

(19) 日本国特許庁(JP)

## (12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第5978309号  
(P5978309)

(45) 発行日 平成28年8月24日(2016.8.24)

(24) 登録日 平成28年7月29日(2016.7.29)

(51) Int.Cl.	F 1
A 23 L 27/20	(2016.01) A 23 L 27/20
A 23 C 19/02	(2006.01) A 23 C 19/02
A 23 L 27/40	(2016.01) A 23 L 27/40
A 61 K 47/10	(2006.01) A 61 K 47/10
A 61 K 47/08	(2006.01) A 61 K 47/08

請求項の数 19 (全 65 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2014-537040 (P2014-537040)  
 (86) (22) 出願日 平成23年10月20日 (2011.10.20)  
 (65) 公表番号 特表2014-533935 (P2014-533935A)  
 (43) 公表日 平成26年12月18日 (2014.12.18)  
 (86) 國際出願番号 PCT/US2011/057146  
 (87) 國際公開番号 WO2013/058758  
 (87) 國際公開日 平成25年4月25日 (2013.4.25)  
 審査請求日 平成26年10月7日 (2014.10.7)

(73) 特許権者 511181544  
 クロモセル コーポレーション  
 アメリカ合衆国、ニュージャージー州 O  
 8902, ノース ブランズウィック, 6  
 85 ユー. エス. ハイウェイ ワン  
 (73) 特許権者 514062242  
 クラフト・フーズ・グループ・プランズ・  
 エルエルシー  
 アメリカ合衆国 イリノイ州 60601  
 シカゴ イースト ランドルフ ストリ  
 ート 200 スイート 7600  
 (74) 代理人 100114775  
 弁理士 高岡 亮一  
 (74) 代理人 100121511  
 弁理士 小田 直

最終頁に続く

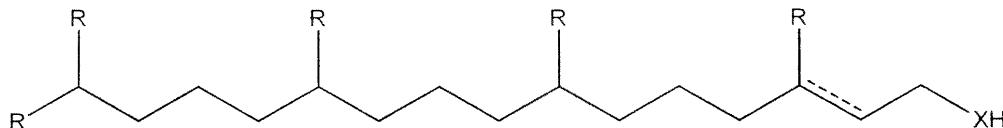
(54) 【発明の名称】 苦味を低減または排除するための化合物、組成物、および方法

## (57) 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

i ) 苦味物質であって、ここで苦味物質がカリウム塩である、苦味物質、ならびに  
i i ) 以下の式 ( I )

## 【化 1】



式 ( I ) ;

10

による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを含む組成物であって、

式中、原子価および安定性が許容するよう：

X は S または O であり；

各 R は独立して H、もしくは C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルであり；

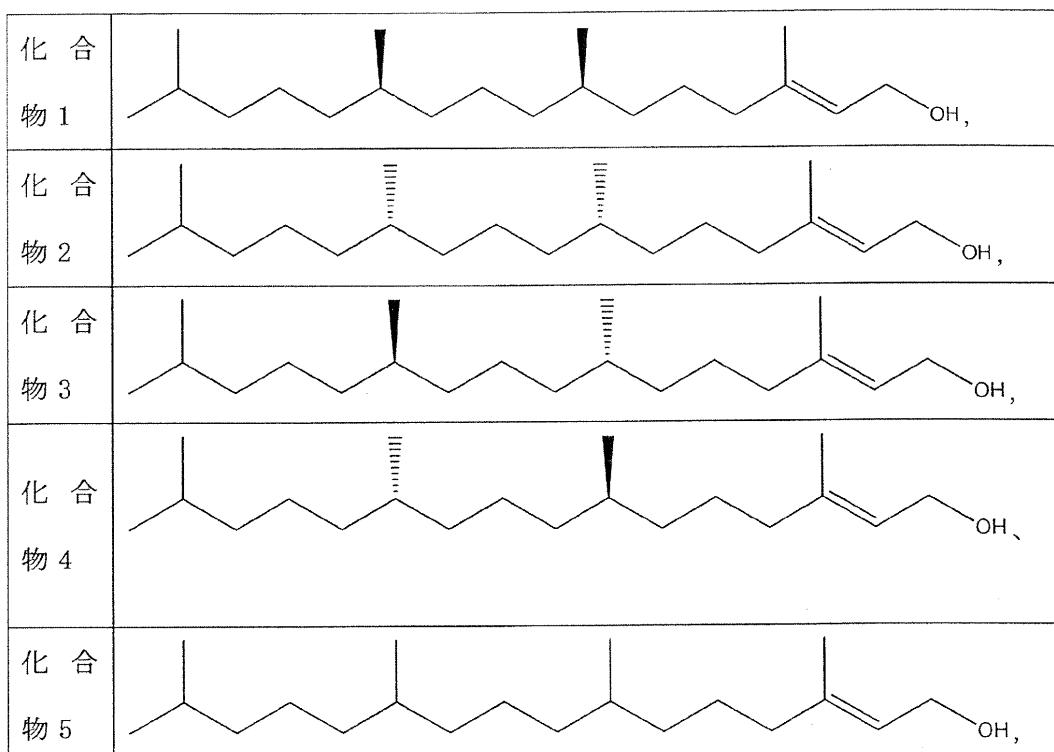
点線結合は E もしくは Z 二重結合を示し；ならびに

前記組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減させている、  
 組成物。

## 【請求項 2】

20

以下  
【化2】



から選択される化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記カリウム塩はKC1または乳酸カリウムである、請求項1もしくは2に記載の組成物。

【請求項4】

請求項1-3のいずれか一つに記載の組成物を含む食品。

【請求項5】

カリウム塩を含む可食組成物を調製する方法であって、方法は：

(a) 食用的に許容される担体を提供すること；および

(b) (a)の食用的に許容される担体に、式(I)による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物1～5のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを添加することを含み、

ここで、前記カリウム塩が、前記食用的に許容される担体中において提供されるかまたは前記カリウム塩が前記食用的に許容される担体へと添加される、  
方法。

【請求項6】

前記カリウム塩はKC1または乳酸カリウムである、請求項5に記載の方法。

【請求項7】

可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法であって：

(a) 前記可食組成物の調製において使用されるある量のナトリウム塩をある量のカリウム塩と置換すること；ならびに

(b) 前記可食組成物中に、有効量の式(I)による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物1～5のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを組み入れ、NaClが低減された可食組成物を生成させることを含む、

方法。

10

20

30

40

50

## 【請求項 8】

被験体のナトリウム摂取を低減させる方法であって：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量のナトリウム塩をある量のカリウム塩と置換すること；および

(b) 前記可食組成物中に、有効量の式(I)による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物1～5のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを組み入れることを含む、

方法。

## 【請求項 9】

前記ナトリウム塩はNaClであり、前記カリウム塩はKClである、請求項7または8に記載の方法。

## 【請求項 10】

可食組成物において苦味物質に起因する苦味を低減させる方法であって、前記苦味物質はカリウム塩であり：

(a) 苦味物質を含む可食組成物を提供すること；および

(b) 有効量の式(I)による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物1～5のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを、(a)で生成される前記可食組成物に添加し、よって、前記苦味物質により誘発される全ての苦味を低減させることを含む、

方法。

## 【請求項 11】

可食組成物において苦味物質に起因する苦味を低減させる方法であって、前記苦味物質はカリウム塩であり、前記方法が：

(a) 有効量の式(I)による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物1～5のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを、前記可食組成物より前、これと一緒に、またはその後の摂取のために提供し、よって、前記苦味物質により誘発される全ての苦味を低減させることを含む、

方法。

## 【請求項 12】

可食組成物を保存する方法であって：

(a) 可食組成物を提供すること；ならびに

(b) 前記可食組成物中に、乳酸カリウム、ならびに、有効量の式(I)による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物1～5のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを組み入れることを含む、

方法。

## 【請求項 13】

前記可食組成物は、食品、消費者製品、および医薬組成物からなる群より選択される、請求項5～12のいずれか一つに記載の方法。

## 【請求項 14】

被験体において苦味の知覚を阻害、低減または排除する方法であって、前記苦味物質はカリウム塩であり、前記方法が：

(a) 前記被験体の口腔内に、式(I)による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物1～5のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせを、置くために提供することを含む、

方法。

10

20

30

40

50

**【請求項 15】**

前記苦味は K C 1 または乳酸カリウムによる、請求項 1\_4 に記載の方法。

**【請求項 16】**

( a ) 苦味のする医薬活性成分（前記医薬活性成分はカリウム塩である）；ならびに  
 ( b ) 式 ( I ) による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物 1 ~ 5 のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせによる化合物を含む、

医薬組成物。

**【請求項 17】**

( a ) 医薬活性成分；  
 ( b ) 苦味物質（前記苦味物質はカリウム塩である）；ならびに  
 ( c ) 式 ( I ) による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物 1 ~ 5 のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせによる化合物を含む、

医薬組成物。

**【請求項 18】**

( a ) 苦味のする成分（前記苦味のする成分はカリウム塩である）；ならびに  
 ( b ) 式 ( I ) による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物 1 ~ 5 のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせによる化合物を含む、

消費者製品。

**【請求項 19】**

苦味物質の苦味を低減させるための消費者製品であって、前記苦味物質はカリウム塩であり、前記消費者製品が：

( a ) 式 ( I ) による化合物、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、または化合物 1 ~ 5 のいずれか一つ、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー、またはそれらの化合物の任意のものの組み合わせによる化合物を含む、

消費者製品。

**【発明の詳細な説明】****【技術分野】**

30

**【0001】**

本発明は可食組成物における香味に関する。

**【背景技術】****【0002】**

例えば、ヒトにおける味覚は、少なくとも 5 つの従来の味覚を検出することができる：甘味、酸味、塩味、苦味、および旨味（いい味）。野菜、食品、食品成分および栄養分を含む多くの栄養物は、苦味物質を含み、および / または苦味を有する。加えて、健康を維持または改善するのに重要な多くの医薬物質は、苦味物質を含み、および / または苦味を有する。ある一定の食品および消費者製品は望ましい苦味を有し、コーヒー、ビールおよびダーク・チョコレートが挙げられるが、多くの事情では、消費者はそのような苦味を嫌う。例えば、多くの消費者はある一定の苦味物質および / または苦味の知覚を嫌い、望ましくない苦味物質または苦味を有する食品または医薬品を避け、望ましくない苦味物質のレベルが低減した、あるいは苦味が減少した、または苦味を完全に欠いた食品および医薬品を好む。望ましくない苦味物質を含む、および / または望ましくない苦味を有する製品に対するこの嫌悪は、口腔および / または胃腸管内に存在する苦味受容体の活性化により媒介される苦味物質および / または苦味の知覚により引き起こされ得る。多くの場合、苦味物質および / または苦味を消費者が嫌うことにより、苦味物質を含むおよび / または苦味を有する所望のレベルの栄養分または保存剤を使用することができないので、食品の栄養品質および安全性の改善が阻止または妨害される。また、いくつかの医薬品の苦味物質または苦味を嫌うことまたはこれに対する嫌悪は、それらの使用に対する処方されたレジ

40

50

メンの順守にマイナスの影響を与える。

【0003】

例えば、食品の製造において使用されるいくつかの添加物、保存剤、乳化剤および食材は苦味物質を含み、および／または苦味を有する。これらの添加物、保存剤、乳化剤および食材は食品の味覚に影響する可能性があるが、それらはまた、有効期間、栄養品質、または食品のテクスチャを改善するのに重要であり得る。例えば、高血圧および心血管疾患の増加傾向は、一部は、洋風の食事の高いナトリウム摂取に起因していた。したがって、塩化ナトリウムの別の塩味化合物による代替が望ましい。最も一般的な塩化ナトリウム代替物は塩化カリウムであり、これは、人口の一部に対し、その塩味に加えて苦味を有するものとして知覚される。塩化カリウムの苦味は、それに敏感な人口の一部に対し、望ましくない苦味を引き起こさずに、食品中の塩化ナトリウムに取って代わるように使用され得る程度を制限する。

【0004】

別の一般的な食品添加物、乳酸ナトリウムは、広い抗菌作用を有し、損傷、および病原菌の増殖の阻害に有効であり、有効期間を延長し、食品安全性を増加させるために食品（例えば、肉および鶏肉加工品）において一般に使用される。しかしながら、そのナトリウム量のために、乳酸ナトリウムは保存剤としては望ましくない可能性がある。乳酸カリウムは同様の抗菌特性を有し、乳酸ナトリウムの代わりに使用されてきた。しかしながら、乳酸カリウムもまた、苦味と関連し、望ましくない苦味を引き起こさずに、食品中の乳酸ナトリウムに取って代わるように使用され得る程度を制限する。

【0005】

加えて、肥満および糖尿病の発生率の増加は、一部は、多くの食事の高い糖摂取に起因していた。したがって、糖の別の甘味化合物による代替が望ましい。食品中の糖を低減するために使用され得る人工および天然糖代替物はしばしば、苦味と関連し、これが再び、これらが不都合な苦味を引き起こさずに食品中の糖に取って代わるように使用され得る程度を制限する。例えば、一般的な糖代替物はアセスルファムKであり、これはまた、その甘味に加えて苦味を有する。

【0006】

理論により制限されないが、苦味、甘味、および旨味物質および化合物は典型的には、Gタンパク質共役受容体を介して味覚応答を誘発するが、塩味および酸味物質および化合物は典型的には、イオンチャネルを介して味覚応答を誘発すると仮定される。苦味受容体は、苦味物質に応じて細胞内カルシウム濃度変化を誘導するGタンパク質共役受容体のT2R（TAS2Rとも呼ばれる）ファミリーに属する。T2R受容体はガストデューション、味覚特異的Gタンパク質を介して作用する。T2Rファミリーの少なくとも25の異なるメンバーが存在し、苦味の知覚は複雑であり、いくつかの異なる味物質・受容体相互作用が関与することが示唆される。口腔および／または胃腸管において苦味受容体の活性化および／またはシグナル伝達を調節することができる化合物は、消費者が増加したレベルの苦味物質または苦味の知覚によりそのような製品を嫌うことなく、食品および医薬品における苦味物質または苦味のする物質の所望の使用レベルを可能にするのに有効となり得るであろう。場合によっては、苦味受容体および苦味のブロッカーまたはモジュレーターは、口腔および／または胃腸管内に存在する苦味受容体および／または味覚伝達シグナル伝達機構を介する苦味物質および／または苦味の知覚を低減させることができる。

【0007】

伝統的に、食品調製物および医薬品では、苦味は甘味料および他の味物質、例えば塩を使用して隠蔽された。しかしながら、場合によっては、これは望ましくなく、あるいは不十分であり、というのも、これは、食品において他の味覚／香味／印象（例えば、苦味なしまたは所望の苦味）を変化させ、隠蔽し、または妨害する可能性があるからである。加えて、このアプローチは、そのような食品または医薬品中に存在する苦味を完全に隠蔽することができたことはめったになかった。そういう理由で、マスキング剤の代わりに、またはこれに加えて苦味を低減させる化合物が好ましい。

10

20

30

40

50

## 【0008】

そのため、苦味物質または苦味の知覚を排除、調節または低減させる、または口腔および/または胃腸管における苦味受容体の対応する活性化を低減させるために、苦味物質を含む、または苦味を有する食品、消費者製品および医薬品に添加され得る化合物を提供することが望ましい。同様に、そのような化合物を含む食品、消費者製品、および医薬組成物を提供することが望ましい。そのような化合物を使用して被験体のナトリウム摂取を減少させ、塩代替物と関連する苦味の知覚を排除、調節または低減させることもまた望ましい。そのような化合物を使用して被験体の糖摂取を減少させ、糖代替物と関連する苦味の知覚を排除、調節または低減させることができることも望ましい。

## 【発明の概要】

10

## 【0009】

本発明は苦味を調節する化合物、そのような化合物を含む可食組成物、およびそのような可食組成物を調製する方法を提供する。本発明はまた、可食組成物中のナトリウムまたは糖の量を低減させる方法および可食組成物の苦味を低減させる方法を提供する。本発明はさらに、被験体において、食品、消費者もしくは医薬品の苦味を低減、調節または排除する方法を提供する。本発明はまた、苦味受容体の活性化を調節する、特に低減させる方法を提供する。

## 【0010】

## 可食組成物

本発明の1つの態様は、苦味物質の苦味を低減させるための可食組成物を提供する。いくつかの実施形態では、可食組成物は分枝アルケン化合物を含む。いくつかの実施形態では、分枝アルケン化合物は、約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有する化合物である。ある一定の実施形態では、分枝アルケン化合物は、式(I)の化合物、または化合物1-5またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0011】

20

ある一定の実施形態では、式(I)の化合物はフィトールまたはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0012】

30

いくつかの実施形態では、可食組成物はシクロヘキサジエン系化合物を含む。いくつかの実施形態では、シクロヘキサジエン系化合物は約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有する化合物である。ある一定の実施形態では、シクロヘキサジエン系化合物は式(II)の化合物、または化合物6またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0013】

ある一定の実施形態では、式(II)の化合物はダマセノンまたはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0014】

40

いくつかの実施形態では、可食組成物は分枝アルケンエステル化合物を含む。いくつかの実施形態では、分枝アルケンエ斯特ル化合物は約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有する化合物である。ある一定の実施形態では、分枝アルケンエ斯特ル化合物は式(III)の化合物、または化合物7またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0015】

ある一定の実施形態では、式(III)の化合物はチグリン酸シトロネリルまたはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0016】

50

いくつかの実施形態では、可食組成物はベンゾジオキソール系化合物を含む。いくつかの実施形態では、ベンゾジオキソール系化合物は約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有する化合物である。ある一定の実施形態では、ベンゾジオキソール系化合物は式(IV)の化合物、または化合物8またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0017】

ある一定の実施形態では、式(IV)の化合物は2-メチル-3-(3,4-メチレンジオキシフェニル)-プロパナールまたはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーである。

## 【0018】

いくつかの実施形態では、可食組成物は、(a)発明の化合物；および(b)苦味物質を含む。いくつかの実施形態では、発明の化合物は約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有する化合物である。ある一定の実施形態では、発明の化合物は、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせである。

## 【0019】

別の実施形態では、可食組成物は(a)本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせ；および(b)苦味物質を含む。

## 【0020】

本発明によれば、苦味物質は、例えば、食品(例えば、コーヒーまたはチョコレート)において本質的である可能性があり、または可食組成物の構成成分(例えば、苦味のする保存剤)であり得る。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質はKClである。他の実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質は乳酸カリウムである。

## 【0021】

いくつかの実施形態では、可食組成物はさらにナトリウム塩を含む。いくつかの実施形態では、可食組成物さらにNaClを含む。他の実施形態では、可食組成物はさらに乳酸ナトリウムを含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに糖を含む。

## 【0022】

発明の別の態様では、可食組成物は少なくとも1つの発明の化合物を含む食品である。ある一定の実施形態では、発明の化合物は、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせである。別の実施形態では、発明の化合物は本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせである。

## 【0023】

本発明の別の態様では、可食組成物は、苦味のする医薬活性成分および本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせを含む医薬組成物である。いくつかの実施形態では、医薬組成物は苦味のする医薬活性成分および本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む。

## 【0024】

さらに他の実施形態では、可食組成物は医薬活性成分、苦味物質、および本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせを含む医薬組成物である。さらに他の実施形態では、医薬組成物は医薬活性成分、苦味物質、および本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む。

## 【0025】

本発明の別の態様では、可食組成物は、苦味物質および本明細書で記載される式(I)

10

20

30

40

50

、式(Ⅱ)、式(Ⅲ)、または式(Ⅴ)の化合物、またはそれらの組み合わせを含む消費者製品である。他の実施形態では、消費者製品は苦味物質および本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む。

#### 【0026】

本発明のさらに別の実施形態は苦味物質の苦味を低減させるための消費者製品を提供し、ここで、前記消費者製品は本明細書で記載される式(Ⅰ)、式(Ⅱ)、式(Ⅲ)、または式(Ⅴ)の化合物、またはそれらの組み合わせを含む。さらに他の実施形態では、苦味物質の苦味を低減させるための消費者製品は本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む。

#### 【0027】

さらなる態様では、本発明は、下記を含む可食組成物を調製する方法を提供する：

(a) 食用的に許容される担体を提供すること；ならびに

(b) (a)の食用的に許容される担体に、本明細書で記載される式(Ⅰ)、式(Ⅱ)、式(Ⅲ)、または式(Ⅴ)の化合物、またはそれらの組み合わせを添加すること。

#### 【0028】

別の実施形態では、可食組成物を調製する方法は下記を含む：

(a) 食用的に許容される担体を提供すること；ならびに

(b) (a)の食用的に許容される担体に、本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを添加すること。

#### 【0029】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品、消費者製品または医薬組成物である。いくつかの実施形態では、食用的に許容される担体は食材、食品、または薬学的に許容される担体である。

#### 【0030】

いくつかの実施形態では、(a)における食用的に許容される担体は本質的に苦い。そのような実施形態では、食用的に許容される担体は、本質的に苦味物質を含み得る（すなわち、食用的に許容される担体は苦味物質の添加なしで苦い）。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、本質的に苦い食材は、カリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩を含む。いくつかの実施形態では、本質的に苦い食材はカリウム塩、例えばKC1を含む。

#### 【0031】

他の実施形態では、可食組成物を調製する方法はさらに下記を含む：(c)苦味物質を添加すること。いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法において使用される苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法において使用される苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法において使用される苦味物質はカリウム塩ある。いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法において使用される苦味物質はKC1である。他の実施形態では、可食組成物を調製する方法において使用される苦味物質は乳酸カリウムである。

#### 【0032】

いくつかの実施形態では、可食組成物はさらにナトリウム塩を含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらにNaClを含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに乳酸ナトリウムを含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに糖を含む。

#### 【0033】

本発明はまた、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、そのような方法は下記を含む：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の1つ以上のナトリウム塩をある量の1つ以上のカリウム塩と置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(Ⅰ)、式(Ⅱ)、式(

10

20

30

40

50

I I I )、または式( I V )による化合物、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

**【 0 0 3 4 】**

別の実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法は下記を含む：

( a ) 可食組成物の調製において使用されるある量の1つ以上のナトリウム塩をある量の1つ以上のカリウム塩と置換すること；ならびに

( b ) 可食組成物中に有効量の、本明細書で記載される化合物1 - 8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

**【 0 0 3 5 】**

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品、消費者製品または医薬組成物である。

10

**【 0 0 3 6 】**

本発明のいくつかの実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法は、可食組成物中に、可食組成物中に存在するナトリウムの25%までのカリウムによる置換を可能にするのに十分な量の化合物を組み入れることを含む。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在するナトリウムの50%までのカリウムによる置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は可食組成物中に存在するナトリウムの75%までのカリウムによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は可食組成物中に存在するナトリウムの100%までのカリウムによる置換を可能にするのに十分である。いくつかの実施形態では、可食組成物は塩味を維持する。

20

**【 0 0 3 7 】**

本発明はまた、可食組成物中のNaClの量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、そのような方法は下記を含む：

( a ) 可食組成物の調製において使用されるある量のNaClをある量のKClと置換すること；ならびに

( b ) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式( I )、式( I I )、式( I I I )、または式( I V )による化合物、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

**【 0 0 3 8 】**

30

別の実施形態では、可食組成物中のNaClの量を低減させる方法は下記を含む：

( a ) 可食組成物の調製において使用されるある量のNaClをある量のKClと置換すること；ならびに

( b ) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される化合物1 - 8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

**【 0 0 3 9 】**

本発明のいくつかの実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法は、可食組成物中に、可食組成物中に存在するNaClの25%までのKClによる置換を可能にするのに十分な量の化合物を組み入れることを含む。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在するNaClの50%までのKClによる置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は可食組成物中に存在するNaClの75%までのKClによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在するNaClの100%までのKClによる置換を可能にするのに十分である。いくつかの実施形態では、可食組成物は塩味を維持する。

40

**【 0 0 4 0 】**

別の実施形態では、本発明は、下記を含む、可食組成物中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法を提供する：

( a ) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに

50

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

【0041】

別の実施形態では、本発明は、下記を含む、可食組成物中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法を提供する：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。 10

【0042】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品、消費者製品または医薬組成物である。

【0043】

本発明のいくつかの実施形態では、可食組成物中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法は、可食組成物中に、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの25%までの乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分な量の化合物を組み入れることを含む。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの50%までの乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの75%までの乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの100%までの乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。いくつかの実施形態では、可食組成物は、乳酸ナトリウムを含む可食組成物と同じ有効期間を有する。 20

【0044】

別の実施形態では、本発明は、下記を含む、可食組成物中の糖の量を低減させる方法を提供する：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の糖を、ある量のアセスルファムKと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせを組み入れること。 30

【0045】

別の実施形態では、本発明は下記を含む、可食組成物中の糖の量を低減させる方法を提供する：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の糖を、ある量のアセスルファムKと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。 40

【0046】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品、消費者製品または医薬組成物である。

【0047】

本発明のいくつかの実施形態では、可食組成物中の糖の量を低減させる方法は、可食組成物中に、可食組成物中に存在する糖の25%までのアセスルファムKによる置換を可能にするのに十分な量の化合物を組み入れることを含む。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の50%までのアセスルファムKによる置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の75%までのアセスルファムKによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物中に組み入れられる化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の100%までのアセスルファムK 50

による置換を可能にするのに十分である。いくつかの実施形態では、可食組成物は甘味を維持する。

#### 【0048】

本発明はまた、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法を提供する。そのような方法は下記を含む：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量のNaClをある量のKClと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせを組み入れ、よって、被験体のナトリウム摂取を低減させること。10

#### 【0049】

別の実施形態では、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法は下記を含む：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量のNaClをある量のKClと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れ、よって、被験体のナトリウム摂取を低減させること。

#### 【0050】

別の実施形態では、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法は下記を含む：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに20

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせを組み入れ、よって、被験体のナトリウム摂取を低減させること。

#### 【0051】

別の実施形態では、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法は下記を含む：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムを、ある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れ、よって、被験体のナトリウム摂取を低減させること。30

#### 【0052】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品、消費者製品または医薬組成物である。

#### 【0053】

本発明のいくつかの実施形態では、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法は、さらに、(c)治療が必要な被験体を同定することを含む。いくつかの実施形態では、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法は、可食組成物中に、カリウム置換を使用してナトリウム摂取を25%までだけ低減させるのに十分なある量の化合物を組み入れることを含む。他の実施形態では、(b)において添加される化合物の量は、カリウム置換を使用してナトリウム摂取を50%までだけ低減させるのに十分である。さらに他の実施形態では、(b)において添加される化合物の量はカリウム置換を使用してナトリウム摂取を75%までだけ低減させるのに十分である。他の実施形態では、(b)において添加される化合物の量は、カリウム置換を使用してナトリウム摂取を100%までだけ低減させるのに十分である。40

#### 【0054】

本発明はまた、下記を含む、被験体の糖摂取を低減させる方法を提供する：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の糖を、ある量のアセスルファムKと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせを組み入れ、よつ50

て、被験体の糖摂取を低減させること。

【0055】

別の実施形態では、被験体の糖摂取を低減させる方法は下記を含む：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の糖をある量のアセスルファムKと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れ、よって、被験体の糖摂取を低減させること。

【0056】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品、消費者製品または医薬組成物である。

【0057】

本発明のいくつかの実施形態では、被験体の糖摂取を低減させる方法はさらに、(c) 治療が必要な被験体を同定することを含む。いくつかの実施形態では、被験体の糖摂取を低減させる方法は、可食組成物中に、アセスルファムK置換を使用して25%までだけ糖摂取を低減させるのに十分な量の化合物を組み入れることを含む。他の実施形態では、(b)において添加される化合物の量は、アセスルファムK置換を使用して50%までだけ糖摂取を低減させるのに十分である。さらに他の実施形態では、(b)において添加される化合物の量はアセスルファムK置換を使用して75%までだけ糖摂取を低減させるのに十分である。他の実施形態では、(b)において添加される化合物の量は、アセスルファムK置換を使用して100%まで糖摂取を低減させるのに十分である。

【0058】

本発明はまた、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせを可食組成物に添加し、よって、苦味物質により誘発される全ての苦味を低減させることを含む、可食組成物中の苦味物質に起因する苦味を低減させる方法を提供する。他の実施形態では、可食組成物に添加される化合物は本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせである。

【0059】

本発明はさらに、可食組成物前、これと一緒に、またはその後に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせを摂取し、よって、苦味物質により誘発される全ての苦味を低減させることを含む、可食組成物中の苦味物質に起因する苦味を低減させる方法を提供する。他の実施形態では、可食組成物と共に摂取される化合物は本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせである。

【0060】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品、消費者製品または医薬組成物である。

【0061】

いくつかの実施形態では、方法は、苦味物質により誘発される苦味を25%までだけ低減させる。いくつかの実施形態では、方法は苦味物質により誘発される苦味を50%までだけ低減させる。他の実施形態では、苦味物質により誘発される苦味は75%までだけ低減される。さらに他の実施形態では、苦味物質により誘発される苦味は100%までだけ低減される。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質はKCLである。

【0062】

さらなる態様では、本発明は、下記を含む、可食組成物を保存する方法を提供する：

(a) 可食組成物を提供すること；ならびに

(b) (a)の可食組成物に、乳酸カリウムおよび有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせを添加すること。

10

20

30

40

50

**【 0 0 6 3 】**

別の実施形態では、可食組成物を保存する方法は下記を含む：

( a ) 可食組成物を提供すること；ならびに

( b ) ( a ) の可食組成物に、乳酸カリウムおよび有効量の、本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを添加すること。

**【 0 0 6 4 】**

本発明はまた、可食組成物を保存する間の可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、そのような方法は下記を含む：

( a ) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに

( b ) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式 ( I ) 、式 ( II ) 、式 ( III ) 、または式 ( IV ) による化合物、またはそれらの組み合わせ組み入れること。

**【 0 0 6 5 】**

本発明はまた、可食組成物を保存する間の可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、そのような方法は下記を含む：

( a ) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに

( b ) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

**【 0 0 6 6 】**

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。

**【 0 0 6 7 】**

本発明はまた、本明細書で記載される式 ( I ) 、式 ( II ) 、式 ( III ) 、または式 ( IV ) の化合物、またはそれらの組み合わせを含む可食組成物を利用して、被験体において苦味を低減または排除する方法を提供する。他の実施形態では、被験体において苦味を低減または排除する組成物は本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを含む。

**【 0 0 6 8 】**

いくつかの実施形態では、苦味は本質的である。いくつかの実施形態では、苦味は苦味のする塩による。いくつかの実施形態では、苦味はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩による。いくつかの実施形態では、苦味は KCl による。他の実施形態では、苦味は乳酸カリウムによる。

**【 0 0 6 9 】**

本発明はまた、苦味受容体の活性化および / またはシグナル伝達を阻害または低減させる方法を提供し、ここで、方法は、苦味受容体を本明細書で記載される式 ( I ) 、式 ( II ) 、式 ( III ) 、または式 ( IV ) の化合物、またはそれらの組み合わせと接触させることを含む。他の実施形態では、方法は、苦味受容体を本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせと接触させることを含む。いくつかの実施形態では、苦味受容体は口腔内に存在する。他の実施形態では、苦味受容体は胃腸管内、例えは、胃内に存在する。他の実施形態では、苦味受容体は、インビトロアッセイにおいて存在する。

**【 0 0 7 0 】**

発明の特定の実施形態は下記番号付けされた段落で明記される：

1 . 式 ( I ) による化合物 :

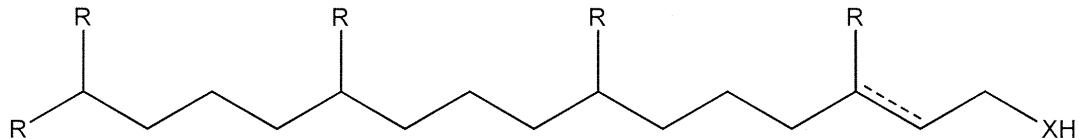
10

20

30

40

## 【化1】



式 (I) ;

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーを含む組成物であって、

10

式中、原子価および安定性が許容するように：

X は S または O であり；

各 R は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；

点線結合は任意的な炭素 - 炭素二重結合を示し；ならびに

組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる、組成物。

2. 段落 1 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X は S または O であり；

各 R は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；ならびに

20

点線結合は任意的な炭素 - 炭素二重結合を示す、組成物。

3. 段落 1 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X は O であり；

各 R は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素 - 炭素二重結合を示す、組成物。

4. 段落 1 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X は S または O であり；

各 R は独立して H または C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素 - 炭素二重結合を示す、組成物。

30

5. 段落 1 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

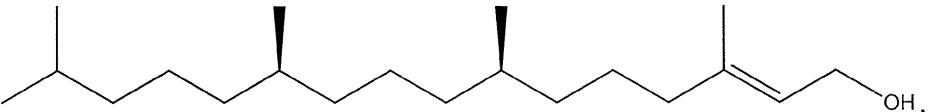
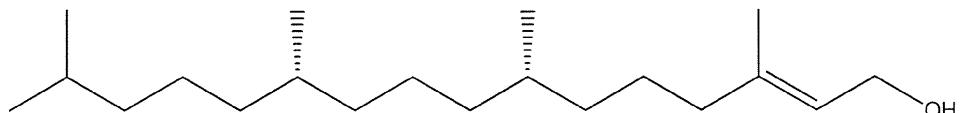
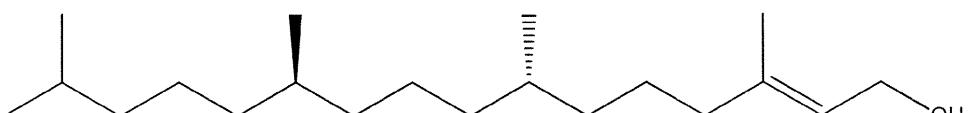
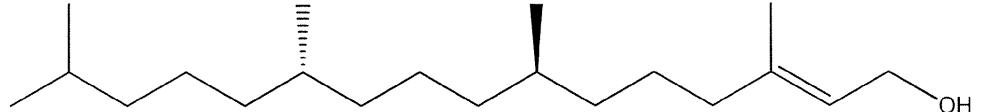
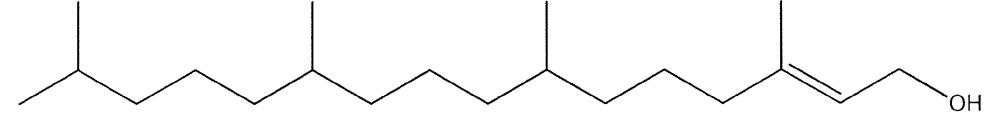
X は O であり；

各 R は独立して H または C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素 - 炭素二重結合を示す、組成物。

6. 段落 1 に記載の組成物であって、前記式 (I) による化合物は下記から選択される、組成物：

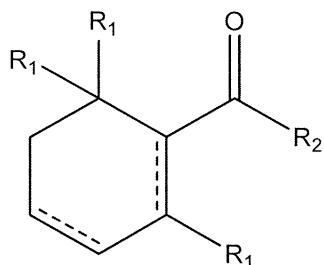
## 【化2】

化 合 物 1		10
化 合 物 2		
化 合 物 3		20
化 合 物 4		30
化 合 物 5		40

その食用的または生物学的に許容される誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー。

7. 式(II)による化合物:

## 【化3】



式(I-I);

10

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーを含む組成物であって、

式中、原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表し；

組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる、組成物。

20

8. 段落7に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す、組成物。

9. 段落7に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルまたはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す、組成物。

30

10. 段落7に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>はHまたはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す、組成物。

11. 段落7に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>はHまたはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニルであり；ならびに

各点線は炭素-炭素二重結合である、組成物。

12. 段落7に記載の組成物であって、前記式(I-I)による化合物は、下記から選択される、組成物：

40

## 【化4】

化合 物 6		,
-----------	--	---

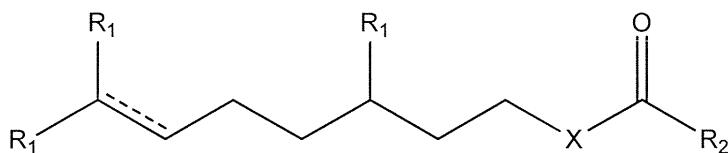
その食用的または生物学的に許容される誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステ

50

レオマー。

13. 式 (III) による化合物：

【化5】



式 (III)；

10

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーを含む組成物であって、

式中、原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub> アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表し；

組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる、組成物。

20

14. 段落 13 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す、組成物。

15. 段落 13 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

30

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す、組成物。

16. 段落 13 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X = O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；ならびに

40

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す、組成物。

17. 段落 13 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す、組成物。

18. 段落 13 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X = O であり；

50

各  $R_1$  は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す、組成物。

19. 段落 13 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

X = O であり；

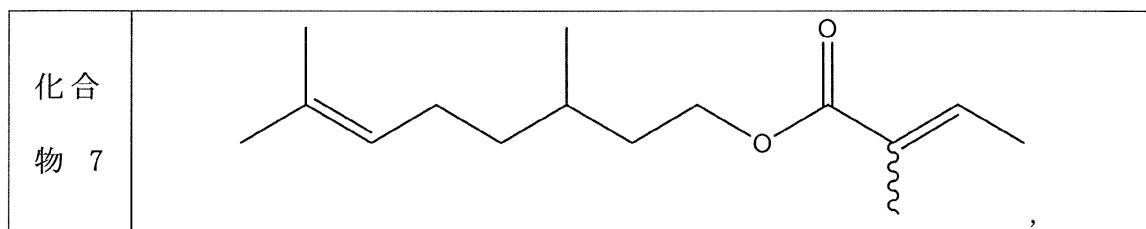
各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニル 10 であり；ならびに

点線は炭素 - 炭素二重結合である、組成物。

20. 段落 13 に記載の組成物であって、前記式 (III) による化合物は下記から選択される、組成物：

【化 6】

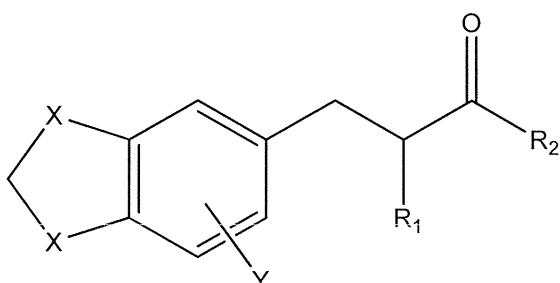


20

その食用的または生物学的に許容される誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー。

21. 式 (IV) による化合物：

【化 7】



式 (IV)；

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーを含む組成物であって、

式中、原子価および安定性が許容するように：

各 X は独立して S または O であり；

Y = H またはハロゲンであり；

R<sub>1</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；ならびに

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；

組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる、組成物。

22. 段落 21 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

各 X は独立して S または O であり；

Y = H またはハロゲンであり；

R<sub>1</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニル 50

であり；ならびに

$R_2$  は H、 $C_1 - C_3$  アルキル、 $C_2 - C_3$  アルケニル、または  $C_2 - C_3$  アルキニルである、組成物。

23. 段落 21 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

$X = O$  であり；

$Y = H$  またはハロゲンであり；

$R_1$  は H、 $C_1 - C_3$  アルキル、 $C_2 - C_3$  アルケニル、または  $C_2 - C_3$  アルキニルであり；ならびに

$R_2$  は H または  $C_1 - C_3$  アルキルである、組成物。

24. 段落 21 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

$X = O$  であり；

$Y = H$  であり；

$R_1$  は H、 $C_1 - C_3$  アルキル、 $C_2 - C_3$  アルケニル、または  $C_2 - C_3$  アルキニルであり；ならびに

$R_2$  は H または  $C_1 - C_3$  アルキルである、組成物。

25. 段落 21 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

$X = O$  であり；

$Y = H$  であり；

$R_1$  は H または  $C_1 - C_3$  アルキルであり；ならびに

$R_2$  は H または  $C_1 - C_3$  アルキルである、組成物。

26. 段落 21 に記載の組成物であって、原子価および安定性が許容するように：

$X = O$  であり；

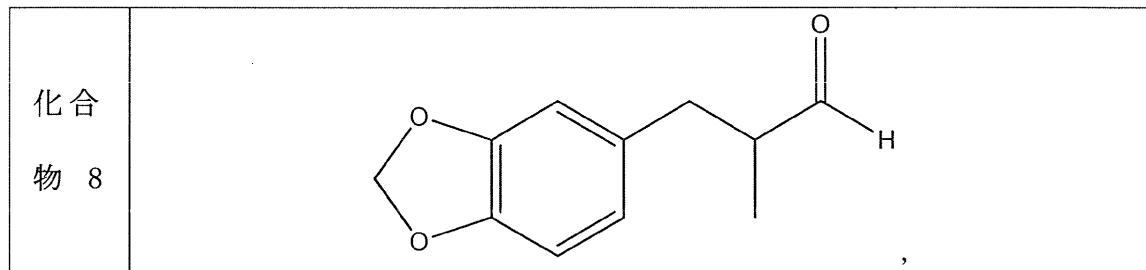
$Y = H$  であり；

$R_1$  は H または  $C_1 - C_3$  アルキルであり；ならびに

$R_2$  は H である、組成物。

27. 段落 21 に記載の組成物であって、前記式(IV)による化合物は下記から選択される、組成物：

【化 8】



30

その食用的または生物学的に許容される誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー。

28. 下記を含む組成物であって：

(a) 本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせ；ならびに

(b) 苦味物質、

組成物は可食である、組成物。

29. 段落 28 に記載の組成物であって、苦味物質は食材である、組成物。

30. 段落 28 に記載の組成物であって、苦味物質は苦味のする塩である、組成物。

31. 段落 30 に記載の組成物であって、苦味のする塩はマグネシウム塩、カルシウム塩、またはカリウム塩である、組成物。

32. 段落 31 に記載の組成物であって、カリウム含有塩は KCl または乳酸カリウムである、組成物。

40

50

33. 段落 1 - 32 のいずれか一つに記載の組成物であって、可食組成物はさらに、下記からなる群より選択される 1 つ以上の構成成分を含む、組成物：NaCl、乳酸ナトリウム、および糖。

34. 段落 1 - 33 のいずれか一つに記載される組成物を含む食品。

35. 下記を含む、可食組成物を調製する方法：

(a) 食用的に許容される担体を提供すること；ならびに

(b) (a) の食用的に許容される担体に、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを添加すること。

10

36. 段落 35 に記載の方法であって、前記食用的に許容される担体は本質的に苦い、方法。

37. 段落 36 に記載の方法であって、食用的に許容される担体は苦味のする塩を含む、方法。

38. 段落 37 に記載の方法であって、苦味のする塩はマグネシウム塩、カルシウム塩、またはカリウム塩である、方法。

39. 段落 38 に記載の方法であって、カリウム塩は KCl または乳酸カリウムである、方法。

40. 段落 35 - 39 のいずれか一つに記載の方法であって、可食組成物はさらに、下記からなる群より選択される 1 つ以上の構成成分を含む方法：NaCl、乳酸ナトリウム、および糖。

20

41. 段落 35 に記載の方法であって、さらに下記を含む、方法：

(c) 苦味物質を添加すること。

42. 段落 41 に記載の方法であって、苦味物質は苦味のする塩である、方法。

43. 段落 42 に記載の方法であって、苦味のする塩はマグネシウム塩、カルシウム塩、またはカリウム塩である、方法。

44. 段落 43 に記載の方法であって、カリウム塩は KCl または乳酸カリウムである、方法。

45. 段落 41 - 44 のいずれか一つに記載の方法であって、可食組成物はさらに、下記からなる群より選択される 1 つ以上の構成成分を含む、方法：NaCl、乳酸ナトリウム、および糖。

30

46. 下記を含む、可食組成物中の NaCl の量を低減させる方法：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の NaCl をある量の KCl と置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

47. 段落 46 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に典型的に存在する NaCl の量の 25 % までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

40

48. 段落 46 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に典型的に存在する NaCl の量の 50 % までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

49. 段落 46 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に典型的に存在する NaCl の量の 75 % までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

50. 段落 46 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に典型的に存在する NaCl の量の 100 % までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

50

51. 段落 46 - 50 のいずれか一つに記載の方法であって、可食組成物は塩味を維持する、方法。

52. 下記を含む、可食組成物中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1 - 8 のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせ、あるいはそれらの組み合わせを組み入れること。

53. 段落 52 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の 25 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。 10

54. 段落 52 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の 50 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

55. 段落 52 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の 75 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

56. 段落 52 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の 100 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。 20

57. 段落 52 - 56 のいずれか一つに記載の方法であって、可食組成物は、乳酸ナトリウムを含む可食組成物と同じ有効期間を有する、方法。

58. 下記を含む、可食組成物中の糖の量を低減させる方法：

(a) 可食組成物中に存在するある量の糖をある量のアセスルファムKと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1 - 8 のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。 30

59. 段落 58 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する糖の量の 25 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

60. 段落 58 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する糖の量の 50 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

61. 段落 58 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する糖の量の 75 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。

62. 段落 58 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に典型的に存在する糖の量の 100 %までだけの置換を可能にするのに十分である、方法。 40

63. 段落 58 - 62 のいずれか一つに記載の方法であって、可食組成物は甘味を維持する、方法。

64. 下記を含む、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量のナトリウム塩をある量のカリウム塩と置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1 - 8 のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れるこ 50

と。

65. 段落 64 に記載の方法であって、ナトリウム塩は NaCl であり、カリウム塩は KCl である、方法。

66. 段落 64 に記載の方法であって、ナトリウム塩は乳酸ナトリウムであり、カリウム塩は乳酸カリウムである、方法。

67. 段落 64 - 66 のいずれか一つに記載の方法であって、さらに (c) 治療が必要な被験体を同定することを含む、方法。

68. 段落 64 - 67 のいずれか一つに記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量はナトリウム摂取をカリウムによる置換により 25%までだけ低減させるのに十分である、方法。 10

69. 段落 64 - 67 のいずれか一つに記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量はナトリウム摂取をカリウムによる置換により 50%までだけ低減させるのに十分である、方法。

70. 段落 64 - 67 のいずれか一つに記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量はナトリウム摂取をカリウムによる置換により 75%までだけ低減させるのに十分である、方法。

71. 段落 64 - 67 のいずれか一つに記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量はナトリウム摂取をカリウムによる置換により 100%までだけ低減させるのに十分である、方法。 20

72. 下記を含む、被験体の糖摂取を低減させる方法：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の糖をある量のアセスルファム K と置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式 (I)、式 (II)、式 (III)、または式 (IV) による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

73. 段落 72 に記載の方法であって、さらに (c) 治療が必要な被験体を同定することを含む、方法。

74. 段落 72 または 73 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は糖摂取をアセスルファム K による置換により 25%までだけ低減させるのに十分である、方法。 30

75. 段落 72 または 73 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は糖摂取をアセスルファム K による置換により 50%までだけ低減させるのに十分である、方法。

76. 段落 72 または 73 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は糖摂取をアセスルファム K による置換により 75%までだけ低減させるのに十分である、方法。

77. 段落 72 または 73 に記載の方法であって、(b)において添加される化合物の量は糖摂取をアセスルファム K による置換により 100%までだけ低減させるのに十分である、方法。 40

78. 下記を含む、可食組成物において苦味物質に起因する苦味を低減させる方法：

(a) 有効量の、本明細書で記載される式 (I)、式 (II)、式 (III)、または式 (IV) による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを可食組成物に添加し、よって、苦味物質により誘発される全ての苦味を低減させること。

79. 下記を含む、可食組成物において苦味物質に起因する苦味を低減させる方法：

(a) 有効量の、本明細書で記載される式 (I)、式 (II)、式 (III)、または式 (IV) による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを、可食組成物と一緒に摂取し、よって、苦味物質により誘発される全ての苦味を低減させること。 50

80. 段落 35 - 79 または 81 - 90 のいずれか一つに記載の方法であって、可食組成物は食品、消費者製品、または医薬組成物である、方法。

81. 段落 78 - 79 のいずれか一つに記載の方法であって、苦味物質により誘発される苦味は 25 %までだけ低減される、方法。

82. 段落 78 - 79 のいずれか一つに記載の方法であって、苦味物質により誘発される苦味は 50 %までだけ低減される、方法。

83. 段落 78 - 79 のいずれか一つに記載の方法であって、苦味物質により誘発される苦味は 75 %までだけ低減される、方法。

84. 段落 78 - 79 のいずれか一つに記載の方法であって、苦味物質により誘発される苦味は 100 %までだけ低減される、方法。 10

85. 段落 78、79、および 81 - 84 のいずれか一つに記載の方法であって、苦味物質は苦味のする塩である、方法。

86. 段落 85 に記載の方法であって、苦味のする塩はマグネシウム塩、カルシウム塩、またはカリウム塩である、方法。

87. 段落 86 に記載の方法であって、カリウム塩は KCl または乳酸カリウムである、方法。

88. 段落 78、79 および 81 - 87 のいずれか一つに記載の方法であって、可食組成物はさらに NaCl、乳酸ナトリウム、または糖を含む、方法。 20

89. 下記を含む、可食組成物を保存する方法：

(a) 可食組成物を提供すること；ならびに

(b) (a) の可食組成物を乳酸カリウムおよび本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせと組み合わせること。

90. 下記を含む、可食組成物を保存する間の可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法：

(a) 可食組成物の調製において使用されるある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに

(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。 30

91. 下記を含む、被験体において、苦味を阻害、低減、または排除する方法：

(a) 被験体の口腔内に、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを置くこと。

92. 段落 91 に記載の方法であって、苦味は苦味のする塩による、方法。

93. 段落 92 に記載の方法であって、苦味はマグネシウム塩、カルシウム塩、またはカリウム塩による、方法。

94. 段落 93 に記載の方法であって、苦味は KCl または乳酸カリウムによる、方法。 40

95. 下記を含む医薬組成物：

(a) 苦味のする医薬活性成分；ならびに

(b) 本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせ。

96. 下記を含む医薬組成物：

(a) 医薬活性成分；

(b) 苦味物質；ならびに

(c) 本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 50

のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせ。

97. 下記を含む消費者製品：

(a) 苦味のする成分；ならびに

(b) 本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせ。

98. 苦味物質の苦味を低減させるための消費者製品であって、下記を含む、消費者製品：

(a) 本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせ。 10

99. 下記を含む苦味受容体を阻害する方法：

(a) 苦味受容体を本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせと接触させること。

100. 段落 99 に記載の方法であって、苦味受容体は被験体の口腔内に存在する、方法。

101. 段落 99 に記載の方法であって、苦味受容体は被験体の胃腸管内に存在する、方法。

102. 段落 99 に記載の方法であって、苦味受容体はインビトロアッセイにおいて存在する、方法。 20

**【発明を実施するための形態】**

**【0071】**

本明細書で記載される本発明を十分に理解させるために、下記詳細な説明が明記される。

**【0072】**

別に規定されない限り、本明細書で使用される全ての技術および科学用語は、この発明が属する分野の当業者により普通に理解されるものと同じ意味を有する。本明細書で記載されるものと同様または等価な方法および材料は本発明の実施または試験において使用することができるが、好適な方法および材料が以下で記載される。材料、方法および実施例は例示にすぎず、制限することを意図しない。本明細書で言及される全ての刊行物、特許および他の文書は、その全体が参照により組み込まれる。 30

**【0073】**

この明細書を通して、「含む」という単語またはバリエーション、例えば「含み」または「含んでいる」は、表示された整数または整数群を含むことを意味し、任意の他の整数または整数群の排除を意味しないことが理解されるであろう。

**【0074】**

「脂肪族」という用語は、完全に飽和され、または 1 つ以上の不飽和単位を含む直鎖または分枝炭化水素を示す。例えば、脂肪族基は置換または非置換直鎖または分枝アルキル、アルケニルおよびアルキニル基を含む。別記されない限り、「脂肪族」という用語は、置換および非置換炭化水素の両方を含む。 40

**【0075】**

「アルコキシ」という用語は O - アルキル置換基を示し、ここで、アルキル部分は任意で置換されてもよい。アルコキシ置換基の例としては、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、イソプロポキシおよび n - ブトキシが挙げられるが、それらに限定されない。O - アルケニルまたは O - アルキニル基もまた明確に「アルコキシ」という用語の範囲内に含まれる。全ての場合において、アルキル、アルケンおよびアルキン部分は任意で置換されてもよい。

**【0076】**

「アルキル」という用語は、例えば、1 - 3、1 - 6、1 - 9、または 1 - 12 の炭素

50

原子を含む直鎖および分枝飽和鎖の両方を示す。アルキル基は任意で置換されてもよい。

【0077】

「アルキルチオ」という用語はS-アルキル置換基を示し、ここで、アルキル部分は任意で置換されてもよい。アルキルチオ置換基の例としては、メチルチオ、エチルチオおよびイソプロピルチオが挙げられるが、それらに限定されない。S-アルケニルまたはS-アルキニル基もまた明確に「アルキルチオ」という用語の範囲内に含まれる。全ての場合において、アルキル、アルケンおよびアルキン部分は任意で置換されてもよい。

【0078】

「アルケニル」という用語は、例えば、2-3、2-6、2-9、または2-12の炭素原子、および少なくとも1つの炭素-炭素二重結合を含む直鎖および分枝飽和鎖の両方を示す。アルケニル基は任意で置換されてもよい。10

【0079】

「アルキニル」という用語は、例えば、2-3、2-6、2-9、または2-12の炭素原子、および少なくとも1つの炭素-炭素三重結合を含む直鎖および分枝飽和鎖の両方を示す。アルキニル基は任意で置換されてもよい。

【0080】

「人工甘味料」および「糖代替物」という用語は、甘味を与えるが、糖よりも低い熱量エネルギーを有する食品添加物を示す。場合によっては、「人工甘味料」または「糖代替物」の熱量エネルギーは無視できる。

【0081】

本明細書で使用される「苦い」または「苦味」という用語は、苦味物質の検出後に得られる知覚または味覚を示す。下記特質は苦味の一因となり得る：渋い、苦い-渋い、金属性、苦い-金属性、ならびに異味、後味および望ましくない味覚、例えば、限定はされないが、冷凍焼けおよびボール紙味覚、および/またはこれらの任意の組み合わせ。当技術分野では、「異味」という用語はしばしば、「苦味」と同義であることに注意すべきである。理論により制限されないが、苦味の多様性は、多数の苦味受容体およびこれらの受容体による苦味物質の分別検出を反映し得る。本明細書で使用される苦味は、苦味物質による苦味受容体の活性化を含む。本明細書で使用される苦味はまた、苦味物質による苦味受容体の活性化、続く下流シグナル伝達を含む。本明細書で使用される苦味はまた、苦味物質による刺激後のシグナル経路の活性化を含む。本明細書で使用される苦味はさらに、苦味受容体による苦味物質の検出後のシグナル伝達に起因する知覚を含む。本明細書で使用される苦味はさらに、苦味受容体を苦味物質と接触させた後のシグナル伝達に起因する知覚を含む。苦味は脳内で知覚され得る。30

【0082】

「苦味受容体」という用語は、受容体、典型的には細胞表面受容体を示し、これに苦味物質が結合できる。苦味受容体は、口腔、および/または口腔外組織、例えば、胃、腸および結腸を含む胃腸管全体にわたる味覚様、ホルモン産生細胞に存在し得る。苦味受容体はまた、インビトロで、例えばアッセイ、例えば、限定はされないが、細胞アッセイまたは結合アッセイにおいて存在し得る。

【0083】

「苦味物質」「苦味リガンド」または「苦味化合物」という用語は、苦味受容体を活性化し、またはこれにより検出され得るおよび/または被験体において苦味の知覚を与える化合物を示す。「苦味物質」はまた、一緒にになり、苦味受容体を活性化する、またはこれにより検出されるおよび/または被験体において苦味の知覚を与える多様な化合物を示す。「苦味物質」はさらに、被験体による摂取時に酵素的に修飾され、苦味受容体を活性化する、またはこれにより検出されるおよび/または被験体において苦味の知覚を与える化合物を示す。苦味の知覚は個体間で変動し得るので、幾人かの個体は、「苦味物質」を、他の個体により同じ化合物に対して知覚される苦味の種類と比較して、異なる種類の苦味を与える化合物として説明する可能性がある。苦味物質と言う用語はまた、苦味を与える化合物を示す。当業者は、苦味物質により意味されるものを容易に同定し、理解すること4050

ができる。苦味物質を含むおよび苦みのする食品を含む1つのまたは複数の苦味物質または材料の非限定的な例としては、コーヒー、無糖ココア、マーマレード、苦瓜、ビール、ビターズ、かんきつ果皮、タンポポの若葉、キクチシャ、キニーネ、マグネシウム塩、カルシウム塩、カリウム塩、KCl、乳酸カリウム、アセスルファムK、芽キャベツ、アスパラガス、ゴーヤ、ワイルドキュウリ、セロリ、ホップ、コールラビ、ダイコン葉、ニンジン、カボチャ、コラードの若葉、ケール、スバルテイン、カフェイン、アトロピン、ニコチン、尿素およびストリキニーネが挙げられる。

#### 【0084】

苦味物質のさらなる例としては医薬品が挙げられる。苦味物質としての医薬品の非限定的な例としては、アセトアミノフェン、アンピシリン、アジスロマイシン、クロルフェニラミン、シメチジン、デキストロメトルファン、ジフェンヒドラミン、エリスロマイシン、イブプロフェン、ペニシリン、フェニルブタゾン、プロソイドエフェドリン、ラニチジン、スピロノラクトンおよびテオフィリン（これらは全て苦味と関連している）が挙げられる。

10

#### 【0085】

「食用的または生物学的に許容される塩」という用語は、本発明の化合物の、任意の食用的または生物学的に許容される塩、エステル、またはそのようなエステルの塩を示し、これは、摂取されると、（直接または間接的に）、苦味物質に起因する苦味の知覚を低減させる能力により特徴付けられる本発明の化合物、またはその代謝産物、残渣または部分を提供することができる。同様に、「食用的または生物学的に許容される誘導体」という用語は、本発明の化合物の任意の食用的または生物学的に許容される誘導体を示し、これは、摂取されると、（直接または間接的に）、苦味物質に起因する苦味の知覚を低減させる能力により特徴付けられる本発明の化合物、その代謝産物、残渣または部分を提供することができる。「食用製品」は、経口使用、例えば飲食に好適な製品である。そのため、食用的に許容される化合物は可食化合物である。

20

#### 【0086】

「消費者製品」という用語は、個人的利用および／または被験体による消費のための健康および美容製品を示す。消費者製品は、任意の形態、例えば、限定はされないが、液体、固体、半固体、錠剤、カプセル、ロゼンジ、ストリップ、粉末、ゲル、ガム、ペースト、スラリー、シロップ、エアロゾルおよびスプレーで存在し得る。消費者製品の非限定的な例としては、栄養補給食品、栄養補助食品、リップスティック、リップクリーム、セッケン、シャンプー、ガム、接着剤（例えば、歯科用接着剤）、練り歯磨き、経口鎮痛薬、口臭予防剤、口腔洗浄薬、歯の漂白剤、および他の歯磨剤が挙げられる。

30

#### 【0087】

「食事」という用語は集合的に、被験体により消費される食品および／または飲料を示す。被験体の「食事」はまた、被験体が摂取する任意の消費者製品または医薬組成物を含む。

#### 【0088】

「可食組成物」という用語は、典型的に口腔を介する消費に好適な組成物を示す（とはいっても、消費は吸入などの非経口手段を介して起こり得る）。可食組成物は、任意の形態、例えば、限定はされないが、液体、固体、半固体、錠剤、ロゼンジ、粉末、ゲル、ガム、ペースト、スラリー、シロップ、エアロゾルおよびスプレーで存在し得る。本明細書で使用されるように、可食組成物は食品、医薬組成物、および消費者製品を含む。可食組成物という用語はまた、例えば、健康および栄養補助食品を示す。本明細書で使用されるように、可食組成物はまた、口腔内に置かれるが、飲み込まれない組成物を含み、専門の歯科用製品、例えば歯科治療薬、充填物、充填材料、型および研磨剤が挙げられる。「食用」という用語は同様の組成物を示し、一般に「可食」と言う用語の同義語として使用される。

40

#### 【0089】

「有効量」という用語は、所望の特性または結果を生成させるのに十分な量を示す。例

50

えば、本発明の化合物の有効量は、苦味物質と関連する苦味の知覚を低減することができる量である。発明の化合物の「有効量」という用語はまた、可食組成物に添加された場合、例えば、NaCl代替物の苦味を低減し、よって、前記可食組成物の所望の塩味の知覚の維持を可能にする量を示す。「化合物の有効量」という用語はまた、可食組成物に添加された場合、食品の保存を可能にし、一方で、保存剤中の苦味物質と関連する苦味を低減または排除する量を示す。「有効量」という用語はまた、食品中の苦味物質または本質的に苦い食品のいずれかと関連する苦味または後味の知覚を低減または排除することができる本発明の化合物の量を示す。

## 【0090】

「香味改良剤」という用語は、可食組成物、例えば食品に添加された場合、可食組成物中に存在する香味（例えば、甘味、塩味、旨味、酸味、または苦味）を改変する（例えば、その知覚を隠蔽、排除、減少、低減、または増強させる）化合物または化合物の混合物を示す。10

## 【0091】

「食品」という用語は、1つ以上の加工食材を含む任意の組成物を示す。食品としては、下記が挙げられるが、それらに限定されない：菓子類、ベーカリー製品（例えば、限定はされないが、パン生地、パン、ビスケット、クラッカー、ケーキ、ペストリー、パイ、タルト、キッシュ、およびクッキー）、アイスクリーム（例えば、限定はされないが、インパルスアイスクリーム、持ち帰りアイスクリーム、フローズン・ヨーグルト、ジェラート、ソルベ、シャーベットおよび大豆、カラスマギ、豆およびコメに基づくアイスクリーム）、乳製品（例えば、限定はされないが、飲用牛乳、チーズ、ヨーグルト、および乳酸飲料）、チーズ（例えば、限定はされないが、ナチュラルチーズおよびプロセスチーズ）、バター、マーガリン、甘味および風味スナック（例えば、限定はされないが、フルーツ味のスナック、チップス／クリスピ、トーティーヤ／トウモロコシチップス、ポップコーン、プレッツェル、チョコレート、およびナッツ）、温かいおよび冷たい飲料（例えば、限定はされないが、飲料、飲料混合物、濃縮物、ジュース、炭酸飲料、非炭酸飲料、アルコール飲料、ノンアルコール飲料、ソフトドリンク、スポーツドリンク、アイソトニック飲料、コーヒー、紅茶、ボトル入り飲料水、および植物および植物抽出物から調製した飲料（例えば、成分として植物または真菌抽出物を用いて調製した冷たい飲料、様々な方法、例えば、様々な植物部位、例えば、限定はされないが葉、花、茎、果実、根、根茎、茎、樹皮、揮発油、またはさらに植物全体の振り出し、煎出、または抽出または蒸留の他の手段で調製された飲料）、スナックバー（例えば、限定はされないが、グラノーラバー、ミューズリーバー、プロテインバー、朝食バー、エネルギーバー、およびフルーツバー）、ミールリプレイスメント製品、携帯食料（例えば、限定はされないが、缶詰食品、保存食品、冷凍食品、乾燥食品、冷蔵食品、ディナーミックス、マカロニおよびチーズ、冷凍ピザ、冷蔵ピザ、および加工調理済みサラダ）、スープ（例えば、限定はされないが、プロス様スープおよびクリーム系スープ）、プロス、グレイビー、しょうゆ、肉および魚（生、調理済み、および乾燥肉を含む）、デリ製品（例えば、限定はされないが、スライス用に好適な肉およびチーズまたは予めスライスされた肉およびチーズ、例えば、シチメンチョウ、チキン、ハム、ボローニャ、サラミ、ピアソーセージ、キャピコラ、チョリソ、コーンビーフ、ダッチローフ、セラーノ、プロシュット、ヘッドチーズ、レバーソーセージ、ミートローフ（例えば、オリーブローフ、ペッパー ローフ、ピメントローフ、ならびにハムおよびチーズローフ）、モルタデッラ、パストラミ、ペパロニ、ローストビーフ、ローストポーク、ソーシソン、薰製肉、サマーソーセージ、タン、アメリカンチーズ、ブルーチーズ、chedarチーズ、コルビーチーズ、コルビージャックチーズ、ゴウダ、モントレージャックチーズ、ミュエンスタチーズモツァレラ、パルミジャーノチーズ、ペッパー ジャックチーズ、プロヴォローネ、ロマーノチーズ、ストリングチーズ、スプレー チーズ、およびスイスチーズ）、野菜（例えば、限定はされないが、生、酢漬け、調理済み、および乾燥野菜、例えばフライドポテト）、果実（生、調理済み、および乾燥果実を含む）、穀物（例えば、限定はされないが、乾燥穀類およびパン）、加工調理済み食品（例20304050

えば、限定はされないが、乾燥、缶詰、または瓶詰めソースおよびスープ)、スナック食品、パスタ(例えば、限定はされないが、生パスタ、冷蔵パスタ、冷凍パスタ、乾燥パスタ、およびマカロニ)、麺(例えば、限定はされないが、卵麺、コムギ麺、コメ麺、リヨクトウ麺、ジャガイモ麺、ソバ麺、トウモロコシ麺、春さめ、チャーメン、フェットチーネ、フジッリ、ニョッキ、ラザニア、リングイーネ、ロメイン、マカロニ、マニコッティ、パッタイ、ペンネ、ラーメン、ビーフン、リガトーニ、そば、スパゲティ、シュペツレ、うどん、およびジー・ティ)、缶詰食品、冷凍食品、乾燥食品、冷蔵食品、油および脂肪、ベビーフード、スプレッド、サラダ、シリアル(例えば、限定はされないが、ホットおよびコールドシリアル)、ソース(例えば、限定はされないが、チーズソース(例えば、マカロニ用およびチーズ)トマトペースト、トマトピューレ、固体ブイヨン、固体スープの素、テーブルソース、ボーアベースソース、パスタソース、料理用ソース、マリネード、乾燥ソース、混合粉末、ケチャップ、マヨネーズ、サラダドレッシング、ビネグレット、マスタード、およびディップ)、ゼリー、ジャム、貯蔵食品、蜂蜜、ブディング、レスピミックス、シロップ、アイシング、充填物、注入食品、塩漬け食品、マリネ食品および香辛料(例えばケチャップ、マスタードおよびステーキソース)。いくつかの実施形態では、食品は動物飼料である。例えば、食品はペット食品、すなわち家庭用ペットによる消費のための食品であってもよい。他の実施形態では、食品は家畜食品、すなわち家畜による消費のための食品である。

## 【0092】

「食材」という用語は、食品を調製するために使用される、未加工成分または基本的栄養または香味含有要素を示す。食材の非限定的な例としては下記が挙げられる：果実、野菜、肉、魚、穀物、乳、卵、塊茎、糖類、甘味料、油、ハーブ、スナック、ソース、スパイスおよび塩。

## 【0093】

「ハロ」または「ハロゲン」という用語はフッ素、塩素、臭素またはヨウ素置換基を示す。

## 【0094】

「百万分率」および「ppm」という用語は、食品業界では、低濃度の溶液を示すために使用される。例えば、 $1\text{ mol}$ の溶媒中の1グラムの溶質は、 $1\text{ ppm}$ の濃度を有し、 $1\text{ mol}$ の溶媒中の1グラムの $1\text{ mol}$ の $1\text{ ppm}$ の $(0.001\text{ g})$ の溶質は $1\text{ ppm}$ の濃度を有する。したがって、1ミリグラム/リットル(すなわち $1\text{ mg/L}$ )の濃度は $1\text{ ppm}$ に等しい。

## 【0095】

「苦味の知覚」「塩辛さの知覚」「香味の知覚」と言う用語および同様の用語は、被験体の特定の味覚または香味の自覚を示す。

## 【0096】

「医薬活性成分」という用語は、生物学的に活性である医薬組成物中の化合物を示す。

## 【0097】

「カリウム塩」という用語はカリウムがカチオンである塩を示す。本発明との関連でカリウム塩は、好ましくは可食カリウム塩、例えば、限定はされないが、下記が挙げられる：アセスルファムK(AceK)、硫酸カリウムアルミニウム、グアニル酸二カリウム、イノシン酸二カリウム、グルタミン酸カリウム、酢酸カリウム、カリウム酸タート( potassium acid tartate)、酒石酸カリウム、アジピン酸カリウム、アルギン酸カリウム、ケイ酸カリウムアルミニウム、アスコルビン酸カリウム、アスパラギン酸カリウム、安息香酸カリウム、重炭酸カリウム、重硫酸カリウム、重亜硫酸カリウム、臭素酸カリウム、炭酸カリウム、塩化カリウム、クエン酸カリウム、クエン酸二水素カリウム、リン酸二水素カリウム、フェロシアン化カリウム、フマル酸カリウム、ジベレリン酸カリウム、グルコン酸カリウム、水酸化カリウム、亜硫酸水素カリウム、ヨウ化カリウム、乳酸カリウム、リンゴ酸カリウム、メタ重亜硫酸カリウム、硝酸カリウム、亜硝酸カリウム、過硫酸カリウム、リン酸カリウム(二塩基性)、リン酸カリウム(一塩

10

20

30

40

50

基性)、リン酸カリウム(三塩基性)、ポリメタリン酸カリウム、ポリリン酸カリウム、ピロリン酸カリウム、プロピオン酸カリウム、サッカリンカリウム、酒石酸ナトリウムカリウム(例えば、L(+)-酒石酸ナトリウムカリウム)、ソルビン酸カリウム、硫酸カリウム、亜硫酸カリウム、およびトリポリリン酸カリウム。

#### 【0098】

「加工食材」という用語は、その元の状態を変化させる任意のプロセス(例えば、収穫、屠殺、および洗浄を除く)に供された食材を示す。食品を加工処理する方法の例としては、下記が挙げられるが、それらに限定されない: 望まれない外層の除去、例えばジャガイモ剥皮または桃の皮剥ぎ; 細断またはスライシング; ミンチにすることまたは漬け込むこと; 液化、例えば果実ジュースを生成させること; 発酵(例えばビール); 乳化; 料理、例えば煮沸、焼くこと、揚げること、加熱、蒸し加熱またはグリル焼き; 油で揚げること; ベーキング; 混合; ガスの添加、例えばパンのための空気混入またはソフトドリンクのガス化; 補強加工; 調味料(例えば、ハーブ、スパイス、塩による); 噴霧乾燥; 低温殺菌; パッケージング(例えば、缶詰化または箱詰め); 押出加工; パフ形成; ブレンディング; ならびに保存(例えば、塩、糖、乳酸カリウムまたは他の保存剤の添加)。

#### 【0099】

「置換する」または「置換すること」という用語は、例えば、食品などの可食組成物において、またはその調製において1つの化合物を別の化合物で代替することを示す。これは完全および部分置換または代替を含む。

#### 【0100】

「塩味」という用語は、例えば、アルカリ金属塩のイオン(例えば、塩化ナトリウムにおけるNa<sup>+</sup>およびCl<sup>-</sup>)により誘発される味覚を示す。塩味を誘発する組成物の非限定的な例としては、食卓塩(塩化ナトリウム)、海水、海塩および塩化カリウムが挙げられる。組成物の塩味の量または塩辛さは、例えば、味覚試験により決定することができる。

#### 【0101】

「ナトリウム」または「ナトリウム塩」という用語は、被験体により摂取される、または別 の方法で消費されるナトリウム(すなわち、ナトリウム塩)の量を示す。一般に、「ナトリウム」または「ナトリウム塩」は、ナトリウムはカチオンである塩または化合物を示す。本発明との関連で、ナトリウム塩としては下記が挙げられるが、それらに限定されない: 硫酸ナトリウムアルミニウム、EDTAカルシウム二ナトリウム、スルホコハク酸ジオクチルナトリウム、5'-リボヌクレオチド二ナトリウム、エチレンジアミン四酢酸二ナトリウム、グアニル酸二ナトリウム、イノシン酸二ナトリウム酢酸ナトリウム、グルタミン酸ナトリウム(MSG)、酒石酸カリウムナトリウム、酸性ピロリン酸ナトリウム、アジピン酸ナトリウム、アルギン酸ナトリウム、アルミノケイ酸ナトリウム、リン酸ナトリウムアルミニウム(酸性)、リン酸ナトリウムアルミニウム(塩基性)、アスコルビン酸ナトリウム、安息香酸ナトリウム、重炭酸ナトリウム、重硫酸ナトリウム、重亜硫酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、カゼイン酸ナトリウム、塩化ナトリウム、クエン酸ナトリウム、サイクラミン酸ナトリウム、デヒドロ酢酸ナトリウム、二酢酸ナトリウム、デヒドロ酢酸ナトリウム、クエン酸二水素ナトリウム、リン酸二水素ナトリウム、DL-リンゴ酸ナトリウム、エリトルビン酸ナトリウム、ナトリウムエリトルビン、パラヒドロキシ安息香酸エチルナトリウム、ピロリン酸第二鉄ナトリウム、フェロシアノ化ナトリウム、ギ酸ナトリウム、フマル酸ナトリウム、グルコン酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、DL-リンゴ酸水素ナトリウム、二酢酸ナトリウム、亜硫酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、次亜リン酸ナトリウム、酒石酸ナトリウム(例えば、L(+)-酒石酸ナトリウム)、乳酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウム、リンゴ酸ナトリウム、メタ重亜硫酸ナトリウム、メタリン酸ナトリウム、パラヒドロキシ安息香酸メチルナトリウム、硝酸ナトリウム、亜硝酸ナトリウム、O-フェニルフェノールナトリウム、リン酸ナトリウム(二塩基性)、リン酸ナトリウム(一塩基性)、リン酸ナトリウム(三塩基性)、ポリリン酸ナトリウム、酒石酸カリウムナトリウム、プロピオ

10

20

30

40

50

ン酸ナトリウム、パラヒドロキシ安息香酸プロピルナトリウム、ピロリン酸ナトリウム、サッカリンナトリウム、セスキ炭酸ナトリウム、ステアロイル乳酸ナトリウム、フマル酸ステアリルナトリウム、コハク酸ナトリウム、硫酸ナトリウム、およびオクテニルコハク酸デンプンナトリウム。

#### 【0102】

「ナトリウム摂取」という用語は、被験体により摂取される、または別 の方法で消費されるナトリウムの量を示す。

#### 【0103】

化学構造との関連で「安定性」または「安定な」という用語は、系がその最低エネルギー状態にある、またはその環境と化学平衡にある化学状態を示す。よって、安定な化合物（または、例えば、安定な多くの原子または置換基を含む化合物）は環境において、または通常の使用中に特に反応性とならず、その予想される実用性の時間スケールでその実用的な特性を保持する。10

#### 【0104】

「被験体」という用語は哺乳類を示す。好ましい実施形態では、被験体はヒトである。いくつかの実施形態では、被験体は飼育または実験動物、例えば、限定はされないが、家庭用ペット、例えばイヌ、ネコ、ブタ、ウサギ、ラット、マウス、スナネズミ、ハムスター、モルモット、およびフェレットである。いくつかの実施形態では、被験体は家畜動物である。家畜動物の非限定的な例としては下記が挙げられる：アルパカ、バイソン、ラクダ、ウシ、シカ、ブタ、ウマ、ラマ、ラバ、ロバ、ヒツジ、ヤギ、ウサギ、トナカイ、およびヤク。20

#### 【0105】

「糖」という用語は、単純な炭水化物、例えば单糖または二糖を示し、甘さの主な味覚感覚を送達する。糖の非限定的な例としてはグルコース、果糖、ガラクトース、スクロース、ラクトース、およびマルトースが挙げられる。

#### 【0106】

「甘味」という用語は、例えば、糖類により誘発される味覚を示す。甘味を誘発する組成物の非限定的な例としては、グルコース、スクロース、果糖、サッカリン、サイクラミン酸、アスパルテーム、アセスルファムカリウム、スクラロース、アリターム、およびネオテームが挙げられる。組成物の甘味の量または甘さは例えば、味覚試験により決定することができる。30

#### 【0107】

脂肪族基は1つ以上の置換基を含み得る。脂肪族基の飽和もしくは不飽和炭素上の好適な置換基の例としては下記が挙げられるが、それらに限定されず：ハロゲン、-CF<sub>3</sub>、-R'、-OR'、-OH、-SH、-SR'、保護されたOH（例えばアシルオキシ）、-NO<sub>2</sub>、-CN、-NH<sub>2</sub>、-NHR'、-N(R')<sub>2</sub>、-NHCO<sub>2</sub>R'、-NHCONHR'、-NHCON(R')<sub>2</sub>、-NRCOR'、-NHC<sub>2</sub>H、-NHCO<sub>2</sub>R'、-CO<sub>2</sub>R'、-CO<sub>2</sub>H、-COR'、-CONH<sub>2</sub>、-CONHR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>H、-S(O)<sub>2</sub>R'、-S(O)<sub>3</sub>H、-S(O)<sub>3</sub>R'、-S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-S(O)H、-S(O)R'、-S(O)<sub>2</sub>NHR'、-S(O)<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-NHS(O)<sub>2</sub>H、または-NHS(O)<sub>2</sub>R'、=O、=S、=NNHR'、=NN(R')<sub>2</sub>、=N-OR'、=NNHCOR'、=NNHCO<sub>2</sub>R'、=NNHSO<sub>2</sub>R'、=N-CN、または=NR'、ここで、R'は下記から選択され：H、脂肪族、カルボシクリル、ヘテロシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアラルキル、ならびに各R'は任意で、1つ以上の下記により置換される：ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、-NH-（非置換脂肪族）、-N-（非置換脂肪族）<sub>2</sub>、カルボキシ、カルバモイル、ヒドロキシ、-O-（非置換脂肪族）、-SH、-S-（非置換脂肪族）、CF<sub>3</sub>、-S(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、非置換脂肪族、非置換カルボシクリル、非置換ヘテロシクリル、非置換アリール、非置換アラルキル、非置換ヘテロアリール、または非置換ヘテロアラルキル。この明細書により導かれ4050

るよう、好適な置換基の選択は、当業者の知識の範囲内にある。

**【0108】**

本明細書で規定されるように、発明の化合物は、化合物の全ての立体化学形態、例えば幾何異性体（すなわち、E、Z）および光学異性体（すなわち、R、S）を含むことが意図される。本化合物の単一の立体化学異性体ならびに鏡像異性体およびジアステレオマー混合物は発明の範囲内にある。別記されない限り、本明細書で示される式はまた、1つ以上の同位体が濃縮された原子の存在においてのみ異なる化合物を含むことを意味する。例えば、水素の重水素またはトリチウムによる置換、または炭素の<sup>13</sup>C - または<sup>14</sup>C - 濃縮炭素による置換を除きこの式を有する化合物は、この発明の範囲内にある。

**【0109】**

本発明は、本発明の化合物を含む可食組成物（前記化合物を含む食品、消費者製品、および医薬組成物を含む）、ならびにそのような組成物を調製する方法を提供する。本発明はまた、食品中のナトリウム（例えば、NaClまたは乳酸ナトリウム）あるいは糖の量を低減させる方法、食事におけるナトリウムまたは糖摂取を低減させる方法、苦味を低減させる方法、ならびに苦味受容体の活性を低減させる方法を提供する。本発明はまた、ナトリウム含有化合物または組成物をカリウム含有化合物組成物と置換することにより、可食組成物または食事中のナトリウムの量を低減することを含む。本発明はまた、糖をカリウム含有甘味料、例えばアセスルファムKと置換することにより、可食組成物または食事中の糖の量を低減することを含む。

**【0110】**

**可食組成物**

1つの態様によれば、本発明は、苦味物質の苦味を低減するために発明の化合物を含む可食組成物を提供する。

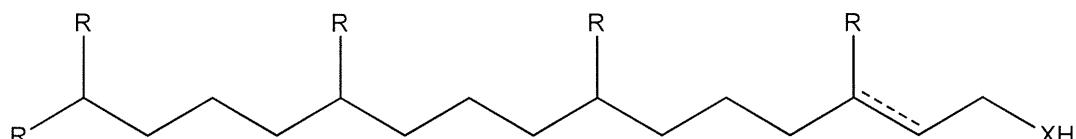
**【0111】**

このおよび本明細書の任意のセクションで開示される化合物の全ての立体化学形態は、具体的に企図され、幾何異性体（すなわち、E、Z）および光学異性体（すなわち、R、S）を含む。このおよび本明細書の任意のセクションで開示される化合物の単一の立体化学異性体、ならびに鏡像異性体およびジアステレオマー混合物もまた、具体的に企図される。

**【0112】**

いくつかの実施形態では、本発明は苦味物質の苦味を低減させるための可食組成物を提供し、ここで、組成物は分枝アルケン化合物を含む。この発明の分枝アルケン化合物は、苦味物質の苦味を低減または排除することができる。いくつかの実施形態では、分枝アルケン化合物は約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有する。ある一定の実施形態では、分枝アルケン化合物は式(I)の化合物：

**【化9】**



式(I)；

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーであり、

式中、原子価および安定性が許容するように：

XはSまたはOであり；

各Rは独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表し；

10

20

30

40

50

ここで、組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる。

**【0113】**

式(I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

XはSまたはOであり；

各Rは独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す。

**【0114】**

式(I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

10

原子価および安定性が許容するように：

XはOであり；

各Rは独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す。

**【0115】**

式(I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

XはSまたはOであり；

各Rは独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；ならびに

20

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す。

**【0116】**

式(I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

XはOであり；

各Rは独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す。

**【0117】**

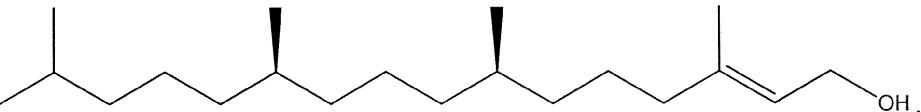
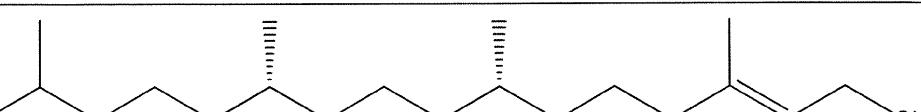
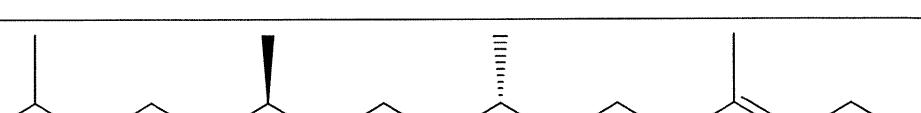
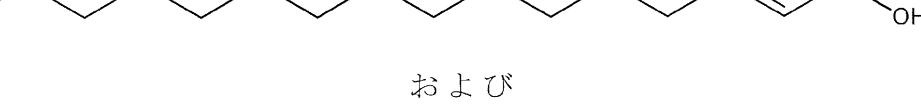
ある一定の実施形態では、式(I)の化合物は点線結合が配置される所にE-二重結合を含む。他の実施形態では、式(I)の化合物は、点線結合が配置される所にZ-二重を含む。さらなる実施形態では、式(I)の化合物は、点線結合が配置される所にE/Z-二重結合の混合物を含む。さらに追加の実施形態では、式(I)の化合物は、点線結合が配置される所に二重結合を含まない。

30

**【0118】**

ある一定の実施形態では、式(I)の化合物は下記である：

## 【化10】

化合物1	
化合物2	
化合物3	
化合物4	
化合物5	および  (Aldrich Cat. No. W502200),

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー。

## 【0119】

本発明の化合物の食用的または生物学的に許容される塩が使用される場合、そのような塩は、好ましくは無機または有機酸および塩基から誘導される。そのような塩の例としては、適切な塩基、例えばアルカリ金属（例えば、ナトリウムおよびカリウム）、アルカリ土類金属（例えば、マグネシウム）、アンモニウムから誘導されるものおよびN<sup>+</sup> (C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル)<sub>4</sub> 塩が挙げられるが、それらに限定されない。

## 【0120】

いくつかの実施形態では、本発明は苦味物質の苦味を低減させるための可食組成物を提供し、ここで、組成物はシクロヘキサジエン系化合物を含む。この発明のシクロヘキサジエン系化合物は、苦味物質の苦味を低減または排除することができる。いくつかの実施形態では、シクロヘキサジエン系化合物は、約1000、500、300または200ダルトン未満の分子量を有する。ある一定の実施形態では、シクロヘキサジエン系化合物は式(I)の化合物：

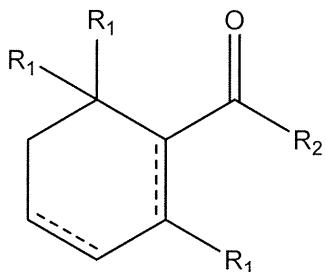
10

20

30

40

## 【化11】



式(I-I);

10

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーであり、

式中、原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表し；

20

ここで、組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる。

## 【0121】

式(I-I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す。

## 【0122】

30

式(I-I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルまたはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニルであり；ならびに

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す。

## 【0123】

式(I-I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>はHまたはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニルであり；ならびに

40

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表す。

## 【0124】

式(I-I)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

各R<sub>1</sub>は独立してHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sub>2</sub>はHまたはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニルであり；ならびに

各点線は炭素-炭素二重結合である。

## 【0125】

式(I-I)の化合物のある一定の実施形態では、環外二重結合はE-二重結合である。

式(I-I)の化合物の他の実施形態では、環外二重結合はZ-二重結合である。さらなる

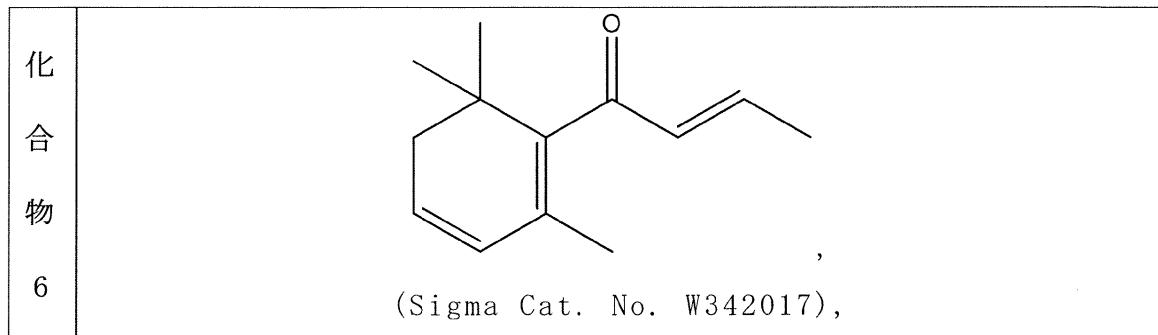
50

実施形態では、式(II)の化合物はE/Z-環外二重結合の混合物を含む。さらに追加の実施形態では、式(II)の化合物は環外二重結合を含まない。

【0126】

ある一定の実施形態では、式(II)の化合物は下記である：

【化12】



10

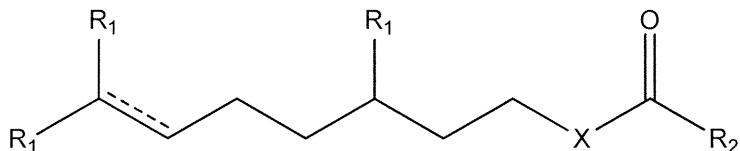
またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー。

【0127】

いくつかの実施形態では、本発明は、苦味物質の苦味を低減させるための可食組成物を提供し、ここで、組成物は分枝アルケンエステル化合物を含む。この発明の分枝アルケンエステル化合物は、苦味物質の苦味を低減または排除することができる。いくつかの実施形態では、分枝アルケンエステル化合物は約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有するある一定の実施形態では、アルケンエ斯特ル化合物は式(III)の化合物：

20

【化13】



30

式(III)；

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーであり、

式中、原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各R<sub>1</sub>は独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>アルキニルであり；ならびに

40

点線結合は任意的な炭素-炭素二重結合を表し；

ここで、組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる。

【0128】

式(III)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各R<sub>1</sub>は独立してH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルであり；ならびに

50

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す。

**【0129】**

式(III)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す。

10

**【0130】**

式(III)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す。

**【0131】**

20

式(III)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = S または O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す。

**【0132】**

30

式(III)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は任意的な炭素 - 炭素二重結合を表す。

**【0133】**

40

式(III)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = O であり；

各 R<sub>1</sub> は独立して H、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキニルであり；

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> アルキニルであり；ならびに

点線は炭素 - 炭素二重結合である。

**【0134】**

50

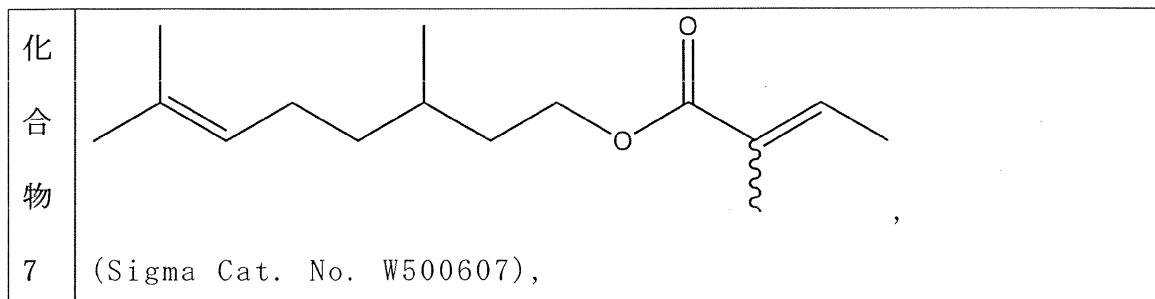
ある一定の実施形態では、式(III)の化合物は、点線結合が配置される所に E - 二重結合を含む。他の実施形態では、式(III)の化合物は点線結合が配置される所に Z - 二重を含む。さらなる実施形態では、式(III)の化合物は、点線結合が配置される

所に E / Z - 二重結合の混合物を含む。さらに追加の実施形態では、式 ( I I I ) の化合物は、点線結合が配置される所に二重結合を含まない。

【 0 1 3 5 】

ある一定の実施形態では、式 ( I I I ) の化合物は下記である：

【 化 1 4 】



10

または、その食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー。

【 0 1 3 6 】

本発明の化合物の食用的または生物学的に許容される塩が使用される場合、そのような塩は好ましくは無機または有機酸および塩基から誘導される。そのような塩の例としては、適切な塩基、例えばアルカリ金属（例えば、ナトリウムおよびカリウム）、アルカリ土類金属（例えば、マグネシウム）、アンモニウムから誘導されるものおよびN<sup>+</sup>(C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル)<sub>4</sub> 塩が挙げられるが、それらに限定されない。

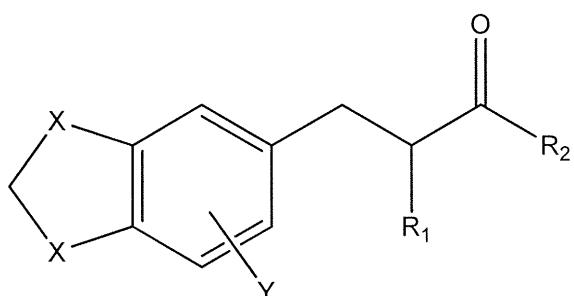
20

【 0 1 3 7 】

いくつかの実施形態では、本発明は苦味物質の苦味を低減させるための可食組成物を提供し、ここで、組成物はベンゾジオキソール系化合物を含む。この発明のベンゾジオキソール系化合物は苦味物質の苦味を低減または排除することができる。いくつかの実施形態では、ベンゾジオキソール系化合物は、約 1000、500、300 または 200 ダルトン未満の分子量を有する。ある一定の実施形態では、ベンゾジオキソール系化合物は式 ( I V ) の化合物：

【 化 1 5 】

30



式 ( I V ) ;

40

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマーであり、

式中、原子価および安定性が許容するように：

各 X は独立して S または O であり；

Y = H またはハロゲンであり；

R<sub>1</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；ならびに

R<sub>2</sub> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルであり；

50

ここで、組成物は可食であり、苦味物質の苦味を低減することができる。

**【0138】**

式(IV)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

各Xは独立してSまたはOであり；

Y = Hまたはハロゲンであり；

R<sub>1</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；ならびに

R<sub>2</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルである。 10

**【0139】**

式(IV)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

各Xは独立してSまたはOであり；

Y = Hまたはハロゲンであり；

R<sub>1</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；ならびに

R<sub>2</sub>はHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルである。

**【0140】**

式(IV)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = Oであり；

Y = Hであり；

R<sub>1</sub>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキニルであり；ならびに

R<sub>2</sub>はHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルである。 20

**【0141】**

式(IV)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = Oであり；

Y = Hであり；

R<sub>1</sub>はHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；ならびに

R<sub>2</sub>はHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルである。 30

**【0142】**

式(IV)の化合物のいくつかの実施形態によれば、

原子価および安定性が許容するように：

X = Oであり；

Y = Hであり；

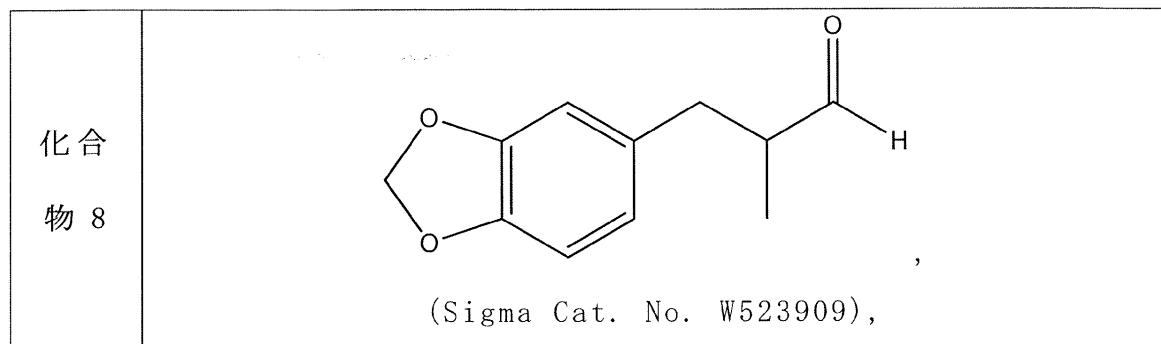
R<sub>1</sub>はHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；ならびに

R<sub>2</sub>はHである。 40

**【0143】**

ある一定の実施形態では、式(IV)の化合物は下記である：

## 【化16】



10

またはその食用的または生物学的に許容される塩または誘導体、またはその鏡像異性体もしくはジアステレオマー。

## 【0144】

本発明の化合物の食用的または生物学的に許容される塩が使用される場合、そのような塩は好ましくは無機または有機酸および塩基から誘導される。そのような塩の例としては、適切な塩基、例えばアルカリ金属（例えば、ナトリウムおよびカリウム）、アルカリ土類金属（例えば、マグネシウム）、アンモニウムから誘導されるものおよびN<sup>+</sup>(C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルキル)<sub>4</sub>塩が挙げられるが、それらに限定されない。

## 【0145】

本発明の別の態様は、a) 発明の化合物；ならびにb) 苦味物質を含む可食組成物を提供する。いくつかの実施形態では、化合物は約1000、500、または300ダルトン未満の分子量を有する化合物である。ある一定の実施形態では、化合物は本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせである。いくつかの実施形態では、発明の化合物は、本明細書で記載される化合物1-8から選択される化合物、またはそれらの組み合わせである。

20

## 【0146】

いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質はKC1である。他の実施形態では、可食組成物中に存在する苦味物質は乳酸カリウムである。

30

## 【0147】

別の実施形態では、可食組成物は、a) 発明の化合物；ならびにb) カリウム塩を含む。いくつかの実施形態では、カリウム塩はKC1または乳酸カリウムである。特定の実施形態では、カリウム塩はKC1である。ある一定の実施形態では、化合物は本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせである。いくつかの実施形態では、発明の化合物は本明細書で記載される化合物1-8から選択される化合物、またはそれらの組み合わせである。

40

## 【0148】

いくつかの実施形態では、可食組成物はさらにナトリウム塩を含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらにNaClを含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに乳酸ナトリウムを含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに糖を含む。

## 【0149】

いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに保存剤、栄養食品、香味材料または追加の香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を含む。

## 【0150】

いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに1つ以上の乳化剤を含む。ナトリウムお

50

およびカリウム系乳化剤が、食品分野では乳化剤として普通に使用される。ナトリウム系乳化剤としては、例えば、脂肪酸のナトリウム塩、アルギン酸ナトリウム、リン酸ナトリウムアルミニウム、カゼイン酸ナトリウム、メタリン酸ナトリウム、リン酸ナトリウム(二塩基性)、リン酸ナトリウム(一塩基性)、リン酸ナトリウム(三塩基性)、ポリリン酸ナトリウム、ピロリン酸ナトリウム、およびステアロイル乳酸ナトリウムが挙げられる。カリウム系乳化剤としては、例えば、脂肪酸のカリウム塩、アルギン酸カリウム、クエン酸カリウム、リン酸カリウム(二塩基性)、リン酸カリウム(一塩基性)、リン酸カリウム(三塩基性)、ポリリン酸カリウム、ポリメタリン酸カリウム、およびピロリン酸カリウムが挙げられる。したがって、本発明のいくつかの実施形態はナトリウム系乳化剤をカリウム系乳化剤と置換すること、および本発明の化合物を添加することを含む。

10

#### 【0151】

いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに、本発明の化合物の有効性を増加または減少させる界面活性剤を含む。好適な界面活性剤としては、非イオン性界面活性剤(例えば、モノおよびジグリセリド、脂肪酸エステル、ソルビタンエステル、プロピレングリコールエステル、および乳酸エステル)、アニオン性界面活性剤(例えば、スルホサクシネットおよびレシチン)およびカチオン性界面活性剤(例えば、四級アンモニウム塩)が挙げられるが、それらに限定されない。

#### 【0152】

可食組成物がさらに保存剤を含むいくつかの実施形態では、保存剤は可食組成物の有効期間を改善する。好適な保存剤としては下記が挙げられるが、それらに限定されない: アスコルビン酸、安息香酸、p-ヒドロキシ安息香酸ブチル、安息香酸カルシウム、EDTAカルシウム二ナトリウム、亜硫酸水素カルシウム、プロピオノ酸カルシウム、ソルビン酸カルシウム、キトサン、硫酸銅、デヒドロ酢酸、ピロ炭酸ジエチル、二炭酸ジメチル、EDTA二ナトリウム、E-ポリリジングリシン、エリソルビン酸、p-ヒドロキシ安息香酸エチル、ギ酸、グーガム、ヘプチルパラベン、ヒノキチオール、パラオキシ安息香酸イソブチル、日本エゴノキベンゾイン抽出物、メチルパラベン、しらこタンパク抽出物、ナタマイシン、ナイシン、ペプチン抽出物、2-フェニルフェノール、ピマリシン、酢酸カリウム、安息香酸カリウム、乳酸カリウム、メタ重亜硫酸カリウム、硝酸カリウム、亜硝酸カリウム、ピロ亜硫酸カリウム、ソルビン酸カリウム、亜硫酸カリウム、プロピオン酸、p-ヒドロキシ安息香酸プロピル、p-オキシ安息香酸プロピル、酸化プロピレン、プロピルパラベン、安息香酸ナトリウム、重亜硫酸ナトリウム、デヒドロ酢酸ナトリウム、二酢酸ナトリウム、エリトルビン酸ナトリウム、亜硫酸水素ナトリウム、次亜リン酸ナトリウム、次亜硫酸ナトリウム、メタ重亜硫酸ナトリウム、硝酸ナトリウム、亜硝酸ナトリウム、o-フェニルフェノールナトリウム、プロピオノ酸ナトリウム、ピロ亜硫酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオシアノ酸ナトリウム、ソルビン酸および二酸化硫黄。いくつかの実施形態では、保存剤は苦味を有する。

20

#### 【0153】

いくつかの実施形態では、組成物はさらに、フロー剤、処理剤、糖類、アミノ酸、他のスクレオチド、および有機酸のナトリウムまたはカリウム塩、例えばクエン酸および酒石酸塩からなる群より選択される、1つ以上の追加の構成成分を含み得る。そのような追加の成分は、香味を添加し、ブレンディング、加工処理、または可食組成物の流動性において補助し得る。

40

#### 【0154】

いくつかの実施形態では、本発明の化合物の放出速度は制御される。本発明の化合物の放出速度は、例えば、水でのその溶解度を変化させることにより変化させることができる。急速な放出は、本発明の化合物を高い水溶性を有する材料を用いて封入することにより達成することができる。本発明の化合物の遅延放出は、本発明の化合物を低い水溶性を有する材料を用いて封入することにより達成することができる。本発明の化合物は、炭水化物またはマスキング味物質、例えば甘味料と共に共封入することができる。本発明の化合物の放出速度はまた、封入率により制御することができる。いくつかの実施形態では、本

50

発明の化合物は完全に封入される。他の実施形態では、本発明の化合物は部分的に封入される。いくつかの実施形態では、放出速度は、苦味物質と共に放出するように制御される。

#### 【0155】

この発明の可食組成物は、当技術分野でよく知られている技術に従い調製される。一般に、発明の可食組成物は可食組成物の構成成分または成分を発明の化合物と共に混合することにより調製される。また、発明の化合物は、可食組成物に直接添加することができる。いくつかの実施形態では、苦味物質は発明の化合物と同時にまたは連続して添加される。連続的である場合、苦味物質は、発明の化合物の前後に添加され得る。いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

10

#### 【0156】

可食組成物において使用される本発明の化合物および苦味物質の両方の量は、様々な因子、例えば、組成物の目的および苦さ、塩辛さ、または甘さの所望のまたは許容される知覚に依存する。その量は、可食組成物の性質、添加される特定の化合物、苦味物質、組成物中に存在する他の化合物、調製方法（使用される熱量を含む）、および可食組成物のpHに依存し得る。ことが理解されるであろう。当業者は所望の味覚（複数可）を生成させるのに必要とされる量をどのように決定するかを知っている。

#### 【0157】

一般に、可食組成物中の本発明の化合物は、約0.001 ppmと1000 ppmの間の濃度で存在し得る。いくつかの実施形態では、可食組成物は、約0.005~500 ppm；0.01~100 ppm；0.05~50 ppm；0.1~5 ppm；0.1~10 ppm；1~10 ppm；1~30 ppm；1~50 ppm；10~30 ppm；10~50 ppm；または30~50 ppmの本発明の化合物を含む。さらに他の実施形態では、可食組成物は約0.1~30 ppm、1~30 ppmまたは1~50 ppmの本発明の化合物を含む。追加の実施形態では、可食組成物は約0.1~5 ppm；0.1~4 ppm；0.1~3 ppm；0.1~2 ppm；0.1~1 ppm；0.5~5 ppm；0.5~4 ppm；0.5~3 ppm；0.5~2 ppm；0.5~1.5 ppm；0.5~1 ppm；5~15 ppm；6~14 ppm；7~13 ppm；8~12 ppm；9~11 ppm；25~35 ppm；26~34 ppm；27~33 ppm；28~32 ppm；または29~31 ppmを含む。

20

#### 【0158】

さらに他の実施形態では、可食組成物は約0.1 ppm、約0.5 ppm、約1 ppm、約2 ppm、約3 ppm、約4 ppm、約5 ppm、約6 ppm、約7 ppm、約8 ppm、約9 ppm、または約10 ppmの本発明の化合物を含む。他の実施形態では、可食組成物は約11 ppm、約12 ppm、約13 ppm、約14 ppm、約15 ppm、約16 ppm、約17 ppm、約18 ppm、約19 ppm、約20 ppm、約21 ppm、約22 ppm、約23 ppm、約24 ppm、約25 ppm、約26 ppm、約27 ppm、約28 ppm、または約30 ppmの本発明の化合物を含む。

30

#### 【0159】

さらに他の実施形態では、可食組成物は約31 ppm、約32 ppm、約33 ppm、約34 ppm、約35 ppm、約36 ppm、約37 ppm、約38 ppm、約39 ppm、約40 ppm、約41 ppm、約42 ppm、約43 ppm、約44 ppm、約45 ppm、約46 ppm、約47 ppm、約48 ppm、約49 ppm、または約50 ppmの本発明の化合物を含む。

40

#### 【0160】

他の実施形態では、可食組成物は約0.5 ppm、1 ppm、5 ppm、10 ppm、15 ppm、20 ppm、25 ppm、または30 ppm超の本発明の化合物、例えば、約30 ppmまたは50 ppmまでを含む。追加の実施形態では、可食組成物は約50 ppm、30 ppm、25 ppm、20 ppm、15 ppm、10 ppm、5 ppm、1 p

50

p m、または0 . 5 p p m未満の本発明の化合物を含む。さらに追加の実施形態では、可食組成物は約30 p p m、10 p p m、または1 p p m未満の本発明の化合物を含む。

#### 【0161】

可食組成物がKC1を含む場合、KC1の量は、可食組成物の性質、望まれる知覚される塩辛さの量および組成物中の他の化合物の存在によって変動するであろう。いくつかの実施形態では、KC1は、約0 . 001 - 15% w / w、0 . 001 - 10% w / w、0 . 001 - 5% w / w；0 . 01 - 5% w / w；0 . 1 - 5% w / w；1 - 5% w / w；0 . 5 - 4 . 8% w / w；0 . 5 - 4% w / w；0 . 5 - 3% w / w；0 . 75 - 3% w / w；1 - 2 . 5% w / w；または1 - 2% w / wの間の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、KC1は、約0 . 5% w / w、約1% w / w、約1 . 5% w / w、約2% w / w、約2 . 5% w / w、約3% w / w、約3 . 5% w / w、約4% w / w、約4 . 5% w / w、または約5% w / wの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、KC1は、約0 . 5% w / wまで、約1% w / wまで、約1 . 5% w / wまで、約2% w / wまで、約2 . 5% w / wまで、約3% w / wまで、約3 . 5% w / wまで、約4% w / wまで、約4 . 5% w / wまで、約5% w / wまで、約6% w / wまで、約7% w / wまで、約8% w / wまで、約9% w / wまで、約10% w / wまで、約11% w / wまで、約12% w / wまで、約13% w / wまで、約14% w / wまで、または約15% w / wまでの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、KC1は、約2% w / wの濃度で存在する。

#### 【0162】

いくつかの実施形態では、KC1は、可食組成物に、塩代替物としてNaClを置換するのに十分な量で添加される。例えば、可食組成物中のKC1の量は、用途によって、置換されるNaClの約0 . 5 ~ 約1 . 5倍の範囲とすることができます。例えば、約0 . 5 mgのNaClが置換される場合、約0 . 25 ~ 約0 . 75 mgのKC1が添加される。典型的には、KC1は、置換されるNaClと同じ重量で添加される。

#### 【0163】

同様に、可食組成物が乳酸カリウムを含む場合、添加される乳酸カリウムの量は可食組成物の性質、要求される保存の量および組成物中の他の化合物の存在によって変動する。乳酸カリウムは、約0 . 001 - 5% w / w；0 . 01 - 5% w / w；0 . 1 - 5% w / w；0 . 5 - 4 . 8% w / w；0 . 5 - 4% w / w；0 . 5 - 3% w / w；0 . 75 - 3% w / w；1 - 2 . 5% w / w；または1 - 2% w / wの間の濃度で存在し得る。

#### 【0164】

いくつかの実施形態では、乳酸カリウムは可食組成物に、乳酸ナトリウムを置換するのに十分な量で添加される。例えば、乳酸ナトリウム代替物が添加された後の食品または飲料中の乳酸カリウムの量は、用途によって、置換される乳酸ナトリウムの約0 . 5 ~ 約1 . 5倍の範囲とすることができます。例えば、約0 . 5 mgの乳酸ナトリウムが置換される場合、約0 . 25 ~ 約0 . 75 mgの乳酸カリウムが添加される。典型的に、乳酸カリウムは置換される乳酸ナトリウムと同じ重量で添加される。

#### 【0165】

さらに、可食組成物が人工甘味料、例えばアセスルファムKを含む場合、添加される甘味料の量は、可食組成物の性質、要求される甘さの量および組成物中の他の化合物の存在によって変動する。例えば、アセスルファムKは、約1 - 200 p p m、10 - 200 p p m、50 - 150 p p m、50 - 125 p p m、75 - 125 p p m、および75 - 100 p p mの間の濃度、好ましくは約75 p p mで存在し得る。

#### 【0166】

いくつかの実施形態では、人工甘味料は、可食組成物に、糖を置換するのに十分な量で添加される。いくつかの実施形態では、人工甘味料は苦味または後味を有する。いくつかの実施形態では、人工甘味料はアセスルファムKである。例えば、可食組成物中のアセスルファムKの量は、用途によって、置換される糖の約0 . 001 ~ 約0 . 01倍の範囲とすることができます。例えば、約100 mgの糖が置換される場合、約0 . 1 ~ 約1 mgのアセスルファムKが添加される。典型的に、アセスルファムKは置換される糖の量の約0 .

005倍で添加されるであろう。

**【0167】**

いくつかの実施形態では、可食組成物はパッケージに包含される。いくつかの実施形態では、可食組成物はまとめてパッケージングされ、この場合、パッケージは、典型的に単一の料理または食品または飲料の給仕のために使用されるものよりも多くの組成物を含む。そのようなバルクパッケージは、紙、プラスチック、または布袋または段ボール箱またはドラムの形態とすることができます。そのようなバルクパッケージは、可食組成物の分配を促進するために、プラスチックまたは金属注ぎ口が取り付けられ得る。

**【0168】**

いくつかの実施形態では、パッケージは、本発明の化合物および苦味物質を含む可食組成物を包含する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本発明の化合物および苦味のする塩を含む可食組成物を包含する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本発明の化合物およびカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩を含む可食組成物を包含する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本発明の化合物およびカリウム塩を含む可食組成物を包含する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本発明の化合物およびKClを含む可食組成物を包含する。他の実施形態では、パッケージは、本発明の化合物および乳酸カリウムを含む可食組成物を包含する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本発明の化合物、カリウム塩、およびナトリウム塩を含む可食組成物を包含する。他の実施形態では、パッケージは、本発明の化合物、KClおよびNaClを含む可食組成物を包含する。さらに他の実施形態では、パッケージは、本発明の化合物、乳酸カリウムおよび乳酸ナトリウムを含む可食組成物を包含する。他の実施形態では、パッケージは、本発明の化合物およびアセスルファムKおよび糖を含む可食組成物を包含する。他の実施形態では、パッケージは、本発明の化合物、乳酸カリウム、KClおよびNaClを含む可食組成物を包含する。

**【0169】**

いくつかの実施形態では、本発明の可食組成物は調味料として、食品中の成分としてまたは香辛料として使用するのに好適な組成物である。そのような実施形態では、可食組成物は、苦味物質を含んでも、含まなくてもよい。例えば、可食組成物は、例えば、苦味物質、例えば、例として、KClを含む調味料において使用され得る。そのような調味料は、加工調理済み食品を調味するために、食卓塩（すなわち、NaCl）の代わりに使用することができる。また、可食組成物は、例えば、苦味物質を含まない調味料において使用され得る。そのような調味料は、苦味物質と関連する苦味を低減させるために、苦味物質（本質的に存在するか、調製中に添加されるかのいずれか）を含む加工調理済み食品を調味するために使用することができる。いくつかの実施形態では、可食組成物は、KClおよび発明の化合物を含む調味料である。いくつかの実施形態では、可食組成物はKCl、NaClおよび発明の化合物を含む調味料である。いくつかの実施形態では調味料はさらにスパイスまたはスパイスのブレンドを含む。

**【0170】**

また、可食組成物は、医薬または衛生目的のために、例えば、セッケン、シャンプー、口腔洗浄薬、薬剤、医薬品、咳止めシロップ、スプレー式点鼻薬、練り歯磨き、歯科用接着剤、歯の漂白剤、のり（例えば、切手および封筒上）、および昆虫および齧歯類管理において使用される毒素において使用され得る。

**【0171】**

**食品**

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。そのような実施形態によれば、食品は（a）食材；ならびに（b）本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む。

**【0172】**

いくつかの実施形態では、食品はさらに、本明細書で記載される苦味物質を含む。いく

10

20

30

40

50

つかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩、例えばKC1または乳酸カリウムである。特定の実施形態では、カリウム塩はKC1である。

**【0173】**

いくつかの実施形態では、食品はさらに、1つ以上の追加の香味改良剤を含む。

**【0174】**

いくつかの実施形態では、食品はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または追加の香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を含む。

**【0175】**

**医薬組成物**

10

いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。そのような実施形態によれば、医薬組成物は（a）苦味のする医薬活性成分；ならびに（b）本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む。

**【0176】**

いくつかの実施形態によれば、医薬組成物は任意の苦味のする医薬活性成分を含むことができる。苦い医薬化合物の非限定的な例としては下記が挙げられる：アセトアミノフェン、アンピシリン、アジスロマイシン、クロルフェニラミン、シメチジン、デキストロメトルファン、ジフェンヒドラミン、エリスロマイシン、イブプロフェン、ペニシリン、フェニルブタゾン、ブソイドエフェドリン、ラニチジン、スピロノラクトン、スタチン（例えば、限定はされないが、アトルバスタチン、セリバスタチン、フルバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、ピタバスタチン、プラバスタチン、ロスバスタチン、およびシンバスタチン）ならびにテオフィリン。

20

**【0177】**

他の実施形態では、本発明は下記を含む医薬組成物を提供する：（a）医薬活性成分；（b）本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせ；ならびに（c）苦味物質。そのような実施形態では、医薬組成物は任意の医薬活性成分を含み得る。

30

**【0178】**

他の実施形態では、本発明は下記を含む医薬組成物を提供する：（a）医薬活性成分；（b）本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせ；ならびに（c）カリウム塩。いくつかの実施形態では、カリウム塩はKC1または乳酸カリウムである。いくつかの実施形態では、カリウム塩はKC1である。

**【0179】**

いくつかの実施形態では、医薬組成物はさらに、1つ以上の追加の香味改良剤を含む。

**【0180】**

40

いくつかの実施形態では、医薬組成物はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を含む。

**【0181】**

**消費者製品**

いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。そのような実施形態によれば、消費者製品は下記を含む：（a）苦味物質；ならびに（b）本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせ。

50

**【 0 1 8 2 】**

別の実施形態では、本発明は、下記を含む消費者製品提供する：( a ) カリウム塩；ならびに( b ) 本明細書で記載される式( I )、式( II )、式( III )、または式( IV )の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせ。いくつかの実施形態では、カリウム塩はKC1または乳酸カリウムである。いくつかの実施形態では、カリウム塩はKC1である。

**【 0 1 8 3 】**

他の実施形態では、本発明は、苦味物質の苦味を低減させるための消費者製品を提供し、ここで、前記消費者製品は本明細書で記載される式( I )、式( II )、式( III )、または式( IV )の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、カリウム塩はKC1または乳酸カリウムである。いくつかの実施形態では、苦味物質はKC1である。

**【 0 1 8 4 】**

いくつかの実施形態では、消費者製品はさらに、1つ以上の追加の香味改良剤を含む。

**【 0 1 8 5 】**

いくつかの実施形態では、消費者製品はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または追加の香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を含む。

**【 0 1 8 6 】****可食組成物を調製する方法**

別の態様によれば、本発明は可食組成物を調製する方法を提供する。方法は下記を含む：( a ) 食用的に許容される担体を提供すること；ならびに( b ) ( a )の食用的に許容される担体に、本明細書で記載される式( I )、式( II )、式( III )、または式( IV )の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを、食用的に許容される担体と共に添加すること。いくつかの実施形態では、発明の化合物は、添加工程( b )前に溶媒に溶解されている。

**【 0 1 8 7 】**

いくつかの実施形態では、( a )における食用的に許容される担体は本質的に苦い。そのような実施形態では、食用的に許容される担体は、本質的に苦味物質を含み得る。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はKC1である。他の実施形態では、本質的な苦味物質は乳酸カリウムである。

**【 0 1 8 8 】**

いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法はさらに、下記を含む：( c ) 苦味物質を添加すること。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、カリウム塩はKC1または乳酸カリウムである。特定の実施形態では、カリウム塩はKC1である。いくつかの実施形態では、苦味物質は本発明の化合物の前に添加される。他の実施形態では、苦味物質は本発明の化合物の後に添加される。いくつかの実施形態では、本発明の化合物は苦味物質と組み合わされ、その後、食用的に許容される担体と組み合わされる。他の実施形態では、本発明の化合物は食用的に許容される担体、その後苦味物質と連続して組み合わされる。さらに他の実施形態では、本発明の化合物は、苦味物質および食用的に許容される担体の混合物と組み合わされる。

**【 0 1 8 9 】**

いくつかの実施形態では、発明の化合物および苦味物質（存在すれば）は、食用的に許容される担体と混合される。他の実施形態では、化合物および苦味物質（存在すれば）は、食用的に許容される担体上に噴霧され、またはこれをコートする。いくつかの実施形態

10

20

30

40

50

では、発明の化合物は炭水化物または塩上に置かれ、塩または炭水化物上で封入され（噴霧乾燥）、またはカリウム塩と共に結晶化され、「トッピング」塩が生成される。

#### 【0190】

いくつかの実施形態では、苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はKC1である。他の実施形態では、苦味物質は乳酸カリウムである。

#### 【0191】

いくつかの実施形態では、可食組成物はさらに、ナトリウム塩を含む。いくつかの実施形態では、可食組成物はさらにNaClを含む。他の実施形態では、可食組成物はさらに乳酸ナトリウムを含む。さらなる実施形態では、可食組成物はさらに糖を含む。10

#### 【0192】

いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法はさらに、1つ以上の追加の香味改良剤を添加することを含む。

#### 【0193】

いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

#### 【0194】

##### 食品を調製する方法

20

別の態様によれば、本発明は、可食組成物を調製する方法を提供し、ここで、可食組成物は食品である。方法は下記を含む：(a) 食材を提供すること；ならびに(b)(a)の食材に、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを添加すること。いくつかの実施形態では、発明の化合物は発明の化合物を含む可食組成物の形態で添加される。

#### 【0195】

いくつかの実施形態では、(a)における食材は本質的に苦い。そのような実施形態では、食材は本質的に苦味物質を含み得る。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はKC1である。他の実施形態では、本質的な苦味物質は乳酸カリウムである。30

#### 【0196】

いくつかの実施形態では、方法は下記を含む：(a) 食品を提供すること；ならびに(b)(a)の食品に、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを添加すること。いくつかの実施形態では、発明の化合物は、発明の化合物を含む可食組成物の形態で添加される。

#### 【0197】

40

いくつかの実施形態では、(a)における食品は苦味物質を含む。いくつかの実施形態では、苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はKC1である。他の実施形態では、苦味物質は乳酸カリウムである。

#### 【0198】

いくつかの実施形態では、食品を調製する方法はさらに下記を含む：(c) 苦味物質を添加すること。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩、例えばKC1または乳酸カリウムである。特定の実施形態では、カリウム塩はKC1である。いくつかの実施形態では、苦味物質は本発明の化合物の前に添加される。他の実施形態では、苦味物質は本

50

発明の化合物の後に添加される。いくつかの実施形態では、発明の化合物は、苦味物質と共に添加される。いくつかの実施形態では、本発明の化合物は苦味物質と組み合わされ、その後、食材または食品と組み合わされる。他の実施形態では、本発明の化合物は、食材または食品、その後苦味物質と連続して組み合わされる。さらに他の実施形態では、本発明の化合物は苦味物質および食材または食品の混合物と組み合わされる。

#### 【0199】

いくつかの実施形態では、化合物および苦味物質（存在すれば）は、食材と混合される。他の実施形態では、化合物および苦味物質（存在すれば）は、食材上に噴霧され、またはこれをコートする。いくつかの実施形態では、発明の化合物は炭水化物または塩上に置かれ、塩または炭水化物上で封入され（噴霧乾燥）、またはカリウム塩と共に結晶化され、「トッピング」塩が生成される。10

#### 【0200】

いくつかの実施形態では、苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はK C 1である。他の実施形態では、苦味物質は乳酸カリウムである。

#### 【0201】

いくつかの実施形態では、食品はさらにナトリウム塩を含む。いくつかの実施形態では、食品はさらにN a C 1を含む。他の実施形態では、食品はさらに乳酸ナトリウムを含む。さらなる実施形態では、食品はさらに糖を含む。20

#### 【0202】

いくつかの実施形態では、食品を調製する方法は、さらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

#### 【0203】

##### 医薬組成物を調製する方法

別の態様によれば、本発明は可食組成物を調製する方法を提供し、ここで、可食組成物は医薬組成物である。方法は下記を含む：（a）医薬活性成分を提供すること；ならびに（b）（a）の医薬活性成分に、本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを、医薬活性成分と共に添加すること。いくつかの実施形態では、発明の化合物は、発明の化合物を含む可食組成物の形態で添加される。30

#### 【0204】

いくつかの実施形態では、（a）における医薬活性成分は本質的に苦い。そのような実施形態では、医薬活性成分は本質的に苦味物質を含み得る。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、本質的な苦味物質はカリウム塩である。

#### 【0205】

いくつかの実施形態では、医薬組成物を調製する方法はさらに下記を含む：（c）苦味物質を添加すること。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、カリウム塩はK C 1または乳酸カリウムである。特定の実施形態では、カリウム塩はK C 1である。いくつかの実施形態では、苦味物質は本発明の化合物の前に添加される。他の実施形態では、苦味物質は本発明の化合物の後に添加される。いくつかの実施形態では、苦味物質は発明の化合物と共に添加される。いくつかの実施形態では、本発明の化合物は、苦味物質と組み合わされ、その後、医薬活性成分と組み合わされる。他の実施形態では、本発明の化合物は医薬活性成分、その後苦味物質と連続して組み合わされる。さらに他の実施形態では、本発明の化合物は苦味物質および医薬活性成分の混合物と組み合わされる。40

**【0206】**

いくつかの実施形態では、化合物および苦味物質（存在すれば）は、医薬活性成分と混合される。他の実施形態では、化合物および苦味物質（存在すれば）は、医薬組成物上に噴霧され、またはこれをコートする。いくつかの実施形態では、発明の化合物は医薬活性成分と共に封入される。いくつかの実施形態では、発明の化合物は、放出速度が苦味物質（いくつかの実施形態では、医薬活性成分である）の放出速度に対して制御されるような形態とされる。

**【0207】**

いくつかの実施形態では、苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。10 いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はKClである。他の実施形態では、苦味物質は乳酸カリウムである。

**【0208】**

いくつかの実施形態では、医薬組成物は、さらにナトリウム塩を含む。いくつかの実施形態では、医薬組成物は、さらにNaClを含む。他の実施形態では、医薬組成物は、さらに乳酸ナトリウムを含む。さらなる実施形態では、医薬組成物は、さらに糖を含む。

**【0209】**

いくつかの実施形態では、医薬組成物はさらに薬学的に許容される担体を含む。これらの組成物において使用され得る薬学的に許容される担体としては、下記が挙げられるが、それらに限定されない：イオン交換体、アルミナ、ステアリン酸アルミニウム、レシチン、血清タンパク質、例えばヒト血清アルブミン、緩衝物質、例えばリン酸塩、グリシン、ソルビン酸、ソルビン酸カリウム、飽和野菜脂肪酸の部分グリセリド混合物、水、塩または電解質、例えば硫酸プロタミン、リン酸水素二ナトリウム、リン酸水素カリウム、塩化ナトリウム、亜鉛塩、コロイドシリカ、三ケイ酸マグネシウム、ポリビニルピロリドン、セルロース系物質、ポリエチレングリコール、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ポリアクリレート、ワックス、ポリエチレン-ポリオキシプロピレン-ブロックポリマ、ポリエチレングリコールおよび羊毛脂。

**【0210】**

いくつかの実施形態では、医薬組成物を調製する方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

**【0211】****被験体において苦味の知覚を低減または排除する方法**

別の態様によれば、本発明は被験体において苦味の知覚を低減または排除する方法を提供する。方法は、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む可食組成物の使用を含む。

**【0212】**

方法は、任意の可食組成物、例えば食材、食品、医薬組成物または消費者製品において苦味を低減または排除するために使用することができる。可食組成物は任意の形態であってもよい。いくつかの実施形態では、組成物は、例えば、ガム、ロゼンジ、ソース、香辛料、肉マトリクス、肉スラリー、ペースト、懸濁液、スプレッド、コーティング、液体、ゲル、エマルジョン、顆粒、または調味料の形態である。

**【0213】**

いくつかの実施形態では、可食組成物は、例えば、口腔内に置くこと、または摂取により利用される。いくつかの実施形態では、可食組成物は、苦い食材、食品、医薬組成物または消費者製品の前に、口腔内に置かれ、または摂取される。いくつかの実施形態では、可食組成物は、苦い食材、食品、医薬組成物または消費者製品と同時に、別々の可食組成物として、または苦い食材、食品、医薬組成物または消費者製品中への組み入れにより、口腔内に置かれ、または摂取される。いくつかの実施形態では、可食組成物は、苦い食材

10

20

30

40

50

、食品、医薬組成物または消費者製品の後で、口腔内に置かれ、または摂取される。例えば、発明の化合物は食材または食品と組み合わせ、食品の苦味を低減させることができる。また、発明の化合物は、例えば、苦い食材、食品、医薬組成物または消費者製品への曝露後に使用するためのロゼンジまたはガム中で使用することができる（例えば、苦味後味を低減または排除するため）。

#### 【0214】

可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法

別の実施形態によれば、本発明は可食組成物、例えば食品、医薬組成物または消費者製品中のナトリウムの量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、本発明は、可食組成物、例えば食品、医薬組成物または消費者製品中のナトリウム含有化合物の量を低減させる方法を提供する。別の実施形態では、本発明は、可食組成物、例えば食品、医薬組成物または消費者製品中のNaClの量を低減させる方法を提供する。別の実施形態では、本発明は、可食組成物、例えば食品、医薬組成物または消費者製品中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、ナトリウム塩は、非ナトリウム塩と置換される。いくつかの実施形態では、非ナトリウム塩はカルシウム塩、マグネシウム塩、またはカリウム塩である。いくつかの実施形態では、非ナトリウム塩はカリウム塩である。

#### 【0215】

いくつかの実施形態では、方法は下記を含む：(a) 可食組成物の調製において使用されるある量のナトリウム塩をある量のカリウム塩と置換すること；ならびに(b) 可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。いくつかの実施形態では、発明の化合物は、発明の化合物を含む可食組成物の形態で添加される。

#### 【0216】

いくつかの実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法は、下記工程を含む：(a) ある量のナトリウム塩が、ある量のカリウム塩と置換されている第1の可食組成物を摂取する工程；ならびに(b) 発明の化合物を含む、第2の可食化合物を摂取する工程。いくつかの実施形態では、第1の可食組成物は、第2の可食組成物の前に摂取される。いくつかの実施形態では、第1の可食組成物は、第2の可食組成物の後に摂取される。いくつかの実施形態では、第1の可食組成物は、第2の可食組成物と同時に摂取される。

#### 【0217】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

#### 【0218】

いくつかの実施形態では、カリウム塩は、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加前に添加される。いくつかの実施形態では、カリウム塩は、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加後に添加される。いくつかの実施形態では、カリウム塩は、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加と同時に添加される。

#### 【0219】

いくつかの実施形態では、工程(a)において可食組成物中の置換されるナトリウムの量は、被験体の健康を維持または回復させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の置換されるナトリウムの量は、被験体において高血圧を減少させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中のカリウムにより置換されるナトリウムの量は、可食組成物のテクスチャまたは凝固点を変化させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、置換されるナトリウムの量は、1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までである。これらの量は制限することを意味せず、列挙され

10

20

30

40

50

たパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。

【0220】

いくつかの実施形態では、工程( b )において添加される化合物の量は、被験体において苦味の知覚を低減させる。苦味は完全に低減され、または部分的に低減される。いくつかの実施形態では、塩味の知覚は維持される。

【0221】

いくつかの実施形態では、工程( b )において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するナトリウム量の 1 %、2 %、3 %、4 %、5 %、6 %、7 %、8 %、9 %、10 %、15 %、20 %、25 %、30 %、35 %、40 %、45 %、50 %、55 %、60 %、65 %、70 %、75 %、80 %、85 %、90 %、95 %または100 %までの、カリウムによる置換を可能にするのに十分である。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。10 いくつかの実施形態では、工程( b )において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するナトリウムの量の 25 %までの、カリウムによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程( b )において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するナトリウムの量の 50 %までの、カリウムによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程( b )において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するナトリウムの量の 75 %までの、カリウムによる置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、工程( b )において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するナトリウムの量の 100 %までの、カリウムによる置換を可能にするのに十分である。20

【0222】

いくつかの実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される 1 つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

【0223】

いくつかの実施形態では、方法は下記を含む：( a )可食組成物の調製において使用されるある量の NaCl をある量の KC1 と置換すること；ならびに( b )可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式( I )、式( II )、式( III )、または式( IV )の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物 1 - 8 のいずれか 1 つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。30

【0224】

いくつかの実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法は、下記の工程を含む：( a )ある量の NaCl がある量の KC1 と置換されている第 1 の可食組成物を摂取すること；ならびに( b )発明の化合物を含む、第 2 の可食化合物を摂取すること。いくつかの実施形態では、第 1 の可食組成物は、第 2 の可食組成物の前に摂取される。いくつかの実施形態では、第 1 の可食組成物は、第 2 の可食組成物の後に摂取される。いくつかの実施形態では、第 1 の可食組成物は、第 2 の可食組成物と同時に摂取される。

【0225】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。40

【0226】

いくつかの実施形態では、KC1 は、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加前に添加される。いくつかの実施形態では、KC1 は、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加後に添加される。いくつかの実施形態では、KC1 は、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加と同時に添加される。

【0227】

いくつかの実施形態では、工程( a )において、可食組成物中の、KC1 により置換される NaCl の量は、被験体の健康を維持または回復させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、KC1 により置換される NaCl の量は、被験体に50

おいて高血圧を減少させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、KC1により置換されるNaClの量は、可食組成物のテクスチャまたは凝固点を変化させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、KC1により置換されるNaClの量は、1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までである。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。

#### 【0228】

いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は被験体において苦味の知覚を低減させる。苦味は完全に低減され、または部分的に低減される。いくつかの実施形態では、塩味の知覚は維持される。

#### 【0229】

いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するNaClの量の1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までの、KC1による置換を可能にするのに十分である。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は可食組成物中に存在するNaClの量の25%までの、KC1による置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するNaClの量の50%までの、KC1による置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するNaClの量の75%までの、KC1による置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在するNaClの量の100%までの、KC1による置換を可能にするのに十分である。

#### 【0230】

いくつかの実施形態では、可食組成物または食品中のNaClの量を低減させる方法は塩味を維持することを含む。

#### 【0231】

いくつかの実施形態では、可食組成物中のNaClの量を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤(本質的な香味を欠いていてもよい)からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

#### 【0232】

他の実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法は下記を含む：(a)可食組成物中に存在するある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること；ならびに(b)可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

#### 【0233】

いくつかの実施形態では、可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法は、下記の工程を含む：(a)ある量の乳酸ナトリウムがある量の乳酸カリウムと置換されている第1の可食組成物を摂取すること；ならびに(b)発明の化合物を含む、第2の可食化合物を摂取すること。いくつかの実施形態では、第1の可食組成物は、第2の可食組成物の前に摂取される。いくつかの実施形態では、第1の可食組成物は、第2の可食組成物の後に摂取される。いくつかの実施形態では、第1の可食組成物は、第2の可食組成物と同時に摂取される。

#### 【0234】

10

20

30

40

50

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

#### 【0235】

いくつかの実施形態では、乳酸カリウムは可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加前に添加される。いくつかの実施形態では、乳酸カリウムは可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加後に添加される。いくつかの実施形態では、乳酸カリウムは、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加と同時に添加される。

#### 【0236】

いくつかの実施形態では、工程(a)において、可食組成物中の、乳酸カリウムにより置換される乳酸ナトリウムの量は、被験体の健康を維持または回復させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、乳酸カリウムにより置換される乳酸ナトリウムの量は、被験体において高血圧を減少させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、乳酸カリウムにより置換される乳酸ナトリウムの量は、可食組成物のテクスチャまたは凝固点を変化させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、乳酸カリウムにより置換される乳酸ナトリウムの量は、1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までである。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。

#### 【0237】

いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は被験体において苦味の知覚を低減させる。苦味は完全に低減され、または部分的に低減される。いくつかの実施形態では、塩味の知覚は維持される。

#### 【0238】

いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの量の1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までの、乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの量の25%までの、乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの量の50%までの、乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの量の75%までの、乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する乳酸ナトリウムの量の100%までの、乳酸カリウムによる置換を可能にするのに十分である。

#### 【0239】

いくつかの実施形態では、可食組成物または食品中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法は、食品の保存を維持することを含む。

#### 【0240】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤(本質的な香味を欠いていてもよい)からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

#### 【0241】

可食組成物または食品中の糖の量を低減させる方法

別の実施形態によれば、本発明は可食組成物中の糖の量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、方法は下記を含む：(a)可食組成物の調製において使用され

10

20

30

40

50

るある量の糖をある量のアセスルファムKと置換すること；ならびに( b )可食組成物中に、有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み入れること。

#### 【0242】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

#### 【0243】

いくつかの実施形態では、アセスルファムKは可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加前に添加される。いくつかの実施形態では、アセスルファムKは、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加後に添加される。いくつかの実施形態では、アセスルファムKは、可食組成物に、有効量の発明の化合物の添加と同時に添加される。10

#### 【0244】

いくつかの実施形態では、(a)において可食組成物中の置換される糖の量は、被験体の健康を維持または回復させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の置換される糖の量は、被験体において体重減少が得られるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、アセスルファムKにより置換される糖の量は、被験体の糖消費または過度の体重と関連する疾患(例えば、糖尿病)の効果を軽減し、またはこれを治療するのに十分な量である。いくつかの実施形態では、アセスルファムKにより置換される糖の量は、1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までである。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。20

#### 【0245】

いくつかの実施形態では、(b)において添加される化合物の量は、被験体において苦味の知覚を低減させる。苦味は完全に低減され、または部分的に低減される。いくつかの実施形態では、甘味の知覚は維持される。

#### 【0246】

いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の量の1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までの、アセスルファムKによる置換を可能にするのに十分である。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の量の25%までの、アセスルファムKによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の量の50%までの、アセスルファムKによる置換を可能にするのに十分である。他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の量の75%までの、アセスルファムKによる置換を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、工程(b)において添加される化合物の量は、可食組成物中に存在する糖の量の100%までの、アセスルファムKによる置換を可能にするのに十分である。3040

#### 【0247】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の糖の量を低減させる方法は、甘味を維持することを含む。

#### 【0248】

いくつかの実施形態では、可食組成物または食品中の糖の量を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤(本質的な香味を欠いていてもよい)か50

らなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

#### 【0249】

##### 被験体のナトリウム摂取を低減させる方法

別の実施形態によれば、本発明は被験体のナトリウム摂取を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、方法は被験体に本発明の可食組成物を提供する工程を含み、ここで、可食組成物中のナトリウム塩の全てまたは一部は1つ以上の非ナトリウム塩と置換され、可食組成物は本発明の化合物を含む。いくつかの実施形態では、非ナトリウム塩はカルシウム塩、マグネシウム塩、またはカリウム塩である。いくつかの実施形態では、非ナトリウム塩はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。いくつかの実施形態では、ナトリウム塩はNaClであり、カリウム塩はKClである。いくつかの実施形態では、ナトリウム塩は乳酸ナトリウムであり、カリウム塩は乳酸カリウムである。10

#### 【0250】

いくつかの実施形態では、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法はさらに、治療が必要な被験体を同定する工程を含む。熟練者であれば、ナトリウム摂取を低減する必要がある被験体を同定することができるであろう。そのような被験体の非限定的な例としては、任意の1つ以上の下記障害を患う被験体が挙げられる：高ナトリウム血症、高血圧、心血管疾患、浮腫、脳浮腫による発作、脱水（発汗過多、下痢、尿路障害または利尿薬による）、尿崩症、Conn症候群、およびCushing症候群。20

#### 【0251】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の、カリウム塩により置換されるナトリウム塩の量は被験体の健康を維持または回復させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、カリウム塩により置換されるナトリウム塩の量は、被験体において高血圧を減少させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、カリウム塩により置換されるナトリウム塩の量は、1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までである。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、被験体の1日のナトリウム摂取は、望ましい場合2500mg/日未満、2000mg/日未満、1500mg/日未満、1000mg/日未満、または500mg/日未満である。30

#### 【0252】

いくつかの実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までだけの、被験体のナトリウム摂取の低減を可能にするのに十分である。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、25%までだけの、被験体のナトリウム摂取の低減を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、50%までだけの、被験体のナトリウム摂取の低減を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、75%までだけの、被験体のナトリウム摂取の低減を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、100%までだけの、被験体のナトリウム摂取の低減を可能にするのに十分である。40

#### 【0253】

いくつかの実施形態では、被験体のナトリウム摂取を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群50

より選択される 1 つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

【 0 2 5 4 】

被験体の糖摂取を低減させる方法

別の実施形態によれば、本発明は、被験体の糖摂取を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、方法は被験体に本発明の可食組成物を提供する工程を含み、ここで、可食組成物中の糖の全てまたは一部は、アセスルファム K と置換され、可食組成物は本発明の化合物を含む。いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

【 0 2 5 5 】

10

いくつかの実施形態では、被験体の糖摂取を低減させる方法はさらに、治療が必要な被験体を同定する工程を含む。熟練者は糖摂取を低減する必要がある被験体を同定することができるであろう。そのような被験体の非限定的な例としては、任意の 1 つ以上の下記障害を患う被験体が挙げられる：糖尿病、糖尿病前症、インスリン抵抗性、肥満、過度の体重、および高血糖症。

【 0 2 5 6 】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の、アセスルファム K により置換される糖の量は被験体の健康を維持または回復させるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、アセスルファム K により置換される糖の量は、被験体において体重減少が得られるのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、アセスルファム K により置換される糖の量は、被験体の糖消費または過度の体重と関連する疾患（例えば、糖尿病）の効果を軽減し、またはこれを治療するのに十分な量である。いくつかの実施形態では、可食組成物中の、アセスルファム K により置換される糖の量は、1 %、2 %、3 %、4 %、5 %、6 %、7 %、8 %、9 %、10 %、15 %、20 %、25 %、30 %、35 %、40 %、45 %、50 %、55 %、60 %、65 %、70 % 75 %、80 %、85 %、90 %、95 %または100 %までである。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、被験体の 1 日の糖摂取は 250 g / 日未満、200 g / 日未満、175 g / 日未満、150 g / 日未満、125 g / 日未満、100 g / 日未満、75 g / 日未満、50 g / 日未満または 25 g / 日未満である。

20

【 0 2 5 7 】

30

いくつかの実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、1 %、2 %、3 %、4 %、5 %、6 %、7 %、8 %、9 %、10 %、15 %、20 %、25 %、30 %、35 %、40 %、45 %、50 %、55 %、60 %、65 %、70 % 75 %、80 %、85 %、90 %、95 %または100 %までだけの、被験体の糖摂取の低減を可能にするのに十分である。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、25 %までだけの、被験体の糖摂取の低減を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、50 %までだけの、被験体の糖摂取の低減を可能にするのに十分である。他の実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、75 %までだけの、被験体の糖摂取の低減を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、可食組成物に添加される発明の化合物の量は、100 %までだけの、被験体の糖摂取の低減を可能にするのに十分である。

40

【 0 2 5 8 】

いくつかの実施形態では、被験体の糖摂取を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される 1 つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

【 0 2 5 9 】

可食組成物の苦味を低減させる方法

50

別の実施形態によれば、本発明は可食組成物において苦味を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

#### 【0260】

1つの実施形態では、方法は下記を含む：(a) 有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを、可食組成物に添加し、よって、苦味を低減させること。

#### 【0261】

別の実施形態では、方法は下記を含む：(a) 有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを、可食組成物前、これと一緒に、またはその後に摂取し、よって、苦味を低減させること。

10

#### 【0262】

いくつかの実施形態では、苦味物質は苦味のする塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩、マグネシウム塩、またはカルシウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、苦味物質はKClである。他の実施形態では、苦味物質は乳酸カリウムである。いくつかの実施形態では、苦味物質は、可食組成物、例えば本質的に苦い食材において本質的である。

20

#### 【0263】

いくつかの実施形態では、苦味は1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までだけ低減される。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、苦味は25%までだけ低減される。他の実施形態では、苦味は50%までだけ低減される。他の実施形態では、苦味は75%までだけ低減される。他の実施形態では、苦味は100%までだけ低減される。

#### 【0264】

30

いくつかの実施形態では、可食組成物中の苦味物質に起因する苦味を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠く）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

#### 【0265】

##### 可食組成物を保存する方法

別の実施形態によれば、本発明は下記を含む、可食組成物を保存する方法を提供する：

(a) 可食組成物を提供すること；ならびに

(b) (a)の可食組成物と共に、保存剤および有効量の、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物、またはそれらの組み合わせを組み合わせること。

40

#### 【0266】

別の実施形態では、可食組成物を保存する方法は下記を含む：

(a) 可食組成物を提供すること；ならびに

(b) (a)の可食組成物と共に、保存剤および有効量の、本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを組み合わせること。

#### 【0267】

本発明によれば、保存剤は任意の苦味のする保存剤とすることができます。いくつかの実施形態では、(a)における保存剤はカリウム塩である。いくつかの実施形態では、(a)における保存剤は乳酸カリウムである。

#### 【0268】

50

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

#### 【0269】

いくつかの実施形態では、可食組成物を保存する方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。

#### 【0270】

可食組成物を保存する間の可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法

別の実施形態によれば、本発明は、可食組成物を保存する間の可食組成物中のナトリウムの量を低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、方法は下記を含む：可食組成物の調製において使用される、ある量のナトリウム含有保存剤をある量のカリウム含有保存剤と置換すること、ならびに有効量の、本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを添加すること。

10

#### 【0271】

いくつかの実施形態では、方法は下記を含む：可食組成物の調製において使用される、ある量の乳酸ナトリウムをある量の乳酸カリウムと置換すること、ならびに有効量の、本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）の化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを添加すること。

20

#### 【0272】

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

#### 【0273】

いくつかの実施形態では、化合物の有効量は、1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、15%、20%、25%、30%、35%、40%、45%、50%、55%、60%、65%、70%、75%、80%、85%、90%、95%または100%までだけの、可食組成物の調製において典型的に使用される乳酸ナトリウムの量の低減を可能にするのに十分である。これらの量は制限することを意味せず、列挙されたパーセンテージの間のインクリメントは発明の部分として特定的に想定される。いくつかの実施形態では、化合物の有効量は、25%までだけの、可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の低減を可能にするのに十分である。他の実施形態では、化合物の有効量は、50%までだけの、可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の低減を可能にするのに十分である。他の実施形態では、化合物の有効量は、75%までだけの、可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の低減を可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、化合物の有効量は、100%までだけの、可食組成物中に典型的に存在する乳酸ナトリウムの量の低減を可能にするのに十分である。

30

#### 【0274】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の苦味物質に起因する苦味を低減させる方法はさらに、保存剤、栄養食品、香味材料または香味改良剤（本質的な香味を欠いていてもよい）からなる群より選択される1つ以上の追加の構成成分を添加することを含む。いくつかの実施形態では、食品を保存する間の可食組成物中の乳酸ナトリウムの量を低減させる方法はさらに、1つ以上の追加の香味改良剤を添加することを含む。

40

#### 【0275】

苦味受容体を阻害する方法

別の実施形態によれば、本発明は苦味受容体の活性化および/またはシグナル伝達を阻害または低減させる方法を提供する。いくつかの実施形態では、方法は、苦味受容体を、本明細書で記載される式（I）、式（II）、式（III）、または式（IV）による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれ

50

か1つ、またはそれらの組み合わせと接触させることを含む。

**【0276】**

いくつかの実施形態では、方法は苦味受容体を、本明細書で記載される式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)による化合物、またはそれらの組み合わせ、あるいは本明細書で記載される化合物1-8のいずれか1つ、またはそれらの組み合わせを含む可食組成物と接触させることを含む。

**【0277】**

いくつかの実施形態では、可食組成物は食品である。いくつかの実施形態では、可食組成物は医薬組成物である。いくつかの実施形態では、可食組成物は消費者製品である。

**【0278】**

いくつかの実施形態では、苦味受容体は、例えば、アッセイにおいて存在するエクスピボ受容体である。いくつかの実施形態では、苦味受容体は、例えば、アッセイにおいて存在するインビトロ受容体である。他の実施形態では、苦味受容体は被験体において存在するインビボ受容体である。いくつかの実施形態では、苦味受容体は、被験体の口腔または胃腸管内に存在する。いくつかの実施形態では、苦味受容体は、ヒトの口腔内に存在する。いくつかの実施形態では、苦味受容体は非ヒト動物の口腔内に存在する。いくつかの実施形態では、苦味受容体は動物モデルの口腔内に存在する。

**【0279】**

いくつかの実施形態では、苦味受容体の阻害は生理的プロセスまたは状態に影響するであろう。苦味受容体の阻害により影響される生理的プロセスおよび状態の非限定的な例としては、苦味、高血圧、恶心、嘔吐、胃腸管への効果、食欲、栄養、栄養分吸収、満腹、空腹、糖尿病、肥満、血糖値、血糖制御、代謝、食事、および摂食障害が挙げられる。

**【0280】**

発明の化合物の調製

いくつかの実施形態では、式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物の1つ以上は、例えば商業的供給源、例として米国ミズーリ州セントルイスのSigma-Aldrich(登録商標)；TCI America、米国オレゴン州ポートランド；ならびにAcross Organics、ベルギーのヘール；などから市販される。

**【0281】**

他の実施形態では、式(I)、式(II)、式(III)、または式(IV)の化合物の1つ以上は市販の試薬から有機合成化学においてルーチン的な方法により調製される。

**【0282】**

式(I)の化合物

1つの実施形態では、1つ以上の式(I)の化合物は以下に記載される多段階シーケンスにより調製される。当業者であれば、式(I)の化合物のいずれの合成のための、記載される条件も容易に適合させることができるであろう。

**【0283】**

フィトールの合成は、アルケンA1のメチルアルミニ化(A1Me<sub>3</sub>)から開始し、続いて、I<sub>2</sub>に曝露させ、ヨードアルケンA2を生成させて、達成することができる。A2はその後、3-ブテニルマグネシウムプロミドとカップリングされ、アルケンA3が得られる。そのようなカップリングは、銅触媒例えば、例えは、Li<sub>2</sub>CuCl<sub>4</sub>を用いて達成され得る。A3は、A1からA2への変換において使用されるものと同様の条件、すなわち、メチルアルミニ化、続いて、I<sub>2</sub>への曝露を用いてA4に変換され得る。A4は、4-トリメチルシリル-3-ブチニルマグネシウムプロミドとクロスカップリングさせ、続いて、脱シリルすることができ、A5が得られる。そのようなクロスカップリングは、銅触媒、例えは、例として、Li<sub>2</sub>CuCl<sub>4</sub>を用いて達成され得る。そのような脱シリル反応は、例えは、メタノールKOHを用いて達成され得る。A5はその後、フィトールに、メチルアルミニ化、n-BuLiとの錯体生成、および(CH<sub>2</sub>O)<sub>n</sub>による処理を介して変換され得る(スキームI)：

10

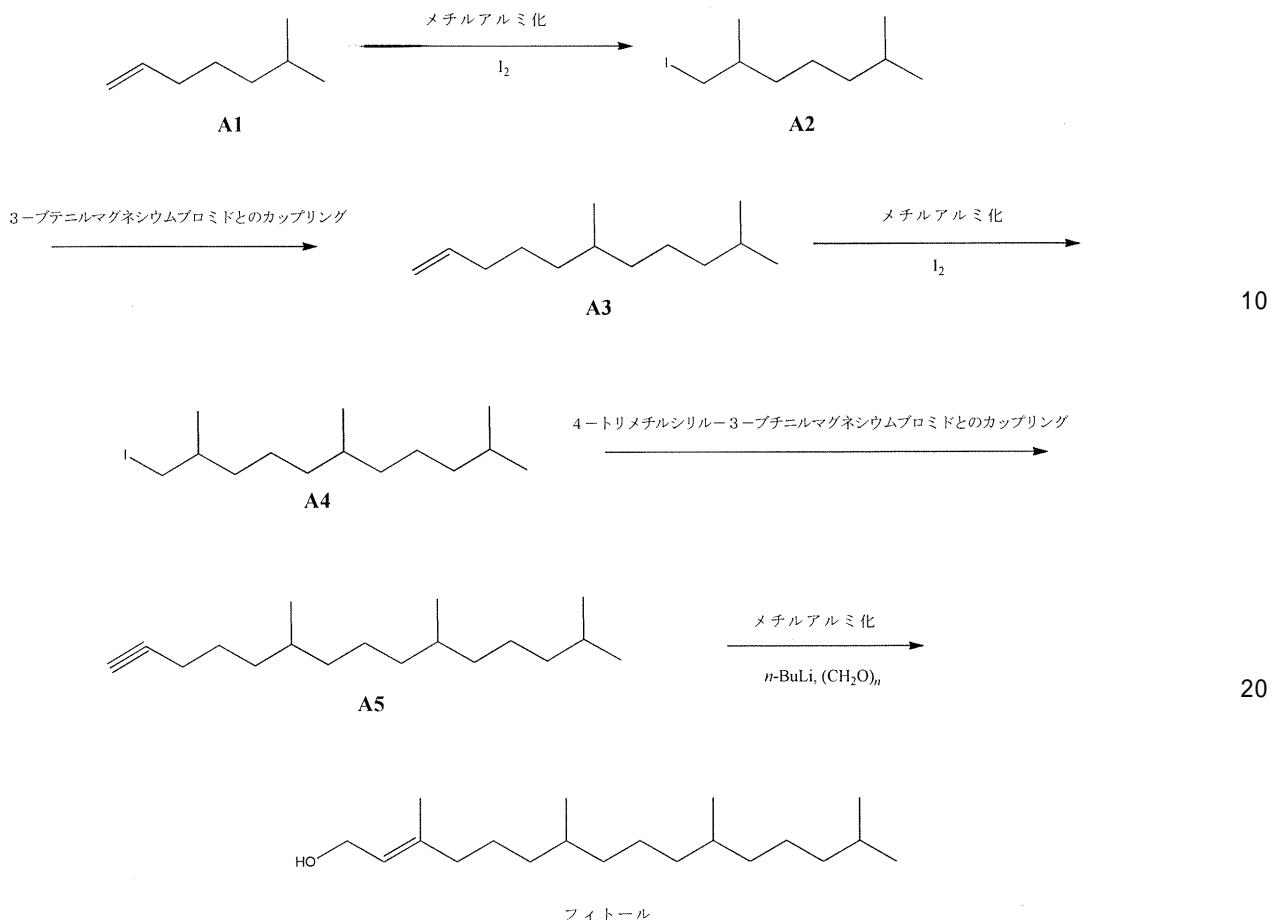
20

30

40

50

## 【化17】



スキーム I

## 【0284】

30

フィトールおよびフィトール様化合物のエナンチオ選択的合成は、例えば、Shouquan Huo et al., *Organic Letters*, 3(21):3253-3256 (2001) (本明細書に参照により組み込まれる)において記載される。

## 【0285】

式(I1)の化合物

式(I1)の化合物は一般に当業者に知られている方法により調製され得る。下記スキームI1は、式(I1)の化合物の合成経路を説明する。通常の技能を有する有機化学者に容易に明らかである他の等価のスキームはまた、下記一般スキームにより説明される分子の様々な部分を合成するために使用され得る。

## 【0286】

40

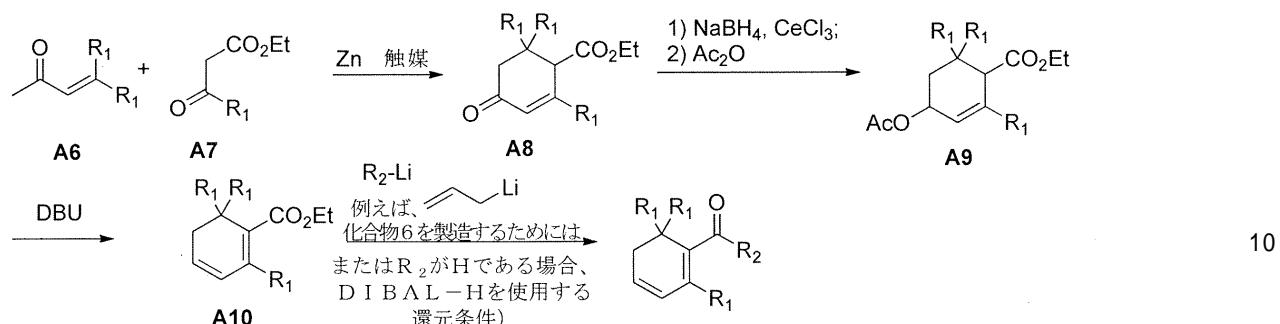
式(I1)の化合物の合成は、Zn触媒、例えば塩化亜鉛により触媒されるA6およびA7の縮合によりA8を生成させることから開始して達成することができる。A8はNaBH<sub>4</sub>/CeCl<sub>3</sub>に媒介される還元、続いて、Ac<sub>2</sub>Oの処理を介してA9に変換され得る。A9からA10への変換は、A9の1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)による処理により達成され得る。A10はリチウム試薬、R<sub>2</sub>-Liにより処理することができ、式(I1)の化合物が生成され、ここで、R<sub>2</sub>はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基である。また、A10はジイソブチルアルミニウムヒドリド(DIBAL-H)により処理することができ、式(I1)の化合物が生成され、ここでR<sub>2</sub>はHである。

## 【0287】

50

1つの実施形態では、1つ以上の式(II)の化合物は、スキームIIに従い調製することができる。

【化18】



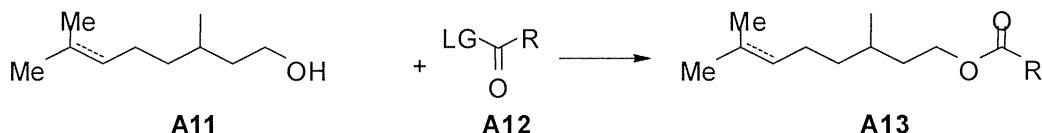
スキームII

【0288】

式(III)の化合物

1つの実施形態では、1つ以上の式(III)の化合物はアルコールA11の、脱離基LGを有するアシル化合物A12を用いたアシル化により調製され、A13が得られる(スキームIII)：

【化19】



スキームIII

【0289】

好適な脱離基としては、アシル化反応のために当技術分野において認識されるもの、例えばハロゲン化物(例えば、クロロ、プロモ、ヨード)、アリールオキシ、活性化エステルと結合された脱離基(例えば、N-スクシンアミドまたはジシクロヘキシカルボジイミドと結合されたもの)、などが挙げられる。ある一定の実施形態では、アシル化合物A7は酸無水物であり；すなわち、LGは-O-C(O)Rである。いくつかの実施形態では、アシル化条件はまた、無機または有機塩基を使用する。好適な塩基はそのような反応のために当技術分野で認識されるものを含み、アルカリおよびアルカリ土類金属炭酸塩(例えばNa<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、CaCO<sub>3</sub>、など)および重炭酸塩(例えばNaHCO<sub>3</sub>、KHCO<sub>3</sub>、など)が挙げられるが、それらに限定されない。他の好適な塩基としては、アミン塩基、例えばアンモニア、水酸化アンモニウム、トリエチルアミン、ピリジン、ピペリジン、ピロリジン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロウンデク-7-エン(DBU)、4-(ジメチルアミノ)-ピリジン、などが挙げられる。

【0290】

1つの特定の実施形態では、A12は酸ハロゲン化物、例えば酸塩化物または臭化物であり、アシル化反応は、アミン塩基、例えばトリエチルアミン、ピリジン、ピペリジン、ピロリジン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロウンデク-7-エン(DBU)、4-(ジメチルアミノ)-ピリジン、などの存在下で進行する。

【0291】

別の実施形態では、A12は活性化エステルであり、アシル化は、強酸の生成とはならない穏やかな条件下で進行する。

20

40

50

## 【0292】

A12は対応するカルボン酸から、当技術分野で知られているルーチン的方法を使用して調製することができる。

## 【0293】

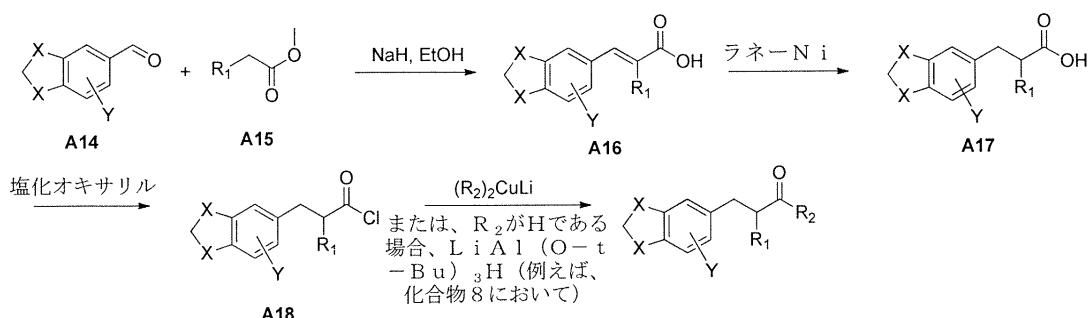
式(IV)の化合物

式(IV)の化合物は、一般に当業者に知られている方法により調製され得る。下記スキームIVは、式(IV)の化合物の合成経路を説明する。通常の技能を有する有機化学者に容易に明らかである他の等価のスキームはまた、下記一般スキームにより説明される分子の様々な部分を合成するために使用され得る

## 【0294】

合成は、A15のNaHによる処理から開始し、続いて、無水EtOHおよびA14の添加により、A16を生成させて達成することができる。A16はラネー-ニにより触媒される還元を介してA17に変換され得る。A17はその後、塩化オキサリルにより処理することができ、塩化アシルA18が生成される。A18はリチウムカブレート試薬、( $R_2$ )<sub>2</sub>CuLiで処理することができ、式IVの化合物が生成され、ここで、 $R_2$ はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基である。また、A18はLiAl(O-t-Bu)<sub>3</sub>Hで処理することができ、式IVの化合物が生成され、ここで $R_2$ はHである(スキームIV)：

## 【化20】



スキームIV

## 【0295】

## 実施例

この発明をさらに十分理解してもらうために、下記実施例が明記される。これらの実施例は、説明のためだけのものにすぎず、いかなる点においても、発明の範囲を限定するものとして解釈されるべきではない。

## 【0296】

下記実施例において使用された試験化合物は、合成および天然化合物のための商業ベンダー、例えばVitam、ChemDiv、ChemBridge、Chromadex、Sigma-Aldrich、Penta、Spectrum Chemical、Vigon、およびIndofineから入手され得る。

## 【0297】

下記実施例で使用された味覚試験パネリストは、彼等の塩化カリウムと関連する苦味を知覚する能力に基づきスクリーニングされ、選択された。苦味を知覚することができるパネリストのみが下記味覚試験に参加した。

## 【0298】

被験体における味覚の知覚の複雑な性質および下記実験の本質的に主観的な性質のために、個々の味覚試験の試みより、ある化合物に対し、異なる結果が得られる可能性がある。下記実施例で提示されるデータは、観察された味覚試験結果を説明する。

## 【0299】

下記味覚試験実験は、様々なサイズのパネル(すなわち様々な数のパネリストを含むパ

10

20

30

40

50

ネル)を用いて実施した。

【0300】

実施例1 ラテン方格二肢強制選択法(ラテン方格-2AFC)を使用した、試験化合物の、ヒトにおけるKC1固体-マトリクス食材の苦味の知覚に対する効果

試験化合物の、ヒトにおける固体-マトリクス食材中のKC1の苦味の知覚に対する効果を、下記の通り、「咀嚼と吐き出し(chew and spit)」試験を使用し、ラテン方格-2AFC試験方法を使用して、評価した。

【0301】

水中にPrague粉末、糖、Evian(商標)水、KC1および/またはNaClを含む2つの型のマリネードを調製した。1つのマリネードは80%KC1:20%NaCl(重量)を含んだ(すなわち、最終食品で約1.6%のKC1濃度を与えるためには約10.9%KC1のマリネード濃度)。第2のマリネードは60%KC1:40%NaCl(重量)を含んだ(すなわち、最終食品で約1.2%のKC1濃度を与えるためには約8.2%KC1のマリネード濃度)。化合物保存溶液を、ある量の試験化合物をエタノールまたは水に溶解し(化合物の溶解度による)、5mg/mLの保存化合物溶液を生成させることにより調製した。十分なエタノールを各保存化合物溶液に添加し、1%エタノールを含む最終保存化合物溶液を生成させた。マリネード、保存化合物溶液およびシチメンチョウ挽肉を混合ボウルに添加し、低速で約2分間混合し、その後、高速で約5分間混合した。マリネしたシチメンチョウ混合物を1ポンドのアリコートに分割し、食品セーバーバッグに真空包装し、約2時間冷蔵庫内でマリネさせた。真空包装したシチメンチョウをその後、約8.6水浴中で約30分間調理した。約30分後、内部シチメンチョウ温度が約170°Fに到達していなかった場合、真空包装したシチメンチョウは、さらに約5分間調理した。真空包装したシチメンチョウをその後、味覚試験前約2週間冷蔵した。KC1標準を、KC1をマリネードに、シチメンチョウ調製中にいずれの試験化合物も添加せずに溶解することにより、同様に調製した。NaCl標準を、NaClをマリネードに、シチメンチョウ調製中にいずれの試験化合物も添加せずに溶解することにより、同様に調製した。(NaCl標準はKC1を含まなかった)。

【0302】

パネリストは、咀嚼して吐き出すことにより部分を味見した。試料の順のあらゆる影響を排除するために、完全ラテン方格設計を利用し、よって、各可能な試料提示順を被験体全体で使用した。各試料を、いくつかの別個の味覚試験実験で試験した。パネリストは、Poland Spring(商標)水ですすぎ、クラッカーを食べ、試料間で約10分待つように求められた。その都度、パネリストは、苦味がより少ない試料を選択するよう求められた。例示的な結果を表1に示す。

10

20

30

【表1】

表1. KC1ラテン方格 - 2 AFC味覚 固体シチメンチョウ

化合物番号	マリネード中のKC1濃度(固体シチメンチョウ中のKC1濃度)	ppmで表される試験した化合物の濃度(苦味の減少を識別したパネリストの数/試験したパネリストの数)	少なくとも50%のパネリストが苦味の減少を識別した濃度(ppm)	少なくとも50%のパネリストが苦味の減少を識別し、p≤0.1である濃度(ppm)
5	10.9% (1.6%)	0.1 (36/69) 1 (35/69) 10 (48/69) 20 (32/69)	0.1 1 10	10
6	10.9% (1.6%)	0.1 (33/69) 1 (42/69) 10 (34/69) 20 (36/69)	1 20	1
7	10.9% (1.6%)	0.1 (32/63) 1 (40/63) 10 (28/63) 20 (24/63)	0.1 1	1
8	10.9% (1.6%)	0.1 (46/78) 1 (37/78) 10 (47/78) 20 (42/78)	10 20	10
標準	10.9% (1.6%)	--	--	--

## 【0303】

実施例2 ラテン方格二肢強制選択法(ラテン方格 - 2 AFC)を使用した、試験化合物の、ヒトにおけるKC1食品の苦味の知覚に対する効果

試験化合物の、ヒトにおける加工調理済み食品中のKC1の苦味の知覚に対する効果を、下記の通り、「咀嚼と吐き出し」試験を使用し、ラテン方格 - 2 AFC試験方法を使用して、評価した。

## 【0304】

可食KC1食品(「KC1試験食品」)を下記指示に従い調製した。6カップの水を、ステンレス鋼ポット中で「回転」沸騰するまで沸騰させた。回転沸騰が達成されるとすぐに、166.5グラムのパスタを煮沸水に添加した。パスタを短時間攪拌し、パスタがポットにくっつかないようにした。パスタを8.5分間沸騰させ、ステンレス鋼水切り器で水切りした。パスタを振り(およそ15回前後および2回上下)、過剰の水を除去した。水切りしたパスタをステンレス鋼ポットに戻し、56グラム(大さじ4)のLand O'Lakes(商標)無塩バターを熱いパスタに添加した。無塩バターが半分解けた時に、39.5グラムのチーズ粉末(KC1を含む)をパスタの中央に添加した。別々に、試験化合物を1mlのプロピレンジコール中で希釈し(PG;または、試験化合物はまた、牛乳保存溶液またはバター油保存溶液中で希釈してもよい)、得られた溶液を99mlの牛乳に添加した。63mlのPG/牛乳溶液を、チーズ粉末の周りに注ぎ、穏やかに、ステンレス鋼スプーンでパスタ中に折り込み、チーズがスプーン上で固まらないようにした

10

20

30

40

50

K C 1 標準を、いずれの試験化合物もなしで牛乳を添加することにより、同様に調製した。N a C 1 標準を、いずれの試験化合物もなしでN a C 1 および牛乳を含むチーズ粉末を添加することにより同様に調製した(N a C 1 標準はK C 1 を含まなかった)。

### 【0305】

パネリストは、咀嚼して吐き出すことにより部分を味見した。試料の順のあらゆる影響を排除するために、完全ラテン方格設計を利用し、よって、各可能な試料提示順を被験体全体で使用した。各試料を、いくつかの別個の味覚試験実験で試験した。パネリストは、P o l a n d S p r i n g (商標)水ですすぎ、クラッカーを食べ、試料間で約10分待つように求められた。その都度、パネリストは、苦味がより少ない試料を選択するよう求められた。例示的な結果を表2に示す。

10

### 【表2】

表2. K C 1 ラテン方格 - 2 A F C 味覚 マカロニおよびチーズ

化 合 物 番 号	チーズ粉末中の KCl 濃度(最終 加工調理済み食 品中の KCl 濃 度)	ppm で表される 試験した化合物 の濃度 (苦味の減少を 識別したパネリ ストの数/試験 したパネリスト の数)	少なくとも 50%のパネリ ストが苦味 の減少を識 別した濃度 (ppm)	少なくとも 50% のパネリスト が苦味の減少 を識別し、 $p \leq 0.1$ である濃 度 (ppm)
5	5.7% (0.34%)	10 (28/50) 20 (20/49)	10	
標準	5.7% (0.34%)			

20

30

---

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I
A 6 1 K 47/14 (2006.01)	A 6 1 K 47/14
A 6 1 K 47/04 (2006.01)	A 6 1 K 47/04
A 6 1 K 47/22 (2006.01)	A 6 1 K 47/22

(74)代理人 100191086

弁理士 高橋 香元

(72)発明者 ブレナン, フランシス ザビエル

アメリカ合衆国, ペンシルバニア州 19119, フィラデルフィア, 6622 グリーン ストリート

(72)発明者 ジョーンズ, ウィリアム ピー.

アメリカ合衆国, イリノイ州 60077, スコーキー, 5005 エルム ストリート

(72)発明者 レランド, ジーン ブイ.

アメリカ合衆国, イリノイ州 60091, ウィルメット, 2016 シラー アベニュー

(72)発明者 ハヤシ, デイビッド

アメリカ合衆国, イリノイ州 60614, シカゴ, 1816 ノース フリモント ストリート

審査官 小石 真弓

(56)参考文献 特開2005-082594 (JP, A)

特表平07-504810 (JP, A)

特表2006-514968 (JP, A)

特表2009-517063 (JP, A)

米国特許第05602184 (US, A)

欧州特許出願公開第02198859 (EP, A1)

Int. Res. J. Pharmacy, 2011年 8月, Vol.2, No.8, , p169-172

Drug Devel. & Ind. Pharmacy, 1991年, Vol.17, No.13, p1875-1882

J. Human Nutrition & Dietetics, 1993年, Vol.6, , p295-305

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A 23 L

A 6 1 K

J S T P l u s / J M E D P l u s / J S T 7 5 8 0 (J D r e a m I I I )

C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N )