

【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

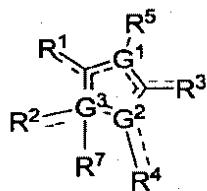
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

甘味を増強する方法であつて、甘味物質および式I

【化 8 1】

**I**

(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-R²^a、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になって、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、

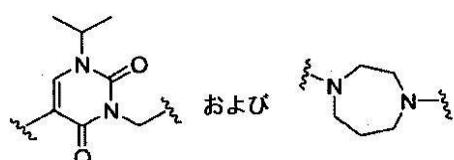
R⁵は、存在しないか、水素、C₁~₆アルキル、および任意に置換されたフェニルアミドからなる群から選択され、

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、R²^a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、

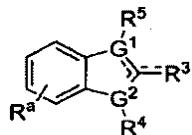
Z²は、存在しないか、O、S、C(=O)、C(=S)、-C(=O)-O、C(=S)-O、-C(=O)-NH-、または-C(=S)-NHであり、

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、

A_r 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】

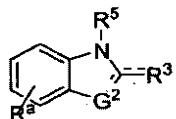


(式中、

R^3 は $L^1 - R^{31}$ であり、 R^4 は、存在しないか、H、C_{1~6} アルキル、またはC_{1~6} 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_{1~6} アルキルであり、 R^a は、HまたはC_{1~6} 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 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】

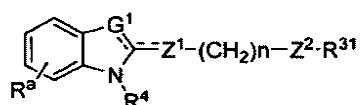


(式中、

R^3 は $L^1 - R^{31}$ であり、 R^5 は、HまたはC_{1~6} 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_{1~6} 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、

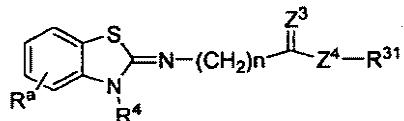
G^1 は、S またはN であり、 R^4 は、H、C_{1~6} アルキル、またはC_{1~6} ヒドロキシアルキルであり、 R^{31} は、H、C_{1~6} アルキル、C_{1~6} アルケニル、または任意に置換されたフェニルであり、

R^a は、HまたはC_{1~6} 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)-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85】



(式中、

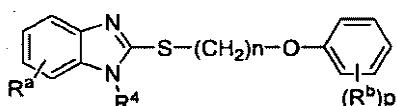
R⁴は、H、C₁～₆アルキル、またはC₁～₆ヒドロキシアルキルであり、R^aは、HまたはC₁～₆アルキルであり、R³¹は、H、C₁～₆アルキル、およびC₁～₆アルケニルからなる群から選択されZ³は、OまたはSであり、Z⁴は、O、S、またはNHであり、

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86】



(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、

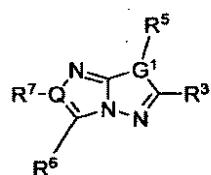
nは、0～3であり、

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87】



(式中、

G¹は、NまたはSであり、

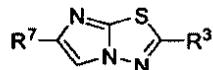
Qは、NまたはCであり、

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】



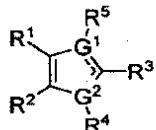
(式中、

R³ は、 H、 C₁ ~ ₆ アルキル、 または任意に置換されたフェニルであり、 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) 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、

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、

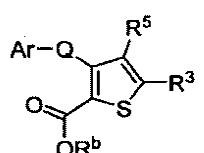
G¹ は、 C または N であり、

G² は、 N または S である) である、 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、

R³ は、 H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、

R⁵ は、 H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、

Ar は、 NO₂、 ハロゲン、 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、

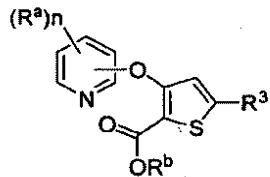
R^b は、 H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、

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91】



(式中、

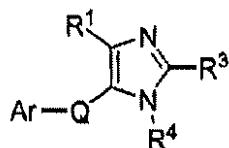
R³ は、H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、各 R^a は、NO₂、ハロゲン、C₁ ~ ₆ アルキル、または C₁ ~ ₆ ヒドロキシアルキルからなる群から独立して選択され、R^b は、H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、

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92A】



(式中、

R¹ は、H、C₁ ~ ₆ アルキル、ハロゲン、または NO₂ であり、R³ および R⁴ は、独立して、H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、

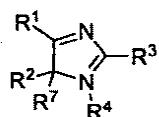
Q は、S、N、または O であり、

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93】



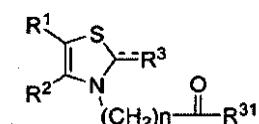
(式中、

R¹ および R³ は、独立して、任意に置換されたフェニルであり、R⁴ は、存在しないか、または C₁ ~ ₆ アルキルであり、R² および R⁷ は、独立して、C₁ ~ 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94】



(式中、

R¹ は、H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、

R² は H であり、

R³ は、C₁ ~ ₆ アルキル、H、オキソ、または = NH であり、

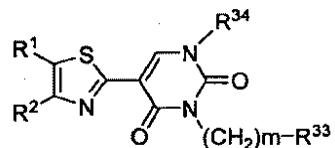
R³¹ は任意に置換されたフェニルであり、

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、

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、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, 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。

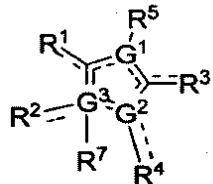
【請求項 19】

前記式 I の化合物および甘味物質の比が、約 1 : 10⁶ ~ 約 1 : 10³ 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、

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、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(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になって、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、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、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L¹-R³¹ からなる群から選択され、

R⁴ 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(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、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、

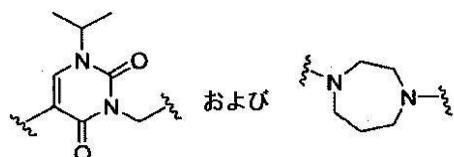
R⁷ は、存在しないか、H および C_{1 ~ 6} アルキルからなる群から選択され、

R^{2a} は、C_{1 ~ 6} アルキルであり、

R³¹ 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、

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

【化5A】



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、

H e t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、

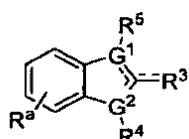
A rは、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

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】



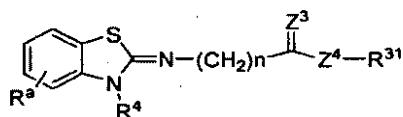
(式中、

R³はL¹-R³¹であり、R⁴は、存在しないか、H、C_{1~6}アルキル、またはC_{1~6}ヒドロキシアルキルであり、R⁵は、存在しないか、HまたはC_{1~6}アルキルであり、R^aは、HまたはC_{1~6}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、

R⁴は、H、C_{1~6}アルキル、またはC_{1~6}ヒドロキシアルキルであり、

R^aは、HまたはC_{1~6}アルキルであり、

R³¹は、H、C_{1~6}アルキル、およびC_{1~6}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、

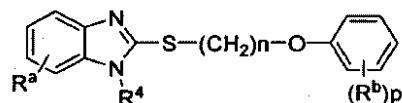
Z⁴は、O、S、またはNHであり、

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99】



(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、

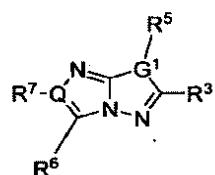
R^bは、C₁～₆アルキル、C₁～₆アルキルオキシ、またはヒドロキシであり、nは、0～3であり、

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、

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、

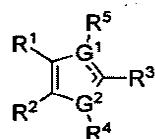
R⁶は、HおよびC₁～₆アルキルからなる群から選択され、

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である場合にR⁷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、

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、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】

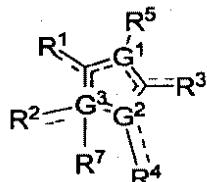
【0022】

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81】



I

(式中、

R¹ および R² は、独立して、存在しないか、水素、C_{1～6}アルキル、ハロゲン、二トロ、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(CH₂)_nC(=O)-O-R^a、および任意に置換された(CH₂)_nC(=O)アリールから選択されるか、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になって、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、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、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L¹-R³-L¹からなる群から選択され、

R⁴ 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(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、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、

R⁷ は、存在しないか、H および C_{1～6}アルキルから選択され、

R³-L¹ 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、

Z¹ は、= N、-NH、O、および S 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、

L¹ 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、CH₂、O、NH、または S であり、

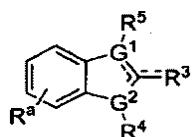
Ar は、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

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。

(項目2)

前記式Iの化合物が、

【化82】



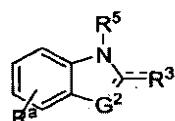
(式中、

R³はL¹-R³¹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、項目1に記載の方法。

(項目3)

前記化合物が、

【化83】



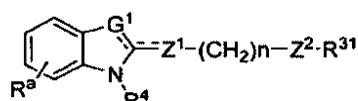
(式中、

R³はL¹-R³¹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、項目2に記載の方法。

(項目4)

前記式Iの化合物が、

【化84】

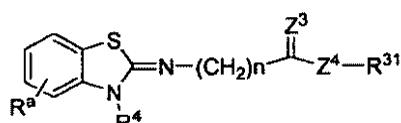


(式中、

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、R³¹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)-N-H-、または-C(=S)-NH-であり、nは、0~4である)である、項目2に記載の方法。

(項目5)

【化85】



(式中、

R⁴は、H、C_{1～6}アルキル、またはC_{1～6}ヒドロキシアルキルであり、

R^aは、HまたはC_{1～6}アルキルであり、

R³は、H、C_{1～6}アルキル、およびC_{1～6}アルケニルから選択され、

Z³は、OまたはSであり、

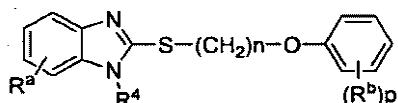
Z⁴は、O、S、またはNHであり、

nは、0～3である)である、項目4に記載の方法。

(項目6)

前記化合物が、

【化86】



(式中、

R⁴は、H、C_{1～6}アルキル、およびC_{1～6}ヒドロキシアルキルから選択され、

R^aは、HまたはC_{1～6}アルキルであり、

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

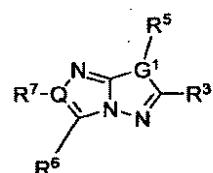
nは、0～3であり、

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87】



(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C_{1～6}アルキルから選択され、

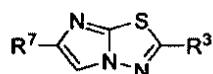
R⁷は、H、C_{1～6}アルキル、および任意に置換されたフェニルから選択されるか、

QがNである場合、R⁷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88】



(式中、

R³は、H、C_{1～6}アルキル、または任意に置換されたフェニルであり、R⁷は、H

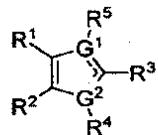
、C_{1～6}アルキル、および任意に置換されたフェニルから選択される)である、項目7

に記載の方法。

(項目 9)

前記式 I の化合物が、

【化 8 9】



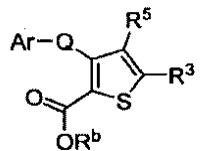
(式中、

R¹ および R² 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 A_r-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、A_r 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 C_{1～6} アルキルであり、R⁴ は、存在しないか、H または C_{1～6} アルキルであり、R⁵ は、存在しないか、H または C_{1～6} 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 1 に記載の方法。

(項目 10)

前記化合物が、

【化 9 0】



(式中、

R³ は、H または C_{1～6} アルキルであり、

R⁵ は、H または C_{1～6} アルキルであり、

A_r は、NO₂、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、

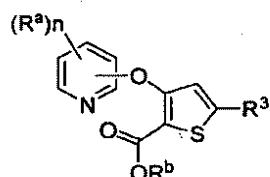
R^b は、H または C_{1～6} アルキルであり、

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 9 1】



(式中、

R³ は、H または C_{1～6} アルキルであり、

各 R^a は、NO₂、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、

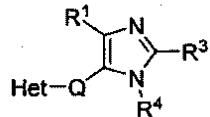
R^b は、H または C_{1～6} アルキルであり、

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、

R¹ は、H、C₁ ~ ₆ アルキル、ハロゲン、またはNO₂ であり、

R³ およびR⁴ は、独立して、HまたはC₁ ~ ₆ アルキルであり、

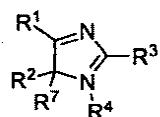
Q は、S、N、またはO であり、

H e t 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、

R¹ およびR³ は、独立して、任意に置換されたフェニルであり、

R⁴ は、存在しないか、O またはC₁ ~ ₆ アルキルであり、

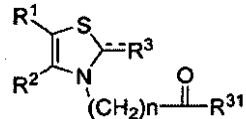
R² およびR⁷ は、独立して、C₁ ~ ₆ アルキルである) である、項目 1 に記載の方法。

。

(項目 14)

前記化合物が、

【化 9 4】



(式中、

R¹ は、H または C₁ ~ ₆ アルキルであり、

R² は H であり、

R³ は、C₁ ~ ₆ アルキル、H、オキソ、または = NH であり、

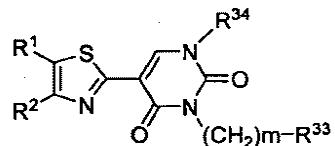
R³¹ は任意に置換されたフェニルであり、

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95】

(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16)前記化合物が、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、項目1に記載の方法。(項目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、項目1に記載の方法。(項目18)

前記食品が飲料である、項目17に記載の方法。

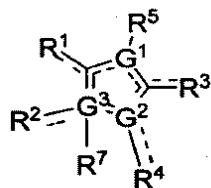
(項目19)

前記式Iの化合物および甘味物質の比が、約1:10⁶～約1:10³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、

R¹およびR²は、独立して、存在しないか、水素、C_{1～6}アルキル、ハロゲン、二トロ、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(CH₂)_nC(=O)-O-R^a、および任意に置換された(CH₂)_nC(=O)アリールから選択されるか、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になって、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、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、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L¹-R³からなる群から選択され、

R⁴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(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、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、

R⁷は、存在しないか、HおよびC_{1～6}アルキルから選択され、
R³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、

Z¹は、=N、-NH、O、およびS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、

L¹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、CH₂、O、NH、またはSであり、

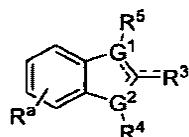
Arは、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールであり、

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含む組成物。

(項目21)

前記式Iの化合物が、

【化97】



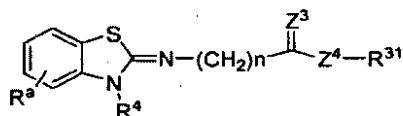
(式中、

R³はL¹-R³¹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、項目20に記載の組成物。

(項目22)

前記式Iの化合物が、

【化98】



(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、

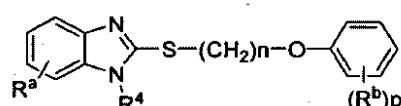
Z⁴は、O、S、またはNHであり、

nは、0~3である)である、項目20に記載の組成物。

(項目23)

前記式Iの化合物が、

【化99】



(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、

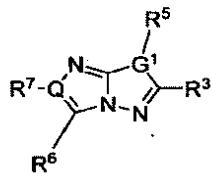
nは、0~3であり、

pは、0~5である)である、項目20に記載の組成物。

(項目24)

前記式Iの化合物が、

【化100】



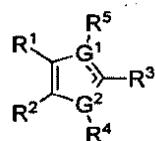
(式中、

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C_{1~6}アルキルから選択され、R⁷は、H、C_{1~6}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20に記載の組成物。

(項目25)

前記式Iの化合物が、

【化101】



(式中、

R¹およびR²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C_{1~6}アルキルであり、R⁴は、存在しないか、HまたはC_{1~6}アルキルであり、R⁵は、存在しないか、HまたはC_{1~6}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20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

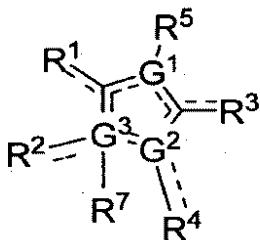
【補正対象項目名】0028

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0028】

【化1】



(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 $(CH_2)_nC(=O)-O-R^2$ ^a、および任意に置換された $(CH_2)_nC(=O)$ 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になって、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 $(CH_2)_nC(=O)$ 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。