



(12)发明专利



(10)授权公告号 CN 103998028 B

(45)授权公告日 2017.12.08

(21)申请号 201180075684.6

(22)申请日 2011.10.20

(65)同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 103998028 A

(43)申请公布日 2014.08.20

(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2014.06.20

(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/US2011/057146 2011.10.20

(87)PCT国际申请的公布数据
W02013/058758 EN 2013.04.25

(73)专利权人 卓莫赛尔公司
地址 美国新泽西州
专利权人 卡夫食品集团品牌有限责任公司

(72)发明人 F·X·布伦南 W·P·琼斯
J·V·里兰 D·哈亚诗

(74)专利代理机构 北京市铸成律师事务所
11313
代理人 郝文博

(51)Int.Cl.
A61K 31/045(2006.01)
A61K 47/00(2006.01)

(56)对比文件
US 6020505 A, 2000.02.01,
US 4347858 A, 1982.09.07,
WO 9420080 A1, 1994.09.15,
审查员 焦士勇

权利要求书5页 说明书50页

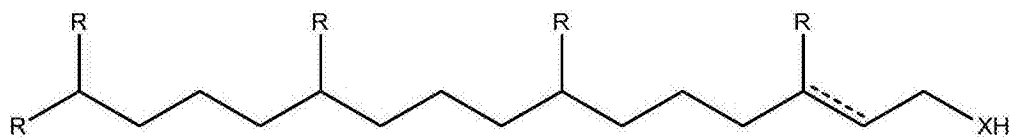
(54)发明名称

用于减小或消除苦味的化合物、组合物和方法

(57)摘要

本发明提供包含本发明化合物的可食用组合物、包含这类可食用组合物的食品以及制备这类食品的方法。本发明还提供降低食品中的NaCl的量的方法、减少饮食中的钠摄入的方法以及减小食品的苦味的方法。

1. 一种组合物,其包含i) 促苦味剂,其中所述促苦味剂选自KCl和乳酸钾,和ii) 根据式(I)的化合物:



式(I);

或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合,

其中,当化合价和稳定性允许时:

X为S或O;

每一个R独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;

其中所述虚线键指示任选的碳-碳双键;且

其中所述组合物是可食用的并且其中所述促苦味剂的苦味被减小。

2. 根据权利要求1所述的组合物,其中所述化合物选自:

化合物1	
化合物2	
化合物3	
化合物4	
化合物5	

或其对映异构体或非对映异构体,或任何前述化合物的组合。

3. 根据权利要求1或2所述的组合物,其中所述促苦味剂为KCl。

4. 一种食品,包含根据权利要求1-3中任一项所述的组合物。

5. 一种制备包括促苦味剂的可食用组合物的方法,其中所述促苦味剂选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 提供食品上可接受的载体;以及

(b) 向所述食品上可接受的载体添加如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合;

其中将所述促苦味剂提供在食品上可接受的载体中,或将所述促苦味剂添加至食品上可接受的载体。

6. 一种制备包括促苦味剂的可食用组合物的方法,其中所述促苦味剂选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 提供食品上可接受的载体;以及

(b) 向所述食品上可接受的载体添加如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合;

其中将所述促苦味剂提供在食品上可接受的载体中,或将所述促苦味剂添加至食品上可接受的载体。

7. 根据权利要求5或6所述的方法,其中所述钾盐为KCl。

8. 一种降低可食用组合物中的钠的量的方法,包括:

(a) 用一定量的钾盐代替用于制备所述可食用组合物的一定量的钠盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;以及

(b) 向所述可食用组合物中并入有效量的如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合,以产生具有减少的钠的可食用组合物。

9. 一种降低可食用组合物中的钠的量的方法,包括:

(a) 用一定量的钾盐代替用于制备所述可食用组合物的一定量的钠盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;以及

(b) 向所述可食用组合物中并入有效量的如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合,以产生具有减少的钠的可食用组合物。

10. 一种减少受试者的钠摄入的方法,所述方法包括:

(a) 用一定量的钾盐代替用于制备可食用组合物的一定量的钠盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;以及

(b) 向所述可食用组合物中并入有效量的如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

11. 一种减少受试者的钠摄入的方法,所述方法包括:

(a) 用一定量的钾盐代替用于制备可食用组合物的一定量的钠盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;以及

(b) 向所述可食用组合物中并入有效量的如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

12. 根据权利要求8-11任一项所述的方法,其中所述钠盐为NaCl且所述钾盐为KCl。

13. 一种减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 提供包含促苦味剂的可食用组合物;以及

(b) 向在(a)中产生的所述可食用组合物添加有效量的如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前

述化合物的组合,从而减小由所述促苦味剂引起的任何苦味。

14.一种减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 提供包含促苦味剂的可食用组合物;以及

(b) 向在(a)中产生的所述可食用组合物添加有效量的如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合,从而减小由所述促苦味剂引起的任何苦味。

15.一种减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 在所述可食用组合物之前、与其同时或在其之后食入有效量的如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合,从而减小由所述促苦味剂引起的任何苦味。

16.一种减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 在所述可食用组合物之前、与其同时或在其之后食入有效量的如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合,从而减小由所述促苦味剂引起的任何苦味。

17.根据权利要求13-16任一项所述的方法,其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多25%。

18.根据权利要求13-16任一项所述的方法,其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多50%。

19.根据权利要求13-16任一项所述的方法,其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多75%。

20.根据权利要求13-16任一项所述的方法,其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多100%。

21.一种使可食用组合物防腐的方法,包括:

(a) 提供可食用组合物;以及

(b) 向所述可食用组合物中并入乳酸钾和有效量的如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

22.一种使可食用组合物防腐的方法,包括:

(a) 提供可食用组合物;以及

(b) 向所述可食用组合物中并入乳酸钾和有效量的如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

23.根据权利要求5-6、8-11、13-16和21-22中任一项所述的方法,其中所述可食用组合物是消费品。

24.根据权利要求23所述的方法,其中所述消费品是食品或药物组合物。

25.一种抑制、减小、或消除受试者中的苦味感觉的方法,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 将如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合放入所述受试者的口腔。

26. 一种抑制、减小、或消除受试者中的苦味感觉的方法,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾,所述方法包括:

(a) 将如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合放入所述受试者的口腔。

27. 根据权利要求25或26所述的方法,其中所述苦味由KCl引起。

28. 一种药物组合物,包含:

(a) 苦味药物活性成分,其中所述药物活性成分为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;和

(b) 如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

29. 一种药物组合物,包含:

(a) 苦味药物活性成分,其中所述药物活性成分为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;和

(b) 如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

30. 一种药物组合物,包含:

(a) 药物活性成分;

(b) 促苦味剂,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;和

(c) 如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

31. 一种药物组合物,包含:

(a) 药物活性成分;

(b) 促苦味剂,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;和

(c) 如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

32. 一种消费品,包含:

(a) 苦味成分,其中所述苦味成分为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;和

(b) 如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

33. 一种消费品,包含:

(a) 苦味成分,其中所述苦味成分为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾;和

(b) 如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

34. 一种用于减小促苦味剂的苦味的消费品,其中所述促苦味剂为钾盐,其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾,且其中所述消费品包含:

(a) 如权利要求1所述的根据式(I)的化合物、或其食品上或生物学上可接受的盐、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

35. 一种用于减小促苦味剂的苦味的消费品, 其中所述促苦味剂为钾盐, 其中所述钾盐选自KCl和乳酸钾, 且其中所述消费品包含:

(a) 如权利要求2所述的化合物1-5中的任一种、或其对映异构体或非对映异构体、或任何前述化合物的组合。

用于减小或消除苦味的化合物、组合物和方法

发明领域

[0001] 本发明涉及可食用组合物的味道。

[0002] 发明背景

[0003] 味觉(例如人的味觉)可以鉴别至少五种传统的味道:甜味、酸味、咸味、苦味和鲜味(美味)。包括植物、食物、食物成分和营养剂的许多营养物质包括促苦味剂和/或具有苦味。此外,对保持或改善健康重要的许多药物物质包含促苦味剂和/或具有苦味。虽然某些食品和消费品具有合乎需要的苦味,包括咖啡、啤酒和黑巧克力,但在许多情况下,消费者不喜欢这些苦味。例如,许多消费者不喜欢某些促苦味剂和/或苦味的感觉并且回避具有不希望的促苦味剂或苦味的食物或药物产品而偏好具有较低含量的不希望的促苦味剂或苦味减小或完全没有苦味的食物和药物产品。对含有不希望的促苦味剂和/或具有不希望的苦味的产品的这种排斥可能由存在于口腔和/或胃肠道中的苦味受体活化介导的促苦味剂和/或苦味的感觉所引起。在很多情况下,消费者不喜欢促苦味剂和/或苦味妨碍或抑制了食物的营养质量和安全的改善,因为不能使用希望的水平的包含促苦味剂和/或具有苦味的营养剂或防腐剂。此外,对某些药剂的促苦味剂或苦味的厌恶或排斥使使用这些药剂的处方方案的顺应性受到负面影响。

[0004] 例如,在食品的制备中使用的一些添加剂、防腐剂、乳化剂和食材包含促苦味剂和/或具有苦味。虽然这些添加剂、防腐剂、乳化剂和食材可能影响食品的味道,但是它们可能对于改善食品的保存期限、营养质量或质地也是重要的。例如,高血压和心血管疾病的日益增加的趋势部分是由于西方饮食的高钠摄入。因此,用另一种咸味化合物代替氯化钠是合乎需要的。最常用的氯化钠替代物是氯化钾,氯化钾对一部分人来说除了具有咸味之外还具有苦味。氯化钾的苦味限制了它可以用于代替食物中的氯化钠而不给对它敏感的人群产生不希望的苦味的范围。

[0005] 另一种常用的食品添加剂乳酸钠具有广泛的抗微生物作用,对抑制酸败和致病细菌的生长有效,并且通常在食品(例如肉和禽产品)中使用来延长保存期限并增加食物安全性。然而,由于其钠含量,乳酸钠作为防腐剂是不合要求的。乳酸钾具有类似的抗微生物性质,已经用于代替乳酸钠。然而,乳酸钾也与苦味相关,这种苦味限制了它可以用于代替食物中的乳酸钠而不引起不希望的苦味的范围。

[0006] 此外,肥胖和糖尿病的日益增加的发病率部分是由于许多饮食的高糖摄入。因此,用另一种甜味化合物代替糖是合乎需要的。可以用于减少食物中的糖的人造和天然糖替代物往往与苦味相关,这也限制了其用于代替食物中的糖而不引起不利的苦味的范围。例如,常用的糖替代物是乙酰磺胺酸钾,其除了具有甜味之外也具有苦味。

[0007] 不受理论限制,促苦味剂、促甜味剂和促鲜味剂和化合物通常通过G-蛋白偶联受体引发味觉反应,而促咸味剂和促酸味剂和化合物通常被假设是通过离子通道引发味觉反应。苦味受体属于诱导响应于促苦味剂的胞内钙浓度变化的G-蛋白偶联受体的T2R(也称为TAS2R)家族。T2R受体通过味蛋白(一种味道特异性的G-蛋白)起作用。有至少二十五种不同的T2R家族成员,显示苦味的感觉是复杂的,其涉及一些不同促味剂-受体相互作用。能够调

节口腔和/或胃肠道中的苦味受体的活化和/或信号传导的化合物可以有效地在食物和药物产品中获得促苦味剂或苦味物质的使用水平,而不引起消费者由于感觉增加的水平的促苦味剂或苦味厌恶这些产品。在一些情况下,苦味受体和苦味的阻滞剂或调节剂可以通过存在于口腔和/或胃肠道中的苦味受体和/或味道转导信号传导机制减小促苦味剂和/或苦味的感觉。

[0008] 传统上,在食物制备和药物中,使用甜味剂和其它促味剂(包括盐)来掩蔽苦味。然而,在一些情况下,这是不希望的或不足够的,因为它可能改变、掩蔽或影响食品中的其它味道/气味/感觉(例如,非苦味或希望的苦味)。此外,该途径很少能够完全地掩蔽存在于这些食品或药物中的苦味。因此,优选减小苦味的化合物而不是掩蔽剂,或除了掩蔽剂之外减小苦味的化合物是优选的。

[0009] 因此,提供可以加入包含促苦味剂或具有苦味的食品、消费品和药物中的化合物来消除、调节或减小所述促苦味剂或苦味的感觉或减小口腔和/或胃肠道中的苦味受体的相应活化是合乎需要的。类似地,提供包含这些化合物的食品、消费品和药物组合物是合乎需要的。使用这些化合物来消除、调节或减小与盐替代物相关的苦味的感觉从而减少受试者的钠摄入也是合乎需要的。使用这些化合物来消除、调节或减小与糖代替物相关的苦味的感觉从而减少受试者的糖摄入也是合乎需要的。

[0010] 发明概述

[0011] 本发明提供调节苦味的化合物、包含这些化合物的可食用组合物以及制备这些可食用组合物的方法。本发明还提供降低可食用组合物中的钠或糖的量的方法以及减小可食用组合物的苦味的方法。本发明还提供减小、调节或消除受试者中的食品、消费品或药品的苦味的方法。本发明还提供调节,特别是减小苦味受体活化的方法。

[0012] 可食用组合物

[0013] 本发明的一个方面提供用于减小促苦味剂的苦味的可食用组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物包含支链烯烃化合物。在一些实施方案中,所述支链烯烃化合物为具有小于约1000、500或300道尔顿的分子量的化合物。在某些实施方案中,所述支链烯烃化合物为式(I)化合物、或化合物1-5或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0014] 在某些实施方案中,式(I)化合物为植醇或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0015] 在一些实施方案中,所述可食用组合物包含基于环己二烯的化合物。在一些实施方案中,所述基于环己二烯的化合物为具有小于约1000、500或300道尔顿的分子量的化合物。在某些实施方案中,所述基于环己二烯的化合物为式(II)化合物、或化合物6或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0016] 在某些实施方案中,式(II)化合物为大马酮或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0017] 在一些实施方案中,所述可食用组合物包含支链烯烃酯化合物。在一些实施方案中,所述支链烯烃酯化合物为具有小于约1000、500或300道尔顿的分子量的化合物。在某些实施方案中,所述支链烯烃酯化合物为式(III)化合物、或化合物7或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0018] 在某些实施方案中,式(III)化合物为惕恪酸香茅酯或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0019] 在一些实施方案中,所述可食用组合物包含基于苯并间二氧杂环戊烯的化合物。在一些实施方案中,基于苯并间二氧杂环戊烯的化合物为具有小于约1000、500或300道尔顿的分子量的化合物。在某些实施方案中,基于苯并间二氧杂环戊烯的化合物为式(IV)化合物、或化合物8或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0020] 在某些实施方案中,式(IV)化合物为2-甲基-3-(3,4-亚甲基二氧基苯基)-丙醛或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0021] 在一些实施方案中,所述可食用组合物包含(a)本发明化合物;和(b)促苦味剂。在一些实施方案中,本发明化合物为具有小于约1000、500或300道尔顿的分子量的化合物。在某些实施方案中,本发明化合物为本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。

[0022] 在另一个实施方案中,所述可食用组合物包含(a)本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合;和(b)促苦味剂。

[0023] 根据本发明,所述促苦味剂可以是在例如食品(如咖啡或巧克力)中固有的或可以是可食用组合物(如苦味防腐剂)的组分。在一些实施方案中,存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为KCl。在其它实施方案中,存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为乳酸钾。

[0024] 在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含钠盐。在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含NaCl。在其它实施方案中,所述可食用组合物进一步包含乳酸钠。在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含糖。

[0025] 在本发明的另一个方面中,所述可食用组合物为包含至少一种本发明化合物的食品。在某些实施方案中,本发明化合物为本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。在另一个实施方案中,本发明化合物为本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0026] 在本发明的另一个方面中,所述可食用组合物为包含苦味药物活性成分和本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合的药物组合物。在一些实施方案中,所述药物组合物包含苦味药物活性成分和本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0027] 在又一些其它实施方案中,所述可食用组合物为包含药物活性成分、促苦味剂和本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合的药物组合物。在又一些其它实施方案中,所述药物组合物包含药物活性成分、促苦味剂和本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0028] 在本发明的另一个方面中,所述可食用组合物为包含促苦味剂和本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合的消费品。在其它实施方案中,所述消费品包含促苦味剂和本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0029] 本发明的又一个实施方案提供用于减小促苦味剂的苦味的消费品,其中所述消费品包含本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。在又一些其它实施方案中,用于减小促苦味剂的苦味的消费品包含本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0030] 在又一个方面中,本发明提供制备可食用组合物的方法,其包括:

[0031] (a) 提供食品上可接受的载体;以及

[0032] (b) 向(a)的食品上可接受的载体添加本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。

[0033] 在另一个实施方案中,制备可食用组合物的方法包括:

[0034] (a) 提供食品上可接受的载体;以及

[0035] (b) 向(a)的食品上可接受的载体添加本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0036] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品、消费品或药物组合物。在一些实施方案中,所述食品上可接受的载体为食材、食品、或药学上可接受的载体。

[0037] 在一些实施方案中,在(a)中的所述食品上可接受的载体本身是苦的。在一些实施方案中,所述食品上可接受的载体可能本身含促苦味剂(即,不添加促苦味剂所述食品上可接受的载体就是苦的)。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,所述本身苦的食材包含钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述本身苦的食材包含钾盐,如KCl。

[0038] 在其它实施方案中,制备可食用组合物的方法进一步包括:(c)添加促苦味剂。在一些实施方案中,制备可食用组合物的方法中使用的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,制备可食用组合物的方法中使用的促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,制备可食用组合物的方法中使用的促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,制备可食用组合物的方法中使用的促苦味剂为KCl。在其它实施方案中,制备可食用组合物的方法中使用的促苦味剂为乳酸钾。

[0039] 在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含钠盐。在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含NaCl。在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含乳酸钠。在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含糖。

[0040] 本发明还提供降低可食用组合物中的钠的量的方法。在一些实施方案中,这些方法包括:

[0041] (a) 用一定量的一种或多种钾盐代替用于制备可食用组合物的一定量的一种或多种钠盐;以及

[0042] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。

[0043] 在另一个实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法包括:

[0044] (a) 用一定量的一种或多种钾盐代替用于制备可食用组合物的一定量的一种或多种钠盐;以及

[0045] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0046] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品、消费品或药物组合物。

[0047] 在本发明的一些实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法包括向所述可食用组合物中并入足以允许用钾代替存在于可食用组合物中的钠的最多25%的量的化合物。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用钾代替存在于可食用组合物中的钠的最多50%。在又一些其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用钾代替存在于可食用组合物中的钠的最多75%。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用钾代替存在于可食用组合物中的钠的最多100%。在一些实施方案中,所述可食用组合物保持咸味。

[0048] 本发明还提供降低可食用组合物中的NaCl的量的方法。在一些实施方案中,这些方法包括:

[0049] (a) 用一定量的KCl代替用于制备可食用组合物的一定量的NaCl;以及

[0050] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。

[0051] 在另一个实施方案中,降低可食用组合物中的NaCl的量的方法包括:

[0052] (a) 用一定量的KCl代替用于制备可食用组合物的一定量的NaCl;以及

[0053] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其4组合。

[0054] 在本发明的一些实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法包括向所述可食用组合物中并入足以允许用KCl代替存在于可食用组合物中的NaCl的最多25%的量的化合物。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用KCl代替存在于可食用组合物中的NaCl的最多50%。在又一些其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用KCl代替存在于可食用组合物中的NaCl的最多75%。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用KCl代替存在于可食用组合物中的NaCl的最多100%。在一些实施方案中,所述可食用组合物保持咸味。

[0055] 在另一个实施方案中,本发明提供降低可食用组合物中的乳酸钠的量的方法,其包括:

[0056] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠;以及

[0057] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。

[0058] 在另一个实施方案中,本发明提供降低可食用组合物中的乳酸钠的量的方法,其包括:

[0059] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠;以及

[0060] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0061] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品、消费品或药物组合物。

[0062] 在本发明的一些实施方案中,降低可食用组合物中的乳酸钠的量的方法包括向所述可食用组合物中并入允许用乳酸钾代替存在于可食用组合物中的乳酸钠的最多25%的量的化合物。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量允许用乳酸钾代替存在于可食用组合物中的乳酸钠的最多50%。在又一些其它实施方案中,并入所述可食用

组合物的化合物的量足以允许用乳酸钾代替存在于可食用组合物中的乳酸钠的最多75%。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用乳酸钾代替存在于可食用组合物中的乳酸钠的最多100%。在一些实施方案中,所述可食用组合物与包含乳酸钠的可食用组合物具有相同的保存期限。

[0063] 在另一个实施方案中,本发明提供降低可食用组合物中的糖的量的方法,其包括:

[0064] (a) 用一定量的乙酰磺胺酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的糖;以及

[0065] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合。

[0066] 在另一个实施方案中,本发明提供降低可食用组合物中的糖的量的方法,其包括:

[0067] (a) 用一定量的乙酰磺胺酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的糖;以及

[0068] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0069] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品、消费品或药物组合物。

[0070] 在本发明的一些实施方案中,降低可食用组合物中的糖的量的方法包括向所述可食用组合物中并入足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于可食用组合物中的糖的最多25%的量的化合物。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于可食用组合物中的糖的最多50%。在又一些其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于可食用组合物中的糖的最多75%。在其它实施方案中,并入所述可食用组合物的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于可食用组合物中的糖的最多100%。在一些实施方案中,所述可食用组合物保持甜味。

[0071] 本发明还提供减少受试者的钠摄入的方法。这些方法包括:

[0072] (a) 用一定量的KCl代替用于制备可食用组合物的一定量的NaCl;以及

[0073] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合,从而减少受试者的钠摄入。

[0074] 在另一个实施方案中,减少受试者的钠摄入的方法包括:

[0075] (a) 用一定量的KCl代替用于制备可食用组合物的一定量的NaCl;以及

[0076] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合,从而减少受试者的钠摄入。

[0077] 在另一个实施方案中,减少受试者的钠摄入的方法包括:

[0078] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠;以及

[0079] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合,从而减少受试者的钠摄入。

[0080] 在另一个实施方案中,减少受试者的钠摄入的方法包括:

[0081] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠;以及

[0082] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合,从而减少受试者的钠摄入。

[0083] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品、消费品或药物组合物。

[0084] 在本发明的一些实施方案中,减少受试者的钠摄入的方法进一步包括(c) 鉴别有

需要的受试者。在一些实施方案中,减少受试者的钠摄入的方法包括向所述可食用组合物中并入足以使用钾代替减少最多25%的钠摄入的量的化合物。在其它实施方案中,在(b)中添加的化合物的量足以使用钾代替减少最多50%的钠摄入。在又一些其它实施方案中,在(b)中添加的化合物的量足以使用钾代替减少最多75%的钠摄入。在其它实施方案中,在(b)中添加的化合物的量足以使用钾代替减少最多100%的钠摄入。

[0085] 本发明还提供减少受试者的糖摄入的方法,其包括:

[0086] (a) 用一定量的乙酰磺胺酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的糖;以及

[0087] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合,从而减少受试者的糖摄入。

[0088] 在另一个实施方案中,减少受试者的糖摄入的方法包括:

[0089] (a) 用一定量的乙酰磺胺酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的糖;以及

[0090] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合,从而减少受试者的糖摄入。

[0091] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品、消费品或药物组合物。

[0092] 在本发明的一些实施方案中,减少受试者的糖摄入的方法进一步包括(c)鉴别有需要的受试者。在一些实施方案中,减少受试者的糖摄入的方法包括向所述可食用组合物中并入足以使用乙酰磺胺酸钾代替减少最多25%的糖摄入的量的化合物。在其它实施方案中,在(b)中添加的化合物的量足以使用乙酰磺胺酸钾代替减少最多50%的糖摄入。在又一些其它实施方案中,在(b)中添加的化合物的量足以使用乙酰磺胺酸钾代替减少最多75%的糖摄入。在其它实施方案中,在(b)中添加的化合物的量足以使用乙酰磺胺酸钾代替减少最多100%的糖摄入。

[0093] 本发明还提供减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法,其包括向所述可食用组合物添加有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合,从而减小由所述促苦味剂引起的苦味。在其它实施方案中,向所述可食用组合物添加的化合物为本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0094] 本发明进一步提供减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法,其包括在所述可食用组合物之前、与同时或在其之后食入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合,从而减小由所述促苦味剂引起的苦味。在其它实施方案中,与所述可食用组合物一起食入的化合物为本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0095] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品、消费品或药物组合物。

[0096] 在一些实施方案中,所述方法使由所述促苦味剂引起的苦味减小最多25%。在一些实施方案中,所述方法使由所述促苦味剂引起的苦味减小最多50%。在其它实施方案中,所述方法使由所述促苦味剂引起的苦味减小最多75%。在又一些其它实施方案中,所述方法使由所述促苦味剂引起的苦味减小最多100%。在一些实施方案中,存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为KCl。

[0097] 在又一个方面中,本发明提供使可食用组合物防腐的方法,其包括:

[0098] (a) 提供可食用组合物;以及

[0099] (b) 向 (a) 的所述可食用组合物添加乳酸钾和有效量的本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合。

[0100] 在另一个实施方案中,使可食用组合物防腐的方法包括:

[0101] (a) 提供可食用组合物;以及

[0102] (b) 向 (a) 的所述可食用组合物添加乳酸钾和有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0103] 本发明还提供降低可食用组合物中的钠的量同时使所述可食用组合物防腐的方法。在一些实施方案中,这些方法包括:

[0104] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠;以及

[0105] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合。

[0106] 本发明还提供降低可食用组合物中的钠的量同时使所述可食用组合物防腐的方法。在一些实施方案中,这些方法包括:

[0107] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠;以及

[0108] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0109] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。

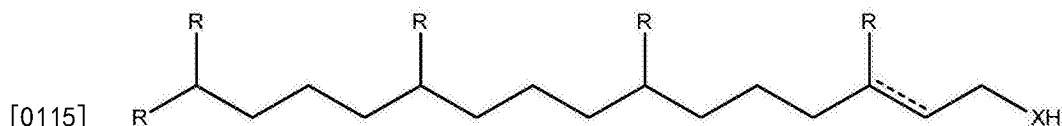
[0110] 本发明还提供使用包含本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合的可食用组合物减小或消除受试者中的苦味的方法。在其它实施方案中,减小或消除受试者中的苦味的组合物包含本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0111] 在一些实施方案中,所述苦味是固有的。在一些实施方案中,所述苦味由苦味的盐引起。在一些实施方案中,所述苦味由钾盐、镁盐或钙盐引起。在一些实施方案中,所述苦味由KCl引起。在其它实施方案中,所述苦味由乳酸钾引起。

[0112] 本发明还提供抑制或减小苦味受体的活化和/或信号传导的方法,其中所述方法包括将苦味受体与本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合接触。在其它实施方案中,所述方法包括将苦味受体与本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。在一些实施方案中,所述苦味受体在口腔中。在其它实施方案中,所述苦味受体在胃肠道中,例如在胃中。在其它实施方案中,所述苦味受体在活体外试验中。

[0113] 本发明的特定实施方案在以下编号的段落中阐述:

[0114] 1. 一种组合物,包含根据式 (I) 的化合物:

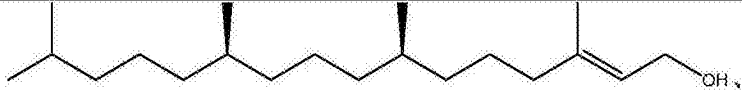
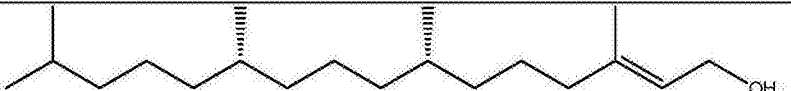
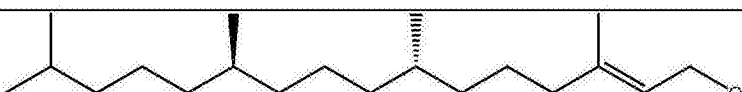
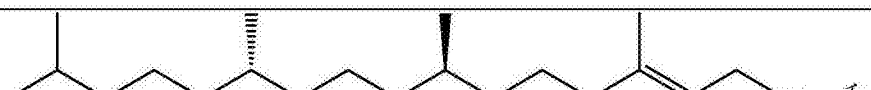
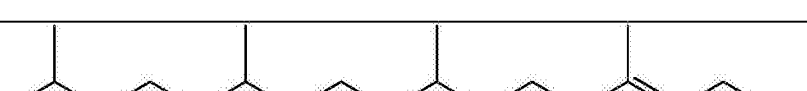


式(I);

[0116] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体,

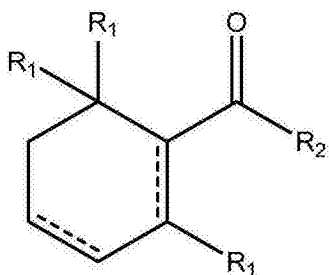
[0117] 其中,当化合价和稳定性允许时:

- [0118] X为S或O；
- [0119] 每一个R独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基；
- [0120] 其中所述虚线键指示任选的碳-碳双键；且
- [0121] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味。
- [0122] 2. 根据段落1的组合物，其中当化合价和稳定性允许时：
- [0123] X为S或O；
- [0124] 每一个R独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基；且
- [0125] 其中所述虚线键指示任选的碳-碳双键。
- [0126] 3. 根据段落1的组合物，其中当化合价和稳定性允许时：
- [0127] X为O；
- [0128] 每一个R独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基；且
- [0129] 其中所述虚线键指示任选的碳-碳双键。
- [0130] 4. 根据段落1的组合物，其中当化合价和稳定性允许时：
- [0131] X为S或O；
- [0132] 每一个R独立地为H或C₁-C₃烷基；且
- [0133] 其中所述虚线键指示任选的碳-碳双键。
- [0134] 5. 根据段落1的组合物，其中当化合价和稳定性允许时：
- [0135] X为O；
- [0136] 每一个R独立地为H或C₁-C₃烷基；且
- [0137] 其中所述虚线键指示任选的碳-碳双键。
- [0138] 6. 根据段落1的组合物，其中根据式(I)的化合物选自：

化合物1	
化合物2	
[0139] 化合物3	
化合物4	
化合物5	

- [0140] 其食品上或生物学上可接受的衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。
- [0141] 7. 一种组合物，包含根据式(II)的化合物：

[0142]



式(II);

[0143] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体,

[0144] 其中,当化合价和稳定性允许时:

[0145] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;[0146] R₂为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;且

[0147] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键;

[0148] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味

[0149] 8. 根据段落7的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0150] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;[0151] R₂为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;且

[0152] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。

[0153] 9. 根据段落7的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0154] 每一个R₁独立地为H或C₁-C₃烷基;[0155] R₂为H、C₁-C₃烷基或C₂-C₃烯基;且

[0156] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。

[0157] 10. 根据段落7的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0158] 每一个R₁独立地为H或C₁-C₃烷基;[0159] R₂为H或C₂-C₃烯基;且

[0160] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。

[0161] 11. 根据段落7的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

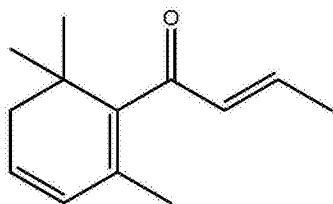
[0162] 每一个R₁独立地为H或C₁-C₃烷基;[0163] R₂为H或C₂-C₃烯基;且

[0164] 每一条虚线为碳-碳双键。

[0165] 12. 根据段落7的组合物,其中根据式(II)的化合物选自:

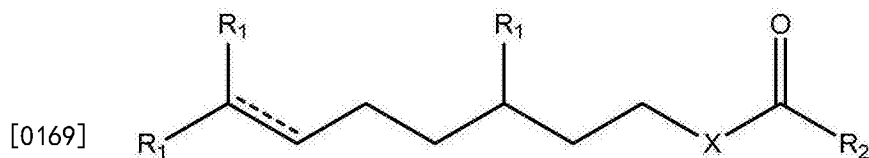
[0166]

化合物 6



[0167] 其食品上或生物学上可接受的衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0168] 13. 一种组合物,包含根据式(III)的化合物:



式(III);

[0170] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体,

[0171] 其中,当化合价和稳定性允许时:

[0172] $X=S$ 或 O ;

[0173] 每一个 R_1 独立地为 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基;

[0174] R_2 为 H 、 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基或 C_2-C_{10} 炔基;且

[0175] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键;

[0176] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味。

[0177] 14. 根据段落13的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0178] $X=S$ 或 O ;

[0179] 每一个 R_1 独立地为 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基;

[0180] R_2 为 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基;且

[0181] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0182] 15. 根据段落13的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0183] $X=S$ 或 O ;

[0184] 每一个 R_1 独立地为 H 、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基;

[0185] R_2 为 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基;且

[0186] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0187] 16. 根据段落13的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0188] $X=O$;

[0189] 每一个 R_1 独立地为 H 、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基;

[0190] R_2 为 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基;且

[0191] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0192] 17. 根据段落13的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0193] $X=S$ 或 O ;

[0194] 每一个 R_1 独立地为 H 、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基;

[0195] R_2 为 H 、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基或 C_2-C_4 炔基;且

[0196] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0197] 18. 根据段落13的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

[0198] $X=O$;

[0199] 每一个 R_1 独立地为 H 、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基;

[0200] R_2 为 H 、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基或 C_2-C_4 炔基;且

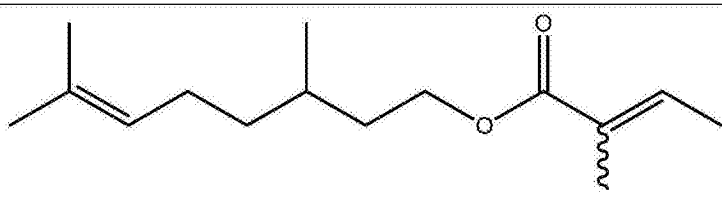
[0201] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0202] 19. 根据段落13的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:

- [0203] $X=O$;
- [0204] 每一个 R_1 独立地为H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基;
- [0205] R_2 为H、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基或 C_2-C_4 炔基;且
- [0206] 所述虚线为碳-碳双键。
- [0207] 20. 根据段落13的组合物, 其中根据式(III)的化合物选自:

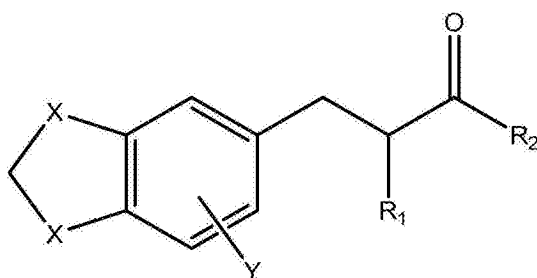
[0208]

化合物 7



- [0209] 其食品上或生物学上可接受的衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。
- [0210] 21. 一种组合物, 包含根据式(IV)的化合物:

[0211]



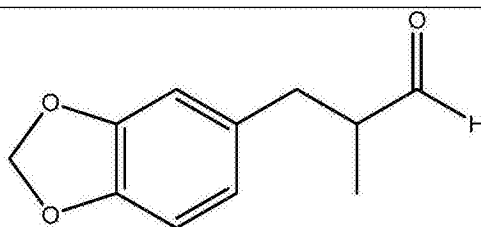
式(IV);

- [0212] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体,
- [0213] 其中, 当化合价和稳定性允许时:
- [0214] 每一个X独立地为S或O;
- [0215] $Y=H$ 或卤素;
- [0216] R_1 为H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基; 且
- [0217] R_2 为H、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基;
- [0218] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味。
- [0219] 22. 根据段落21的组合物, 其中当化合价和稳定性允许时:
- [0220] 每一个X独立地为S或O;
- [0221] $Y=H$ 或卤素;
- [0222] R_1 为H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基; 且
- [0223] R_2 为H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基。
- [0224] 23. 根据段落21的组合物, 其中当化合价和稳定性允许时:
- [0225] 每一个X独立地为S或O;
- [0226] $Y=H$ 或卤素;
- [0227] R_1 为H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基; 且
- [0228] R_2 为H或 C_1-C_3 烷基。
- [0229] 24. 根据段落21的组合物, 其中当化合价和稳定性允许时:
- [0230] $X=O$;

- [0231] Y=H;
- [0232] R₁为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;且
- [0233] R₂为H或C₁-C₃烷基。
- [0234] 25. 根据段落21的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:
- [0235] X=O;
- [0236] Y=H;
- [0237] R₁为H或C₁-C₃烷基;且
- [0238] R₂为H或C₁-C₃烷基。
- [0239] 26. 根据段落21的组合物,其中当化合价和稳定性允许时:
- [0240] X=O;
- [0241] Y=H;
- [0242] R₁为H或C₁-C₃烷基;且
- [0243] R₂为H。
- [0244] 27. 根据段落21的组合物,其中根据式(IV)的化合物选自:

[0245]

化合物8



- [0246] 其食品上或生物学上可接受的衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。
- [0247] 28. 一种组合物,包含:
- [0248] (a) 本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合;和
- [0249] (b) 促苦味剂,
- [0250] 其中所述组合物是可食用的。
- [0251] 29. 根据段落28的组合物,其中所述促苦味剂为食材。
- [0252] 30. 根据段落28的组合物,其中所述促苦味剂为苦味的盐。
- [0253] 31. 根据段落30的组合物,其中所述苦味的盐为镁盐、钙盐、或钾盐。
- [0254] 32. 根据段落31的组合物,其中所述含钾盐为KCl或乳酸钾。
- [0255] 33. 段落1-32中任一个的组合物,其中所述可食用组合物进一步包含一种或多种选自由以下组成的组的组分:NaCl、乳酸钠和糖。
- [0256] 34. 一种食品,包含段落1-33中任一个的组合物。
- [0257] 35. 一种制备可食用组合物的方法,包括:
- [0258] (a) 提供食品上可接受的载体;以及
- [0259] (b) 向(a)的食品上可接受的载体添加本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0260] 36. 根据段落35的方法,其中所述食品上可接受的载体本身是苦的。
- [0261] 37. 根据段落36的方法,其中所述食品上可接受的载体包含苦味的盐。

- [0262] 38. 根据段落37的方法, 其中所述苦味的盐为镁盐、钙盐、或钾盐。
- [0263] 39. 根据段落38的方法, 其中所述钾盐为KCl或乳酸钾。
- [0264] 40. 根据段落35-39中任一个的方法, 其中所述可食用组合物进一步包含一种或多种选自以下组成的组的组分: NaCl、乳酸钠和糖。
- [0265] 41. 根据段落35的方法, 其中所述方法进一步包括:
- [0266] (c) 添加促苦味剂。
- [0267] 42. 根据段落41的方法, 其中所述促苦味剂为苦味的盐。
- [0268] 43. 根据段落42的方法, 其中所述苦味的盐为镁盐、钙盐、或钾盐。
- [0269] 44. 根据段落43的方法, 其中所述钾盐为KCl或乳酸钾。
- [0270] 45. 根据段落41-44中任一个的方法, 其中所述可食用组合物进一步包含一种或多种选自以下组成的组的组分: NaCl、乳酸钠和糖。
- [0271] 46. 一种降低可食用组合物中的NaCl的量的方法, 包括:
- [0272] (a) 用一定量的KCl代替用于制备可食用组合物的一定量的NaCl; 以及
- [0273] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0274] 47. 根据段落46的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多25%。
- [0275] 48. 根据段落46的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多50%。
- [0276] 49. 根据段落46的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多75%。
- [0277] 50. 根据段落46的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多100%。
- [0278] 51. 根据段落46-50中任一个的方法, 其中所述可食用组合物保持咸味。
- [0279] 52. 一种降低可食用组合物中的乳酸钠的量的方法, 包括:
- [0280] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠; 以及
- [0281] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或本文中描述的其组合、或其组合。
- [0282] 53. 根据段落52的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多25%。
- [0283] 54. 根据段落52的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多50%。
- [0284] 55. 根据段落52的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多75%。
- [0285] 56. 根据段落52的方法, 其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多100%。
- [0286] 57. 根据段落52-56中任一个的方法, 其中所述可食用组合物与包含乳酸钠的可食用组合物具有相同的保存期限。

- [0287] 58.一种降低可食用组合中的糖的量的方法,包括:
- [0288] (a) 用一定量的乙酰磺胺酸钾代替存在于可食用组合中的一些量的糖;以及
- [0289] (b) 向所述可食用组合中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0290] 59.根据段落58的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合中的糖的量的最多25%。
- [0291] 60.根据段落58的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合中的糖的量的最多50%。
- [0292] 61.根据段落58的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合中的糖的量的最多75%。
- [0293] 62.根据段落58的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以允许代替通常存在于所述可食用组合中的糖的量的最多100%。
- [0294] 63.根据段落58-62中任一个的方法,其中所述可食用组合保持甜味。
- [0295] 64.一种减少受试者的钠摄入的方法,所述方法包括:
- [0296] (a) 用一定量的钾盐代替用于制备可食用组合的一些量的钠盐;以及
- [0297] (b) 向所述可食用组合中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0298] 65.根据段落64的方法,其中所述钠盐为NaCl且所述钾盐为KCl。
- [0299] 66.根据段落64的方法,其中所述钠盐为乳酸钠,且所述钾盐为乳酸钾。
- [0300] 67.根据段落64-66中任一个的方法,其中所述方法进一步包括(c)鉴别有需要的受试者。
- [0301] 68.根据段落64-67中任一个的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以通过用钾代替减少最多25%的钠摄入。
- [0302] 69.根据段落64-67中任一个的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以通过用钾代替减少最多50%的钠摄入。
- [0303] 70.根据段落64-67中任一个的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以通过用钾代替减少最多75%的钠摄入。
- [0304] 71.根据段落64-67中任一个的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以通过用钾代替减少最多100%的钠摄入。
- [0305] 72.一种减少受试者的糖摄入的方法,所述方法包括:
- [0306] (a) 用一定量的乙酰磺胺酸钾代替用于制备可食用组合的一些量的糖;以及
- [0307] (b) 向所述可食用组合中并入有效量的本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0308] 73.根据段落72的方法,其中所述方法进一步包括(c)鉴别有需要的受试者。
- [0309] 74.根据段落72或73的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以通过用乙酰磺胺酸钾代替减少最多25%的糖摄入。
- [0310] 75.根据段落72或73的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以通过用乙酰磺胺酸钾代替减少最多50%的糖摄入。
- [0311] 76.根据段落72或73的方法,其中在(b)中添加的化合物的量足以通过用乙酰磺胺

酸钾代替减少最多75%的糖摄入。

[0312] 77. 根据段落72或73的方法, 其中在 (b) 中添加的化合物的量足以通过用乙酰磺胺酸钾代替减少最多100%的糖摄入。

[0313] 78. 一种减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法, 包括:

[0314] (a) 向所述可食用组合物添加有效量的本文中描述的根据式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合, 从而减小由所述促苦味剂引起的苦味。

[0315] 79. 一种减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法, 包括:

[0316] (a) 食入有效量的本文中描述的根据式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合、以及所述可食用组合物, 从而减小由所述促苦味剂引起的苦味。

[0317] 80. 根据段落35-79或81-90中任一个的方法, 其中所述可食用组合物为食品、消费品、或药物组合物。

[0318] 81. 根据段落78-79中任一个的方法, 其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多25%。

[0319] 82. 根据段落78-79中任一个的方法, 其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多50%。

[0320] 83. 根据段落78-79中任一个的方法, 其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多75%。

[0321] 84. 根据段落78-79中任一个的方法, 其中由所述促苦味剂引起的苦味被减小最多100%。

[0322] 85. 根据段落78、79和81-84中任一个的方法, 其中所述促苦味剂为苦味的盐。

[0323] 86. 根据段落85的方法, 其中所述苦味的盐为镁盐、钙盐、或钾盐。

[0324] 87. 根据段落86的方法, 其中所述钾盐为KCl或乳酸钾。

[0325] 88. 根据段落78、79和81-87中任一个的方法, 其中所述可食用组合物进一步包含NaCl、乳酸钠、或糖。

[0326] 89. 一种使可食用组合物防腐的方法, 包括:

[0327] (a) 提供可食用组合物; 以及

[0328] (b) 与乳酸钾和本文中描述的根据式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合 (a) 的所述可食用组合物混合。

[0329] 90. 一种降低可食用组合物中的钠的量同时使所述可食用组合物防腐的方法, 所述方法包括:

[0330] (a) 用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的乳酸钠; 以及

[0331] (b) 向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的根据式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0332] 91. 一种抑制、减小、或消除受试者中的苦味的方法, 包括:

[0333] (a) 将本文中描述的根据式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合放入所述受试者的口腔。

[0334] 92. 根据段落91的方法, 其中所述苦味由苦味的盐引起。

- [0335] 93. 根据段落92的方法, 其中所述苦味由镁盐、钙盐、或钾盐引起。
- [0336] 94. 根据段落93的方法, 其中所述苦味由KCl或乳酸钾引起。
- [0337] 95. 一种药物组合物, 包含:
- [0338] (a) 苦味药物活性成分; 和
- [0339] (b) 本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0340] 96. 一种药物组合物, 包含:
- [0341] (a) 药物活性成分;
- [0342] (b) 促苦味剂; 和
- [0343] (c) 本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0344] 97. 一种消费品, 包含:
- [0345] (a) 苦味成分; 和
- [0346] (b) 本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0347] 98. 一种用于减小促苦味剂的苦味的消费品, 其中所述消费品包含:
- [0348] (a) 本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。
- [0349] 99. 一种抑制苦味受体的方法, 包括:
- [0350] (a) 将所述苦味受体与本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合接触。
- [0351] 100. 根据段落99的方法, 其中所述苦味受体在受试者的口腔中。
- [0352] 101. 根据段落99的方法, 其中所述苦味受体在受试者的胃肠道中。
- [0353] 102. 根据段落99的方法, 其中所述苦味受体存在于活体外试验中。
- [0354] 发明详述
- [0355] 为了可以充分地理解本文中描述的本发明, 提出以下详细描述。
- [0356] 除非另外定义, 否则本文中使用的所有技术和科学术语均具有与本发明所属领域一般技术人员通常理解的相同含义。虽然在本发明的实践或试验中可以使用与本文中描述的那些类似或等价的方法和材料, 但是合适的方法和材料如下所述。所述材料、方法和实例仅是说明性的, 不希望是限制性的。本文中提到的所有出版物、专利和其它文献全部以引用方式并入。
- [0357] 在整个说明书中, 措词“包含”或变体如“包括”或“含有”应理解为表示包括说明的整数或整数组而不是排除任何其它整数或整数组。
- [0358] 术语“脂肪族”是指完全饱和或含有一个或多个不饱和单元的直链或支链烃。例如, 脂肪族基团包括取代的或未取代的直链或支链烷基、烯基和炔基。除非另外指出, 否则术语“脂肪族”涵盖取代的和未取代的烃。
- [0359] 术语“烷氧基”是指O-烷基取代基, 其中烷基部分可以被任选取代。烷氧基取代基的实例包括但不限于甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基和正丁氧基。还明确地包括在术语“烷氧基”范围内的是O-烯基或O-炔基。在所有情况下, 烷基、烯烃和炔烃部分可以被任选

取代。

[0360] 术语“烷基”是指含有例如1-3、1-6、1-9或1-12个碳原子的直链和支链饱和链。烷基可以被任选取代。

[0361] 术语“烷基硫代”是指S-烷基取代基，其中烷基部分可以被任选取代。烷基硫代取代基的实例包括但不限于甲硫基、乙硫基和异丙硫基。还明确地包括在术语“烷基硫代”范围内的是S-烯基或S-炔基。在所有情况下，烷基、烯烃和炔烃部分可以被任选取代。

[0362] 术语“烯基”是指含有例如2-3、2-6、2-9或2-12个碳原子和至少一个碳-碳双键的直链和支链饱和链。烯基可以被任选取代。

[0363] 术语“炔基”是指含有例如2-3、2-6、2-9或2-12个碳原子和至少一个碳-碳三键的直链和支链饱和链。炔基可以被任选取代。

[0364] 术语“人工甜味剂”和“糖替代物”是指带来甜味但是比糖具有较少的卡路里能量的食品添加剂。在一些情况下，“人工甜味剂”或“糖替代物”的卡路里能量可以忽略。

[0365] 本文中使用的术语“苦的”或“苦味”是指检测促苦味剂之后产生的感觉或味觉。以下性质可能有助于产生苦味：涩味、苦涩味、金属味、苦金属味以及变质味、余味和不希望有的味道(包括但不限于冻灼味(freezer-burn)和纸板味)，和/或这些的任何组合。应该注意的是，本领域中术语“变质味”往往与“苦味”同义。不受理论限制，苦味的多样性可能反映大量的苦味受体以及这些受体对促苦味剂的不同检测。本文中使用的苦味包括促苦味剂对苦味受体的活化。本文中使用的苦味还包括下游信号传导之后的促苦味剂对苦味受体的活化。本文中使用的苦味还包括促苦味剂刺激之后的信号传导途径的活化。本文中使用的苦味还包括由苦味受体检测促苦味剂之后的信号传导引起的感觉。本文中使用的苦味还包括由将苦味受体与促苦味剂接触之后的信号传导引起的感觉。苦味可以在脑内感觉到。

[0366] 术语“苦味受体”是指促苦味剂可以结合的受体，通常是细胞表面受体。苦味受体可能存在于口腔和/或口腔外组织中，例如遍及胃肠道(包括胃、肠和结肠)的味觉样、激素产生细胞中。苦味受体还可以存在于活体外，如存在于试验中，包括但不限于基于细胞的试验或结合试验。

[0367] 术语“促苦味剂”、“苦味配体”或“苦味化合物”是指活化苦味受体或可以被苦味受体检测和/或为受试者带来苦味感觉的化合物。“促苦味剂”还指联合起来活化苦味受体或被苦味受体检测和/或为受试者带来苦味感觉的许多化合物。“促苦味剂”还指受试者食入时经酶修饰以活化苦味受体或被苦味受体检测和/或为受试者带来苦味感觉的化合物。因为苦味感觉可能随个体不同而变化，所以与其它个体感觉的相同化合物的苦味相比，某些个体可能把“促苦味剂”描述为带来不同种类的苦味的化合物。术语促苦味剂还指带来苦味的化合物。本领域技术人员可以容易地识别并理解促苦味剂的含义。包含促苦味剂并且味苦的含有促苦味剂或物质的食物的非限制性实例包括咖啡、不甜的可可、果酱、苦瓜、啤酒、苦药、柑桔皮、蒲公英叶、菊苣、奎宁、镁盐、钙盐、钾盐、KCl、乳酸钾、乙酰磺胺酸钾、球芽甘蓝、芦笋、苦瓜(bitter gourd)、野黄瓜、芹菜、蛇麻子、甘蓝(kohlrabi)、萝卜叶、人参、南瓜、羽衣甘蓝叶、甘蓝菜(kale)、鹰爪豆碱、咖啡因、阿托品、尼古丁、脲和番木鳖碱。

[0368] 促苦味剂的其它实例包括药物。作为促苦味剂的药物的非限制性实例包括醋氨酚、氨苄青霉素、阿奇霉素、氯芬胺、西咪替丁、美沙芬、苯海拉明、红霉素、布洛芬、青霉素、保泰松、伪麻黄碱、雷尼替丁、螺内酯和茶碱，它们全部与苦味相关。

[0369] 术语“食品上或生物学上可接受的盐”是指本发明化合物的任何食品上或生物学上可接受的盐、酯或这种酯的盐,当食入时,其能够提供(直接或间接地)本发明化合物或其代谢物、残余物或部分,其特征在于能够减小由促苦味剂引起的苦味的感觉。类似地,术语“食品上或生物学上可接受的衍生物”是指本发明化合物的任何食品上或生物学上可接受的衍生物,当食入时,其能够提供(直接或间接地)本发明化合物或其代谢物、残余物或部分,其特征在于能够减小由促苦味剂引起的苦味的感觉。“可食的产品”是适于口服使用(如吃或喝)的产品。因此,食品上可接受的化合物为可食用的化合物。

[0370] 术语“消费品”是指用于个人使用和/或被受试者消耗的保健和美容产品。消费品可以以任何形式存在,包括但不限于液体、固体、半固体、片剂、胶囊、锭剂、条带、粉末、凝胶、胶、糊剂、浆液、糖浆、气溶胶和喷雾剂。消费品的非限制性实例包括保健品、营养补充剂、唇膏、润唇膏、肥皂、洗发水、胶、粘合剂(例如牙科粘合剂)、牙膏、口腔镇痛剂、呼吸清新剂、嗽口水、牙齿增白剂和其它洁齿剂。

[0371] 术语“饮食”总地来说是指受试者消耗的食品和/或饮料。受试者的“饮食”也包括受试者食入的任何消费品或药物组合物。

[0372] 术语“可食用组合物”是指通常适于通过口腔使用的组合物(不过可以通过非口服途径如吸入使用)。可食用组合物可以以任何形式存在,包括但不限于液体、固体、半固体、片剂、锭剂、粉末、凝胶、胶、糊剂、浆液、糖浆、气溶胶和喷雾剂。本文中使用的可食用组合物包括食品、药物组合物和消费品。术语可食用组合物还指例如饮食和营养补充剂。本文中使用的可食用组合物还包括放入口腔内而不吞咽的组合物,包括专业的牙科产品,如牙科治疗、填充、包装材料、模具和抛光剂。术语“食用的”是指类似的组合物并且一般作为术语“可食用的”同义词使用。

[0373] 术语“有效量”是指足以产生希望的性质或结果的量。例如,有效量的本发明化合物为能够减小与促苦味剂相关的感觉的量。术语“有效量”的本发明化合物还指当加入可食用组合物中时减小例如NaCl替代物的苦味从而允许保持所述可食用组合物的希望的咸味感觉的量。术语“有效量”的化合物还指当加入可食用组合物中时允许使食品防腐同时减小或消除与所述防腐剂中的促苦味剂相关的苦味的量。术语“有效量”还指能够减小或消除与食品中的促苦味剂或本身苦味的食品相关的苦味或余味感觉的本发明化合物的量。

[0374] 术语“味道调节剂”是指当加入可食用组合物如食品中时调节(例如掩蔽、消除、减小、降低或增加)存在于所述可食用组合物中的味道感觉(例如甜味、咸味、鲜味、酸味或苦味)的化合物或化合物的混合物。

[0375] 术语“食品”是指含有一种或多种加工的食材的任何组合物。食品包括但不限于糖果、焙烤食品(包括但不限于生面团、面包、饼干(biscuits)、饼干(crackers)、蛋糕、糕点、馅饼、蛋挞、乳蛋饼(quiches)和小甜饼)、冰淇淋(包括但不限于脉动(impulse)冰淇淋、外带冰淇淋、冷冻酸奶、意式冰激凌、冰沙(sorbet)、冰糕(sherbet)和基于黄豆、燕麦、豌豆和稻米的冰淇淋)、乳制品(包括但不限于饮用奶、奶酪、酸奶和酸牛奶饮料)、奶酪(包括但不限于天然奶酪和加工奶酪)、黄油、人造黄油、甜味和咸味点心(包括但不限于水果点心、土豆片/卷、玉米圆饼/玉米片、爆米花、卷饼、巧克力和坚果)、热饮料和冷饮料(包括但不限于饮料、饮料混合物、浓缩液、果汁、充气饮料、非充气饮料、酒精饮料、非酒精饮料、软饮料、运动饮料、等渗饮料、咖啡、茶、瓶装水、和从植物和植物提取物(包括用植物或真菌提取物作

为成分制备的冷饮料,以及以多种方式如浸渍、煎煮制备的饮料,或各种植物部分的其它提取或蒸馏方式制备的饮料,这些植物部分包括但不限于叶、花、茎、果实、根、根茎、茎、皮、挥发油或甚至是完整植物)制备的饮料)、点心棒(包括但不限于燕麦棒、麦果棒、蛋白棒、早餐棒、能量棒和水果棒)、膳食替代产品、现成食物(包括但不限于罐装食物、防腐食物、冷冻食物、干燥食物、冷藏食物、餐点组合(dinner mixes)、通心粉(macaroni)和奶酪、冷冻比萨、冷藏比萨和特制沙拉)、汤(包括但不限于类似肉汤的汤和基于奶油的汤)、肉汤、肉汁、酱、肉和鱼(包括生的、烹调的和干肉)、熟食产品(包括但不限于适于切片的肉和奶酪或预先切片的肉和奶酪,例如火鸡、鸡、火腿、波洛尼亚香肠(bologna)、萨拉米香肠(salami)、啤酒香肠(bierwurst)、意大利头颈肉香肠(capicola)、西班牙辣香肠(chorizo)、咸牛肉、荷兰式肉卷(dutch loaf)、西班牙塞拉诺火腿(Serrano)、意大利熏火腿(prosciutto)、猪头肉冻(head cheese)、肝香肠、烘肉卷(包括橄榄烘肉卷、胡椒烘肉卷、辣椒烘肉卷以及火腿和奶酪烘肉卷)、摩泰台拉香肚(mortadella)、熏牛肉、意大利香肠(pepperoni)、烤牛肉、烤猪肉、大红肠(saucisson)、熏肉、夏季香肠、口条、美国奶酪、蓝奶酪、车达奶酪(cheddar cheese)、科尔奶酪(Colbycheese)、科尔比-杰克奶酪(Colby-Jack cheese)、豪达奶酪(gouda)、蒙特瑞杰克奶酪(Monterey Jack cheese)、明斯特奶酪(muenster cheese)、马苏里拉奶酪(mozzarella)、帕尔马奶酪(parmigiano cheese)、胡椒杰克奶酪(pepper jack cheese)、熏干酪(provolone)、罗马奶酪(romanocheese)、线奶酪(string cheese)、喷雾奶酪(spray cheese)和瑞士奶酪(swiss cheese))、蔬菜(包括但不限于生的、腌的、煮的和干蔬菜如炸薯条)、水果(包括生的、煮的和干水果)、谷物(包括但不限于干谷类和面包)、预加工食品(包括但不限于干的、罐装的或坛装的酱和汤)、快餐食品、意大利面(pasta)(包括但不限于新鲜意大利面、冷藏意大利面、冷冻意大利面、干意大利面和通心粉)、面条(包括但不限于鸡蛋面条、小麦面条、稻米面条、绿豆面条、马铃薯面条、荞麦面条、玉米面条、绿豆面条、炒面、意大利宽面条(fettuccini)、螺丝粉(fusilli)、意大利面疙瘩(gnocchi)、意大利千层面(lasagna)、黄油宽面(linguini)、捞面(lo mein)、通心粉、袖筒面(manicotti)、泰式炒河粉(pad thai)、短管状通心面(penne、ramen)、米粉(rice vermicelli)、粗通心面(rigatoni)、荞麦面(soba)、意大利式细面条(spaghetti)、面疙瘩(spatzle)、乌冬面(udon)和细管面(ziti))、罐头食品、冷冻食品、干燥食品、冷藏食品、油和脂肪、婴儿食品、涂抹食品(spreads)、沙拉、谷类(包括但不限于热的和冷的谷类)、酱(包括但不限于奶酪酱(例如,用于通心粉和奶酪)番茄酱、番茄糊、汤粉块、浓缩固体汤料(stock cubes)、食用酱、男孩用酱(boys bases sauces)、意大利面酱、烹调酱、腌泡汁、干酱、粉末混合物、调味酱、蛋黄酱(mayonnaises)、沙拉汁、油醋汁(vinegrettes)、芥末和蘸酱(dips))、果冻(jellies)、果酱、防腐剂、蜂蜜、布丁、秘方混合物、糖浆、糖衣(icings)、填充物、灌注食物、盐防腐食物、醋渍食物和辛辣料(如调味酱、芥末和肉排酱)。在一些实施方案中,所述食品为动物饲料。例如,所述食品可以为宠物食品,即用于家庭宠物消费的食品。在其它实施方案中,所述食品为家畜食品,即用于家畜消费的食品。

[0376] 术语“食材”是指用于制备食品的未加工的成分或含有基本营养剂或味道的要素。食材的非限制性实例包括:水果、蔬菜、肉、鱼、谷物、奶、蛋、块茎、糖、甜味剂、油、香草、点心、酱、香料和盐。

[0377] 术语“卤代”或“卤素”是指氟、氯、溴或碘取代基。

[0378] 术语“百万分率”和“ppm”在食品工业中是指溶液的低浓度。例如，在1000ml溶剂中有1克溶质的浓度为1000ppm，在1000ml溶剂中有千分之一克(0.001g)溶质的浓度为1ppm。因此，1毫克每升(即1mg/L)的浓度等于1ppm。

[0379] 术语“苦味的感觉”、“咸味的感觉”、“味道的感觉”和类似术语是指受试者对特定的味道或滋味的感觉。

[0380] 术语“药物活性成分”是指在药物组合物中有生物活性的化合物。

[0381] 术语“钾盐”是指其中钾为阳离子的盐。在本发明的范围中钾盐优选为可食用的钾盐，包括但不限于乙酰磺胺酸钾(Ace K)、硫酸铝钾、鸟苷酸二钾、肌苷酸二钾、谷氨酸一钾、醋酸钾、酒石酸氢钾(potassium acid tartate)、酒石酸氢钾、己二酸钾、藻酸钾、硅酸铝钾、抗坏血酸钾、天冬氨酸钾、苯甲酸钾、碳酸氢钾、硫酸氢钾、亚硫酸氢钾、溴酸钾、碳酸钾、氯化钾、柠檬酸钾、柠檬酸二氢钾、磷酸二氢钾、亚铁氰化钾、富马酸钾、赤霉酸钾、葡萄糖酸钾、氢氧化钾、亚硫酸氢钾、碘化钾、乳酸钾、苹果酸钾、焦亚硫酸钾、硝酸钾、亚硝酸钾、过硫酸钾、磷酸钾(二碱)、磷酸钾(单碱)、磷酸钾(三碱)、聚偏磷酸钾、聚磷酸钾、焦磷酸钾、丙酸钾、糖精钾、酒石酸钠钾(例如L(+)-酒石酸钠钾)、山梨酸钾、硫酸钾、亚硫酸钾和三聚磷酸钾。

[0382] 术语“加工的食材”是指已经经受改变其原始状态(排除例如收获、屠宰和清洗)的任何加工的食材。加工食物的方法的实例包括但不限于除去不必要的外层，如马铃薯去皮或桃去皮；切碎或切片；剁碎或浸渍；液化，如生产果汁；发酵(例如啤酒)；乳化；蒸煮，如煮沸、煎、炸、加热、蒸或烧烤；油炸；烘焙；混合；增加气体如面包加气或软饮料的充气；醒发(proofing)；调味(例如用香草、香料、盐)；喷雾干燥；巴氏灭菌；包装(例如罐装或装箱)；挤压；膨胀；掺混；以及防腐(例如添加盐、糖、乳酸钾或其它防腐剂)。

[0383] 术语“代替”是指在例如可食用组合物(如食品)或其制备中用一种化合物替代另一种化合物。其包含完全和部分代替。

[0384] 术语“咸味”是指例如由碱金属盐的离子(例如氯化钠中的 Na^+ 和 Cl^-)引起的味道。引起咸味的组合物的非限制性实例包括食盐(氯化钠)、海水、海盐和氯化钾。组合物的咸味的量或咸度可以通过例如味道试验来确定。

[0385] 术语“钠”或“钠盐”是指食入或另外被受试者消耗的钠(即钠盐)的量。一般来讲，“钠”或“钠盐”是指其中钠为阳离子的盐或化合物。在本发明的范围中的钠盐包括但不限于硫酸铝钠、EDTA二钠钙、琥珀酸二异辛酯磺酸钠、5'-核糖核苷酸二钠、乙二胺四乙酸二钠、鸟苷酸二钠、肌苷酸二钠、醋酸钠、谷氨酸一钠(MSG)、酒石酸钠钾、焦磷酸氢钠、己二酸钠、海藻酸钠、铝硅酸钠、磷酸钠铝(酸性)、磷酸钠铝(碱性)、抗坏血酸钠、苯甲酸钠、碳酸氢钠、硫酸氢钠、亚硫酸氢钠、碳酸钠、羧甲基纤维素钠、酪蛋白酸钠、氯化钠、柠檬酸钠、甜蜜素、脱氢醋酸钠、二醋酸钠、脱氢醋酸钠、柠檬酸二氢钠、磷酸二氢钠、DL-苹果酸钠、异抗坏血酸钠、异抗坏血酸钠(sodium erythorbate)、对-羟基苯甲酸乙酯钠、焦磷酸铁钠、亚铁氰化钠、甲酸钠、富马酸钠、葡萄糖酸钠、碳酸氢钠、DL-苹果酸氢钠、醋酸氢钠、亚硫酸氢钠、氢氧化钠、次磷酸钠、酒石酸钠(例如L(+)-酒石酸钠)、乳酸钠、十二烷基硫酸钠、苹果酸钠、焦亚硫酸钠、偏磷酸钠、对-羟基苯甲酸甲酯钠、硝酸钠、亚硝酸钠、O-苯基苯酚钠、磷酸钠(二碱价)、磷酸钠(单碱价)、磷酸钠(三碱价)、聚磷酸钠、酒石酸钾钠、丙酸钠、对-羟基苯甲酸丙酯钠、焦磷酸钠、糖精钠、倍半碳酸钠、硬脂酰乳酸钠、硬脂基富马酸钠、琥珀酸钠、硫酸钠和辛烯

基琥珀酸淀粉钠。

[0386] 术语“钠摄入”是指食入或另外被受试者消耗的钠的量。

[0387] 在化学结构的范围中术语“稳定性”或“稳定的”是指系统处于其最低能量状态或与其环境处于化学平衡时的化学状态。因此,稳定化合物(或例如,含有若干稳定的原子或取代基的化合物)在环境中或在正常使用期间反应性不是特别强,并且在其预期的有用性的时间跨度中保持其有用的性质。

[0388] 术语“受试者”是指哺乳动物。在优选实施方案中,受试者为人。在一些实施方案中,受试者为驯养动物或实验室动物,包括但不限于家庭宠物,如犬、猫、猪、兔、大鼠、小鼠、沙鼠、仓鼠、豚鼠和雪貂。在一些实施方案中,受试者为家畜动物。家畜动物的非限制性实例包括:羊驼、野牛、骆驼、家牛、鹿、猪、马、美洲驼、骡子、驴、绵羊、山羊、兔、驯鹿和牦牛。

[0389] 术语“糖”是指产生甜味的基本味觉的简单的碳水化合物。糖的非限制性实例包括葡萄糖、果糖、半乳糖、蔗糖、乳糖和麦芽糖。

[0390] 术语“甜味”是指由例如糖引起的味道。引起甜味的组合物的非限制性实例包括葡萄糖、蔗糖、果糖、糖精、环磺酸盐、阿斯巴甜、乙酰磺胺酸钾、三氯蔗糖、阿力甜(alitame)和纽甜(neotame)。组合物的甜味的量或甜度可以通过例如味道试验来确定。

[0391] 脂肪族基团可含有一个或多个取代基。脂肪族基团的饱和或不饱和碳上的合适的取代基的实例包括但不限于,卤素、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{R}'$ 、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SR}'$ 、保护的OH(如酰氧基)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}'$ 、 $-\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NHCOR}'$ 、 $-\text{NHCONH}_2$ 、 $-\text{NHCONHR}'$ 、 $-\text{NHCON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NRCOR}'$ 、 $-\text{NHCOR}_2\text{H}$ 、 $-\text{NHCOR}_2\text{R}'$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{COR}'$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CONHR}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{H}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}'$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_3\text{R}'$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}'$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NHR}'$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{H}$ 、或 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}'$ 、 $=\text{O}$ 、 $=\text{S}$ 、 $=\text{NNHR}'$ 、 $=\text{NN}(\text{R}')_2$ 、 $=\text{NOR}'$ 、 $=\text{NNHCOR}'$ 、 $=\text{NNHCO}_2\text{R}'$ 、 $=\text{NNHSO}_2\text{R}'$ 、 $=\text{N-CN}$ 、或 $=\text{NR}'$,其中 R' 选自H、脂肪族基、碳环基、杂环基、芳基、芳烷基、杂芳基、或杂芳烷基并且每一个 R' 任选被一个或多个卤素、硝基、氰基、氨基、 $-\text{NH}$ -(未取代的脂肪族基)、 $-\text{N}$ -(未取代的脂肪族基) $_2$ 、羧基、氨基甲酰基、羟基、 $-\text{O}$ -(未取代的脂肪族基)、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{S}$ -(未取代的脂肪族基)、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ 、未取代的脂肪族基、未取代的碳环基、未取代的杂环基、未取代的芳基、未取代的芳烷基、未取代的杂芳基、或未取代的杂芳烷基取代。通过本说明书的指导,合适的取代基的选择在本领域技术人员知识范围之内。

[0392] 如本文所定义的,本发明化合物意欲包括化合物的所有立体化学形式,包括几何异构体(即E、Z)和旋光异构体(即R、S)。单一立体化学异构体以及本发明化合物的对映体和非对映体混合物在本发明的范围之内。除非另外说明,否则在本文中描述的化学式也表示包括仅在一种或多种同位素富集的原子存在下不同的化合物。例如,除了氢被氘或氚替换或碳被 ^{13}C 或 ^{14}C 富集的碳替换的具有本发明化学式的化合物在本发明的范围之内。

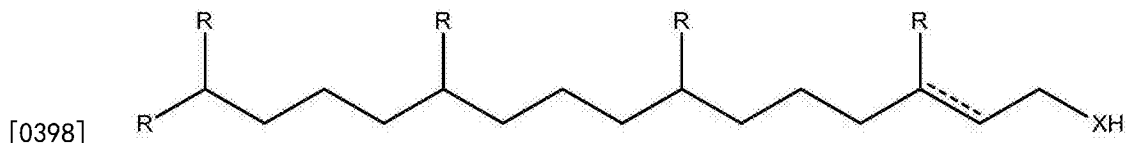
[0393] 本发明提供包含本发明化合物的可食用组合物(包括含有所述化合物的食品、消费产品和药物组合物)以及制备这些组合物的方法。本发明还提供降低食品中的钠(例如NaCl或乳酸钠)或糖的量的方法、减少饮食中的钠或糖摄入的方法、减小苦味的方法和减小苦味受体活性的方法。本发明还包括通过用含有钾的化合物或组合物代替含有钠的化合物或组合物来降低可食用组合物或饮食中的钠的量。本发明还包括通过用含有钾的甜味剂(如乙酰磺胺酸钾)代替糖来降低可食用组合物或饮食中的糖的量。

[0394] 可食用组合物

[0395] 根据一个方面,本发明提供包含用于减小促苦味剂的苦味的本发明化合物的可食用组合物。

[0396] 明确地涵盖在本文的该部分和任何部分中公开的化合物的所有立体化学形式,包括几何异构体(即E、Z)和旋光异构体(即R、S)。还明确地涵盖在本文的该部分和任何部分中公开的化合物的单一立体化学异构体以及对映体和非对映体的混合物。

[0397] 在一些实施方案中,本发明提供用于减小促苦味剂的苦味的可食用组合物,其中所述组合物包含支链烯烃化合物。本发明的支链烯烃化合物能够减小或消除促苦味剂的苦味。在一些实施方案中,所述支链烯烃化合物具有小于约1000、500、或300道尔顿的分子量。在某些实施方案中,所述支链烯烃化合物为式(I)的化合物:



式(I);

[0399] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体,

[0400] 其中,当化合价和稳定性允许时:

[0401] X为S或O;

[0402] 每一个R独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;且

[0403] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键;

[0404] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味。

[0405] 根据式(I)的化合物的一些实施方案,

[0406] 当化合价和稳定性允许时:

[0407] X为S或O;

[0408] 每一个R独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;且

[0409] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。

[0410] 根据式(I)的化合物的一些实施方案,

[0411] 当化合价和稳定性允许时:

[0412] X为O;

[0413] 每一个R独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;且

[0414] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。

[0415] 根据式(I)的化合物的一些实施方案,

[0416] 当化合价和稳定性允许时:

[0417] X为S或O;

[0418] 每一个R独立地为H或C₁-C₃烷基;且

[0419] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。

[0420] 根据式(I)的化合物的一些实施方案,

[0421] 当化合价和稳定性允许时:

[0422] X为O;

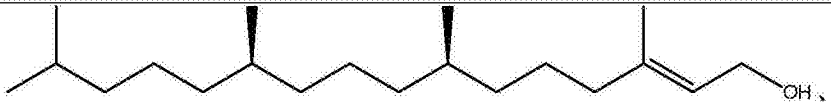
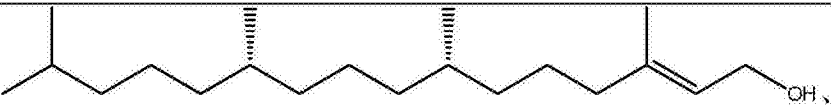
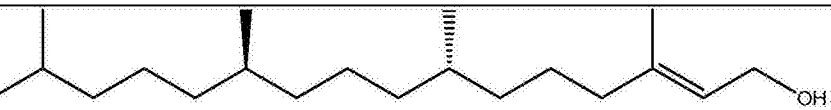
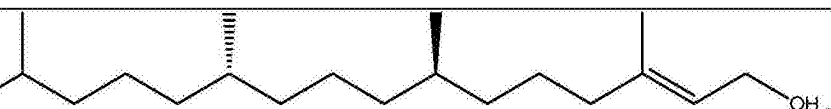
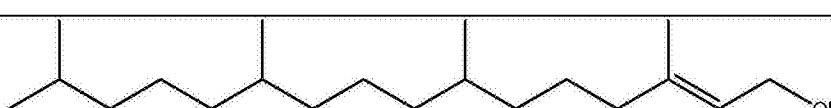
[0423] 每一个R独立地为H或C₁-C₃烷基;且

[0424] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。

[0425] 在某些实施方案中,式(I)化合物包括虚线键所处位置的E-双键。在其它实施方案中,式(I)化合物包括虚线键所处位置的Z-双键。在其它的实施方案中,式(I)化合物包括虚线键所处位置的E/Z-双键的混合物。在又一些另外的实施方案中,式(I)化合物不包括虚线键所处位置的双键。

[0426] 在某些实施方案中,式(I)化合物为:

[0427]

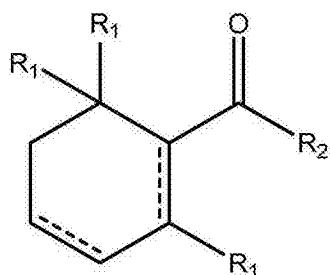
化合物1	
化合物2	
化合物3	
化合物4	
化合物5	 (Aldrich目录号W502200),

[0428] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0429] 如果使用本发明化合物的食品上或生物学上可接受的盐,那么这种盐优选衍生自无机或有机酸和碱。这些盐的实例包括但不限于衍生自适当的碱的盐,包括碱金属(例如钠和钾)、碱土金属(例如镁)、铵和 N^+ (C_{1-4} 烷基)₄盐。

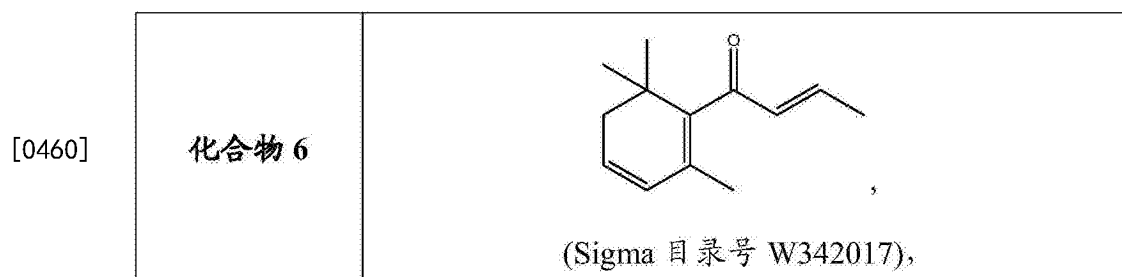
[0430] 在一些实施方案中,本发明提供用于减小促苦味剂的苦味的可食用组合物,其中所述组合物包含基于环己二烯的化合物。本发明的基于环己二烯的化合物能够减小或消除促苦味剂的苦味。在一些实施方案中,所述基于环己二烯的化合物具有小于约1000、500、300或200道尔顿的分子量。在某些实施方案中,所述基于环己二烯的化合物为式(II)化合物:

[0431]



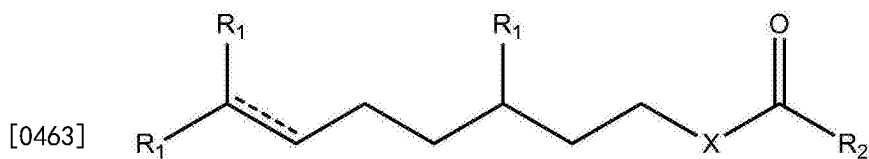
式(II);

- [0432] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体，
- [0433] 其中，当化合价和稳定性允许时：
- [0434] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基；
- [0435] R₂为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基；且
- [0436] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键；
- [0437] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味。
- [0438] 根据式 (II) 化合物的一些实施方案，
- [0439] 当化合价和稳定性允许时：
- [0440] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基；
- [0441] R₂为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基；且
- [0442] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。
- [0443] 根据式 (II) 化合物的一些实施方案，
- [0444] 当化合价和稳定性允许时：
- [0445] 每一个R₁独立地为H或C₁-C₃烷基；
- [0446] R₂为H、C₁-C₃烷基或C₂-C₃烯基；且
- [0447] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。
- [0448] 根据式 (II) 化合物的一些实施方案，
- [0449] 当化合价和稳定性允许时：
- [0450] 每一个R₁独立地为H或C₁-C₃烷基；
- [0451] R₂为H或C₂-C₃烯基；且
- [0452] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键。
- [0453] 根据式 (II) 化合物的一些实施方案，
- [0454] 当化合价和稳定性允许时：
- [0455] 每一个R₁独立地为H或C₁-C₃烷基；
- [0456] R₂为H或C₂-C₃烯基；且
- [0457] 每一条虚线为碳-碳双键。
- [0458] 在式 (II) 化合物的某些实施方案中，环外双键为E-双键。在式 (II) 化合物的其它实施方案中，环外双键为Z-双键。在其它的实施方案中，式 (II) 化合物包括E/Z-环外双键的混合物。在又一些另外的实施方案中，式 (II) 化合物不包括环外双键。
- [0459] 在某些实施方案中，式 (II) 化合物为：



- [0461] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。
- [0462] 在一些实施方案中，本发明提供用于减小促苦味剂的苦味的可食用组合物，其中所述组合物包含支链烯烃酯化合物。本发明的支链烯烃酯化合物能够减小或消除促苦味剂

的苦味。在一些实施方案中,所述支链烯酯化合物具有小于约1000、500或300道尔顿的分子量。在某些实施方案中,烯酯化合物为式(III)化合物:



式(III);

[0464] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体,

[0465] 其中,当化合价和稳定性允许时:

[0466] X=S或O;

[0467] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;

[0468] R₂为H、C₁-C₁₀烷基、C₂-C₁₀烯基或C₂-C₁₀炔基;且

[0469] 所述虚线键表示任选的碳-碳双键;

[0470] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味。

[0471] 根据式(III)化合物的一些实施方案,

[0472] 当化合价和稳定性允许时:

[0473] X=S或O;

[0474] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;

[0475] R₂为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;且

[0476] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0477] 根据式(III)化合物的一些实施方案,

[0478] 当化合价和稳定性允许时:

[0479] X=S或O;

[0480] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;

[0481] R₂为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;且

[0482] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0483] 根据式(III)化合物的一些实施方案,

[0484] 当化合价和稳定性允许时:

[0485] X=O;

[0486] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;

[0487] R₂为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;且

[0488] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0489] 根据式(III)化合物的一些实施方案,

[0490] 当化合价和稳定性允许时:

[0491] X=S或O;

[0492] 每一个R₁独立地为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;

[0493] R₂为H、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基或C₂-C₄炔基;且

[0494] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0495] 根据式(III)化合物的一些实施方案,

[0496] 当化合价和稳定性允许时:

[0497] $X=O$;

[0498] 每一个 R_1 独立地为H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基;

[0499] R_2 为H、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基或 C_2-C_4 炔基;且

[0500] 所述虚线表示任选的碳-碳双键。

[0501] 根据式(III)化合物的一些实施方案,

[0502] 当化合价和稳定性允许时:

[0503] $X=O$;

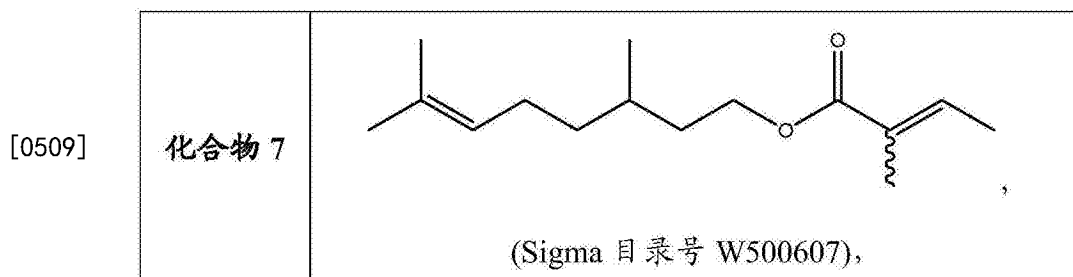
[0504] 每一个 R_1 独立地为H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基或 C_2-C_3 炔基;

[0505] R_2 为H、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基或 C_2-C_4 炔基;且

[0506] 所述虚线为碳-碳双键。

[0507] 在某些实施方案中,式(III)化合物包括虚线键所处位置的E-双键。在其它实施方案中,式(III)化合物包括虚线键所处位置的Z-双键。在其它的实施方案中,式(III)化合物包括虚线键所处位置的E/Z-双键的混合物。在又一些另外的实施方案中,式(III)化合物不包括虚线键所处位置的双键。

[0508] 在某些实施方案中,式(III)化合物为:

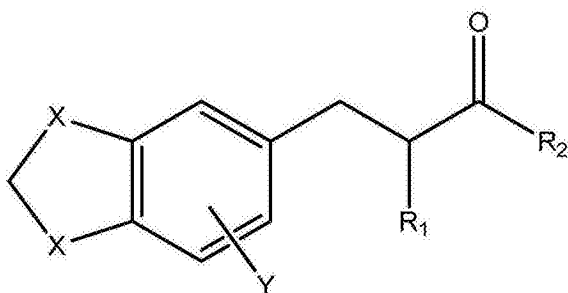


[0510] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0511] 如果使用本发明化合物的食品上或生物学上可接受的盐,那么这种盐优选衍生自无机或有机酸和碱。这些盐的实例包括但不限于衍生自适当的碱的盐,包括碱金属(例如钠和钾)、碱土金属(例如镁)、铵和 N^+ (C_{1-4} 烷基)₄盐。

[0512] 在一些实施方案中,本发明提供用于减小促苦味剂的苦味的可食用组合物,其中所述组合物包含基于苯并间二氧杂环戊烯的化合物。本发明的基于苯并间二氧杂环戊烯的化合物能够减小或消除促苦味剂的苦味。在一些实施方案中,基于苯并间二氧杂环戊烯的化合物具有小于约1000、500、300或200道尔顿的分子量。在某些实施方案中,基于苯并间二氧杂环戊烯的化合物为式(IV)化合物:

[0513]



式(IV);

[0514] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体,

[0515] 其中,当化合价和稳定性允许时:

[0516] 每一个X独立地为S或O;

[0517] Y=H或卤素;

[0518] R₁为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;且[0519] R₂为H、C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基或C₂-C₆炔基;

[0520] 其中所述组合物是可食用的并且能够减小促苦味剂的苦味。

[0521] 根据式(IV)化合物的一些实施方案,

[0522] 当化合价和稳定性允许时:

[0523] 每一个X独立地为S或O;

[0524] Y=H或卤素;

[0525] R₁为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;且[0526] R₂为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基。

[0527] 根据式(IV)化合物的一些实施方案,

[0528] 当化合价和稳定性允许时:

[0529] 每一个X独立地为S或O;

[0530] Y=H或卤素;

[0531] R₁为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;且[0532] R₂为H或C₁-C₃烷基。

[0533] 根据式(IV)化合物的一些实施方案,

[0534] 当化合价和稳定性允许时:

[0535] X=O;

[0536] Y=H;

[0537] R₁为H、C₁-C₃烷基、C₂-C₃烯基或C₂-C₃炔基;且[0538] R₂为H或C₁-C₃烷基。

[0539] 根据式(IV)化合物的一些实施方案,

[0540] 当化合价和稳定性允许时:

[0541] X=O;

[0542] Y=H;

[0543] R₁为H或C₁-C₃烷基;且

[0544] R_2 为H或C₁-C₃烷基。

[0545] 根据式 (IV) 化合物的一些实施方案，

[0546] 当化合价和稳定性允许时：

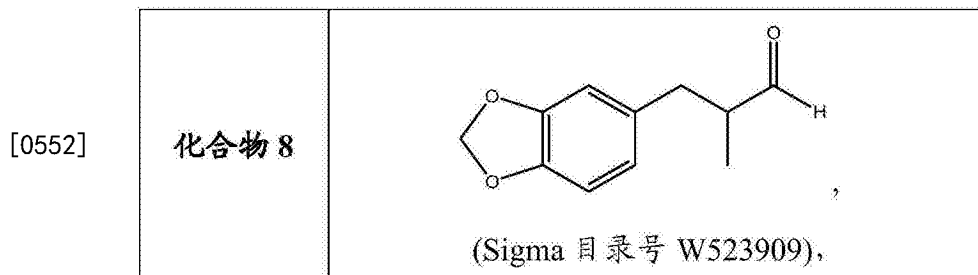
[0547] $X=O$ ；

[0548] $Y=H$ ；

[0549] R_1 为H或C₁-C₃烷基；且

[0550] R_2 为H。

[0551] 在某些实施方案中，式 (IV) 化合物为：



[0553] 或其食品上或生物学上可接受的盐或衍生物、或其对映异构体或非对映异构体。

[0554] 如果使用本发明化合物的食品上或生物学上可接受的盐，那么这种盐优选衍生自无机或有机酸和碱。这些盐的实例包括但不限于衍生自适当的碱的盐，包括碱金属（例如钠和钾）、碱土金属（例如镁）、铵和 N^+ (C₁₋₄烷基)₄盐。

[0555] 本发明的另一方面提供包含以下的可食用组合物：a) 本发明化合物；和b) 促苦味剂。在一些实施方案中，所述化合物为具有小于约1000、500或300道尔顿的分子量的化合物。在某些实施方案中，所述化合物为本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合。在一些实施方案中，本发明化合物为选自本文中描述的化合物1-8、或其组合的化合物。

[0556] 在一些实施方案中，存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中，存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中，存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中，存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为KCl。在其它实施方案中，存在于所述可食用组合物中的促苦味剂为乳酸钾。

[0557] 在另一个实施方案中，所述可食用组合物包含a) 本发明化合物；和b) 钾盐。在一些实施方案中，所述钾盐为KCl或乳酸钾。在特定实施方案中，所述钾盐为KCl。在某些实施方案中，所述化合物为本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合。在一些实施方案中，本发明化合物为选自本文中描述的化合物1-8、或其组合的化合物。

[0558] 在一些实施方案中，所述可食用组合物进一步包含钠盐。在一些实施方案中，所述可食用组合物进一步包含NaCl。在一些实施方案中，所述可食用组合物进一步包含乳酸钠。在一些实施方案中，所述可食用组合物进一步包含糖。

[0559] 在一些实施方案中，所述可食用组合物进一步包含选自由防腐剂、营养剂、调味剂或其它味道调节剂（其本身可能没有味道）组成的组的一种或多种其它组分。

[0560] 在一些实施方案中，所述可食用组合物进一步包含一种或多种乳化剂。在食品领域中通常使用基于钠和钾的乳化剂作为乳化剂。基于钠的乳化剂包括例如脂肪酸的钠盐、

海藻酸钠、磷酸钠铝、酪蛋白酸钠、偏磷酸钠、磷酸钠(二碱价)、磷酸钠(单碱价)、磷酸钠(三碱价)、聚磷酸钠、焦磷酸钠和硬脂酰乳酸钠。基于钾的乳化剂包括例如脂肪酸的钾盐、藻酸钾、柠檬酸钾、磷酸钾(二碱价)、磷酸钾(单碱价)、磷酸钾(三碱价)、多聚磷酸钾、聚偏磷酸钾和焦磷酸钾。因此,本发明的一些实施方案包括用基于钾的乳化剂代替基于钠的乳化剂以及添加本发明化合物。

[0561] 在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含表面活性剂以增加或降低本发明化合物的有效性。合适的表面活性剂包括但不限于非离子表面活性剂(例如单甘油酯和二甘油酯、脂肪酸酯、失水山梨醇酯、丙二醇酯和乳酸酯)、阴离子表面活性剂(例如磺基琥珀酸酯和卵磷脂)和阳离子表面活性剂(例如季铵盐)。

[0562] 在所述可食用组合物进一步包含防腐剂的一些实施方案中,所述防腐剂增加所述可食用组合物的保存期限。合适的防腐剂包括但不限于抗坏血酸、苯甲酸、对羟基苯甲酸丁酯、苯甲酸钙、EDTA二钠钙、亚硫酸氢钙、丙酸钙、山梨酸钙、壳聚糖、硫酸铜、脱氢乙酸、焦碳酸二乙酯、二碳酸二甲酯、EDTA二钠、E-聚赖氨酸甘氨酸、异抗坏血酸、对羟基苯甲酸乙酯、甲酸、橡胶树脂、对羟基苯甲酸庚酯、日柏酚、对羟基苯甲酸异丁酯、日本安息香提取物、对羟基苯甲酸甲酯、鱼精蛋白提取物、纳他霉素(natamycin)、乳酸链球菌素、果胶提取物、2-苯基苯酚、匹马菌素(pimaricin)、醋酸钾、苯甲酸钾、乳酸钾、焦亚硫酸钾、硝酸钾、亚硝酸钾、焦亚硫酸钾、山梨酸钾、亚硫酸钾、丙酸、对羟基苯甲酸丙酯、对氧基苯甲酸丙酯、环氧丙烷、对羟基苯甲酸丙酯、苯甲酸钠、亚硫酸氢钠、脱氢醋酸钠、二醋酸钠、异抗坏血酸钠、亚硫酸氢钠、次磷酸钠、硫代硫酸钠、焦亚硫酸钠、硝酸钠、亚硝酸钠、邻苯基苯酚钠、丙酸钠、焦亚硫酸钠、亚硫酸钠、硫氰酸钠、山梨酸和二氧化硫。在一些实施方案中,所述防腐剂具有苦味。

[0563] 在一些实施方案中,所述组合物可以进一步包含选自由流动剂、加工剂、糖、氨基酸、其它核苷酸和有机酸的钠或钾盐(如柠檬酸盐和酒石酸盐)组成的组的一种或多种其它组分。这些其它成分可以增加味道或有助于所述可食用组合物的掺混、加工或流动特性。

[0564] 在一些实施方案中,本发明化合物的释放速率受调节。本发明化合物的释放速率可以通过例如改变其在水中的溶解度来调整。可以通过用具有高水溶解度的材料包封本发明化合物来实现迅速的释放。本发明化合物的延缓释放可以通过用具有低水溶解度的材料包封本发明化合物来实现。本发明化合物可以与碳水化合物或掩蔽促味剂如甜味剂一同包封。本发明化合物的释放速率还可以通过包封的程度来调节。在一些实施方案中,本发明化合物被完全地包封。在其它实施方案中,本发明化合物被部分包封。在一些实施方案中,所述释放速率受控制以便与所述促苦味剂一起释放。

[0565] 本发明的可食用组合物根据本领域熟知的技术来制备。一般来讲,本发明的可食用组合物通过将可食用组合物的组分或成分与本发明化合物一起混合来制备。或者,可以将本发明化合物直接添加到所述可食用组合物中。在一些实施方案中,同时或依次添加促苦味剂与本发明化合物。如果依次添加,可以在本发明化合物之前或之后添加促苦味剂。在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0566] 在可食用组合物中使用的本发明化合物和促苦味剂的量取决于各种因素,包括组合物的目的和希望的或可接受的苦味、盐味或甜味的感觉。所述量可取决于可食用组合物

的性质、添加的特定化合物、促苦味剂、存在于所述组合物中的其它化合物、制备方法(包括使用的热量)以及所述可食用组合物的pH。应理解的是,本领域技术人员知道如何确定产生一种或多种希望的味道所需的量。

[0567] 一般而言,存在于可食用组合物中的本发明化合物的浓度介于约0.001ppm和1000ppm之间。在一些实施方案中,所述可食用组合物包含介于约0.005至500ppm;0.01至100ppm;0.05至50ppm;0.1至5ppm;0.1至10ppm;1至10ppm;1至30ppm;1至50ppm;10至30ppm;10至50ppm;或30至50ppm之间的本发明化合物。在又一些其它实施方案中,所述可食用组合物包含约0.1至30ppm、1至30ppm或1至50ppm的本发明化合物。在另外的实施方案中,所述可食用组合物包含约0.1至5ppm;0.1至4ppm;0.1至3ppm;0.1至2ppm;0.1至1ppm;0.5至5ppm;0.5至4ppm;0.5至3ppm;0.5至2ppm;0.5至1.5ppm;0.5至1ppm;5至15ppm;6至14ppm;7至13ppm;8至12ppm;9至11ppm;25至35ppm;26至34ppm;27至33ppm;28至32ppm;或29至31ppm。

[0568] 在又一些其它实施方案中,所述可食用组合物包含约0.1ppm、约0.5ppm、约1ppm、约2ppm、约3ppm、约4ppm、约5ppm、约6ppm、约7ppm、约8ppm、约9ppm、或约10ppm的本发明化合物。在其它实施方案中,所述可食用组合物包含约11ppm、约12ppm、约13ppm、约14ppm、约15ppm、约16ppm、约17ppm、约18ppm、约19ppm、约20ppm、约21ppm、约22ppm、约23ppm、约24ppm、约25ppm、约26ppm、约27ppm、约28ppm about, 29ppm、或约30ppm的本发明化合物。

[0569] 在又一些其它实施方案中,所述可食用组合物包含约31ppm、约32ppm、约33ppm、约34ppm、约35ppm、约36ppm、约37ppm、约38ppm、约39ppm、约40ppm、约41ppm、约42ppm、约43ppm、约44ppm、约45ppm、约46ppm、约47ppm、约48ppm、约49ppm、或约50ppm的本发明化合物。

[0570] 在其它实施方案中,所述可食用组合物包含大于约0.5ppm、1ppm、5ppm、10ppm、15ppm、20ppm、25ppm、或30ppm的本发明化合物,最多例如约30ppm或50ppm。在另外的实施方案中,所述可食用组合物包含小于约50ppm、30ppm、25ppm、20ppm、15ppm、10ppm、5ppm、1ppm、或0.5ppm的本发明化合物。在又一些另外的实施方案中,所述可食用组合物包含小于约30ppm、10ppm、或1ppm的本发明化合物。

[0571] 当所述可食用组合物包含KCl时,KCl的量将取决于可食用组合物的性质、希望感觉到的咸度和组合物中存在的其它化合物而变化。在一些实施方案中,存在的KCl的浓度介于约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;或1-2%w/w。在一些实施方案中,存在的KCl的浓度为约0.5%w/w、约1%w/w、约1.5%w/w、约2%w/w、约2.5%w/w、约3%w/w、约3.5%w/w、约4%w/w、约4.5%w/w、或约5%w/w。在一些实施方案中,存在的KCl的浓度为最多约0.5%w/w、最多约1%w/w、最多约1.5%w/w、最多约2%w/w、最多约2.5%w/w、最多约3%w/w、最多约3.5%w/w、最多约4%w/w、最多约4.5%w/w、最多约5%w/w、最多约6%w/w、最多约7%w/w、最多约8%w/w、最多约9%w/w、最多约10%w/w、最多约11%w/w、最多约12%w/w、最多约13%w/w、最多约14%w/w、或最多约15%w/w。在一些实施方案中,存在的KCl的浓度为约2%w/w。

[0572] 在一些实施方案中,将KCl以足以代替NaCl的量作为盐替代物加入所述可食用组合物中。例如,在所述可食用组合物中的KCl的量取决于应用可以在被代替的NaCl的约0.5至约1.5倍范围内,例如,如果约0.5mg NaCl被代替,那么就添加0.25至约0.75mg KCl。通

常,添加的KCl与被代替的NaCl的重量相同。

[0573] 类似地,当所述可食用组合物包含乳酸钾时,添加的乳酸钾的量取决于可食用组合物的性质、防腐需要的量和所述组合物中存在的其它化合物而变化。存在的乳酸钾的浓度可以介于约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或1-2%w/w之间。

[0574] 在一些实施方案中,以足以代替乳酸钠的量将乳酸钾加入所述可食用组合物中。例如,乳酸钠替代物添加之后的食品或饮料中的乳酸钾的量取决于应用可以在被代替的乳酸钠的约0.5至约1.5倍范围内,例如,如果约0.5mg乳酸钠被代替,就添加约0.25至约0.75mg乳酸钾。通常地,添加的乳酸钾与被代替的乳酸钠的重量相同。

[0575] 此外,当所述可食用组合物包含人工甜味剂如乙酰磺胺酸钾时,添加的甜味剂的量取决于所述可食用组合物的性质、需要的甜味的量和所述组合物中存在的其它化合物而变化。例如,存在的乙酰磺胺酸钾的浓度可以介于约1-200ppm、10-200ppm、50-150ppm、50-125ppm、75-125ppm和75-100ppm之间,优选约75ppm。

[0576] 在一些实施方案中,加入所述可食用组合物的人工甜味剂的量足以代替糖。在一些实施方案中,所述人工甜味剂具有苦味或余味。在一些实施方案中,所述人工甜味剂为乙酰磺胺酸钾。例如,在所述可食用组合物中的乙酰磺胺酸钾的量取决于应用可以在被代替的糖的约0.001至约0.01倍范围内,例如,如果代替约100mg糖,就添加约0.1至约1mg乙酰磺胺酸钾。通常地,以被代替的糖的量的约0.005倍添加乙酰磺胺酸钾。

[0577] 在一些实施方案中,所述可食用组合物包含在包装中。在一些实施方案中,所述可食用组合物为散装包装,其中所述包装包含比通常用于单个盘子或提供食品或饮料更多的组合物。这些散装包装可以是纸袋、塑料袋或布袋或纸板盒或桶的形式。这些散装包装可以配有塑料或金属出口以便于分配所述可食用组合物。

[0578] 在一些实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物和促苦味剂的可食用组合物。在一些实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物和苦味的盐的可食用组合物。在一些实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物和钾盐、镁盐或钙盐的可食用组合物。在一些实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物和钾盐的可食用组合物。在一些实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物和KCl的可食用组合物。在其它实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物和乳酸钾的可食用组合物。在一些实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物、钾盐和钠盐的可食用组合物。在其它实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物、KCl和NaCl的可食用组合物。在又一些其它实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物、乳酸钾和乳酸钠的可食用组合物。在其它实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物和乙酰磺胺酸钾和糖的可食用组合物。在其它实施方案中,所述包装包含含有本发明化合物、乳酸钾、KCl和NaCl的可食用组合物。

[0579] 在一些实施方案中,本发明的可食用组合物是适合于用作调料、食品中的成分或调味品。在这些实施方案中,所述可食用组合物可以包含或不包含促苦味剂。例如,所述可食用组合物可以在例如含有促苦味剂如KCl的调料中使用。这些调料可以代替食盐(即NaCl)使用来为预加工食品调味。或者,所述可食用组合物可以在例如不包含促苦味剂的调料中使用。这些调料可以用于为包含促苦味剂(本身存在或在制备期间添加)的预加工食品调味以减小与促苦味剂相关的苦味。在一些实施方案中,所述可食用组合物是含有KCl和本

发明化合物的调料。在一些实施方案中,所述可食用组合物是含有KCl、NaCl和本发明化合物的调料。在一些实施方案中,所述调料进一步包含香料或香料的掺混物。

[0580] 可选地,所述可食用组合物可以用于医学或卫生目的,例如,用于肥皂、洗发水、嗽口水、药品、药物、止咳糖浆、鼻喷雾剂、牙膏、牙科粘合剂、牙齿增白剂、胶水(例如在邮票和信封上)和昆虫和啮齿动物控制中使用的毒素。

[0581] 食品

[0582] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。根据这些实施方案,所述食品包含(a) 食材;和(b) 本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0583] 在一些实施方案中,所述食品进一步包含本文中描述的促苦味剂。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐,如KCl或乳酸钾。在特定实施方案中,所述钾盐为KCl。

[0584] 在一些实施方案中,所述食品进一步包含一种或多种另外的味道调节剂。

[0585] 在一些实施方案中,所述食品进一步包含选自由防腐剂、营养剂、调味剂或其它味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0586] 药物组合物

[0587] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。根据这些实施方案,所述药物组合物包含(a) 苦味药物活性成分;和(b) 本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0588] 根据一些实施方案,所述药物组合物可以包含任何苦味药物活性成分。苦味药物化合物的非限制性实例包括:醋氨酚(acetaminophen)、氨苄青霉素、阿奇霉素、氯芬胺(chlorpheniramine)、西咪替丁(cimetidine)、美沙芬(dextromethorphan)、苯海拉明(diphenhydramine)、红霉素、布洛芬(ibuprofen)、青霉素、保泰松(phenylbutazone)、伪麻黄碱(pseudoephedrine)、雷尼替丁(ranitidine)、螺内酯、他汀类(包括但不限于阿伐他汀(atorvastatin)、ceirvastatin、氟伐他汀(fluvastatin)、lovastatin、美伐他汀(mevastatin)、匹伐他汀(pitavastatin)、普伐他汀(pravastatin)、瑞舒伐他汀(rosuvastatin)和辛伐他汀(simvastatin))和茶碱。

[0589] 在其它实施方案中,本发明提供包含以下的药物组合物:(a) 药物活性成分;(b) 本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合;和(c) 促苦味剂。在一些实施方案中,所述药物组合物可包含任何药物活性成分。

[0590] 在其它实施方案中,本发明提供包含以下的药物组合物:(a) 药物活性成分;(b) 本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合;和(c) 钾盐。在一些实施方案中,所述钾盐为KCl或乳酸钾。在一些实施方案中,所述钾盐为KCl。

[0591] 在一些实施方案中,所述药物组合物进一步包含一种或多种其它味道调节剂。

[0592] 在一些实施方案中,所述药物组合物进一步包含选自由防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0593] 消费品

[0594] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。根据这些实施方案,所述消费品

包含 (a) 促苦味剂; 和 (b) 本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0595] 在另一个实施方案中, 本发明提供包含以下的消费品: (a) 钾盐; 和 (b) 本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。在一些实施方案中, 所述钾盐为KCl或乳酸钾。在一些实施方案中, 所述钾盐为KCl。

[0596] 在其它实施方案中, 本发明提供用于减小促苦味剂的苦味的消费品, 其中所述消费品包含本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。在一些实施方案中, 所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中, 所述钾盐为KCl或乳酸钾。在一些实施方案中, 所述促苦味剂为KCl。

[0597] 在一些实施方案中, 所述消费品进一步包含一种或多种其它味道调节剂。

[0598] 在一些实施方案中, 所述消费品进一步包含选自由防腐剂、营养剂、调味剂或其它味道调节剂 (其本身可能没有味道) 组成的组的一种或多种其它组分。

[0599] 制备可食用组合物的方法

[0600] 根据另一方面, 本发明提供制备可食用组合物的方法。所述方法包括: (a) 提供食品上可接受的载体; 以及 (b) 向 (a) 的食品上可接受的载体添加本文中描述的式 (I)、式 (II)、式 (III) 或式 (IV) 的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合, 以及所述食品上可接受的载体。在一些实施方案中, 本发明化合物在添加步骤 (b) 之前已经被溶于溶剂中。

[0601] 在一些实施方案中, 在 (a) 中的食品上可接受的载体本身是苦的。在一些实施方案中, 所述食品上可接受的载体可能本身含促苦味剂。在一些实施方案中, 所述固有的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中, 所述固有的促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中, 所述固有的促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中, 所述固有的促苦味剂为KCl。在其它实施方案中, 所述固有的促苦味剂为乳酸钾。

[0602] 在一些实施方案中, 制备可食用组合物的方法进一步包括: (c) 添加促苦味剂。在一些实施方案中, 所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中, 所述钾盐为KCl或乳酸钾。在特定实施方案中, 所述钾盐为KCl。在一些实施方案中, 所述促苦味剂在本发明化合物之前添加。在其它实施方案中, 所述促苦味剂在本发明化合物之后添加。在一些实施方案中, 本发明化合物与所述促苦味剂混合并且随后与所述食品上可接受的载体混合。在其它实施方案中, 本发明化合物依次与所述食品上可接受的载体并且随后所述促苦味剂混合。在又一些其它实施方案中, 本发明化合物与所述促苦味剂和所述食品上可接受的载体的混合物混合。

[0603] 在一些实施方案中, 本发明化合物和所述促苦味剂 (如果存在) 与所述食品上可接受的载体混合。在其它实施方案中, 所述化合物和所述促苦味剂 (如果存在) 被喷到或涂到所述食品上可接受的载体上。在一些实施方案中, 本发明化合物被覆在碳水化合物或盐上, 封装在盐或碳水化合物 (喷雾干燥) 或与钾盐共结晶以生成“表面”的盐。

[0604] 在一些实施方案中, 所述促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中, 所述促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中, 所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中, 所述促苦味剂为KCl。在其它实施方案中, 所述促苦味剂为乳酸钾。

[0605] 在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含钠盐。在一些实施方案中,所述可食用组合物进一步包含NaCl。在其它实施方案中,所述可食用组合物进一步包含乳酸钠。在其它的实施方案中,所述可食用组合物进一步包含糖。

[0606] 在一些实施方案中,制备可食用组合物的方法进一步包括添加选自防腐剂、营养剂、调味剂或其它味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。在一些实施方案中,制备可食用组合物的方法进一步包括添加一种或多种其它味道调节剂。

[0607] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0608] 制备食品的方法

[0609] 根据另一方面,本发明提供制备可食用组合物的方法,其中所述可食用组合物为食品。所述方法包括:(a)提供食材;和(b)向(a)的食材添加本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。在一些实施方案中,以包含本发明化合物的可食用组合物的形式添加本发明化合物。

[0610] 在一些实施方案中,在(a)中的食材本身是苦的。在一些实施方案中,所述食材可能本身含促苦味剂。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为KCl。在其它实施方案中,所述固有的促苦味剂为乳酸钾。

[0611] 在一些实施方案中,所述方法包括:(a)提供食品;和(b)向(a)的食品添加本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。在一些实施方案中,以包含本发明化合物的可食用组合物的形式添加本发明化合物。

[0612] 在一些实施方案中,(a)中的食品包含促苦味剂。在一些实施方案中,所述促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为KCl。在其它实施方案中,所述促苦味剂为乳酸钾。

[0613] 在一些实施方案中,制备食品的方法进一步包括:(c)添加促苦味剂。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐,如KCl或乳酸钾。在特定实施方案中,所述钾盐为KCl。在一些实施方案中,所述促苦味剂在本发明化合物之前添加。在其它实施方案中,所述促苦味剂在本发明化合物之后添加。在一些实施方案中,本发明化合物与促苦味剂一起添加。在一些实施方案中,本发明化合物与所述促苦味剂混合并且随后与所述食材或食品混合。在其它实施方案中,本发明化合物依次与所述食材或食品并且随后与所述促苦味剂混合。在又一些其它实施方案中,本发明化合物与所述促苦味剂和所述食材或食品的混合物混合。

[0614] 在一些实施方案中,本发明化合物和所述促苦味剂(如果存在)与所述食材混合。在其它实施方案中,所述化合物和所述促苦味剂(如果存在)被喷到或涂到所述食材上。在一些实施方案中,本发明化合物被覆在碳水化合物或盐上,包封在盐或碳水化合物上(喷雾干燥)或与钾盐共结晶以生成“表面”的盐。

[0615] 在一些实施方案中,所述促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,所述

促苦味剂为KCl。在其它实施方案中,所述促苦味剂为乳酸钾。

[0616] 在一些实施方案中,所述食品进一步包含钠盐。在一些实施方案中,所述食品进一步包含NaCl。在其它实施方案中,所述食品进一步包含乳酸钠。在其它的实施方案中,所述食品进一步包含糖。

[0617] 在一些实施方案中,制备食品的方法进一步包括添加选自防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0618] 制备药物组合物的方法

[0619] 根据另一方面,本发明提供制备可食用组合物的方法,其中所述可食用组合物为药物组合物。所述方法包括:(a) 提供药物活性成分;以及(b) 向(a)的药物活性成分添加本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合、以及药物活性成分。在一些实施方案中,以包含本发明化合物的可食用组合物的形式添加本发明化合物。

[0620] 在一些实施方案中,(a)中的药物活性成分本身是苦的。在一些实施方案中,所述药物活性成分可能本身含促苦味剂。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述固有的促苦味剂为钾盐。

[0621] 在一些实施方案中,制备药物组合物的方法进一步包括:(c) 添加促苦味剂。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,所述钾盐为KCl或乳酸钾。在特定实施方案中,所述钾盐为KCl。在一些实施方案中,所述促苦味剂在本发明化合物之前添加。在其它实施方案中,所述促苦味剂在本发明化合物之后添加。在一些实施方案中,所述促苦味剂与本发明化合物一起添加。在一些实施方案中,本发明化合物与所述促苦味剂混合并且随后与所述药物活性成分混合。在其它实施方案中,本发明化合物依次与所述药物活性成分并且随后所述促苦味剂混合。在又一些其它实施方案中,本发明化合物与所述促苦味剂和所述药物活性成分的混合物混合。

[0622] 在一些实施方案中,本发明化合物和所述促苦味剂(如果存在)与所述药物活性成分混合。在其它实施方案中,所述化合物和所述促苦味剂(如果存在)被喷到或涂到所述药物组合物上。在一些实施方案中,本发明化合物与所述药物活性成分包封在一起。在一些实施方案中,本发明化合物是使释放速率相对所述促苦味剂的释放速率受控制的形式,在一些实施方案中,所述促苦味剂为所述药物活性成分。

[0623] 在一些实施方案中,所述促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为KCl。在其它实施方案中,所述促苦味剂为乳酸钾。

[0624] 在一些实施方案中,所述药物组合物进一步包含钠盐。在一些实施方案中,所述药物组合物进一步包含NaCl。在其它实施方案中,所述药物组合物进一步包含乳酸钠。在其它的实施方案中,所述药物组合物进一步包含糖。

[0625] 在一些实施方案中,所述药物组合物进一步包含药学上可接受的载体。可以在这些组合物中使用的可药用的载体包括但不限于离子交换剂、铝矾土、硬脂酸铝、卵磷脂、血清蛋白如人血清白蛋白、缓冲物质如磷酸盐、甘氨酸、山梨酸、山梨酸钾、饱和植物脂肪酸的偏甘油酯混合物、水、盐或电解质如硫酸鱼精蛋白、磷酸氢二钠、磷酸氢钾、氯化钠、锌盐、硅

胶、三硅酸镁、聚乙烯吡咯烷酮、基于纤维素的物质、聚乙二醇、羧甲基纤维素钠、聚丙烯酸酯、石蜡、聚乙烯-聚氧丙烯-嵌段聚合物、聚乙二醇和羊毛脂。

[0626] 在一些实施方案中,制备药物组合物的方法进一步包括添加选自防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0627] 减小或消除受试者中的苦味感觉的方法

[0628] 根据另一方面,本发明提供减小或消除受试者中的苦味感觉的方法。所述方法包括使用包含本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合的可食用组合物。

[0629] 所述方法可被用于减小或消除任何可食用组合物(包括食材、食品、药物组合物或消费品)中的苦味。所述可食用组合物可以是任何形式的。在一些实施方案中,所述组合物是例如胶、锭剂、酱、调味品、肉质(meat matrix)、肉浆、糊剂、混悬剂、分散剂、涂层、液体、凝胶、乳液、颗粒或调料的形式。

[0630] 在一些实施方案中,所述可食用组合物通过例如放入口腔或通过食入来使用。在一些实施方案中,所述可食用组合物在摄入苦味食品、药物组合物或消费品之前被放入口腔或食入。在一些实施方案中,所述可食用组合物与苦味食品、药物组合物或消费品被同时放入口腔或食入,作为单独的可食用组合物或并入所述苦味食品、药物组合物或消费品中。在一些实施方案中,所述可食用组合物在苦味食品、药物组合物或消费品之后被放入口腔或食入。例如,本发明化合物可以与食材或食品混合以减小食品的苦味。或者,例如,本发明化合物可以在用于接触苦味食材、食品、药物组合物或消费品之后使用的锭剂或胶中使用(例如用于减小或消除苦味余味)。

[0631] 降低可食用组合物中的钠的量的方法

[0632] 根据另一个实施方案,本发明提供降低可食用组合物如食品、药物组合物或消费品中的钠的量的方法。在一些实施方案中,本发明提供降低可食用组合物如食品、药物组合物或消费品中的含钠化合物量的方法。在另一个实施方案中,本发明提供降低可食用组合物如食品、药物组合物或消费品中的NaCl的量的方法。在另一个实施方案中,本发明提供降低可食用组合物如食品、药物组合物或消费品中的乳酸钠的量的方法。在一些实施方案中,所述钠盐被非钠盐代替。在一些实施方案中,所述非钠盐为钙盐、镁盐或钾盐。在一些实施方案中,所述非钠盐为钾盐。

[0633] 在一些实施方案中,所述方法包括:(a)用一定量的钾盐代替用于制备可食用组合物的一定量的钠盐;以及(b)向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。在一些实施方案中,以包含本发明化合物的可食用组合物的形式添加本发明化合物。

[0634] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法包括以下步骤:(a)食入第一种可食用组合物,其中一定量的钠盐已被一定量的钾盐代替;以及(b)食入第二种可食用的化合物,其包含本发明化合物。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物在所述第二可食用组合物之前食入。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物在所述第二可食用组合物之后食入。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物与所述第二可食用组合物同时食入。

[0635] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组

合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0636] 在一些实施方案中,所述钾盐在添加有效量的本发明化合物之前加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述钾盐在添加有效量的本发明化合物之后加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述钾盐在添加有效量的本发明化合物的同时加入所述可食用组合物。

[0637] 在一些实施方案中,在步骤(a)的可食用组合物中被代替的钠的量为足以保持或恢复受试者的健康的量。在一些实施方案中,在所述可食用组合物中的被代替的钠的量为足以降低受试者的高血压的量。在一些实施方案中,在所述可食用组合物中的被钾代替的钠的量为足以改变所述可食用组合物的质地或凝固点的量。在一些实施方案中,被代替的钠的量为最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。

[0638] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量减小受试者的苦味感觉。所述苦味被完全减小或部分减小。在一些实施方案中,保持咸味的感觉。

[0639] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用钾代替存在于所述可食用组合物中的钠的量的最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用钾代替存在于所述可食用组合物中的钠的量的最多25%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用钾代替存在于所述可食用组合物中的钠的量的最多50%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用钾代替存在于所述可食用组合物中的钠的量的最多75%。在又一些其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用钾代替存在于所述可食用组合物中的钠的量的最多100%。

[0640] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法进一步包括添加选自由防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0641] 在一些实施方案中,所述方法包括:(a)用一定量的KCl代替用于制备可食用组合物的一定量的NaCl;以及(b)向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0642] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法包括以下步骤:(a)食入第一种可食用组合物,其中一定量的NaCl已经被一定量的KCl代替;以及(b)食入第二种可食用的化合物,其包含本发明化合物。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物在所述第二可食用组合物之前食入。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物在所述第二可食用组合物之后食入。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物与所述第二可食用组合物同时食入。

[0643] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0644] 在一些实施方案中,所述KCl在添加有效量的本发明化合物之前加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述KCl在添加有效量的本发明化合物之后加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述KCl在添加有效量的本发明化合物的同时加入所述可食用组合物。

[0645] 在一些实施方案中,在步骤(a)的可食用组合物中被KCl代替的NaCl的量为足以保持或恢复受试者的健康的量。在一些实施方案中,在所述可食用组合物中的被KCl代替的NaCl的量为足以降低受试者的高血压的量。在一些实施方案中,在所述可食用组合物中的被KCl代替的NaCl的量为足以改变所述可食用组合物的质地或凝固点的量。在一些实施方案中,被KCl代替的NaCl的量为最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。

[0646] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量减小受试者的苦味感觉。所述苦味被完全减小或部分减小。在一些实施方案中,保持咸味的感觉。

[0647] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用KCl代替存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用KCl代替存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多25%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用KCl代替存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多50%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用KCl代替存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多75%。在又一些其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用KCl代替存在于所述可食用组合物中的NaCl的量的最多100%。

[0648] 在一些实施方案中,降低可食用组合物或食品中的NaCl的量的方法包括保持咸味。

[0649] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的NaCl的量的方法进一步包括添加选自防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0650] 在其它实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法包括:(a)用一定量的乳酸钾代替存在于可食用组合物中的一定量的乳酸钠;以及(b)向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0651] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的钠的量的方法包括以下步骤:(a)食入第一种可食用组合物,其中一定量的乳酸钠已经被一定量的乳酸钾代替;以及(b)食入第二种可食用的化合物,其包含本发明化合物。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物在所述第二可食用组合物之前食入。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物在所述第二可食用组合物之后食入。在一些实施方案中,所述第一可食用组合物与所述第二可食用组合物同时食入。

[0652] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0653] 在一些实施方案中,所述乳酸钾在添加有效量的本发明化合物之前加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述乳酸钾在添加有效量的本发明化合物之后加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述乳酸钾在添加有效量的本发明化合物的同时加入所述可食用组合物。

[0654] 在一些实施方案中,在步骤(a)的可食用组合物中被乳酸钾代替的乳酸钠的量为足以保持或恢复受试者的健康的量。在一些实施方案中,在所述可食用组合物中的被乳酸钾代替的钠的量为足以降低受试者的高血压的量。在一些实施方案中,在所述可食用组合物中的被乳酸钾代替的乳酸钠的量为足以改变所述可食用组合物的质地或凝固点的量。在一些实施方案中,被乳酸钾代替的乳酸钠的量为最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。

[0655] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量减小受试者的苦味感觉。所述苦味被完全减小或部分减小。在一些实施方案中,保持咸味的感觉。

[0656] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乳酸钾代替存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乳酸钾代替存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多25%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乳酸钾代替存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多50%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乳酸钾代替存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多75%。在又一些其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乳酸钾代替存在于所述可食用组合物中的乳酸钠的量的最多100%。

[0657] 在一些实施方案中,降低可食用组合物或食品中的乳酸钠的量的方法包括保持食品的防腐。

[0658] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的乳酸钠的量的方法进一步包括添加选自防腐剂和营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0659] 降低可食用组合物中的糖的量或食品的方法

[0660] 根据另一个实施方案,本发明提供降低可食用组合物中的糖的量的方法。在一些实施方案中,所述方法包括:(a)用一定量的乙酰磺胺酸钾代替用于制备可食用组合物的一定量的糖;以及(b)向所述可食用组合物中并入有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0661] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0662] 在一些实施方案中,所述乙酰磺胺酸钾在添加有效量的本发明化合物之前加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述乙酰磺胺酸钾在添加有效量的本发明化合物之后加入所述可食用组合物。在一些实施方案中,所述乙酰磺胺酸钾在添加有效量的本发明化合物的同时加入所述可食用组合物。

[0663] 在一些实施方案中,在步骤(a)的可食用组合物中被代替的糖的量为足以保持或恢复受试者的健康的量。在一些实施方案中,在可食用组合物中的被代替的糖的量为足以引起受试者体重减轻的量。在一些实施方案中,所述可食用组合物中的被乙酰磺胺酸钾代替的糖的量是足以减轻与受试者的糖消耗或过重相关的疾病(例如糖尿病)的影响或治疗所述疾病的量。在一些实施方案中,被乙酰磺胺酸钾代替的糖的量为最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。

[0664] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量减小受试者的苦味感觉。所述苦味被完全减小或部分减小。在一些实施方案中,保持甜味的感觉。

[0665] 在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于所述可食用组合物中的糖的量的最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于所述可食用组合物中的糖的量的最多25%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于所述可食用组合物中的糖的量的最多50%。在其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于所述可食用组合物中的糖的量的最多75%。在又一些其它实施方案中,在步骤(b)中添加的化合物的量足以允许用乙酰磺胺酸钾代替存在于所述可食用组合物中的糖的量的最多100%。

[0666] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的糖的量的方法包括保持甜味。

[0667] 在一些实施方案中,降低可食用组合物中的糖的量的方法或食品进一步包含添加选自防腐剤、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0668] 减小受试者的钠摄入的方法

[0669] 根据另一个实施方案,本发明提供减少受试者的钠摄入的方法。在一些实施方案中,所述方法包括向受试者提供本发明的可食用组合物的步骤,其中所述可食用组合物中的全部或部分钠盐被一种或多种非钠盐代替,并且其中所述可食用组合物包含本发明化合物。在一些实施方案中,所述非钠盐为钙盐、镁盐或钾盐。在一些实施方案中,所述非钠盐为钾盐。在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。在一些实施方案中,所述钠盐为NaCl并且所述钾盐为KCl。在一些实施方案中,所述钠盐为乳酸钠并且所述钾盐为乳酸钾。

[0670] 在一些实施方案中,减少受试者的钠摄入的方法进一步包括鉴别有需要的受试者

的步骤。技术人员将能够鉴别需要减少钠摄入的受试者。这些受试者的非限制性实例包括患有以下病症中的任何一种或多种的受试者：高钠血症、高血压、心血管疾病、水肿、脑水肿引起的发作、脱水（由过度出汗、腹泻、尿路病症或利尿剂引起）、尿崩症、康恩氏综合征（Conn's syndrome）和库欣氏综合征（Cushing's syndrome）。

[0671] 在一些实施方案中，在可食用组合物中的被钾盐代替的钠盐的量为足以保持或恢复受试者的健康的量。在一些实施方案中，在所述可食用组合物中的被钾盐代替的钠盐的量为足以降低受试者的高血压的量。在一些实施方案中，在所述可食用组合物中的被钾盐代替的钠盐的量为最多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%或100%。这些量不表示限制，并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中，如果有必要，受试者的每日钠摄入小于2500mg/天、小于2000mg/天、小于1500mg/天、小于1000mg/天或小于500mg/天。

[0672] 在一些实施方案中，加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少受试者的钠摄入最多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%或100%。这些量不表示限制，并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中，加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少所述受试者的钠摄入最多25%。在其它实施方案中，加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少所述受试者的钠摄入最多50%。在其它实施方案中，加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少所述受试者的钠摄入最多75%。在又一些其它实施方案中，加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少所述受试者的钠摄入最多100%。

[0673] 在一些实施方案中，减小受试者的钠摄入的方法进一步包括添加选自由防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂（其本身可能没有味道）组成的组的一种或多种其它组分。

[0674] 减小受试者的糖摄入的方法

[0675] 根据另一个实施方案，本发明提供减少受试者的糖摄入的方法。在一些实施方案中，所述方法包括向受试者提供本发明的可食用组合物的步骤，其中所述可食用组合物中的全部或部分糖被乙酰磺胺酸钾代替，并且其中所述可食用组合物包含本发明化合物。在一些实施方案中，所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中，所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中，所述可食用组合物为消费品。

[0676] 在一些实施方案中，减少受试者的糖摄入的方法进一步包括鉴别有需要的受试者的步骤。技术人员将能够鉴别需要减少糖摄入的受试者。这些受试者的非限制性实例包括患有以下病症的任何一种或多种的受试者：糖尿病、糖尿病前期、胰岛素抵抗、肥胖、过重和高血糖。

[0677] 在一些实施方案中，所述可食用组合物中的被乙酰磺胺酸钾代替的糖的量是足以保持或恢复受试者的健康的量。在一些实施方案中，所述可食用组合物中的被乙酰磺胺酸钾代替的糖的量是足以引起受试者体重减轻的量。在一些实施方案中，所述可食用组合物中的被乙酰磺胺酸钾代替的糖的量是足以减轻与受试者的糖消耗或过重相关的疾病（例如糖尿病）的影响或治疗所述疾病的量。在一些实施方案中，所述可食用组合物中的被乙酰磺

胺酸钾代替的糖的量为最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,受试者的每日糖摄入小于250g/天、小于200g/天、小于175g/天、小于150g/天、小于125g/天、小于100g/天、小于75g/天、小于50g/天或小于25g/天。

[0678] 在一些实施方案中,加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少受试者的糖摄入最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少受试者的糖摄入最多25%。在其它实施方案中,加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少受试者的糖摄入最多50%。在其它实施方案中,加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少受试者的糖摄入最多75%。在又一些其它实施方案中,加入所述可食用组合物中的本发明化合物的量足以允许减少受试者的糖摄入最多100%。

[0679] 在一些实施方案中,减小受试者的糖摄入的方法进一步包括添加选自防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0680] 减小苦味可食用组合物的方法

[0681] 根据另一个实施方案,本发明提供减小可食用组合物的苦味的方法。在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0682] 在一个实施方案中,所述方法包括:(a)向可食用组合物添加有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合,从而减小苦味。

[0683] 在替代实施方案中,所述方法包括:(a)在所述可食用组合物之前、与其同时或在其之后食入有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合,从而减小苦味。

[0684] 在一些实施方案中,所述促苦味剂为苦味的盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐、镁盐、或钙盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为钾盐。在一些实施方案中,所述促苦味剂为KCl。在其它实施方案中,所述促苦味剂为乳酸钾。在一些实施方案中,所述促苦味剂是所述可食用组合物中固有的,如在本身是苦味的食材中。

[0685] 在一些实施方案中,所述苦味被减小最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,所述苦味被减小最多25%。在其它实施方案中,所述苦味被减小最多50%。在其它实施方案中,所述苦味被减小最多75%。在其它实施方案中,所述苦味被减小最多100%。

[0686] 在一些实施方案中,减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法进一步包括添加选自防腐剂、营养剂、调味剂或其它味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0687] 使可食用组合物防腐的方法

[0688] 根据另一个实施方案,本发明提供使可食用组合物可食用组合物防腐的方法,其包括:

[0689] (a) 提供可食用组合物;以及

[0690] (b) 将防腐剂和有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合与(a)的所述可食用组合物混合。

[0691] 在另一个实施方案中,使可食用组合物防腐的方法包括:

[0692] (a) 提供可食用组合物;以及

[0693] (b) 将防腐剂和有效量的本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合与(a)的所述可食用组合物混合。

[0694] 根据本发明,所述防腐剂可以是任何苦味的防腐剂。在一些实施方案中,(a)中的防腐剂为钾盐。在一些实施方案中,(a)中的防腐剂为乳酸钾。

[0695] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0696] 在一些实施方案中,使可食用组合物防腐的方法进一步包含添加选自由防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。

[0697] 降低可食用组合物中的钠的量同时使所述可食用组合物防腐的方法

[0698] 根据另一个实施方案,本发明提供降低可食用组合物中的钠的量的方法同时使所述可食用组合物防腐的方法。在一些实施方案中,所述方法包括用一定量的含钾防腐剂代替一定量的用于制备可食用组合物的含钠防腐剂以及添加有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0699] 在一些实施方案中,所述方法包括用一定量的乳酸钾代替用于制备可食用组合物的一定的量的乳酸钠以及添加有效量的本文中描述的式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合。

[0700] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0701] 在一些实施方案中,所述有效量的化合物足以允许降低通常存在于可食用组合物中的乳酸钠的量的最多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%或100%。这些量不表示限制,并且列举的百分数之间的增量明确地视为本发明的一部分。在一些实施方案中,所述有效量的化合物足以允许降低通常存在于可食用组合物中的乳酸钠的量的最多25%。在其它实施方案中,所述有效量的化合物足以允许降低通常存在于可食用组合物中的乳酸钠的量的最多50%。在其它实施方案中,所述有效量的化合物足以允许降低通常存在于可食用组合物中的乳酸钠的量的最多75%。在又一些其它实施方案中,所述有效量的化合物足以允许降低通常存在于可食用组合物中的乳酸钠的量的最多100%。

[0702] 在一些实施方案中,减小由可食用组合物中的促苦味剂引起的苦味的方法进一步包括添加选自由防腐剂、营养剂、调味剂或味道调节剂(其本身可能没有味道)组成的组的一种或多种其它组分。在一些实施方案中,降低可食用组合物中的乳酸钠的量同时使食品

防腐的方法进一步包括添加一种或多种其它味道调节剂。

[0703] 抑制苦味受体的方法

[0704] 根据另一个实施方案,本发明提供抑制或减小苦味受体的活化和/或信号传导的方法。在一些实施方案中,所述方法包括将苦味受体与本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合接触。

[0705] 在一些实施方案中,所述方法包括将苦味受体与包含本文中描述的根据式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物、或其组合、或本文中描述的化合物1-8中的任一种、或其组合的可食用组合物接触。

[0706] 在一些实施方案中,所述可食用组合物为食品。在一些实施方案中,所述可食用组合物为药物组合物。在一些实施方案中,所述可食用组合物为消费品。

[0707] 在一些实施方案中,所述苦味受体为存在于例如试验中的离体(ex vivo)受体。在一些实施方案中,所述苦味受体为存在于例如试验中的活体外受体。在其它实施方案中,所述苦味受体,所述苦味受体为存在于受试者中的活体内受体。在一些实施方案中,所述苦味受体存在于受试者的口腔或胃肠道中。在一些实施方案中,所述苦味受体在人的口腔中。在一些实施方案中,所述苦味受体在非人动物的口腔中。在一些实施方案中,所述苦味受体在动物模型的口腔中。

[0708] 在一些实施方案中,对苦味受体的抑制将影响生理过程或状态。通过对苦味受体的抑制受影响的生理过程或状态的非限制性实例包括苦味、高血压、恶心、呕吐、对胃肠道的影响、食欲、营养、营养吸收、饱腹感、饥饿、糖尿病、肥胖、血糖水平、血糖调节、代谢、饮食和进食障碍。

[0709] 本发明化合物的制备

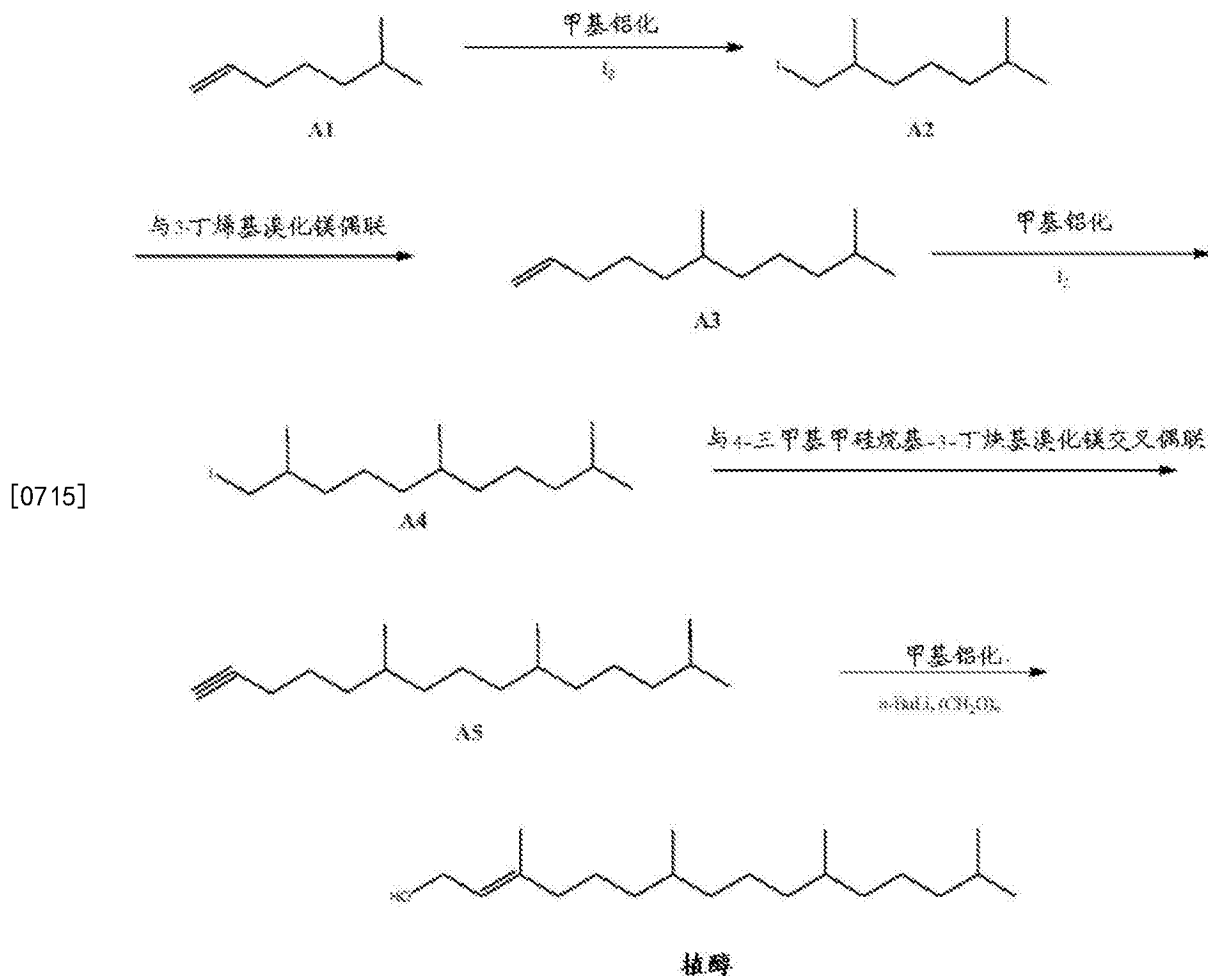
[0710] 在一些实施方案中,式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物中的一种或多种商购自例如,如St.Louis, Missouri, USA的Sigma-Aldrich®; TCI America, Portland, Oregon, USA; 和Acros Organics, Geel, Belgium等商业来源。

[0711] 在其它实施方案中,式(I)、式(II)、式(III)或式(IV)的化合物中的一种或多种通过合成有机化学中的常规方法从商购试剂制备。

[0712] 式(I)的化合物

[0713] 在一个实施方案中,一种或多种式(I)化合物通过下面描述的多步骤次序制备。本领域技术人员能够容易地改进所描述的用于合成任何式(I)化合物的条件。

[0714] 植醇的合成可如下完成:从烯烃A1的甲基铝化(AlMe_3)开始,随后暴露于 I_2 以产生碘烯烃A2。然后A2可与3-丁烯基溴化镁偶联以得到烯烃A3。这种偶联可使用铜催化剂例如 Li_2CuCl_4 来完成。使用与A1至A2转化中所用条件类似的条件-即通过甲基铝化、随后暴露于 I_2 ,可将A3转化成A4。A4可与4-三甲基甲硅烷基-3-丁炔基溴化镁交叉偶联,随后脱甲硅基,以得到A5。此类交叉偶联可使用铜催化剂例如 Li_2CuCl_4 来完成。这种脱甲硅基反应可使用例如甲醇KOH来完成。然后可经由甲基铝化、与n-BuLi络合以及用 $(\text{CH}_2\text{O})_n$ 处理(方案I)将A5转化为植醇:



[0716] 方案I

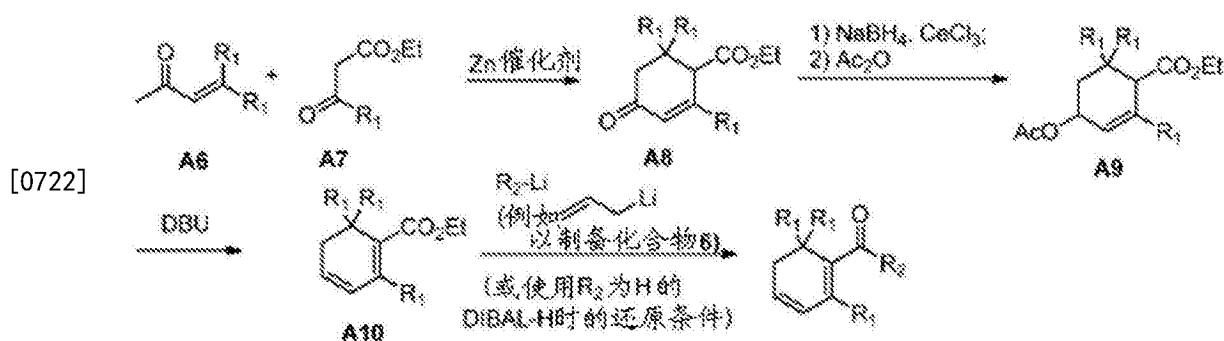
[0717] 植醇和植醇样化合物的对映选择性合成描述于例如,Shouquan Huo等人,Organic Letters,3 (21):3253-3256 (2001)中,其据此通过引用并入。

[0718] 式(II)化合物

[0719] 一般而言,式(II)化合物可通过本领域技术人员已知的方法来制备。下面方案II阐述了至式(II)化合物的合成路径。普通熟练有机化学研究员将容易明了的其它等效方案可选地用于合成分子的不同部分,如下面通用方案所阐述。

[0720] 式(II)化合物的合成可如下完成:从通过Zn催化剂如氯化锌催化的A6与A7的缩合开始,以产生A8。可经由 $\text{NaBH}_4/\text{CeCl}_3$ 介导的还原、随后处理 Ac_2O 将A8转化为A9。A9至A10转化可通过用1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)处理A9来完成。可用锂试剂 $\text{R}_2\text{-Li}$ 处理A10以产生式(II)化合物,其中 R_2 为 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烯基或 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 炔基。可选地,A10可用二异丁基氢化铝(DIBAL-H)处理以产生式(II)化合物,其中 R_2 为H。

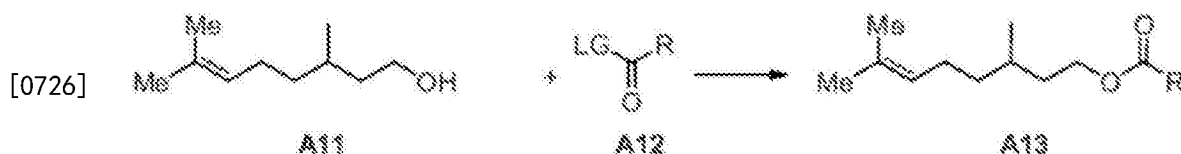
[0721] 在一个实施方案中,一种或多种式(II)化合物可根据方案II来制备。



[0723] 方案II

[0724] 式 (III) 化合物

[0725] 在一个实施方案中,一种或多种式 (III) 化合物通过如下制备:用具有离去基团LG的酰基化合物A12使醇A11酰基化以得到产物A13(方案III):



[0727] 方案III

[0728] 适合的离去基团包括本领域公认的用于酰基化反应的那些,如卤化物(例如氯、溴、碘)、芳基氧基、与活性酯相关的离去基团(例如,N-琥珀酰胺或与二环己基碳二亚胺相关的)等。在某些实施方案中,酰基化合物A7为酸酐;即LG为-OC(O)R。在一些实施方案中,酰基化条件也采用无机或有机碱。适合的碱包括本领域公认的用于这些反应的那些碱,并且包括但不限于碱金属和碱土金属碳酸盐(如 Na_2CO_3 、 K_2CO_3 、 CaCO_3 等)和碳酸氢盐(如 NaHCO_3 、 KHCO_3 等)。其它合适的碱包括胺碱,如氨、氢氧化铵、三乙胺、吡啶、哌啶、吡咯烷、2,6-卢剔啶、1,8-二氮杂二环十一碳-7-烯(DBU)、4-(二甲氨基)-吡啶等。

[0729] 在一个特定实施方案中,A12为酰卤,如酰氯或酰溴,并且酰基化反应在胺碱如三乙胺、吡啶、哌啶、吡咯烷、2,6-卢剔啶、1,8-二氮杂二环十一碳-7-烯(DBU)、4-(二甲氨基)-吡啶等的存在下进行。

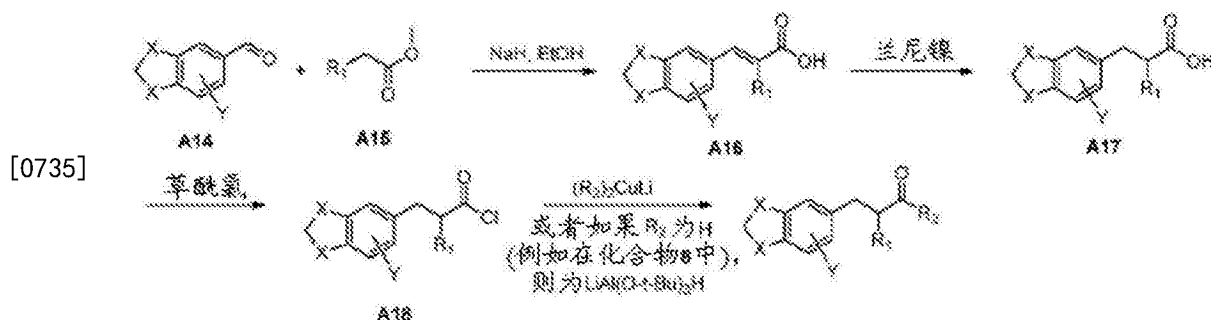
[0730] 在另一个实施方案中,A12为活化酯并且酰基化反应在不导致强酸产生的温和条件下进行。

[0731] A12可使用本领域已知的常规方法由相应的羧酸制备。

[0732] 式 (IV) 化合物

[0733] 一般而言,式 (IV) 化合物可通过本领域技术人员已知的方法来制备。下面方案IV阐述了至式 (IV) 化合物的合成路径。普通熟练有机化学研究员将容易明了的其它等效方案可选地用于合成分子的不同部分,如下面通用方案所阐述。

[0734] 合成可如下完成:从用NaH处理A15开始,随后添加绝对EtOH和A14,以产生A16。可通过兰尼镍催化的还原反应将A16转化为A17。然后A17可用草酰氯处理以产生酰基氯A18。A18可用铜酸锂试剂 $(\text{R}_2)_2\text{CuLi}$ 处理,以产生式IV化合物,其中 R_2 为 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基或 C_2 - C_6 炔基。可选地,A18可用 $\text{LiAl}(\text{O}-t\text{-Bu})_3\text{H}$ 处理以产生式IV化合物,其中 R_2 为H(方案IV):



[0736] 方案IV

实施例

[0737] 了更充分地理解本发明, 阐述以下实施例。这些实施例只是为了说明的目的, 无论如何都不应认为是限制本发明的范围。

[0738] 在以下实施例中使用的测试化合物自合成和天然化合物的商业供应商获得, 如 VitasM、ChemDiv、ChemBridge、Chromadex、Sigma Aldrich、Penta、Spectrum Chemical、Vigon 和 Indofine。

[0739] 在以下实施例中所用的味道试验评测者基于其感觉与氯化钾相关的苦味的能力进行筛选并选择。只有能够感觉苦味的评测者才能参与以下味道试验。

[0740] 由于受试者味道感觉的复杂性质和以下实验的固有的主观性质, 个别的味道试验实验可能对于给定化合物产生不同的结果。以下实施例中提供的数据用于说明观察到的味道试验结果。

[0741] 以下味道试验实验用具有不同规模的小组 (即包含不同数量的评测者的小组) 进行。

[0742] 实施例1 使用拉丁方阵 (Latin Square) 两种替代强迫性选择方法 (拉丁方阵-2AFC), 测试化合物对人感觉KCl固体基质食材的苦味的影响

[0743] 使用如下拉丁方阵-2AFC试验方法, 使用“咀嚼和吐出 (chew and spit)”测试评价测试化合物对人感觉固体基质食材中KCl的苦味的影响。

[0744] 制备在水中含有Prague粉、糖、Evian™水、KCl和/或NaCl的两种类型的腌泡汁。一种腌泡汁含有80%KCl:20%NaCl (按重量计) (即, 腌泡汁浓度为约10.9%KCl以在最终食品中得到约1.6%的KCl浓度)。第二种腌泡汁含有60%KCl:40%NaCl (按重量计) (即, 腌泡汁浓度为约8.2%KCl以在最终食品中得到约1.2%的KCl浓度)。化合物储备溶液通过如下制备: 将一定量的测试化合物溶解于乙醇或水中 (取决于化合物的溶解度) 以产生5mg/mL储备化合物溶液。将足够的乙醇加至每种储备化合物溶液以产生含有1%乙醇的最终储备化合物溶液。将腌泡汁、储备化合物溶液和火鸡碎肉加至混合钵中, 以低速混合约2分钟, 然后以高速混合约5分钟。将腌泡的火鸡肉混合物分成一磅等份, 真空密封成食物包装袋 (food saver bag), 允许在冰箱中腌泡约2小时。然后将真空密封的火鸡肉在约86°C水浴中蒸煮约30分钟。如果约30分钟后内部火鸡肉温度未达到约170°F, 那么将真空密封的火鸡肉再蒸煮约5分钟。然后在味道试验之前将真空密封的火鸡肉冷冻约两周。在火鸡肉制备期间通过将KCl溶解于腌泡汁中而在不添加任何测试化合物下类似地制备KCl标准物。在火鸡肉制备期间通过将NaCl溶解于腌泡汁中而在不添加任何测试化合物下类似地制备NaCl标准物 (NaCl

标准物不含有任何KCl)。

[0745] 评测者通过咀嚼和吐出品尝各份。为了消除样品次序的影响,采用完全拉丁方阵设计以使在受试者中利用送样的每种可能次序。在数个独立的味道试验试验中测试每个样品。在样品之间要求评测者用Poland Spring™水漱口,吃饼干,并等待约10分钟。在每种情况下,要求评测者选择苦味较小的样品。说明性结果在表1中提供。

[0746] 表1.KCl拉丁方阵-2AFC味道固体火鸡肉

化合物 编号	腌泡汁中 KCl的浓 度(固体 火鸡肉中 KCl的浓 度)	以ppm计的所测试 的化合物的浓度 (识别出苦味减小 的评测者的数量/ 所测试的评测者 的数量)	至少50%评 测者识别出 苦味减小的 浓度(ppm)	至少50%评测 者识别出苦味 减小的浓度并 且 $p \leq 0.1$ (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
标准物	10.9% (1.6%)	--	--	--

[0748] 实施例2 使用拉丁方阵两种替代强迫性选择方法(拉丁方阵-2AFC),测试化合物对人感觉KCl食品的苦味的影响

[0749] 使用如下拉丁方阵-2AFC试验方法,使用“咀嚼和吐出”试验评价测试化合物对人感觉所制备的食品中KCl的苦味的影响。

[0750] 根据下列操作指南制备可食用KCl食品(“KCl测试食品”)。将6杯水在不锈钢锅中煮沸至‘翻滚’沸腾。一旦达到翻滚沸腾,将166.5克意大利面添加至沸水中。短暂搅拌意大利面以防意大利面黏锅。将意大利面煮沸8.5分钟并在不锈钢滤锅中排干。振摇意大利面(前后约15次和上下两次)以除去过量水。将排干的意大利面放回不锈钢锅,将56克(4汤匙)Land O’Lakes™无盐黄油加至热意大利面。当无盐黄油半数融化时,在意大利面中央加入39.5克奶酪粉末(含有KCl)。另外,将测试化合物在1ml丙二醇(PG;可选地可将测试化合物在牛奶储备溶液或黄油储备溶液中稀释)并且将所得溶液添加至99ml牛奶。在奶酪粉末周围倒入63ml PG/牛奶溶液并用不锈钢匙小心地调入意大利面中以避免奶酪在匙上凝结。通过添加牛奶而无任何测试化合物下类似地制备KCl标准物。通过添加包含NaCl的奶酪粉末

和牛奶而无任何测试化合物下类似地制备NaCl标准物(NaCl标准物不含有任何KCl)。

[0751] 评测者通过咀嚼和吐出品尝各份。为了消除样品次序的影响,采用完全拉丁方阵设计以使在受试者中利用送样的每种可能次序。在数个独立的味道试验试验中测试每个样品。在样品之间要求评测者用Poland Spring™水漱口,吃饼干,并等待约10分钟。在每种情况下,要求评测者选择苦味较小的样品。说明性结果在表2中提供。

[0752] 表2.KCl拉丁方阵-2AFC味道通心粉和奶酪

[0753]

化合物 编号	奶酪粉末中 KCl的浓度(最终所制备的食 品中KCl的浓度)	以ppm计的所测试 的化合物的浓度 (识别出苦味减小的 评测者的数量/所测试 的评测者的数量)	至少50%评 测者识别出 苦味减小的 浓度(ppm)	至少50%评 测者识别出 苦味减小的 浓度并且 $p \leq 0.1$ (ppm)
5	5.7% (0.34%)	10 (28/50) 20 (20/49)	10	
标准物	5.7% (0.34%)			