、およびSから選択され、

Z^2 は、O、S、 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $-C(=O)-O$ 、 $C(=S)-O$ 、 $-C(=O)-NH-$ 、または $-C(=S)-NH$ であり、

L^1 は、1～30個の炭素原子および/またはヘテロ原子を含むリンカーであり、

Qは、 CH_2 、O、NH、またはSであり、

Arは、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

nは0～10である)の化合物またはその生理学的に許容可能な塩を被験体に投与する工程を含む、方法に関する。