

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2018-505159
(P2018-505159A)

(43) 公表日 平成30年2月22日(2018.2.22)

(51) Int.Cl.	F 1	テーマコード (参考)
C07D 311/20 (2006.01)	C07D 311/20	4 B 04 7
A23L 27/00 (2016.01)	A23L 27/00	E 4 C 06 2
A23L 27/30 (2016.01)	A23L 27/00 A23L 27/30	1 O 1 Z A

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 81 頁)

(21) 出願番号	特願2017-537293 (P2017-537293)	(71) 出願人	505069085 クロモセル コーポレイション アメリカ合衆国 ニュージャージー 08 902, ノース ブランズウィック, ユー . エス. ハイウェイ ワン 685
(86) (22) 出願日	平成28年1月13日 (2016.1.13)	(74) 代理人	110000855 特許業務法人浅村特許事務所
(85) 翻訳文提出日	平成29年8月18日 (2017.8.18)	(72) 発明者	ルオ、ロバート ジョン アメリカ合衆国、ニューヨーク、ニュー シティー、ヘイヴアーミル ロード 79
(86) 國際出願番号	PCT/US2016/013269	(72) 発明者	カーラン、ケヴィン アメリカ合衆国、ニュージャージー、サマ ーセット、グローサー ロード 18
(87) 國際公開番号	W02016/115263		
(87) 國際公開日	平成28年7月21日 (2016.7.21)		
(31) 優先権主張番号	62/102,790		
(32) 優先日	平成27年1月13日 (2015.1.13)		
(33) 優先権主張国	米国(US)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】甘味を調節するための化合物、組成物、およびその方法

(57) 【要約】

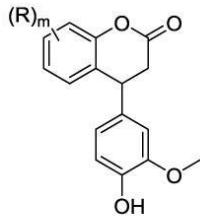
本開示は、本開示の甘味調節剤または苦味遮断剤を含む可食組成物、かかる可食組成物を含む食品、およびかかる食品を調製する方法を提供する。本開示はまた、食品中の糖の量を低減する方法、食事中のカロリー摂取量を低減する方法、および食品中の甘味を増強させる、または苦味を遮断する方法も提供する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



I

10

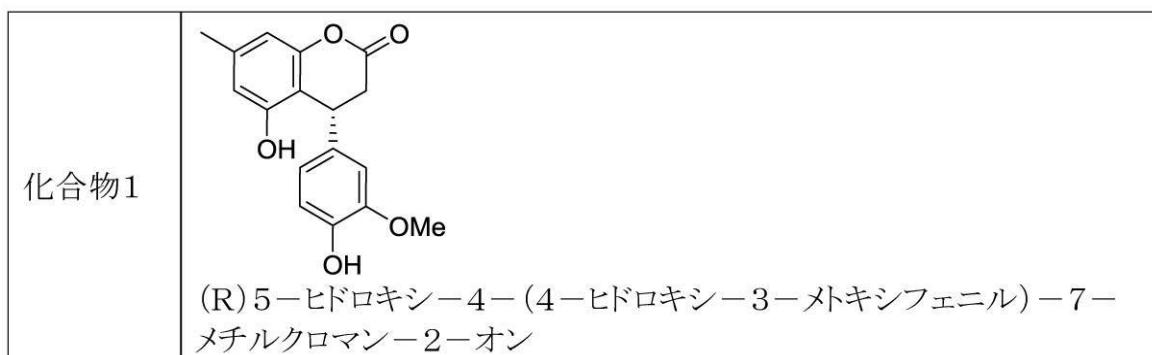
の化合物であって、式中、Rが、-OH、C₁-C₄アルキル、-CO₂H、アシリル、もしくはホルミルであり、mが2もしくは3であり、少なくとも1つのRがOHではない、化合物、またはその食用として許容される塩、光学異性体、誘導体、もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

以下の構造を有する化合物1である、請求項1に記載の化合物、またはその食用として許容される溶媒和物。

【化 2】

20



30

【請求項 3】

式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、組成物であって、前記組成物が、可食、かつ甘味料の甘味を増強することができる、組成物。

【請求項 4】

前記組成物が、甘味料をさらに含む、請求項3に記載の組成物。

【請求項 5】

40

可食組成物中の甘味料の甘味を増強する方法であって、有効量の式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを、前記可食組成物に添加することを含み、それによって、前記甘味料の甘味強度の知覚を増強させる、方法。

【請求項 6】

有効量の化合物1またはその溶媒和物が添加される、請求項5に記載の方法。

【請求項 7】

前記甘味料が、カロリー甘味料、人工甘味料、人工の高効能甘味料、天然の高効能甘味料、糖アルコール、希少糖、またはこれらの組み合わせである、請求項3または4に記載の組成物。

【請求項 8】

50

前記カロリー甘味料が、スクロース、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップ、グルコース、およびフルクトースから選択される炭水化物である、請求項5に記載の組成物または方法。

【請求項9】

前記カロリー甘味料が、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップである、請求項6に記載の組成物または方法。

【請求項10】

前記カロリー甘味料が、スクロースである、請求項6に記載の組成物または方法。

【請求項11】

前記糖アルコールが、エリトリトール、ソルビトール、マンニトール、およびキシリトールから選択されるポリオールである、請求項5に記載の組成物または方法。 10

【請求項12】

前記人工の高効能甘味料が、スクラロース、アセスルファムカリウムもしくはその他の塩、アスパルテーム、アリターム、サッカリンのナトリウムもしくはカルシウム塩、ネオヘスペリジンジヒドロカルコン、シクラミン酸ナトリウム、ネオチーム、もしくはアドバンチーム、または前述の甘味料のうちのいずれかの塩である、請求項5に記載の組成物または方法。

【請求項13】

前記天然の高効能甘味料が、ステビオールグリコシド、レバウディオサイドA、レバウディオサイドB、レバウディオサイドC(ズルコシドB)、レバウディオサイドD、レバウディオサイドE、レバウディオサイドF、レバウディオサイドI、レバウディオサイドH、レバウディオサイドL、レバウディオサイドK、レバウディオサイドJ、レバウディオサイドN、レバウディオサイドO、レバウディオサイドM、ズルコシドA、ルブソシド、ステビア葉抽出物、ステビオシド、グリコシル化ステビオールグリコシド、モグロシド、モグロシドV、イソモグロシド、モグロシドIV、羅漢果(Luo Han Guo)果実抽出物、シアメノシド、モナチンまたはその任意の塩(モナチンSS、RR、RS、SR)、クルクリン、グリシルリジン酸またはその任意の塩、タウマチン、モネリン、マビンリン、プラゼイン、ヘルナンズルチン、フィロズルチン、グリシフィリン、フロリジン、トリロバチン、バイユノシド、オスラジン、ポリポドシドA、ブテロカリオシドA、ブテロカリオシドB、ムクロジオシド、フロミソシドI、ペリアンドリンI、アブルソシドA、もしくはシクロカリオシドI、または前述の甘味料のうちのいずれかの混合物である、請求項5に記載の組成物または方法。 20

【請求項14】

前記希少糖が、D-ブシコース、D-ツラノース、D-アロース、D-タガトース、D-ソルボース、L-フルクトース、L-グルコース、D-ソルボース、L-フルクトース、L-タロース、L-リボース、L-アラビノース、またはこれらの組み合わせである、請求項5に記載の組成物または方法。

【請求項15】

前記甘味料の甘味強度の知覚が、約6.5～約7.5のpHの可食組成物において約5%～約50%増強される、請求項3、4、および7～14のいずれか一項に記載の組成物、または請求項5～14のいずれか一項に記載の方法。 40

【請求項16】

前記甘味料の甘味強度の知覚が、約2.5～約3.5のpHの可食組成物において約5%～約50%増強される、請求項3、4、および7～14のいずれか一項に記載の組成物、または請求項5～14のいずれか一項に記載の方法。

【請求項17】

前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約5%～約100%増強される、請求項3、4、および7～14のいずれか一項に記載の組成物、または請求項5～14のいずれか一項に記載の方法。

【請求項18】

10

20

30

40

50

前記可食組成物が、1つ以上の甘味改善添加剤をさらに含む、請求項3、4、および7～14のいずれか一項に記載の組成物、または請求項5～17のいずれか一項に記載の方法。

【請求項19】

前記甘味改善添加剤が、炭水化物、ポリオール、グリコシド、アミノ酸、糖酸、ポリアミノ酸、ヌクレオチド、塩、有機酸、有機エステル、香味料、甘い風味、アルコール、フラボノイド、苦味化合物、タンパク質、タンパク質加水分解物、乳化剤、界面活性剤、およびポリマーからなる群から選択される、請求項16に記載の組成物または方法。

【請求項20】

前記ポリオールが、エリトリトールである、請求項17に記載の組成物または方法。

10

【請求項21】

前記アミノ酸が、グリシン、アラニン、リシン、グルタミン酸、タウリン、セリン、またはプロリンである、請求項17に記載の組成物または方法。

【請求項22】

前記塩が、NaCl、KCl、またはMgCl₂である、請求項17に記載の組成物または方法。

【請求項23】

前記甘味料の甘味強度の知覚が、甘味反応アッセイのためのインビトロアッセイにおいて測定されたとき、増強される、請求項3、4、および7～22のいずれか一項に記載の組成物、または請求項5～22のいずれか一項に記載の方法。

20

【請求項24】

前記甘味料の甘味強度の知覚が、甘味反応アッセイのためのインビボアッセイにおいて測定されたとき、増強される、請求項3、4、および7～22のいずれか一項に記載の組成物、または請求項5～22のいずれか一項に記載の方法。

【請求項25】

可食組成物中の苦味物質の苦味を低減する方法であって、有効量の式(I)の風味料等級化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを、前記可食組成物に添加することを含み、それによって、前記苦味物質の苦味の味覚が低減される、方法。

30

【請求項26】

式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、可食組成物中の異味を軽減するために使用される、請求項5～25のいずれか一項に記載の方法。

【請求項27】

前記異味が、苦味、金属味、または渋味である、請求項26に記載の方法。

【請求項28】

可食組成物を調製する方法であって、

(a) 食用として許容される担体を提供することと、

(b) 前記食用として許容される担体に、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを添加することと、を含む、方法。

40

【請求項29】

前記食用として許容される担体が、甘味料を含む、請求項28に記載の方法。

【請求項30】

前記甘味料が、カロリー甘味料、人工甘味料、天然の高効能甘味料、または前述の甘味料のうちのいずれかの組み合わせである、請求項28または29に記載の方法。

【請求項31】

前記カロリー甘味料が、スクロース、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップ、

50

グルコース、およびフルクトースである、請求項 30 に記載の方法。

【請求項 32】

前記カロリー甘味料が、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップである、請求項 30 に記載の方法。

【請求項 33】

前記カロリー甘味料が、エリトリトール、ソルビトール、マンニトール、およびキシリトールから選択されるポリオールである、請求項 30 に記載の方法。

【請求項 34】

前記人工甘味料が、スクラロース、アセスルファムカリウムもしくはその他の塩、アスパルテーム、アリターム、サッカリンのナトリウムもしくはカルシウム塩、ネオヘスペリジンジヒドロカルコン、シクラミン酸ナトリウム、ネオターム、もしくはアドバンテーム、またはそれらの塩である、請求項 30 に記載の方法。

10

【請求項 35】

前記天然の高效能甘味料が、ステビオールグリコシド、レバウディオサイド A、レバウディオサイド B、レバウディオサイド C (ズルコシド B)、レバウディオサイド D、レバウディオサイド E、レバウディオサイド F、レバウディオサイド I、レバウディオサイド H、レバウディオサイド L、レバウディオサイド K、レバウディオサイド J、レバウディオサイド N、レバウディオサイド O、レバウディオサイド M、ズルコシド A、ルブソシド、ステビア葉抽出物、ステビオシド、グリコシル化ステビオールグリコシド、モグロシド V、イソモグロシド、モグロシド I V、羅漢果果実抽出物、シアメノシド、モナチンもしくはその塩のうちの 1 つ (モナチン S S、R R、R S、S R)、クルクリン、グリシルリジン酸もしくはその塩、タウマチン、モネリン、マビンリン、ブラゼイン、ヘルナンズルチン、フィロズルチン、グリシフィリン、フロリジン、トリロバチン、バイユノシド、オスラジン、ポリポドシド A、ブテロカリオシド A、ブテロカリオシド B、ムクロジオシド、フロミソシド I、ペリアンドリン I、アブルソシド A、もしくはシクロカリオシド I、またはこれらの混合物である、請求項 30 に記載の方法。

20

【請求項 36】

式 (I) による甘味料および甘味調節剤、化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、卓上甘味料組成物。

30

【請求項 37】

少なくとも 1 つの增量剤、添加剤、固化防止剤、機能性成分、またはこれらの組み合わせをさらに含む、請求項 36 に記載の卓上甘味料組成物。

【請求項 38】

前記卓上甘味料組成物が、液体の形態である、請求項 36 に記載の卓上甘味料組成物。

【請求項 39】

糖またはポリオールを含む共結晶性風味組成物、凝集風味組成物、圧縮風味組成物、乾燥風味組成物、粒子風味組成物、球状風味組成物、顆粒風味組成物、または液体風味組成物からなる群から選択される送達システムであって、前記風味組成物が、式 (I) の化合物、化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、送達システム。

40

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

関連出願の相互参照

本出願は、2015年1月13日に出願された米国仮出願第 62/102,790 号の利益を主張し、この米国仮出願の開示は、参照によりその全体が本明細書に組み込まれる

50

。

【0002】

本開示は、可食組成物中の香料に関する。

【背景技術】

【0003】

味の好みのため、生活習慣の理由により、または健康関連の目的のためにある特定の個体（例えば糖尿病患者）のためであろうとなかろうと、食物および飲料物中の低減された糖含量のより広範な利用可能な選択を有するために世界的に増えている需要がある。したがって、食物および飲料物中の糖含量の低減に関する健康上の利益が望ましい。食物中のカロリー甘味料および非カロリー甘味料等の甘味料のレベルを低減するための非カロリー人工および天然の高効能甘味料の使用は、時間的および/または風味の問題、例えば、遅延開始時の甘さ、甘さの残味、苦味、金属味、または甘草味により限定されている。したがって、低減された量のカロリー甘味料（例えば砂糖）の使用を可能にするが、望ましい甘味を維持し、砂糖の代用品に関する風味の問題を回避する、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。

10

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0004】

本開示は、甘味を増強させる化合物、かかる化合物を含む可食組成物、およびかかる可食組成物を調製する方法を提供する。本開示はまた、可食組成物中の甘味料の量を低減する方法も提供する。本開示は、対象における、食物、消費者、または薬学的生成物等の可食組成物の甘味を増強、調節、または増進する方法をさらに提供する。本開示はまた、甘味受容体の活性化を調節する、特に増強するまたは増進する方法も提供する。本開示のさらなる態様は、不快な味覚を隠すまたは低減するための、具体的には、苦味物質の苦味覚を隠すまたは低減するための化合物またはこれらの混合物を提供する。

20

【0005】

本開示の一態様は、甘味物質の甘味を調節する（例えば甘味を増強する）ための化合物を提供する。いくつかの実施形態では、本化合物は、ネオフラボノイド化合物である。いくつかの実施形態では、ネオフラボノイド化合物は、約1000、約500、または約300ダルトン未満の分子量を有する。ある特定の実施形態では、ネオフラボノイド化合物は、式（I）の化合物、その食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、または誘導体である。ある特定の実施形態では、ネオフラボノイド化合物は、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、光学異性体、溶媒和物、もしくは誘導体である。本開示はまた、式（I）の化合物等の甘味調節化合物を含む可食組成物も含む。加えて、本開示はまた、化合物1等の甘味調節化合物、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体を含む可食組成物も含む。

30

【0006】

かかる味覚調節剤は、任意の好適な甘味料、例えば、天然カロリー甘味料、天然の高効能甘味料、合成高効能甘味料を含む合成甘味料、糖アルコール、希少糖、甘味料増強剤、またはこれらの組み合わせと組み合わせて、甘さを増強する組成物を提供し得る。いくつかの実施形態では、式（I）の化合物、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、またはこれらの組み合わせは、その甘味閾値以下の量で組成物中に存在する。他の実施形態では、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体は、その甘味閾値以下の量で組成物中に存在する。本化合物がその甘味閾値以下の量で組成物中に存在する実施形態では、この化合物は、甘味料としての役割を果たさない。本組成物は、少なくとも1つの甘味改善組成物をさらに含んでもよい。

40

【0007】

別の態様では、本開示は、（i）少なくとも1つの甘味料、例えば、天然カロリー甘味

50

料、天然の高効能甘味料、合成甘味料（合成の高効能甘味料、糖アルコール、希少糖、甘味料増強剤、またはこれらの組み合わせを含む）、および（i i）ネオフラボノイド本開示の甘味調節剤、例えば、式（I）の化合物、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、またはその光学異性体、またはこれらの組み合わせを含む、甘味料の甘味を増強する方法を提供する。いくつかの実施形態では、本開示のネオフラボノイド甘味調節剤は、化合物1その食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体である。本方法は、（i i i）少なくとも1つの甘味改善組成物を混合することをさらに含んでもよい。本化合物は、それらの甘味閾値以下の量で添加されてもよい。

【0008】

10

本開示の他の態様は、飲料組成物等の可食組成物、濃縮物（例えば飲料組成物で用いるための）、食品、薬学的調製物、および本開示の組成物を含む卓上甘味料；可食組成物を調製するための方法；可食組成物中の甘味料の量を低減させるための方法；カロリー摂取量を低減させるための方法；甘味受容体の活性化を増強する方法、ならびに本開示の甘味調節剤を合成する方法を含む。

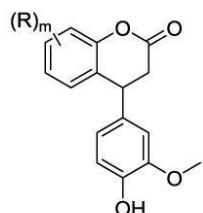
【0009】

本開示の特定の実施形態が、以下の番号付けされた項目において記述されている。

1. 式（I）：

【化1】

20



I

の化合物であって、式中、Rが、-OH、C₁～C₄アルキル、-CO₂H、アシル、もしくはホルミルであり、mが2もしくは3であり、少なくとも1つのRがOHではない化合物、またはその食用として許容される塩、光学異性体、誘導体、もしくは溶媒和物。

30

2. 前記化合物が、(R)5-ヒドロキシ-4-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-7-メチルクロマン-2-オン、またはその食用として許容される溶媒和物である、項目1に記載の化合物。

3. 可食組成物中の甘味料の甘味を増強する方法であって、有効量の式（I）の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを、前記可食組成物に添加することを含み、それによって、前記甘味料の甘味強度の知覚を増強させる、方法。

4. 有効量の化合物1またはその溶媒和物が添加される、項目3に記載の方法。

40

5. 前記甘味料が、カロリー甘味料、人工甘味料、人工の高効能甘味料、天然の高効能甘味料、糖アルコール、希少糖、またはこれらの組み合わせである、項目3～4のいずれか1つに記載の方法。

6. 前記カロリー甘味料が、スクロース、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップ、グルコース、およびフルクトースから選択される炭水化物である、項目5に記載の方法。

7. 前記カロリー甘味料が、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップである、項目6に記載の方法。

8. 前記カロリー甘味料が、スクロースである、項目6に記載の方法。

9. 前記糖アルコールが、エリトリトール、ソルビトール、マンニトール、およびキシ

50

リトルから選択されるポリオールである、項目 5 に記載の方法。

10. 前記人工の高効能甘味料が、スクラロース、アセスルファムカリウムもしくは他の塩、アスパルチーム、アリターム、サッカリンのナトリウムもしくはカルシウム塩、ネオヘスペリジンジヒドロカルコン、シクラミン酸ナトリウム、ネオターム、もしくはアドバンチーム、または前述の甘味料のうちのいずれかの塩である、項目 5 に記載の方法。

11. 前記天然の高効能甘味料が、ステビオールグリコシド、レバウディオサイド A、レバウディオサイド B、レバウディオサイド C (ズルコシド B)、レバウディオサイド D、レバウディオサイド E、レバウディオサイド F、レバウディオサイド I、レバウディオサイド H、レバウディオサイド L、レバウディオサイド K、レバウディオサイド J、レバウディオサイド N、レバウディオサイド O、レバウディオサイド M、ズルコシド A、ルブソシド、ステビア葉抽出物、ステビオシド、グリコシル化ステビオールグリコシド、モグロシド、モグロシド V、イソモグロシド、モグロシド I V、羅漢果 (Luo Han Guo) 果実抽出物、シアメノシド、モナチンまたはその任意の塩 (モナチン SS, RR, RS, SR)、クルクリン、グリシルリジン酸またはその任意の塩、タウマチン、モネリン、マビンリン、プラゼイン、ヘルナンズルチン、フィロズルチン、グリシフィリン、フロリジン、トリロバチン、バイユノシド、オスラジン、ポリポドシド A、プテロカリオシド A、プテロカリオシド B、ムクロジオシド、フロミソシド I、ペリアンドリン I、アブルソシド A、もしくはシクロカリオシド I、または前述の甘味料のうちのいずれかの混合物である、項目 5 に記載の方法。

12. 前記希少糖が、D - プシコース、D - ツラノース、D - アロース、D - タガトース、D - ソルボース、L - フルクトース、L - グルコース、D - ソルボース、L - フルクトース、L - タロース、L - リボース、L - アラビノース、またはこれらの組み合わせである、項目 5 に記載の方法。

13. 前記式 (I) の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約 1 ppm ~ 約 100 ppm の濃度で前記可食組成物中に存在する、項目 3 ~ 12 のいずれか 1 つに記載の方法。

14. 前記式 (I) の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約 1 ppm ~ 約 60 ppm の濃度で前記可食組成物中に存在する、項目 13 に記載の方法。

15. 前記式 (I) の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約 1 ppm ~ 約 50 ppm または約 5 ppm ~ 約 50 ppm の濃度で前記可食組成物中に存在する、項目 13 に記載の方法。

16. 前記式 (I) の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約 20 ppm ~ 約 3,000 ppm の濃度で前記可食組成物中に存在する、項目 3 ~ 12 のいずれか 1 つに記載の方法。

17. 前記式 (I) の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約 100 ppm ~ 約 1,000 ppm の濃度で前記可食組成物中に存在する、項目 16 に記載の方法。

18. 前記式 (I) の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約 100 ppm ~ 約 300 ppm の濃度で前記可食組成物中に存在する、項目 17 に記載の方法。

19. 前記式 (I) の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約 5 ppm、約 10 ppm、約 15 ppm、約 20 ppm

10

20

30

40

50

、約25ppm、約30ppm、約35ppm、約40ppm、約45ppm、または約50ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目3～12のいずれか1つに記載の方法。

20. 前記可食組成物が、約2.0～約8.5のpHである、項目3～19のいずれか1つに記載の方法。

21. 前記可食組成物が、約2.0～約4.0または約6.0～約8.0のpHである、項目20に記載の方法。

22. 前記可食組成物が、約3.0または約7.0のpHである、項目21に記載の方法。

23. 前記甘味料の甘味強度の知覚が、約6.5～約7.5のpHの可食組成物において約5%～約50%増強される、項目3～21のいずれか1つに記載の方法。 10

24. 前記甘味料の甘味強度の知覚が、約2.5～約3.5のpHの可食組成物において約5%～約50%増強される、項目3～21のいずれか1つに記載の方法。

25. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約5%～約100%増強される、項目3～21のいずれか1つに記載の方法。

26. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約5%～約75%増強される、項目25に記載の方法。

27. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約10%～約60%増強される、項目26に記載の方法。

28. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約10%～約50%増強される、項目27に記載の方法。 20

29. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約10%～約25%増強される、項目28に記載の方法。

30. 前記可食組成物が、飲料である、項目3～29のいずれか1つに記載の方法。

31. 前記飲料が、非アルコール飲料である、項目30に記載の方法。

32. 前記可食組成物が、酸化防止剤、ビタミン、グルコサミン、食物繊維、水和剤、プロバイオティック、プレバイオティック、植物ステロール、オメガ3油、脂肪酸、サポニン、天然もしくは合成防腐剤、ミネラル、体重管理剤、骨粗鬆症管理剤、植物エストロゲン、長鎖第1級脂肪族飽和アルコール、もしくは植物ステロール、または前述のもののうちのいずれかの組み合わせのうちの1つ以上をさらに含む、項目3～31のいずれか1つに記載の方法。 30

33. 前記可食組成物が、1つ以上の甘味改善添加剤をさらに含む、項目3～32のいずれか1つに記載の方法。

34. 前記甘味改善添加剤が、炭水化物、ポリオール、グリコシド、アミノ酸、糖酸、ポリアミノ酸、ヌクレオチド、塩、有機酸、有機エステル、香味料、甘い風味、アルコール、フラボノイド、苦味化合物、タンパク質、タンパク質加水分解物、乳化剤、界面活性剤、およびポリマーからなる群から選択される、項目33に記載の方法。

35. 前記甘味改善添加剤が、甘い風味である、項目34に記載の方法。

36. 前記甘味改善添加剤が、ポリオールである、項目35に記載の方法。

37. 前記ポリオールが、エリトリトールである、項目36に記載の方法。 40

38. エリトリトール対前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせの重量比が、約1:1～約800:1である、項目37に記載の方法。

39. エリトリトール対前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、重量で約(30～200):1または約(50～100):1である、項目38に記載の方法。

40. 前記甘味改善添加剤が、アミノ酸である、項目33に記載の方法。

41. 前記アミノ酸が、グリシン、アラニン、リジン、グルタミン酸、タウリン、セリ 50

ン、またはプロリンである、項目 40 に記載の方法。

42. 前記アミノ酸が、約 10 ppm ~ 約 25,000 ppm の濃度で存在する、項目 40 または 41 に記載の方法。

43. 前記アミノ酸が、約 100 ppm ~ 約 5,000 ppm の濃度で存在する、項目 42 に記載の方法。

44. 前記甘味改善添加剤が、塩である、項目 33 に記載の方法。

45. 前記塩が、NaCl、KCl、または MgCl₂ である、項目 44 に記載の方法。

46. 甘い反応性アッセイのためのインピトロアッセイにおいて測定されたとき、前記甘味料の甘味強度の知覚が、増強される、項目 3 ~ 45 のいずれか 1 つに記載の方法。 10

47. 甘い反応性アッセイのためのインピボアッセイにおいて測定されたとき、前記甘味料の甘味強度の知覚が、増強される、項目 3 ~ 45 のいずれか 1 つに記載の方法。

48. 可食組成物中の苦味物質の苦味を低減する方法であって、有効量の式 (I) の化合物、化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを、前記可食組成物に添加することを含み、それによって、前記苦味物質の苦味の味覚が低減される、方法。

49. 前記式 (I) の化合物、化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、可食組成物中の異味を軽減するために使用される、項目 3 ~ 48 のいずれか 1 つに記載の方法。 20

50. 前記異味が、苦味、金属味、または渋味である、項目 49 に記載の方法。

51. 式 (I) の化合物、化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、組成物であって、前記組成物が、可食、かつ甘味料の甘味を増強することができる、組成物。

52. 前記組成物が、甘味料をさらに含む、項目 51 に記載の組成物。

53. 前記甘味料が、カロリー甘味料、人工甘味料、天然の高効能甘味料、または前述の甘味料のうちのいずれかの組み合わせである、項目 51 ~ 52 のいずれか 1 つに記載の組成物。 30

54. 前記カロリー甘味料が、スクロース、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップ、グルコース、およびフルクトースから選択される炭水化物である、項目 53 に記載の組成物。

55. 前記カロリー甘味料が、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップである、項目 53 に記載の組成物。

56. 前記カロリー甘味料が、スクロースである、項目 53 に記載の組成物。

57. 前記カロリー甘味料が、エリトリトール、ソルビトール、マンニトール、およびキシリトールから選択されるポリオールである、項目 53 に記載の組成物。

58. 前記人工甘味料が、スクラロース、アセスルファムカリウムもしくはその他の塩、アスパルテーム、アリターム、サッカリンのナトリウムもしくはカルシウム塩、ネオヘスペリジンジヒドロカルコン、シクラミン酸ナトリウム、ネオターム、もしくはアドバントーム、またはそれらの塩である、項目 53 に記載の組成物。 40

59. 前記天然の高効能甘味料が、ステビオールグリコシド、レバウディオサイド A、レバウディオサイド B、レバウディオサイド C (ズルコシド B)、レバウディオサイド D、レバウディオサイド E、レバウディオサイド F、レバウディオサイド I、レバウディオサイド H、レバウディオサイド L、レバウディオサイド K、レバウディオサイド J、レバウディオサイド N、レバウディオサイド O、レバウディオサイド M、ズルコシド A、ルブソシド、ステビア葉抽出物、ステビオシド、グリコシル化ステビオールグリコシド、モグロシド V、イソモグロシド、モグロシド I V、羅漢果果実抽出物、シアメノシド、モナチンまたはその任意の塩 (モナチン S S、R R、R S、S R)、クルクリン、グリシルリジ

10

20

30

40

50

ン酸またはその任意の塩、タウマチン、モネリン、マビンリン、プラゼイン、ヘルナンズルチン、フィロズルチン、グリシフィリン、フロリジン、トリロバチン、バイユノシド、オスラジン、ポリポドシドA、ブテロカリオシドA、ブテロカリオシドB、ムクロジオシド、フロミソシドI、ペリアンドリンI、アブルソシドA、もしくはシクロカリオシドI、または前述の甘味料のうちのいずれかの混合物である、項目53に記載の組成物。

60. 前記組成物が、化合物1またはその食用として許容される塩もしくは溶媒和物を含む、項目51～59のいずれか1つに記載の組成物。

61. 前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約0.1ppm～約100ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目51～59のいずれか1つに記載の組成物。

62. 前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約5ppm～約60ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目61に記載の組成物。

63. 前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約10ppm～約50ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目62に記載の組成物。

64. 前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約30ppm～約3,000ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目51～59のいずれか1つに記載の組成物。

65. 前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約100ppm～約1,000ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目64に記載の組成物。

66. 前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約100ppm～約300ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目65に記載の組成物。

67. 前記式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせが、約1ppm、約5ppm、約10ppm、約15ppm、約20ppm、約25ppm、約30ppm、約35ppm、約40ppm、約45ppm、または約50ppmの濃度で前記可食組成物中に存在する、項目65に記載の組成物。

68. 前記可食組成物が、約2.0～約8.5のpHである、項目51～67のいずれか1つに記載の組成物。

69. 前記可食組成物が、約2.0～約4.0、約3.0～約7.0、または約6.0～約8.0のpHである、項目68に記載の組成物。

70. 前記可食組成物が、約3.0または約7.0のpHである、項目69に記載の組成物。

71. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約5%～約100%増強される、項目51～70のいずれか1つに記載の組成物。

72. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約5%～約70%増強される、項目71に記載の組成物。

73. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約5%～約50%増強される、項目72に記載の組成物。

74. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約10%～約60%増強される、項目73に記載の組成物。

10

20

30

40

50

75. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約10%～約50%増強される、項目74に記載の組成物。

76. 前記可食組成物中の前記甘味料の甘味強度の知覚が、約10%～約40%増強される、項目75に記載の組成物。

77. 前記可食組成物が、飲料である、項目51～76のいずれか1つに記載の組成物。

78. 前記飲料が、非アルコール飲料である、項目77に記載の組成物。

79. 前記可食組成物が、酸化防止剤、ビタミン、グルコサミン、纖維、水和剤、バイオティック、プレバイオティック、植物ステロール、オメガ3油、脂肪酸、サポニン、天然もしくは合成防腐剤、ミネラル、体重管理剤、骨粗鬆症管理剤、植物エストロゲン、長鎖第1級脂肪族飽和アルコール、植物ステロール、または前述のもののうちのいずれかの組み合わせのうちの1つ以上をさらに含む、項目51～78のいずれか1つに記載の組成物。

80. 前記可食組成物が、1つ以上の甘味改善添加剤をさらに含む、項目51～79のいずれか1つに記載の方法。

81. 前記甘味改善添加剤が、炭水化物、ポリオール、グリコシド、アミノ酸、糖酸、ポリアミノ酸、ヌクレオチド、塩、有機酸、有機エステル、香味料、甘い風味、アルコール、フラボノイド、苦味化合物、タンパク質、タンパク質加水分解物、乳化剤、界面活性剤、およびポリマーからなる群から選択される、項目80に記載の組成物。

82. 前記甘味改善添加剤が、ポリオールである、項目81に記載の組成物。

83. 前記ポリオールが、エリトリトールである、項目82に記載の組成物。

84. エリトリトール対式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせの重量比が、約1：1～約800：1である、項目83に記載の組成物。

85. エリトリトール対式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせの重量比が、約(30～200)：1または約(50～100)：1である、項目84に記載の組成物。

86. 前記甘味改善添加剤が、アミノ酸である、項目81に記載の組成物。

87. 前記アミノ酸が、グリシン、アラニン、タウリン、セリン、またはプロリンである、項目86に記載の組成物。

88. 前記アミノ酸が、約10ppm～約25,000ppmの濃度で存在する、項目86または87に記載の組成物。

89. 前記アミノ酸が、約100ppm～約1000ppmの濃度で存在する、項目88に記載の組成物。

90. 前記甘味改善添加剤が、塩である、項目80に記載の組成物。

91. 前記塩が、NaCl、KCl、またはMgCl₂である、項目90に記載の組成物。

92. 可食組成物を調製する方法であって、

(a) 食用として許容される担体を提供することと、

(b) 前記食用として許容される担体に、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを添加することと、を含む、方法。

93. 前記食用として許容される担体が、甘味料を含む、項目92に記載の方法。

94. 前記甘味料が、カロリー甘味料、人工甘味料、天然の高効能甘味料、または前述の甘味料のうちのいずれかの組み合わせである、項目92～93のいずれか1つに記載の方法。

95. 前記カロリー甘味料が、スクロース、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップ、グルコース、およびフルクトースから選択される炭水化物である、項目94に記載

10

20

30

40

50

の方法。

96. 前記カロリー甘味料が、高フルクトースコーンまたはデンプンシロップである、項目94に記載の方法。

97. 前記カロリー甘味料が、エリトリトール、ソルビトール、マンニトール、およびキシリトールから選択されるポリオールである、項目94に記載の方法。

98. 前記人工甘味料が、スクラロース、アセスルファムカリウムもしくはその他の塩、アスパルテーム、アリターム、サッカリンのナトリウムもしくはカルシウム塩、ネオヘスペリジンジヒドロカルコン、シクラミン酸ナトリウム、ネオターム、もしくはアドバントーム、またはそれらの塩である、項目94に記載の方法。

99. 前記天然の高効能甘味料が、ステビオールグリコシド、レバウディオサイドA、レバウディオサイドB、レバウディオサイドC(ズルコシドB)、レバウディオサイドD、レバウディオサイドE、レバウディオサイドF、レバウディオサイドI、レバウディオサイドH、レバウディオサイドL、レバウディオサイドK、レバウディオサイドJ、レバウディオサイドN、レバウディオサイドO、レバウディオサイドM、ズルコシドA、ルブソシド、ステビア葉抽出物、ステビオシド、グリコシル化ステビオールグリコシド、モグロシドV、イソモグロシド、モグロシドIV、羅漢果果実抽出物、シアメノシド、モナチンもしくはその塩のうちの1つ(モナチンSS、RR、RS、SR)、クルクリン、グリシルリジン酸もしくはその塩、タウマチン、モネリン、マビンリン、プラゼイン、ヘルナンズルチソ、フィロズルチソ、グリシフィリン、フロリジン、トリロバチソ、バイユノシド、オスラジン、ポリポドシドA、ブテロカリオシドA、ブテロカリオシドB、ムクロジオシド、フロミソシドI、ペリアンドリンI、アブルソシドA、もしくはシクロカリオシドI、またはこれらの混合物である、項目94に記載の方法。

100. 前記組成物が、非炭酸飲料、炭酸飲料、コーラ、ルートビア、果物味の飲料、シトラス味の飲料、果汁、果実含有飲料、野菜ジュース、野菜含有飲料、茶、コーヒー、乳飲料、スポーツドリンク、エネルギードリンク、および増強またはフレーバー水からなる群から選択される飲料である、項目77に記載の組成物。

101. 前記組成物が、食品、飲料製品、薬学的組成物、栄養製品、機能的製品、栄養補助食品、市販薬、または口腔ケア製品で使用される、項目51に記載の組成物。

102. 式(I)による甘味料および甘味調節剤、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、卓上甘味料組成物。

103. 少なくとも1つの增量剤、添加剤、固化防止剤、機能性成分、またはこれらの組み合わせをさらに含む、項目102に記載の卓上甘味料組成物。

104. 前記卓上甘味料組成物が、液体の形態である、項目102に記載の卓上甘味料組成物。

105. 前記食品または前記飲料製品が、スープ、粉末ソフトドリンク、ベーカリー製品、チューインガム、砂糖菓子、シリアル、可食ゲル、ジャムまたはゼリー、スプレッド、ケチャップ、乳製品、冷凍乳製品、ゼラチン/プロテイニア、およびアイスクリームからなる群から選択される、項目101に記載の組成物。

106. 糖またはポリオールを含む共結晶性風味組成物、凝集風味組成物、圧縮風味組成物、乾燥風味組成物、粒子風味組成物、球状風味組成物、顆粒風味組成物、または液体風味組成物からなる群から選択される送達システムであって、前記風味組成物が、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、送達システム。

107. 可食組成物中の苦味物質の苦味を低減する方法であって、有効量の式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを、前記可食組成物に添加することを含み、それによって、前記苦味物質の苦味の味覚が低減される、方法。

10

20

30

40

50

108. 式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、組成物であって、前記組成物が、可食、かつ苦味物質の苦味を低減させることができる、組成物。

109. 式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む、組成物であって、前記組成物が、可食、かつ甘味料の甘味を増強し、苦味物質の苦味を低減させることができる、組成物。

110. 前記組成物が、飲料である、項目109に記載の組成物。

【図面の簡単な説明】

10

【0010】

【図1】pH7の高フルクトースコーンシロップ溶液で甘味が付けてあるレモンライムマトリックス中の化合物1に起因すると考えられる7つの味覚の記述的な分析評価を示す。化合物1は、対照甘味料溶液に対するスパイダープロット形式で比較される。

【発明を実施するための形態】

【0011】

本明細書に記載される本開示を十分に理解することができるよう、以下の詳細な説明を記述する。

【0012】

別段に定義されない限り、本明細書において用いられるすべての技術用語および科学用語は、本開示が属する当業者によって一般に理解されるのと同じ意味を有する。本明細書に記載される方法および材料に類似するか、または同等の方法および材料を本開示の実践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は以下に記載されている。材料、方法、および実施例は例示のみであり、限定することを意図していない。本明細書に記述されたすべての刊行物、特許、および他の参考文献は、参照によりその全体が組み込まれる。

20

【0013】

本出願を通して、「含む(comprise)」という単語または「含んでいる(comprises)」もしくは「含む(comprising)」等の変化形は、示されている整数または整数群を含むことを意味するが、任意の他の整数または整数群を除外することを意味しないと理解されるであろう。

30

【0014】

「脂肪族」という用語は、完全に飽和されるか、または1つ以上の不飽和単位を含有する直鎖または分岐鎖の炭化水素を指す。例えば、脂肪族基には、置換または非置換の直鎖または分岐鎖アルキル基、アルケニル基、およびアルキニル基が含まれる。別段示されない限り、「脂肪族」という用語は、置換または非置換の両方の炭化水素を包含する。

【0015】

「アルコキシ」という用語は、O-アルキル置換基を指し、このアルキル部分は、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、これらに限定されない。また、O-アルケニル基またはO-アルキニル基は、「アルコキシ」という用語の範囲内に明確に含まれる。すべての場合において、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。

40

【0016】

「アルキル」という用語は、例えば、1~3個、1~6個、1~9個、または1~12個の炭素原子を含有する直鎖および分岐鎖の飽和鎖の両方を指す。アルキル基は、任意で置換されてもよい。

【0017】

「アルケニル」という用語は、例えば、2~3個、2~6個、2~9個、または2~12個の炭素原子、および少なくとも1つの炭素-炭素二重結合を含有する直鎖および分岐

50

鎖の飽和鎖の両方を指す。アルケニル基は、任意で置換されてもよい。

【0018】

「アルキニル」という用語は、例えば、2～3個、2～6個、2～9個、または2～12個の炭素原子、および少なくとも1つの炭素-炭素三重結合を含有する直鎖および分岐鎖の飽和鎖の両方を指す。アルキニル基は、任意で置換されてもよい。

【0019】

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指す。下記の香料の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、および異味の後味、ならびに冷凍焼けおよびボール紙味覚が挙げられるが、これらに限定されない、望ましくない味覚、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。

10

【0020】

「苦味物質」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/または対象において苦味の知覚を与える化合物を指す。「苦味物質」はまた、一緒になり、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/または対象において苦味の知覚を与える多様な化合物を指す。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、理解することができる。苦味物質は、甘味も有するか、または甘味も主に有する物質を含み得る。かかる物質の例には、ステビオールグリコシドおよびアセスルファムカリウムが含まれる。

20

【0021】

「食用としてまたは生物学的に許容される塩」という用語は、摂取の際に、甘味料に起因する甘味の知覚を増強する、および/または苦味物質による苦い味の知覚を低減させる能力を特徴とする、本開示の化合物、またはその代謝体、残留物、もしくはその一部を(直接的または間接的に)提供することができる、本開示の化合物の任意の食用としてもしくは生物学的に許容される塩、エステル、またはかかるエステルの塩を指す。同様に、「食用としてまたは生物学的に許容される誘導体」という用語は、摂取の際に、甘味料に起因する甘味の知覚を増強する、および苦味物質による苦い味の知覚を低減させる能力を特徴とする、本開示の化合物、またはその代謝体、残留物、もしくはその一部を(直接的または間接的に)提供することができる、本開示の化合物の任意の食用としてもしくは生物学的に許容される誘導体を指す。「食用製品」は、経口使用、例えば、飲食行動に適している製品である。したがって、食用として許容される化合物は、可食化合物である。本開示の化合物の食用としてまたは生物学的に許容される塩が使用され、かかる塩は、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。かかる塩の例としては、適切な塩基から誘導される塩、例えば、アルカリ金属(例えばナトリウムおよびカリウム)塩、アルカリ土類金属(例えばマグネシウム)塩、アンモニウム塩、ならびにN⁺(C₁～₄アルキル)₄塩が挙げられるが、これらに限定されない。

30

【0022】

本開示の化合物に関する「組み合わせ」という用語は、式(I)の2つ以上の風味料等級化合物(化合物1を含む)、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体を指す。

40

【0023】

「溶媒和物」という用語は、化合物の生物学的活性を妨げない1つ以上の溶媒分子との本開示の化合物の物理的会合を指す。この物理的会合は、水素結合を含む、様々な程度のイオンおよび共有結合を含む。場合によっては、溶媒和物は、例えば1つ以上の溶媒分子が結晶固体の結晶格子内に組み込まれているとき、単離が可能であろう。「溶媒和物」は、溶液相溶媒和物と単離可能な溶媒和物の両方を包含する。好適な溶媒和物の限定されない例としては、エタノラート、水和物等が挙げられる。「水和物」は、溶媒分子が水であり、半水和物、一水和物、セスキ水和物、二水和物等を含む、溶媒和物である。

50

【0024】

「食事」という用語は集合的に、対象によって消費される食品および／または飲料を指す。対象の「食事」はまた、対象が摂取する任意の消費者製品または薬学的組成物を含む。

【0025】

「風味改良剤」という用語は、食品等の可食組成物に添加されるときに、食品風味料の個々の特徴（臭いおよび／または味覚）を変化させる、化合物または化合物の混合物を指す。香料改良効果は、可食組成物中の香料の関連感覚特性の知覚を増大、軽減、隠蔽、排除、低減、増強、または変化させることを含み得る。風味改良剤の風味を改良する能力は、それらの芳香族または味覚特性から独立し得る。

【0026】

「薬学的に活性な成分」という用語は、生物学的に活性である薬学的組成物中の化合物を指す。

【0027】

「置き換える」または「置き換えられている」という用語は、例えば、食品等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指す。これは、完全および部分置換または代替を含む。

【0028】

脂肪族基は、1つ以上の代替を含有してもよい。脂肪族基の飽和または非飽和炭素上の好適な置換基の例としては、ハロゲン、-CF₃、-R'、-OR'、-OH、-SH、-SR'、保護OH（アシルオキシ等）、-NO₂、-CN、-NH₂、-NHR'、-N(R')₂、-NHCOR'、-NHCONH₂、-NHCONHR'、-NHCON(R')₂、-NRCOR'、-NHCO₂H、-NHCO₂R'、-CO₂R'、-CO₂H、-COR'、-CONH₂、-CONHR'、-CON(R')₂、-S(O)H、-S(O)₂R'、-S(O)₃H、-S(O)₃R'、-S(O)₂NH₂、-S(O)H、-S(O)R'、-S(O)₂NHR'、-S(O)₂N(R')₂、-NH₂S(O)₂H、または-NHS(O)₂R'、=O、=S、=NNHR'、=NN(R')₂、=N-OR'、=NNHCOR'、=NNHCO₂R'、=NNHSO₂R'、=N-CN、または=NR'が挙げられるが、これらに限定されず、式中、R'が、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から選択され、各R'が、任意に、1つ以上のハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、-NH-（非置換脂肪族）、-N-（非置換脂肪族）₂、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）、CF₃、-S(O)₂NH₂、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で置換される。この明細書により導かれるように、好適な置換基の選択は、当業者の知識の範囲内にある。

【0029】

本明細書で規定されるように、本開示の化合物は、化合物のすべての立体化学形態、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の混合物は、本開示の範囲内にあり、具体的に企図される。別段示されない限り、本明細書に示される式はまた、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¹³C-または¹⁴C-濃縮炭素による置換を除き、この式を有する化合物は、この開示の範囲内にある。

【0030】

本開示の1つの態様は、食品、消費者製品、および前記化合物を含む薬学的組成物を含む、本開示の甘味調節剤を含む可食組成物、ならびにかかる組成物を調製する方法を提供する。本開示はまた、可食組成物中の甘味料の量を低減させる方法、カロリー摂取量を低減させるための方法、甘味料の甘味を増強または増進する方法、苦味を遮断する方法、甘

10

20

30

40

50

味受容体の活性を増強または増進する方法、および甘味調節剤を合成する方法も提供する。本開示はまた、糖または他の甘味料の量を、1つ以上の化合物または本開示の化合物を含有する1つ以上の抽出物の量と置換することによって、可食組成物または食事中の甘味料の量を低減することも含む。

【0031】

甘味調節剤

一様によれば、本開示は、甘味を調節する（例えば甘味料の甘味を増強または強化する）ための化合物を提供する。

【0032】

本明細書で使用される場合、「甘味調節剤」という用語は、味覚修飾活性を有する香料物質を指す。甘味増強剤は、甘味の知覚を甘味増強剤の特有の甘味のみを単に起因しない様式で増加する一種の「甘味調節剤」であることを理解されたい。「甘味増強剤」という用語は、甘味料組成物または甘味付与組成物の甘味の知覚を増強または増大させることができる少なくとも組成物を含むことを理解されたい。「甘味増強剤」という用語は、「甘味修飾化合物」、「甘味増進剤（sweet taste potentiator）」、「甘味增幅剤（sweetness amplifier）」、および「甘味強化剤（sweetness intensifier）」という用語と同義である。概して、本明細書で提供される甘味を調節する化合物（甘味の知覚を増強するのに役立つ）は、許容される使用レベルではそれら自体は顕著な甘味を提供することなく、甘味料の甘味を増強または増進してもよいが、甘味増強剤はそれら自体、甘味閾値レベルを上回る濃度で甘みを提供してもよい。甘味増強剤は、それらの甘味閾値レベルを上回る濃度で存在するとしても、増強剤として有効であり得ることに留意されたい。かかる実施形態では、甘味料が本組成物中にも存在するときに、甘味料に起因する固有の甘味の増強を介して、組成物の甘さへの甘味増強剤の主な貢献がある。本明細書で使用される場合、「甘味閾値レベル」という用語は、甘味が可食組成物中の甘美として知覚できる濃度を少なくとも含むことが理解されたい。甘味閾値レベルは、異なる可食組成物（例えば異なるマトリックスで）に對して異なり、甘味を感知する個体に関して異なり得る。

【0033】

本開示のすべての実施形態では、本開示の甘味調節剤（複数を含む）は、本組成物の甘味料とは異なる化合物である。したがって、成分が甘味調節剤および甘味料の両方の特徴を有し得るが、本開示のすべての実施形態では、甘味調節剤および甘味料は、異なる成分であり、すなわち、甘味調節剤および甘味料は、同じ化合物ではない。

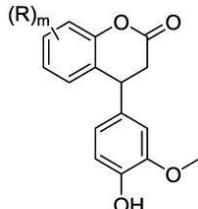
【0034】

本明細書に記載される本開示の各実施形態は、単独でまたは本開示の1つ以上の他の実施形態と組み合わせて得られ得る。

【0035】

本開示は、甘味料の甘味を調節または増進するためのネオフラボノイド化合物を提供する。本開示のネオフラボノイド化合物は、甘味料の甘味を調節または増進することができる。ネオフラボノイド化合物は、約1000、約500、または約300ダルトン未満の分子量を有し得る。ある特定の実施形態では、ネオフラボノイド化合物は、式（I）：

【化2】



I

10

20

30

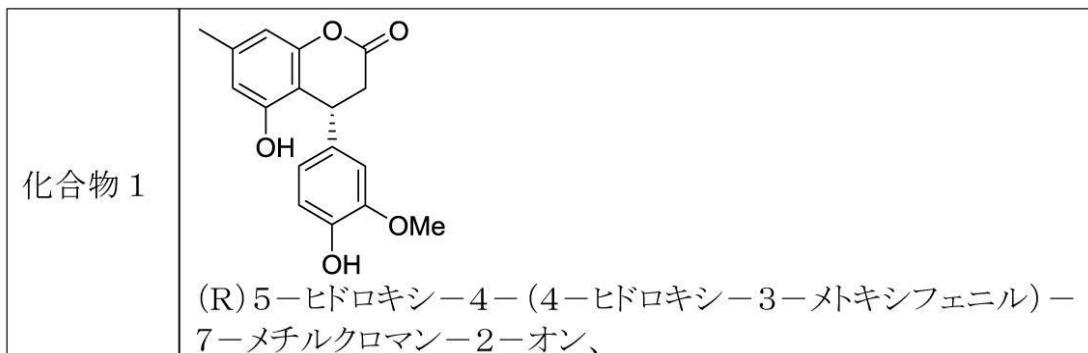
40

50

の化合物であって、式中、Rが、-OH、C₁-C₄アルキル、-CO₂H、アシリル、もしくはホルミルであり、mが2もしくは3であり、少なくとも1つのRがOHではない、化合物、またはその食用として許容される塩、誘導体、光学異性体、もしくは溶媒和物、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせである。

式(I)のいくつかの実施形態では、本化合物は、

【化3】



10

またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩もしくは溶媒和物である。

【0036】

「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、摂取する際に、甘味料に起因する甘味の知覚を増強するまたは苦味物質に起因する苦い味の知覚を低減させる能力を特徴とする、本開示の甘味調節剤もしくは苦味抑制剤、またはその多形体、代謝体、残留物、もしくはその一部を(直接的または間接的に)提供することができる、本開示の甘味調節剤の任意の食用的または生物学的に許容される誘導体を指す。「食用製品」は、経口使用、例えば、飲食行動に適している生成物である。したがって、食用として許容される化合物は、可食化合物である。

20

【0037】

甘味調節剤は、甘味料と相乗して、甘味料による甘味の知覚を増強または増進する。甘味調節剤がそれらの甘味閾値レベルを上回って使用される場合、それらは、甘味料と相乗して、甘味料による甘味の知覚を増強または増進する。このような場合に、甘味調節剤、または甘味調節剤および甘味化合物の組み合わせを含む組成物の甘味全体は、甘味調節剤のそれぞれ、または甘味調節剤および甘味化合物の組み合わせによる特有の甘味の単なる添加よりも高い。例えば、1%スクロースに相当する甘味を有する甘味調節剤を5%スクロース溶液に添加する場合、結果として得られる組成物の知覚甘味は、6%スクロース溶液の知覚甘味よりも高い、つまり、6%スクロース溶液よりも高い任意の知覚甘味が、甘味調節剤の甘味増強特性に起因し得る。知覚甘味のそのような増加は、付加的ではなく、相乗的であると称され得る。

30

【0038】

「甘味閾値」および「甘味認識閾値」という用語は、本明細書では、同義に使用され、ある特定の甘味化合物の最低の既知の濃度が、ヒトの味覚によって甘いと知覚できるレベルを指す。この甘味認識閾値はまた、甘味を感じる閾値(sweetness detection threshold)も包含し、ある特定の甘味化合物の最低の既知の濃度が、ヒトの味覚によって甘いと知覚できるレベルを指す。甘味閾値は、人それぞれにより異なり得る。甘味閾値はまた、マトリックスそれぞれ(例えば、水および炭酸飲料中の異なる甘味閾値)により異なり得る。例えば、水中のスクロースに対する甘味閾値レベルは、約1%または1.5%であり得る。いくつかの実施形態では、式(I)、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせの甘味増強剤は、それらの甘味閾値を下回る濃度で使用される。

40

【0039】

50

「有効濃度」および「有効量」という用語は、本明細書では同義に使用され、所望の特性または結果を生じるのに十分な量を指す。例えば、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの有効量は、甘味料に関連する甘味の知覚を調節する（例えば増強する）ことができる量である。本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの「有効量」という用語はまた、可食組成物に添加されるときに、例えば、糖の甘味を増強し、それによって、可食組成物の所望の甘い風味の知覚の維持を可能にする。「有効量」という用語はまた、食品または特有の甘い食品のいずれかの中の甘味料と関連する甘味の知覚を調節する（例えば増強する）ことができる、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの量も指す。本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、ある特定の濃度において甘味または味を付与することができるが、他の濃度において知覚し得る甘味または味を付与することができない。例えば、甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの味（例えば甘味）が知覚され得ないような量で存在し得る。本明細書で論じられる組成物は、有効量の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを含む。有効量の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、甘味料の甘味強度の知覚を増強するのに十分な量を含む。

【0040】

一般に、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、この化合物が約0.001 ppm～約1000 ppmの濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、この化合物が約0.005 ppm～約500 ppm、約0.01 ppm～約100 ppm、約0.05 ppm～約50 ppm、約0.1 ppm～約5 ppm、約0.1 ppm～約10 ppm、約0.1 ppm～約100 ppm、約1 ppm～約10 ppm、約1 ppm～約30 ppm、約1 ppm～約50 ppm、約10 ppm～約20 ppm、約10 ppm～約25 ppm、約10 ppm～約30 ppm、約1 ppm～約50 ppm、または約5 ppm～約50 ppm、約10 ppm～約50 ppm、約30 ppm～約50 ppm、約1 ppm～約60 ppm、約100 ppm～約300 ppm、約100 ppm～約1000 ppm、または約30 ppm～約3000 ppmの濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、この化合物または甘味調節剤の組み合わせが、約50 ppm～約100 ppm、約100 ppm～約200 ppm、約200 ppm～約300 ppm、約300 ppm～約400 ppm、約400 ppm～約500 ppm、約500 ppm～約600 ppm、約600 ppm～約700 ppm、約700 ppm～約800 ppm、約800 ppm～約900 ppm、約900 ppm～約1000 ppm、約1000 ppm～約1100 ppm、約1100 ppm～約1200 ppm、約1200 ppm～約1300 ppm、約1300 ppm～約1400 ppm、約1400 ppm～約1500 ppm、約1500 ppm～約1600 ppm、約1600 ppm～約1700 ppm、約1700 ppm～約1800 ppm、約1800 ppm～約1900 ppm、約1900 ppm～約2000 ppm、約2000 ppm～約2100 ppm、約2100 ppm～約2200 ppm、約2200 ppm～約2300 ppm、約2300 ppm～約2400 ppm、約2400 ppm～約2500 ppm、約2500 ppm～約2600 ppm、約2600 ppm～約2700 ppm、約2700 ppm～約2800 ppm、約2800 ppm～約2900 ppm、または約2900 ppm～約3000 ppmの濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。

さらに他の実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、本化合

10

20

30

40

50

物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 0.1 ppm ~ 約 30 ppm、約 1 ppm ~ 約 30 ppm、または約 1 ppm ~ 約 50 ppm の濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。さらなる実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 0.1 ppm ~ 約 5 ppm、約 0.1 ppm ~ 約 4 ppm、約 0.1 ppm ~ 約 3 ppm、約 0.1 ppm ~ 約 2 ppm、約 0.1 ppm ~ 約 1 ppm、約 0.5 ppm ~ 約 5 ppm、約 0.5 ppm ~ 約 4 ppm、約 0.5 ppm ~ 約 3 ppm、約 0.5 ppm ~ 約 2 ppm、約 0.5 ppm ~ 約 1.5 ppm、約 0.5 ppm ~ 約 1 ppm、約 5 ppm ~ 約 15 ppm、約 6 ppm ~ 約 14 ppm、約 7 ppm ~ 約 13 ppm、約 8 ppm ~ 約 12 ppm、約 9 ppm ~ 約 11 ppm、約 25 ppm ~ 約 35 ppm、約 26 ppm ~ 約 34 ppm、約 27 ppm ~ 約 33 ppm、約 28 ppm ~ 約 32 ppm、または約 29 ppm ~ 約 31 ppm の濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。

【0041】

さらに他の実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、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、約 10 ppm、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、約 29 ppm、約 30 ppm、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、約 50 ppm、約 51 ppm、約 52 ppm、約 53 ppm、約 54 ppm、約 55 ppm、約 56 ppm、約 57 ppm、約 58 ppm、約 59 ppm、約 60 ppm、約 61 ppm、約 62 ppm、約 63 ppm、約 64 ppm、約 65 ppm、約 66 ppm、約 67 ppm、約 68 ppm、約 69 ppm、約 70 ppm、約 71 ppm、約 72 ppm、約 73 ppm、約 74 ppm、約 75 ppm、約 76 ppm、約 77 ppm、約 78 ppm、約 79 ppm、約 80 ppm、約 81 ppm、約 82 ppm、約 83 ppm、約 84 ppm、約 85 ppm、約 86 ppm、約 87 ppm、約 88 ppm、約 89 ppm、約 90 ppm、約 91 ppm、約 92 ppm、約 93 ppm、約 94 ppm、約 95 ppm、約 96 ppm、約 97 ppm、約 98 ppm、約 99 ppm、約 100 ppm、約 101 ppm、約 102 ppm、約 103 ppm、約 104 ppm、約 105 ppm、約 106 ppm、約 107 ppm、約 108 ppm、約 109 ppm、約 110 ppm、約 111 ppm、約 112 ppm、約 113 ppm、約 114 ppm、約 115 ppm、約 116 ppm、約 117 ppm、約 118 ppm、約 119 ppm、約 120 ppm、約 121 ppm、約 122 ppm、約 123 ppm、約 124 ppm、約 125 ppm、約 126 ppm、約 127 ppm、約 128 ppm、約 129 ppm、約 130 ppm、約 131 ppm、約 132 ppm、約 133 ppm、約 134 ppm、約 135 ppm、約 136 ppm、約 137 ppm、約 138 ppm、約 139 ppm、約 140 ppm、約 141 ppm、約 142 ppm、約 143 ppm、約 144 ppm、約 145 ppm、約 146 ppm、約 147 ppm、約 148 ppm、約 149 ppm、または約 150 ppm の濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 0.1 ppm の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 0.5 ppm の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物また

10

20

30

40

50

合物の組み合わせは、約 77 ppm の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 78 ppm の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 79 ppm の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 80 ppm の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 81 ppm の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物または

2 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 2 3 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 2 4 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 2 5 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 2 6 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 2 7 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 2 8 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 2 9 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 0 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 1 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 2 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 3 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 4 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 5 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 6 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 7 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 8 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 3 9 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 0 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 1 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 2 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 3 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 4 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 5 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 6 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 7 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 8 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 4 9 p p m の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約 1 5 0 p p m の濃度で存在する。

【 0 0 4 2 】

本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物 1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、0 . 1 p p m、0 . 5 p p m、1 p p m、2 p p m、3 p p m、4 p p m、5 p p m、6 p p m、7 p p m、8 p p m、9 p p m、1 0 p p m、1 1 p p m、1 2 p p m、1 3 p p m、1 4 p p m、1 5 p p m、1 6 p p m、1 7 p p m、1 8 p p m、1 9 p p m、2 0 p p m、2 1 p p m、2 2 p p m、2 3 p p m、2 4 p p m、2 5 p p m、2 6 p p m、2 7 p p m、2 8 p p m、2 9 p p m、3 0 p p m、3 1 p p m、3 2 p p m、3 3 p p m、3 4 p p m、3 5 p p m、3 6 p p m、3 7 p p m、3 8 p p m、3 9 p p m、4 0 p p m、4 1 p p m、4 2 p p m、4 3 p p m、4 4 p p m、4 5 p p m、4 6 p p m、4 7 p p m、4 8 p p m、4 9 p p m、5 0 p p m、5 1 p p m、5 2 p p m、5 3 p p m、5 4 p p m、5 5 p p m、5 6 p p m、5 7 p p m、5 8 p p m、5 9 p p m、6 0 p p m、6 1 p p m、6 2 p p m、6 3 p p m、6

10

20

30

40

50

いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、70 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、71 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、72 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、73 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、74 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、75 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、76 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、77 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、78 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、79 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、80 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、81 ppmの濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物

10

20

30

40

50

【0043】

他の実施形態では、本開示の甘味調節剤（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、本化合物が、約0.5 ppm、約1 ppm、約5 ppm、約10 ppm、約15 ppm、約20 ppm、約25 ppm、約30 ppm、または約35 ppm、例えば、最大約35 ppmまたは約50 ppm超の濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、0.5 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、1 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、5 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、10 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、15 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、20 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、25 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、30 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、35 ppm超の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、50 ppm超の濃度で存在する。さらなる実施形態では、本開示の甘味調節剤（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、約50 ppm、約35 ppm、約30 ppm、約25 ppm、約20 ppm、約15 ppm、約10 ppm、約5 ppm、約1 ppm、または約0.5 ppm未満の濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、50 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、35 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、30 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、25 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、20 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、15 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、10 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、5 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、1 ppm未満の濃度で存在する。いくつかの実施形態では、本化合物またはこれらの化合物の組み合わせは、0.5 ppm未満の濃度で存在する。さらにさらなる実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、本化合物が、約35 ppm、約10 ppm、または約1 ppm未満の濃度で存在するときに、甘味料の甘さを増強する。

【0044】

「百万分率」および「ppm」という用語は、食品産業では、低濃度の溶液を指すために使用される。例えば、1000mLの溶媒中の1グラムの溶質は、1000 ppmの濃度を有し、1000mLの溶媒中の1グラムの1000分の1（0.001g）の溶質は、1 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1mg/L）の濃度は1 ppmに等しい。1mg%の濃度は、1mg / 100mLである。したがって、1mg%の濃度は、10 ppmに等しい。

【0045】

本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、本明細書に記載される実施形態（例えば、可食組成物および方法）で使用されるときに、既知の天然および/または合成

10

20

30

40

50

甘味調節剤と組み合わせられ得る。

【0046】

甘味料

甘味料を含む本開示の組成物および方法では、甘味料は、任意の種類、例えば、天然、非天然、または合成甘味料であり得る。かかる甘味料の限定されない例としては、カロリー炭水化物甘味料、天然炭水化物甘味料、非天然炭水化物甘味料、天然の高効能甘味料、非天然の高効能甘味料、合成高効能甘味料、合成炭水化物甘味料、糖アルコール、希少糖、およびこれらの組み合わせが挙げられる。いくつかの実施形態では、少なくとも1つの甘味料が、カロリー甘味料から選択される。別の実施形態では、少なくとも1つの甘味料が、合成甘味料から選択される。別の実施形態では、少なくとも1つの甘味料が、非天然甘味料から選択される。希少糖の限定されない例としては、D-ブシコース、D-ツラノース、D-アロース、D-タガトース、D-ソルボース、L-フルクトース、L-グルコース、L-フルクトース、L-タロース、L-リボース、およびL-アラビノースが挙げられる。

10

【0047】

いくつかの実施形態では、甘味料は、可食組成物の天然または固有成分である。例えば、甘味料は、果実または果実製品（例えば果実ソース）等の食品のまたは食料品の固有成分であり得る。したがって、本開示の化合物または化合物の組み合わせは、甘味料が添加されていない可食組成物中に使用され得る。

20

【0048】

「カロリー甘味料」および「カロリー炭水化物甘味料」という用語は、本明細書において同義で使用され、カロリーを提供し、糖類およびポリオール等のすべてのカロリー炭水化物甘味料を含む栄養甘味料を指す。好適なカロリー炭水化物甘味料の限定されない例としては、スクロース、フルクトース、グルコース、エリトリトール、マルチトール、ラクチトール、ソルビトール、マンニトール、キシリトール、D-タガトース、トレハロース、ガラクトース、ラムノース、シクロデキストリン（例えば、-シクロデキストリン、-シクロデキストリン、および-シクロデキストリン）、リブロース、トレオース、アラビノース、キシロース、リキソース、アロース、アルトロース、マンノース、イドース、ラクトース、マルトース、転化糖、イソトレハロース、ネオトレハロース、パラチノースもしくはイソマルツロース、エリトロース、デオキシリボース、グロース、イドース、タロース、エリトルロース、キシルロース、ブシコース、ツラノース、セロビオース、グルコサミン、マンノサミン、フコース、グルクロン酸、グルコン酸、グルコノ-ラクトン、アベクオース、ガラクトサミン、キシロ-オリゴ糖（キシロトリオース、キシロビオース等）、ゲンチオ-オールオリゴ糖（ゲンチオビオース、ゲンチオトリオース、ゲンチオテトラオース等）、ガラクト-オリゴ糖、ソルボース、ニゲロ-オリゴ糖、フラクトオリゴ糖（ケストース、ニストース等）、マルトテトラオール、マルトトリオール、マルト-オリゴ糖（マルトトリオース、マルトテトラオース、マルトペンタオース、マルトヘキサオース、マルトヘプタオース等）、ラクトロース、メリビオース、ラフィノース、ラムノース、リボース、異性化液糖、例えば高果糖コーン/デンブンシロップ（例えば、HFCS 55、HFCS 42、もしくはHFCS 90）、蜂蜜、メープルシロップ、カップリングシュガー、大豆オリゴ糖、ならびにグルコースシロップが挙げられる。好ましくは、甘味料は、グルコース、フルクトース、スクロース、およびこれらの混合物から選択される天然甘味料である。

30

【0049】

本明細書で使用される、「ポリオール」という用語は、1つを超えるヒドロキシル基を含有する分子を指す。ポリオールは、それぞれ、2つ、3つ、および4つのヒドロキシル基を含有する、ジオール、トリオール、またはテトラオールであってもよい。ポリオールはまた、4つより多いヒドロキシル基を含有してもよく、例えば、ペンタオール、ヘキサオール、ヘプタオール等であり、それぞれ、5つ、6つ、または7つのヒドロキシル基を含有する。さらに、ポリオールは、炭水化物の還元形態である、糖アルコール、多価アル

40

50

コール、またはポリアルコールであってもよく、このカルボニル基（アルデヒドもしくはケトン、還元糖）は、第1または第2ヒドロキシル基に還元されている。いくつかの実施形態では、ポリオールの限定されない例としては、エリトリトール、マルチトール、マンニトール、ソルビトール、ラクチトール、キシリトール、イソマルト、プロピレングリコール、グリセロール（グリセリン）、トレイトール、ガラクチトール、パラチノース、還元イソマルト-オリゴ糖、還元キシロ-オリゴ糖、還元ゲンチオ-オリゴ糖、還元マルトースシロップ、還元グルコースシロップ、および糖アルコール、または可食組成物の味に悪影響を及ぼさない還元可能な任意の他の炭水化物が挙げられる。

【0050】

いくつかの実施形態では、甘味料は、炭水化物甘味料である。かかる実施形態では、甘味料は、スクロース、フルクトース、グルコース、エリトリトール、高フルクトースコンまたはデンプンシロップ、およびこれらの混合物から選択される。

10

【0051】

「合成高効能甘味料」および「人工の高効能甘味料」という用語は、本明細書では同義に使用され、天然には見出されず、スクロース、フルクトース、またはグルコースよりも大きい甘味効能が特徴的に有するが、カロリーが少ないまたはカロリーがないあらゆる組成物を指す。本開示の実施形態に適している合成甘味料の限定されない例としては、スクラロース、アセスルファムカリウムもしくはその他の塩、アスパルテーム、アリターム、サッカリン、ネオヘスペリジンジヒドロカルコン、チクロ、ネオターム、アドバンテーム、およびこれらの塩が挙げられる。

20

【0052】

いくつかの実施形態では、甘味料は、合成甘味料である。好ましくは、合成甘味料は、スクラロース、アスパルテーム、カリウムアセサルフェーム、およびこれらの混合物から選択される。

【0053】

本明細書に提供される実施形態で用いるのに適している他の甘味料は、例えば、天然甘味料を含む。「天然の高効能甘味料」、「N H P S」、「N H P S 組成物」、および「天然の高効能甘味料組成物」という用語は、本明細書では同義に使用され、天然には見出されず、生の、抽出された、精製された、または任意の他の形態の、単独でまたはそれらの組み合わせであってよく、スクロース、フルクトース、またはグルコースよりも大きい甘味効能が特徴的に有するが、カロリーが少ないまたはカロリーがないあらゆる甘味料を指す。本開示の実施形態に適しているN H P Sの限定されない例としては、ステビオールグリコシド、レバウディオサイドA、レバウディオサイドB、レバウディオサイドC（ズルコシドB）、レバウディオサイドD、レバウディオサイドE、レバウディオサイドF、レバウディオサイドI、レバウディオサイドH、レバウディオサイドL、レバウディオサイドK、レバウディオサイドJ、レバウディオサイドN、レバウディオサイドO、レバウディオサイドM、ズルコシドA、ルブソシド、ステビア葉抽出物、ステビオシド、グリコシル化ステビオールグリコシド、モグロシド、モグロシドV、イソモグロシド、モグロシドIV、羅漢果果実抽出物、シアメノシド、モナチンおよびそれらの塩（モナチンSS、RR、RS、SR）、クルクリン、グリシルリジン酸およびそれらの塩、タウマチン、モネリン、マビンリン、プラゼイン、ヘルナンズルチン、フィロズルチン、グリシフィリン、フロリジン、トリロバチン、バイユノシド、オスラジン、ポリポドシドA、ブテロカリオシドA、ブテロカリオシドB、ムクロジオシド、フロミソシドI、ペリアンドリンI、アブルソシドA、またはシクロカリオシドIが挙げられる。いくつかの実施形態では、グリコシル化ステビオールグリコシドは、13-[(2-O- -D-グルコピラノシル-3-O- (4-O- -D-グルコピラノシル) - -D-グルコピラノシル- -D-グルコピラノシル) オキシ]エント-カウラ-16-エン-19-オイク酸-[(4-O- -D-グルコピラノシル- -D-グルコピラノシル) エステル]、13-[(2-O- -D-グルコピラノシル- -D-グルコピラノシル) オキシ]エント-カウラ-16-エン-19-オイク酸-[(4-O- (4-O- -D-グルコピラノ

30

40

50

50

シル) - - D - グルコピラノシル) - - D - グルコピラノシル) - - D - グルコピラノシルエステル]、13-[(2-O- - D - グルコピラノシル - 3-O-(4-O- (4-O- (4-O- D - グルコピラノシル) - - D - グルコピラノシル - - D - グルコピラノシル) オキシ] エント - カウラ - 16 - エン - 19 - オイク酸 - D - グルコピラノシルエステル、または13-[(2-O- - D - グルコピラノシル - 3-O-(4-O- (4-O- (4-O- D - グルコピラノシル) - - D - グルコピラノシル) - - D - グルコピラノシル) - - D - グルコピラノシル - - D - グルコピラノシル) オキシ] エント - カウラ - 16 - エン - 19 - オイク酸 - [(4-O- - D - グルコピラノシル - - D - グルコピラノシル) エステル] が挙げられる。N H P S はまた、修飾N H P S を含む。修飾N H P S は、天然に変えられているN H P S を含む。例えば、修飾N H P S としては、発酵された、酵素と接触させられた、またはN H P S に誘導体化もしくは置換された、N H P S が挙げられるが、これらに限定されない。一実施形態では、少なくとも1つの修飾N H P S は、少なくとも1つのN H P S と組み合わせて使用してもよい。別の実施形態では、少なくとも1つの修飾N H P S は、N H P S なしで使用してもよい。したがって、修飾N H P S は、N H P S の代わりに用いても、本明細書に記載される実施形態のうちのいずれかにおいて、N H P S と組み合わせて使用してもよい。しかしながら、簡潔さのために、実施形態の説明において、修飾N H P S は、未修飾N H P S の代わりとして明白に記載されていないが、本明細書に開示された任意の実施形態においても、修飾N H P S をN H P S の代わりに用いることができるることを理解すべきである。

10

20

30

【0054】

いくつかの実施形態では、甘味料は、個々にまたは他の甘味料と組み合わせて使用してもよい。例えば、甘味料組成物は、単一のカロリー甘味料、単一のN H P S 、もしくは単一の合成甘味料；単一のN H P S を含む単一のカロリー甘味料；単一の合成甘味料を含む単一のカロリー甘味料；単一のN H P S を含む1種以上のカロリー甘味料；単一の合成甘味料を含む1種以上のカロリー甘味料；1種以上のN H P S を含む単一のカロリー甘味料；単一の合成甘味料と組み合わせた単一のN H P S ；1種以上の合成甘味料と組み合わせた1種以上のN H P S ；1種以上の合成甘味料と組み合わせた単一のN H P S ；1種以上の合成甘味料と組み合わせた1種以上のN H P S ；または1種以上のN H P S および1種以上の合成甘味料を含む1種以上のカロリー甘味料を含んでもよい。複数の天然および/または合成甘味料は、混合効果が甘味料組成物または経口甘味付与組成物の味に悪影響を及ぼさない限り、使用されてもよい。

30

【0055】

当業者は、甘味料組成物が所望のカロリー含有量を得るようにカスタマイズされ得ることを理解されたい。例えば、低カロリー甘味料またはノンカロリー合成甘味料を高カロリー甘味料および/または他の高カロリー添加剤と組み合わせて、好ましいカロリー含有量を有する甘味料組成物を得ることができる。

40

【0056】

甘味料は、その甘味閾値レベルよりも大きい量で本組成物中に存在する。いくつかの実施形態では、甘味料は、組成物の全重量に対して0.01重量% ~ 99.9重量% の範囲の量で存在する。例えば、少なくとも1つの甘味料は、組成物の全重量に対して2重量% ~ 50重量% 、または例えば、4重量% ~ 50重量% の範囲の量で存在する。いくつかの実施形態では、少なくとも1つの甘味料は、約5重量% ~ 約20重量% で存在する。さらなる実施形態では、少なくとも1つの甘味料は、約5重量% ~ 約15重量% で存在する。なおさらなる実施形態では、少なくとも1つの甘味料は、飲料、例えば、非アルコール飲料中の約5重量% ~ 約12重量% で存在する。

40

【0057】

本開示に従って、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、甘味料の甘味を増進または増強する。本開示の甘味料および甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物は、甘味調節剤を含まない少なくとも1つの甘味料、または甘味調節剤の

50

組み合わせを含む組成物よりも強い甘味強度を有する。

【0058】

本明細書で使用される場合、「甘味強度」という用語は、あらゆる知覚できる甘味を意味することが理解される。本開示の甘味料および甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物は、甘味調節剤を含まない甘味料、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物よりも知覚的に甘い。例えば、本開示の甘味料および甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物は、甘味調節剤を含まない甘味料、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物よりもわずかに甘い、適度に甘い、または著しく甘くてもよい。上で論じられるように、式(I)の甘味調節剤、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせがそれらの甘味閾値を上回って使用される実施形態では、甘味強度の増加は、付加的ではなく、相乗的である。

10

【0059】

組成物の甘味は、既知の甘味基準に基づき（すなわち、比較され）得る。かかる甘味基準に基づいた甘い化合物としては、例えば、天然、非天然、または合成甘味料が挙げられるが、これらに限定されない。かかる甘味料の限定されない例としては、カロリー炭水化物甘味料、天然炭水化物甘味料、非天然炭水化物甘味料、天然の高効能甘味料、非天然の高効能甘味料、合成の高効能甘味料、合成炭水化物甘味料、およびこれらの組み合わせが挙げられる。例えば、組成物の甘味は、5%スクロース溶液に基づき得る。そのような場合には、本開示の甘味料および甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物は、5.5%スクロース溶液に相当する甘味を有すると知覚され得る。他の実施形態では、本開示の甘味料および甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物は、6.0%、6.5%、7.0%、7.5%、8.0%、8.5%、9.0%、9.5%、または10%スクロース溶液に相当する甘味を有すると知覚され得る。好適な甘味基準としては、スクロース基準、フルクトース基準、およびグルコース基準が挙げられるが、これらに限定されない。これらの基準のそれぞれは、0.5%、1.0%、1.5%、2.0%、2.5%、3.0%、3.5%、4.0%、4.5%、5.0%、5.5%、6.0%、6.5%、7.0%、7.5%、8.0%、8.5%、9.0%、9.5%、または10%溶液が挙げられるが、これらに限定されない、濃度で使用され得る。いくつかの実施形態では、本開示の甘味料および甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物の甘味強度は、甘味調節剤を含まない甘味料、または甘味調節剤の組み合わせを含む組成物と比較して、甘味基準に基づいて知覚甘味を10%超、20%超、30%超、40%超、50%超、または60%超増加させる。

20

【0060】

いくつかの実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚（すなわち、可食組成物中の甘味料の甘味の知覚）が、最大1%、2%、3%、4%、5%、6%、7%、8%、9%、10%、11%、12%、13%、14%、15%、16%、17%、18%、19%、20%、21%、22%、23%、24%、25%、26%、27%、28%、29%、30%、31%、32%、33%、34%、35%、36%、37%、38%、39%、40%、41%、42%、43%、44%、45%、46%、47%、48%、49%、50%、51%、52%、53%、54%、55%、56%、57%、58%、59%、60%、61%、62%、63%、64%、65%、66%、67%、68%、69%、70%、71%、72%、73%、74%、75%、76%、77%、78%、79%、80%、81%、82%、83%、84%、85%、86%、87%、88%、89%、90%、91%、92%、93%、94%、95%、96%、97%、98%、99%、または100%増強される。いくつかの実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、100%を超えて、例えば、125%、150%、175%、200%、225%、250%、275%、300%、325%、350%、375%、400%、425%、450%、475%、500%、または列挙されるものの間での増加量を超えて増強される。いくつかの実施形態では、甘味強度の知覚は、最大25%増強される。他の実施形態では、甘味強度

30

40

50

度の知覚は、最大 50 % 増強される。他の実施形態では、甘味強度の知覚は、最大 75 % 増強される。他の実施形態では、甘味強度は、最大 100 % 増強される。いくつかの実施形態では、甘味強度の知覚は、約 5 % ~ 約 100 %、約 5 % ~ 約 90 %、約 5 % ~ 約 80 %、約 5 % ~ 約 70 %、約 5 % ~ 約 60 %、約 5 % ~ 約 50 %、約 5 % ~ 約 40 %、約 5 % ~ 約 30 %、約 10 % ~ 約 30 %、約 10 % ~ 約 25 %、約 20 % ~ 約 80 %、約 20 % ~ 約 70 %、約 20 % ~ 約 60 %、約 20 % ~ 約 50 %、約 20 % ~ 約 40 %、約 20 % ~ 約 30 %、約 25 % ~ 約 80 %、約 25 % ~ 約 70 %、約 25 % ~ 約 60 %、約 25 % ~ 約 50 %、約 25 % ~ 約 40 %、または約 25 % ~ 約 30 % 増強される。これらの量は、限定することを意図するものではなく、言及された割合の間の増分が本開示の一部として特に想定される。

10

【0061】

少なくとも 1 つの甘味増強剤および少なくとも 1 つの甘味料の組み合わせが、甘味料組成物または甘味付与組成物の味に物質的または悪影響を及ぼさない任意の pH の範囲で実施され得ることが企図される。pH の範囲の限定されない例は、約 1.5 ~ 約 9.0 であってもよい。さらなり例には、約 2.0 ~ 約 8.5、約 2.0 ~ 約 8.0、約 2.0 ~ 約 7.5、約 2.0 ~ 約 7.0、約 2.5 ~ 約 7.0、および約 3.0 ~ 約 7.0 の pH の範囲が含まれる。pH の範囲のさらなる例には、約 2.0 ~ 約 4.0、約 2.5 ~ 約 4.5、約 3.5 ~ 約 5.5、約 5.0 ~ 約 6.0、約 4.0 ~ 約 5.5、約 5.0 ~ 約 6.0、約 6.5 ~ 約 7.5、および約 6.0 ~ 約 8.0 が含まれる。いくつかの実施形態では、pH は、約 3.0 または約 7.0 である。組成物の温度は、例えば、約 -4 ~ 約 90 の範囲であってもよい。

20

【0062】

当業者は、いかなる方法によっても、甘味料（複数を含む）および甘味調節剤（複数を含む）、または甘味調節剤の組み合わせを混合してもよい。

【0063】

甘味改善組成物

「甘味改善組成物」および「甘味改善添加剤」という用語は、本明細書において同義に使用され、合成甘味料により砂糖様の経時プロファイルもしくは砂糖様の風味プロファイルまたはその両方を付与する任意の材料を指す。本開示の実施形態で有用である好適な甘味改善添加剤としては、アミノ酸およびそれらの塩、ポリ-アミノ酸およびそれらの塩、ペプチド、糖酸およびそれらの塩、ヌクレオチドおよびそれらの塩、有機酸、無機酸、有機塩（有機酸塩および有機塩基塩を含む）、無機酸塩（例えば、塩化ナトリウム、塩化カリウム、塩化マグネシウム）、酸性塩（例えばクエン酸ナトリウム）、苦味化合物、風味剤および風味材料、渋味化合物、ポリマー、タンパク質またはタンパク質加水分解物、界面活性剤、乳化剤、フラボノイド、アルコール、および天然の高効能甘味料が挙げられる。

30

【0064】

「砂糖様の特性」、「砂糖様の味」、「砂糖様の甘味」、「砂糖のような（sugary）」、および「砂糖様の」という用語は、本明細書において同義に使用され、スクロースの特性と類似した任意の特性を含み、最大反応、風味プロファイル、経時プロファイル、適応挙動、食感、濃度 / 反応機能挙動、味物質および香料 / 甘味の相互作用、空間パターンの選択性、ならびに温度効果が含まれるが、これらに限定されない。これらの特性は、スクロースの味が甘味を増強した甘味料組成物の味と異なる特徴である。組成物がより砂糖様の味を有するかどうかを判定するための好適な手順は、当該技術分野において公知である。

40

【0065】

本開示の組成物はまた、少なくとも 1 つのさらなる添加剤、例えば、甘味改善組成物および / または甘味改善添加剤をさらに含んでもよい。例えば、本開示の組成物は、甘味を増強した甘味料組成物の経時および / または風味プロファイルを釣り合わせるために、少なくとも 1 つの甘味改善組成物を含んでもよい。甘味料組成物の経時および / または風味

50

プロファイルを改善するための甘味改善組成物の使用は、米国特許出願公開第2007/0128311号、同第2007/0275147号、同第2008/0292765号、同第2011/0160311号、およびUS 2011/0318464に詳述されており、これらの開示は、参照によりそれらの全体が本明細書に組み込まれる。

【0066】

例示的な好適な甘味改善化合物としては、炭水化物、ポリオール、アミノ酸およびそれらの対応する塩、ポリ-アミノ酸およびそれらの対応する塩、糖酸およびそれらの対応する塩、スクレオチド、有機酸、無機酸、有機塩（有機酸塩および有機塩基塩を含む）、無機塩、苦味化合物、風味剤および風味材料、渋味化合物、タンパク質またはタンパク質加水分解物、界面活性剤、乳化剤、フラボノイド、アルコール、ポリマー、砂糖様の特性等を付与する他の甘みを改善する味覚添加剤、ならびにこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、甘味改善化合物は、エリトリトールである。いくつかのかかる実施形態では、エリトリトール対化合物1の重量比は、約1：1～約800：1である。他の実施形態では、エリトリトール対化合物1の重量比は、約(30～200)：1または約(50～100)：1である。

【0067】

本開示の実施形態で用いるための好適な甘味改善アミノ酸添加剤としては、アスパラギン酸、アルギニン、グリシン、グルタミン酸、プロリン、スレオニン、テアニン、システィン、シスチン、アラニン、バリン、チロシン、ロイシン、イソロイシン、アスパラギン、セリン、リジン、ヒスチジン、オルニチン、メチオニン、カルニチン、アミノ酪酸（-、-、もしくは-異性体）、グルタミン、ヒドロキシプロリン、タウリン、ノルバリン、サルコシン、およびこれらの塩（ナトリウム塩もしくはカルシウム塩または酸性塩等）が挙げられるが、これらに限定されない。甘味改善アミノ酸添加剤はまた、D-またはL-配置であってもよく、同じまたは異なるアミノ酸のモノ、ジ、もしくはトリ形態であり得る。さらに、アミノ酸は、適切な場合、-、-、-、-、および-異性体であってもよい。前述のアミノ酸およびそれらの対応する塩（例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、またはその他のアルカリもしくはアルカリ土類金属塩、あるいは酸性塩）はまた、いくつかの実施形態では、好適な甘味改善添加剤である。アミノ酸は、天然であっても、合成であってもよい。アミノ酸はまた、修飾されてもよい。修飾アミノ酸は、少なくとも1つの原子が付加されているか、除去されているか、置換されているか、またはこれらの組み合わせである任意のアミノ酸（例えば、N-アルキルアミノ酸、N-アシルアミノ酸、またはN-メチルアミノ酸）を指す。修飾アミノ酸の限定されない例には、トリメチルグリシン、N-メチル-グリシン、およびN-メチル-アラニン等のアミノ酸誘導体が含まれる。本明細書で使用される場合、修飾アミノ酸は、修飾アミノ酸および非修飾アミノ酸の両方を包含する。本明細書で使用される場合、アミノ酸はまた、ペプチドおよびポリペプチド（例えば、ジペプチド、トリペプチド、テトラペプチド、およびペンタペプチド）、例えば、グルタチオンおよびL-アラニル-L-グルタミンも包含し得る。好適な甘味改善ポリアミノ酸添加剤には、ポリ-L-アスパラギン酸、ポリ-L-リシン（例えば、ポリ-L-リシンもしくはポリ-L-リシン）、ポリ-L-オルニチン（例えば、ポリ-L-オルニチンもしくはポリ-L-オルニチン）、ポリ-L-アルギニン、アミノ酸の他のポリマー形態、およびその塩形態（例えば、カルシウム塩、カリウム塩、ナトリウム塩、またはマグネシウム塩、例えば、L-グルタミン酸モノナトリウム塩）が挙げられる。甘味改善ポリ-アミノ酸添加剤はまた、D-配置であっても、L-配置であってもよい。さらに、ポリ-アミノ酸は、適切な場合、-、-、-、-、および-異性体であってもよい。前述のポリ-アミノ酸およびそれらの対応する塩（例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、またはその他のアルカリもしくはアルカリ土類金属塩、あるいは酸性塩）はまた、いくつかの実施形態では、好適な甘味改善添加剤である。本明細書に記載されるポリ-アミノ酸はまた、異なるアミノ酸のコポリマーも含み得る。ポリ-アミノ酸は、天然であっても、合成であってもよい。ポリ-アミノ酸はまた、少なくとも1つの原子

10

20

30

40

50

が付加されているか、除去されているか、置換されている、またはこれらの組み合わせであるように修飾することもできる（例えば、N-アルキルポリ-アミノ酸またはN-アシリルポリ-アミノ酸）。本明細書で使用される場合、ポリ-アミノ酸は、修飾ポリ-アミノ酸および非修飾ポリ-アミノ酸の両方を包含する。例えば、修飾ポリ-アミノ酸としては、様々な分子量（MW）のポリ-アミノ酸、例えば、1,500のMW、6,000のMW、25,200のMW、63,000のMW、83,000のMW、または300,000のMWを有するポリ-L-リシンが挙げられるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、味覚改善アミノ酸添加剤は、グリシン、アラニン、タウリン、セリン、またはプロリンである。かかる実施形態では、味覚改善アミノ酸添加剤は、約100 ppm～約25,000 ppmまたは約100 ppm～約1000 ppmの濃度中で存在する。

10

【0068】

好適な甘味改善糖酸添加剤としては、例えば、アルドン酸、ウロン酸、アルダル酸、アルギン酸、グルコン酸、グルクロン酸、グルカル酸、ガラクトタル酸、ガラクトロン酸、およびこれらの塩（例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩または他の生理学的に許容される塩）、ならびにこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。

【0069】

例えば、好適な甘味改善ヌクレオチド添加剤としては、イノシンーリン酸（IMP）、グアノシンーリン酸（GMP）、アデノシンーリン酸（AMP）、シトシンーリン酸（CMP）、ウラシルーリン酸（UMP）、イノシンニリン酸、グアノシンニリン酸、アデノシンニリン酸、シトシンニリン酸、ウラシルニリン酸、イノシン三リン酸、グアノシン三リン酸、アデノシン三リン酸、シトシン三リン酸、ウラシル三リン酸、これらのアルカリもしくはアルカリ土類金属塩、ならびにこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。本明細書に記載されるヌクレオチドはまた、ヌクレオチド関連添加剤、例えばヌクレオシドまたは核酸塩基（例えば、グアニン、シトシン、アデニン、チミン、ウラシル）も含み得る。

20

【0070】

好適な甘味改善有機酸添加剤は、-COOH部分を含む任意の化合物を含む。好適な甘味改善有機酸添加剤としては、例えば、C₂～C₃₀カルボン酸、置換ヒドロキシルC₂～C₃₀カルボン酸、安息香酸、置換安息香酸（例えば2,4-ジヒドロキシ安息香酸）、置換桂皮酸、ヒドロキシ酸、置換ヒドロキシ安息香酸、置換シクロヘキシルカルボン酸、タンニン酸、乳酸、酒石酸、クエン酸、グルコン酸、グルコヘプトン酸、アジピン酸、ヒドロキシクエン酸、リンゴ酸、フルーツ酸（fruit acid）（リンゴ酸、フマル酸、および酒石酸のブレンド）、フマル酸、マレイン酸、コハク酸、クロロゲン酸、サリチル酸、クレアチン、コーヒー酸、胆汁酸、酢酸、アスコルビン酸、アルギン酸、エリソルビン酸、ポリグルタミン酸、グルコノデルタラクトン、およびそれらのアルカリまたはアルカリ土類金属塩誘導体が挙げられるが、これらに限定されない。加えて、有機酸添加剤はまた、D-またはL-配置のいずれであってもよい。

30

【0071】

例えば、好適な甘味改善有機酸添加剤塩としては、すべての有機酸のナトリウム、カルシウム、カリウム、およびマグネシウム塩、例えば、クエン酸、リンゴ酸、酒石酸、フマル酸、乳酸（例えばアルギン酸ナトリウム）、アルギン酸（例えばアルギン酸ナトリウム）、アスコルビン酸（例えばアスコルビン酸ナトリウム）、安息香酸（例えば安息香酸ナトリウムまたは安息香酸カリウム）、およびアジピン酸の塩が挙げられるが、これらに限定されない。記載される甘味改善有機酸添加剤の例は、任意に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、カルボキシル、アシル、アシルオキシ、アミノ、アミド、カルボキシル誘導体、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、アルコキシ、アリールオキシ、ニトロ、シアノ、スルホ、チオール、イミン、スルホニル、スルフェニル、スルフィニル、スルファミル、カルボキシアルコキシ、カルボキサミド

40

50

、ホスホニル、ホスフィニル、ホスホリル、ホスフィノ、チオエステル、チオエーテル、アンヒドリド、オキシイミノ、ヒドラジノ、カルバミル、ホスホ、ホスホナート、および任意の他の実行可能な官能基から選択される少なくとも1つの基で置換され得るが、但し、置換有機酸添加剤が合成甘味料の甘味を改善する機能を果たすものとする。

【0072】

例えは、好適な甘味改善無機酸添加剤としては、リン酸、亜リン酸、ポリリン酸、塩酸、硫酸、炭酸、リン酸二水素ナトリウム、およびそのアルカリまたはアルカリ土類金属塩（例えは、イノシトール六リン酸Mg/Ca）が挙げられるが、これらに限定されない。

【0073】

好適な甘味改善苦味化合物添加剤としては、例えは、カフェイン、キニン、尿素、橙皮油、ナリンギン、カシア、およびこれらの塩が挙げられるが、これらに限定されない。

10

【0074】

可食組成物

一態様によれば、本開示は、甘味料の甘味を増強もしくは増進する、または苦味もしくは不快な味覚を隠すもしくは遮断するために、本開示の甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせを含む可食組成物を提供する。それ故に、かかる可食組成物は、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含み得る。任意に、可食組成物は、(i)甘味料、および(ii)式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む。

20

【0075】

「可食組成物」、「経口的に摂取可能な組成物」、および「甘くすることができる組成物」という用語は、本明細書において同義に使用され、典型的には、（消費が吸入等の非経口手段を介して生じ得るが）口腔を介して消費に適している組成物を指す。可食組成物は、液体、固体、半固体、錠剤、薬用キャンディー、粉末、ゲル、ゴム、ペースト、スラリー、シロップ、エアゾール、およびスプレーが挙げられるが、これらに限定されない、任意の形態で存在し得る。本明細書で使用される場合、可食組成物は、食品、薬学的組成物、および消費者製品を含む。可食組成物という用語はまた、例えは、食物および栄養補助食品を指す。本明細書で使用される場合、可食組成物はまた、歯科治療、充填法、充填材料、鋳型、および研磨等の専門的な歯科製品を含む、口腔内に置かれるが、飲み込まれない、組成物も含む。「食用」という用語は、類似の組成物を指し、概して、「可食」という用語に対する同義語として使用される。

30

【0076】

「食品」という用語は、1つ以上の加工された食品を含む任意の組成物を指す。食品としては、菓子類、ベーカリー製品（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、およびクッキーが挙げられるが、これらに限定されない）、アイスクリーム（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、カラスムギ、豆、および米ベースのアイスクリームが挙げられるが、これらに限定されない）、乳製品（飲用牛乳、チーズ、ヨーグルト、および乳酸飲料が挙げられるが、これらに限定されない）、チーズ（ナチュラルチーズおよびプロセスチーズが挙げられるが、これらに限定されない）、バター、マーガリン、甘味および風味スナック（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、およびナッツが挙げられるが、これらに限定されない）、温かいおよび冷たい飲料（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された飲料（例えは、成分として植物または真菌抽出物を用いて調製された冷たい飲料、様々な方法、例えは、葉、花、茎、果実、根、根茎、茎、樹皮、揮発油、またはさらに植物全体が挙げられる

40

50

が、これらに限定されない、様々な植物部位の振り出し、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)が挙げられる)、スナックバー(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が挙げられるが、これらに限定されない)、ミールリブレイスマント製品、携帯食料(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が挙げられるが、これらに限定されない)、スープ(プロス様スープおよびクリーム系スープが挙げられるが、これらに限定されない)、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(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、ビアソーセージ、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(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が挙げられる)、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アレラ、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が挙げられるが、これらに限定されない)、野菜(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が挙げられるが、これらに限定されない)、果実(生、調理済み、および乾燥果実を含む)、穀物(乾燥穀類およびパンが挙げられるが、これらに限定されない)、加工調理済み食品(乾燥、缶詰、または瓶詰めソースおよびスープが挙げられるが、これらに限定されない)、スナック食品、パスタ(生パスタ、冷蔵パスタ、冷凍パスタ、乾燥パスタ、およびマカロニが挙げられるが、これらに限定されない)、麺(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、春雨、チャーメン、フェットチーネ、フジッリ、ニヨッキ、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、シュペッツレ、うどん、およびジー ティが挙げられるが、これらに限定されない)、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(ホットおよびコールドシリアルが挙げられるが、これらに限定されない)、ソース(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、固形ブイヨン、固形スープの素、テーブルソース、ボイベースソース、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、およびディップが挙げられるが、これらに限定されない)、ゼリー、ジャム、貯蔵食品、蜂蜜、ブディング、レシピミックス、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(ケチャップ、マスタード、およびステーキソース等)が挙げられるが、これらに限定されない。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。

【0077】

「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。食材の限定されない例としては、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、および塩が挙げられる。

【0078】

「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)に供された食材を指す。食品を加工処理する方法の例としては、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

10

20

30

40

50

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）が挙げられるが、これらに限定されない。

【0079】

「消費者製品」という用語は、個人的利用および／または対象による消費のための健康および美容製品を指す。消費者製品は、液体、固体、半固体、錠剤、カプセル剤、薬用キヤンディー、ストリップ、粉末、ゲル、ゴム、ペースト、スラリー、シロップ、エアゾール、およびスプレーが挙げられるが、これらに限定されない、任意の形態で存在し得る。消費者製品の限定されない例としては、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、石鹼、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。

10

【0080】

可食組成物は、(i) 本開示の甘味調節剤またはこれらの組み合わせ、および(ii) 甘味料を含み得る。いくつかの実施形態では、甘味調節化合物または甘味調節剤の組み合わせは、約1000、500、または約300ダルトン未満の分子量を有するネオフラボノイド化合物である。ある特定の実施形態では、甘味調節化合物は、式(I)の化合物、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体、あるいは前述のもののうちのいずれかの組み合わせである。他の実施形態では、甘味調節化合物は、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、光学異性体、もしくは誘導体である。

20

【0081】

いくつかの実施形態では、可食組成物は、甘味料を天然にまたは本質的に含む。例えば、甘味料は、果実または果実製品（例えば果実ソース）等の食品のまたは食料品の固有成分であり得る。したがって、本開示の化合物または化合物の組み合わせは、甘味料が添加されていない可食組成物中に使用され得る。

30

【0082】

別の実施形態では、可食組成物は、(i) 本開示の甘味調節剤（例えば、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）、および(ii) 甘味料を含む、甘味付与組成物である。

【0083】

いくつかの実施形態では、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせは、任意の天然または合成甘味料、例えば、任意の好適なカロリー、低カロリー、またはノンカロリー甘味料の甘味または知覚を増強するために使用され得る。式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせは、固有の甘味を有し得、いくつかの実施形態では、それは、その甘味閾値以上で存在するが、組成物中の主な甘味料ではない。むしろ、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせは、甘味料の甘味を増強させるのに役立つ。式(I)の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせは、それらの甘味閾値以下で存在し得る。そのような場合には、化合物または化合物の組み合わせは、甘味料の甘味を増強させることのみに役立つ。当業者は、風味料等級の甘味調節剤、または風味料等級調節剤の組み合わせの濃度を選択することができ

40

50

、それによって、甘味料を含む組成物に、増強した甘味の知覚を付与し得る。例えば、当業者は、甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせの濃度を選択してもよく、それによって、甘味料を含まない組成物に、いかなる知覚できる甘味も付与しない。かかる甘味料の限定されない例としては、カロリー炭水化物甘味料、天然炭水化物甘味料、非天然炭水化物甘味料、天然の高効能甘味料、非天然の高効能甘味料、合成の高効能甘味料、合成炭水化物甘味料、およびこれらの組み合わせが挙げられる。

【0084】

いくつかの実施形態では、可食組成物は、機能性成分をさらに含む。「機能性成分」という用語は、組成物に対して、真のまたは知覚される健康利益を提供する化合物を指す。機能性成分としては、サポニン、酸化防止剤、食物繊維源、脂肪酸、ビタミン、グルコサミン、鉱物、保存剤、水和剤、プロバイオティック、プレバイオティック、体重管理剤、骨粗鬆症管理剤、植物エストロゲン、長鎖第1級脂肪族飽和アルコール、植物ステロール、およびこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。

10

【0085】

いくつかの実施形態では、可食組成物は、飲料である。さらなる実施形態では、飲料はまた、組成物に対して、真のまたは知覚される健康利益を提供する1つ以上の機能性成分も含有し得る。機能性成分としては、サポニン、酸化防止剤、食物繊維源、脂肪酸、ビタミン、グルコサミン、鉱物、保存剤、水和剤、プロバイオティック、プレバイオティック、体重管理剤、骨粗鬆症管理剤、植物エストロゲン、長鎖第1級脂肪族飽和アルコール、植物ステロール、およびこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。

20

【0086】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つのサポニンである。本明細書で使用される場合、少なくとも1つのサポニンは、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として、単一のサポニンまたは複数のサポニンを含み得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つのサポニンは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【0087】

サポニンは、アグリコン環構造および1つ以上の糖部分を含むグリコシド天然植物産物である。非極性アグリコンおよび水溶性糖部分の組み合わせは、水溶液中で振とうしたときに、発泡体を形成することを可能にする、サポニンの界面活性剤の特性を得る。

30

【0088】

サポニンは、いくつかの共通の特性に基づいてグループとしてまとめられる。具体的には、サポニンは、溶血活性を示し、コレステロールと複合体を形成する界面活性剤である。サポニンがこれらの特性を共有するが、それらは構造的に多様である。サポニン中の環構造を形成するアグリコン環構造の種類は、大きく異なり得る。本開示の特定の実施形態で用いるためのサポニン中のアグリコン環構造の種類の限定されない例としては、ステロイド、トリテルペノイド、およびステロイダルアルカロイドが挙げられる。本開示の特定の実施形態で用いるための特定のアグリコン環構造の限定されない例としては、ソヤサポゲノールA、ソヤサポゲノールB、およびソヤサポゲノールEが挙げられる。アグリコン環構造に付着される糖部分の数および種類もまた、大きく異なり得る。本開示の特定の実施形態で用いるための糖部分の限定されない例としては、グルコース、ガラクトース、グルクロン酸、キシロース、ラムノース、およびメチルペントース部分が挙げられる。本開示の特定の実施形態で用いるための特定のサポニンの限定されない例としては、A群アセチルサポニン、B群アセチルサポニン、およびE群アセチルサポニンが挙げられる。

40

【0089】

サポニンは、多種多様の植物および植物産物において見出され得、特に植物の皮および樹皮において高頻度に見られ、そこにろう様保護コーティングを形成する。サポニンのいくつかの共通源は、乾燥重量で約5%のサポニン含量を有する大豆、歴史的に根が石鹼として使用されたシャボンソウ植物(Saponaria)、さらに、アルファルファ、アロエ、アスパラガス、ブドウ、ひよこ豆、ユッカ、および様々な他の豆および雑草を含む

50

。サポニンは、当業者に公知の抽出技術を用いることによってこれらの源から得られ得る。従来の抽出技術の説明は、米国特許出願第2005/0123662号に見出され得、この開示は、参照により明示的に組み込まれる。

【0090】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの酸化防止剤である。本明細書で使用される場合、少なくとも1つの酸化防止剤は、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として、単一の酸化防止剤または複数の酸化防止剤を含み得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの酸化防止剤は、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

10

【0091】

本明細書で使用される場合、「酸化防止剤」とは、細胞および生体分子への酸化的損傷を阻害、抑制、または低減する任意の物質を指す。理論により拘束されないが、酸化防止剤は、有害な反応を引き起こし得る前にフリー・ラジカルを安定化させることによって、細胞または生体分子への酸化的損傷を阻害、抑制、または低減すると考えられている。したがって、酸化防止剤は、いくつかの変性疾患の発症を防止または遅延させることができる。

【0092】

本開示の実施形態において好適な酸化防止剤の例としては、ビタミン、ビタミン補因子、ミネラル、ホルモン、カロテノイド、カロテノイドテルペノイド、非カロテノイドテルペノイド、フラボノイド、フラボノイドポリフェノール類（例えばバイオフラボノイド）、フラボノール、フラボン、フェノール、ポリフェノール、フェノールのエステル、ポリフェノールのエステル、非フラボノイドフェノール類、イソチオシアネート、およびこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、酸化防止剤は、ビタミンA、ビタミンC、ビタミンE、ユビキノン、無機質セレン、マンガン、メラトニン、-カロテン、-カロテン、リコピン、ルテイン、ゼアンチン、クリポキサンチン、レスセルバトール、オイゲノール、ケルセチン、カテキン、ゴシポール、ヘスペレチン、クルクミン、フェルラ酸、チモール、ヒドロキシチロソール、ターメリック（t u m e r i c）、タイム、オリーブ油、リポ酸、グルタチノン（g l u t a t h i n o n e）、グタミン（g u t a m i n e）、シュウ酸、トコフェロール由来の化合物、ブチル化ヒドロキシアニソール（B H A）、ブチル化ヒドロキシトルエン（B H T）、エチレンジアミン四酢酸（E D T A）、tert - ブチルヒドロキノン、酢酸、ペクチン、トコトリエノール、トコフェロール、補酵素Q10、ゼアキサンチン、アスタキサンチン、カントキサンチン（c a n t h a x a n t i n）、サポニン、リモノイド、ケンペドロール（k a e m p f e d r o l）、ミリセチン、イソラムネチン、プロアントシアニジン、ケルセチン、ルチン、ルテオリン、アピゲニン、タンゲリチン、ヘスペレチン、ナリンゲニン、エロジクチオール（e r o d i c t y o l）、フラバン-3-オール（例えば、アントシアニジン）、ガロカテキン、エピカテキンおよびそのガレート形態、エピガロカテキンおよびそのガレート形態（E C G C）テアフラビンおよびそのガレート形態、テアルビジン、イソフラボン植物エストロゲン、ゲニステイン、ダイゼイン、グリシテイン、アントシアニン（a n y t h o c y a n i n）、シアニジング（c y a n i d i n g）、デルフィニジン、マルビジン、ペラルゴニジン、ペオニジン、ペツニジン、エラグ酸、没食子酸、サリチル酸、ロスマリン酸、桂皮酸およびその誘導体（例えばフェルラ酸）、クロロゲン酸、チコリ酸、ガロタンニン、エラジタンニン、アントキサンチン、ベタシアニンおよび他の植物顔料、シリマリン、クエン酸、リグナン、抗栄養素、ビリルビン、尿酸、R - - リポ酸、N - アセチルシスティン、エンブリカニン（e m b l i c a n i n）、リンゴ抽出物、リンゴ皮抽出物（アップルフェノン）、ルイボス抽出物レッド、ルイボス抽出物グリーン、ホーソンベリー抽出物、レッドラズベリー抽出物、グリーンコーヒー酸化防止剤（G C A）、アロニア抽出物20%、ブドウ種子抽出物（V i n O s e e d）、ココア抽出物、ホップ抽出物、マンゴスチン抽出物、マンゴスチン外皮抽出物、クランベリ

20

30

40

50

ー抽出物、ザクロ抽出物、ザクロ外皮抽出物、ザクロ種子抽出物、ホーソンベリー抽出物、ポメラザクロ抽出物、桂皮抽出物、ブドウの皮抽出物、ビルベリー抽出物、松樹皮抽出物、ピクノジェノール、エルダーベリー抽出物、クワ根抽出物、クコ (gogi) 抽出物、ブラックベリー抽出物、ブルーベリー抽出物、ブルーベリー葉抽出物、ラズベリー抽出物、ターメリック抽出物、シトラスバイオフラボノイド、クロフサスグリ、ショウガ、アサイー粉末、グリーンコーヒー豆抽出物、緑茶抽出物、およびフィチン酸、またはこれらの組み合わせである。代替の実施形態では、酸化防止剤は、例えば、ブチル化ヒドロキシトルエンまたはブチル化ヒドロキシアニソール等の合成酸化防止剤である。本開示の実施形態において好適な酸化防止剤の他の源には、果実、野菜、茶、ココア、チョコレート、スパイス、ハーブ、米、家畜の内臓肉、酵母、全粒、または穀粒が含まれるが、これらに限定されない。

10

【0093】

特定の酸化防止剤は、ポリフェノール (polyphenols) (「ポリフェノール類 (polyphenolics)」としても知られている) と呼ばれる植物性栄養素の種類に属し、これは植物中に見られる一群の化学物質であり、1分子当たり1つを超えるフェノール基の存在を特徴とする。癌、心疾患、および慢性炎症疾患の予防、ならびに精神的な強さおよび身体的な強さの改善を含む、様々な健康上の利益をポリフェノールから得ることができる。本開示の実施形態において好適なポリフェノールには、カテキン、プロアントシアニジン、プロシアニジン、アントシアニン、クエルセリン (quercetin)、ルチン、レスセルバトロール (reservatrol)、イソフラボン、クルクミン、ブニカラギン、エラジタンニン、ヘスペリジン、ナリンギン、シトラスフラボノイド、クロロゲン酸、他の類似の材料、およびこれらの組み合わせが含まれる。

20

【0094】

特定の実施形態では、酸化防止剤は、例えば、没食子酸エピガロカテキン (EGCG) 等のカテキンである。本開示の実施形態において好適なカテキンの源には、緑茶、白茶、紅茶、ウーロン茶、チョコレート、ココア、赤ワイン、ブドウ種子、赤ブドウの皮、紫ブドウの皮、赤ブドウジュース、紫ブドウジュース、ベリー、ピクノジェノール、および赤リンゴの皮が含まれるが、これらに限定されない。

30

【0095】

いくつかの実施形態では、酸化防止剤は、プロアントシアニジン、プロシアニジン、またはこれらの組み合わせから選択される。本開示の実施形態において好適なプロアントシアニジンおよびプロシアニジンの源には、赤ブドウ、紫ブドウ、ココア、チョコレート、ブドウ種子、赤ワイン、カカオ豆、クランベリー、リンゴの皮、プラム、ブルーベリー、クロフサスグリ、チョークベリー、緑茶、ソルガム、シナモン、大麦、金時豆、ピント豆、ホップ、アーモンド、ヘーゼルナッツ、ピーカン、ピスタチオ、ピクノジェノール、および色彩豊かなベリーが含まれるが、これらに限定されない。

【0096】

特定の実施形態では、酸化防止剤は、アントシアニジンである。本開示の実施形態において好適なアントシアニジンの源には、レッドベリー、ブルーベリー、ビルベリー、クランベリー、ラズベリー、サクランボ、ザクロ、イチゴ、エルダーベリー、チョークベリー、赤ブドウの皮、紫ブドウの皮、ブドウ種子、赤ワイン、クロフサスグリ、アカフサスグリ、ココア、プラム、リンゴの皮、モモ、レッドペアー、赤キャベツ、赤タマネギ、赤オレンジ、およびブラックベリーが含まれるが、これらに限定されない。

40

【0097】

いくつかの実施形態では、酸化防止剤は、ケルセチン、ルチン、またはこれらの組み合わせから選択される。本開示の実施形態において好適なケルセチンおよびルチンの源には、赤リンゴ、タマネギ、ケール、クロマメノキ、コケモモ、チョークベリー、クランベリー、ブラックベリー、ブルーベリー、イチゴ、ラズベリー、クロフサスグリ、緑茶、紅茶、プラム、アプリコット、パセリ、リーキ、ブロッコリー、チリペッパー、ベリーワイン、およびイチョウが含まれるが、これらに限定されない。

50

【0098】

いくつかの実施形態では、酸化防止剤は、レスベラトロールである。本開示の実施形態において好適なレスベラトロールの源には、赤ブドウ、ピーナツ、クランベリー、ブルーベリー、ビルベリー、クワ、日本産イタドリ茶、および赤ワインが含まれるが、これらに限定されない。

【0099】

特定の実施形態では、酸化防止剤は、イソフラボンである。本開示の実施形態において好適なイソフラボンの源には、大豆、大豆製品、豆類、アルファルファもやし、ひよこ豆、ピーナツ、およびムラサキツメクサが含まれるが、これらに限定されない。

【0100】

いくつかの実施形態では、酸化防止剤は、クルクミンである。本開示の実施形態において好適なクルクミンの源には、ターメリックおよびカラシが含まれるが、これらに限定されない。

【0101】

特定の実施形態では、酸化防止剤は、ブニカラギン、エラジタンニン、またはこれらの組み合わせから選択される。本開示の実施形態において好適なブニカラギンおよびエラジタンニンの源には、ザクロ、ラズベリー、イチゴ、クルミ、およびオークで熟成した赤ワインが含まれるが、これらに限定されない。

【0102】

いくつかの実施形態では、酸化防止剤は、ヘスペリジンまたはナリンギン等のシトラスフラボノイドである。本開示の実施形態において好適なヘスペリジンまたはナリンギン等のシトラスフラボノイドの源には、オレンジ、グレープフルーツ、およびシトラスジュースが含まれるが、これらに限定されない。

【0103】

特定の実施形態では、酸化防止剤は、クロロゲン酸である。本開示の実施形態において好適なクロロゲン酸の源には、グリーンコーヒー、イエルバ・マテ、赤ワイン、ブドウ種子、赤ブドウの皮、紫ブドウの皮、赤ブドウジュース、紫ブドウジュース、リンゴジュース、クランベリー、ザクロ、ブルーベリー、イチゴ、ヒマワリ、エキナセア (Echinacea)、ピクノジェノール、およびリンゴの皮が含まれるが、これらに限定されない。

【0104】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの食物纖維源である。本明細書で使用される場合、少なくとも1つの食物纖維源は、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として、単一の食物纖維源または複数の食物纖維源を含み得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの食物纖維源は、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【0105】

組成および結合の両方において有意に異なる構造を有する多数の高分子炭水化物が食物纖維の定義に含まれる。このような化合物は当業者に公知であり、その限定されない例としては、非デンプン多糖、リグニン、セルロース、メチルセルロース、ヘミセルロース、-グルカン、ペクチン、ガム、粘液、ワックス、イヌリン、オリゴ糖、フラクトオリゴ糖、シクロデキストリン、キチン、およびこれらの組み合わせが挙げられる。

【0106】

多糖は、グリコシド結合によって結合された单糖で構成される複合糖質である。非デンプン多糖は 結合で結合されており、ヒトは 結合を破壊する酵素がないためにこれを消化することができない。反対に、消化可能なデンプン多糖は、通常 (1-4) 結合を含む。

【0107】

リグニンは、酸化されたフェニルプロパン単位に基づく大型の高度分岐および架橋ポリ

10

20

30

40

50

マーである。セルロースは、(1-4)結合によって結合したグルコース分子の線状ポリマーであり、哺乳類アミラーゼはこれを加水分解することができない。メチルセルロースは、セルロースのメチルエステルであり、増粘剤および乳化剤として食料品において使用されることが多い。これは市販されている(例えば、G l a x o S m i t h K l i n e によるC i t r u c e l、S h i r e P h a r m a c e u t i c a l s によるC e l e v a c)。ヘミセルロースは、主にグルクロノ-および4-O-メチルグルクロキシランからなる高分岐ポリマーである。-グルカンは、主にオート麦および大麦等の穀類中に見られる混合結合(1-3)、(1-4)-D-グルコースポリマーである。ベータペクチン等のペクチンは、主にD-ガラクトロン酸で構成された多糖の群であり、種々の程度にメトキシル化されている。

10

【0108】

ガムおよび粘液は、広範囲の異なる分枝状構造を表す。グァー種子の粉碎した胚乳に由来するグァーガムは、ガラクトマンナンである。グーガムは市販されている(例えばN o v a r t i s A G によるB e n e f i b e r)。アラビアガムおよびペクチン等の他のガムは、さらに異なる構造を有する。さらに他のガムには、キサンタンガム、ゲランガム、タラガム、オオバコ種子殻ガム、およびローカストビーンガムが含まれる。

【0109】

ワックスは、エチレングリコールおよび2つの脂肪酸のエステルであり、通常、水に不溶性の疎水性液体として存在する。

20

【0110】

イヌリンは、フルクトタンとして知られている炭水化物の種類に属する天然に存在するオリゴ糖を含む。これらは一般に、末端グルコース単位を有する(2-1)グリコシド結合によって結合されたフルクトース単位で構成される。オリゴ糖は、通常3~6個の成分糖を含有するサッカライドポリマーである。これらは一般に、タンパク質中の適合性アミノ酸側鎖か、あるいは脂質分子のいずれかにO-またはN-結合されて見出される。フルクトオリゴ糖は、フルクトース分子の短鎖からなるオリゴ糖である。

30

【0111】

食物繊維の食品源には、穀物、豆類、果実、および野菜が含まれるが、これらに限定されない。食物繊維を提供する穀物には、オート麦、ライ麦、大麦、小麦が含まれるが、これらに限定されない。繊維を提供する豆類には、エンドウマメおよびマメ、例えば大豆等が含まれるが、これらに限定されない。繊維の源を提供する果実および野菜には、リンゴ、オレンジ、セイヨウナシ、バナナ、ベリー、トマト、グリーンビーンズ、ブロッコリー、カリフラワー、ニンジン、ジャガイモ、セロリが含まれるが、これらに限定されない。ふすま、ナツツ、および種子(亜麻仁等)等の植物性食品も食物繊維の源である。食物繊維を提供する植物の部分には、茎、根、葉、種子、果肉、および皮が含まれるが、これらに限定されない。

30

【0112】

食物繊維は一般に植物源に由来するが、キチン等の消化しにくい動物性食品も食物繊維に分類される。キチンは、セルロースの結合と同様の(1-4)結合によって結合されたアセチルグルコサミン単位で構成される多糖である。

40

【0113】

食物繊維の源は、水中の溶解度に基づいて可溶性繊維および不溶性繊維の種類に分けられることが多い。可溶性繊維および不溶性繊維は両方とも植物の特徴に応じて様々な程度で植物性食品中に見られる。不溶性繊維は水中では不溶性であるが、受動的な親水性特性を有し、嵩を増すのに役立ち、便を軟化させ、糞固体が腸管を通過する時間を短縮する。

【0114】

不溶性繊維とは違って、可溶性繊維は、水中に容易に溶解する。可溶性繊維は、結腸内で発酵による活性代謝処理を受け、結腸細菌叢を増大させ、それにより糞固体の質量を増大させる。結腸細菌による繊維の発酵は、著しい健康上の利益を有する最終生成物もたらす。例えば、食物塊の発酵は、気体および短鎖脂肪酸を生じる。発酵中に生じる酸には

50

、酪酸、酢酸、プロピオン酸、および吉草酸が含まれ、これらは、すい臓インスリン放出に作用することによる血糖レベルの安定化や、グリコーゲンの分解による肝臓制御の提供などの種々の有益な特性を有する。さらに、纖維の発酵は、肝臓によるコレステロール合成を低下させ、LDLおよびトリグリセリドの血中レベルを低下させることによって、アテローム性動脈硬化を低減し得る。発酵中に生じる酸は結腸pHを低くし、それにより、結腸の内層を癌ポリープの形成から保護する。また結腸pHがより低いと、ミネラル吸収が増大され、結腸粘膜層のバリア特性が改善され、炎症および接着刺激物が阻害される。纖維の発酵は、ヘルパーT細胞、抗体、白血球、脾細胞、サイトカイニン、およびリンパ球の産生を刺激することによって、免疫系のためにもなり得る。

【0115】

10

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの脂肪酸である。

【0116】

本明細書で使用される場合、少なくとも1つの脂肪酸は、本明細書に提供される甘味料可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一の脂肪酸または複数の脂肪酸であり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの脂肪酸は、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【0117】

本明細書で使用される場合、「脂肪酸」は、任意の直鎖モノカルボン酸を指し、飽和脂肪酸、不飽和脂肪酸、長鎖脂肪酸、中鎖脂肪酸、短鎖脂肪酸、脂肪酸前駆体（オメガ-9脂肪酸前駆体を含む）、およびエステル化脂肪酸を含む。本明細書で使用される場合、「長鎖多価不飽和脂肪酸」は、長い脂肪族尾部を有する任意の多価不飽和カルボン酸または有機酸を指す。本明細書で使用される場合、「オメガ-3脂肪酸」は、その炭素鎖末端メチル端部から3番目の炭素-炭素結合として第1の二重結合を有する任意の多価不飽和脂肪酸を指す。特定の実施形態では、オメガ-3脂肪酸は、長鎖オメガ-3脂肪酸を含み得る。本明細書で使用される場合、「オメガ-6脂肪酸」は、その炭素鎖末端メチル端部から6番目の炭素-炭素結合として第1の二重結合を有する任意の多価不飽和脂肪酸。

20

【0118】

30

本開示の実施形態で用いるために好適なオメガ-3脂肪酸は、例えば、藻類、魚、動物、植物、またはこれらの組み合わせに由来することができる。好適なオメガ-3脂肪酸の例としては、リノレン酸、アルファ-リノレン酸、エイコサペンタエン酸、ドコサヘキサエン酸、ステアリドン酸、エイコサテトラエン酸、およびこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、好適なオメガ-3脂肪酸は、魚油、（例えば、メンヘーデン油、マグロ油、サケ油、カツオ油、タラ油）、微細藻類オメガ-3油、またはこれらの組み合わせ中に提供され得る。特定の実施形態では、好適なオメガ-3脂肪酸は、例えば、Microalgae DHA油（Martek（Columbia, MD）から）、OmegaPure（Omega Protein（Houston, TX）から）、Marinol C-38（Lipid Nutrition（Channahon, IL）から）、Bonito油およびMEG-3（Ocean Nutrition（Dartmouth, NS）から）、Evogel（Symrise（Holzminden, Germany）から）、マグロまたはサケからのMarine油（Arista Wilton, CT）から）、OmegaSource 2000、メンヘーデンからのMarine Oil、およびタラからのMarine Oil（OmegaSource（ RTP, NC）から）等の市販のオメガ-3脂肪酸に由来し得る。

40

【0119】

好適なオメガ-6脂肪酸としては、リノール酸、ガンマ-リノレン酸、ジホモ-ガンマ-リノレン酸、アラキドン酸、エイコサジエン酸、ドコサジエン酸、アドレン酸、ドコサペンタエン酸、およびこれらの組み合わせが含まれるが、これらに限定されない。

【0120】

50

本開示の実施形態に好適なエステル化脂肪酸には、オメガ-3および/もしくはオメガ

- 6 脂肪酸を含有するモノアシルグリセロール、オメガ - 3 および / もしくはオメガ - 6 脂肪酸を含有するジアシルグリセロール、またはオメガ - 3 および / もしくはオメガ - 6 脂肪酸を含有するトリアシルグリセロール、ならびにこれらの組み合わせが含まれ得るが、これらに限定されない。

【 0 1 2 1 】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも 1 つのビタミンである。本明細書で使用される場合、少なくとも 1 つのビタミンは、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一のビタミンまたは複数のビタミンであり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも 1 つのビタミンは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

10

【 0 1 2 2 】

ビタミンは、人体が正常な機能を果たすために少量必要とする有機化合物である。身体は、炭水化物およびタンパク質等の他の栄養素とは異なり、ビタミンを分解することなく使用する。今日まで、13 のビタミンが認識されており、1 つ以上を本明細書中の機能性甘味料および甘味付与組成物において使用することができる。好適なビタミンには、ビタミン A、ビタミン D、ビタミン E、ビタミン K、ビタミン B1、ビタミン B2、ビタミン B3、ビタミン B5、ビタミン B6、ビタミン B7、ビタミン B9、ビタミン B12、およびビタミン C が含まれる。ビタミンの多くは代替の化学名も有し、これらの限定されない例を、以下に提供する。

【 表 1 】

20

ビタミン	代替名
ビタミン A	レチノール、レチナールデヒド、レチノイン酸、レチノイド、レチナール、レチノイン酸エステル
ビタミン D (ビタミン D1 ~ D5)	カルシフェロール、コレカルシフェロール、ルミステロール、エルゴカルシフェロール、ジヒドロタキステロール、7-ジヒドロコレステロール
ビタミン E	トコフェロール、トコトリエノール
ビタミン K	フィロキノン、ナフトキノン
ビタミン B1	チアミン
ビタミン B2	リボフラビン、ビタミン G
ビタミン B3	ナイアシン、ニコチン酸、ビタミン PP
ビタミン B5	パントテン酸
ビタミン B6	ピリドキシン、ピリドキサール、ピリドキサミン
ビタミン B7	ビオチン、ビタミン H
ビタミン B9	葉酸、葉酸塩、フォラシン、ビタミン M、ブテロイル-L-グルタミン酸
ビタミン B12	コバラミン、シアノコバラミン
ビタミン C	アスコルビン酸

30

40

【 0 1 2 3 】

様々な他の化合物が、当局によってビタミンに分類されている。これらの化合物は、ブソイド - ビタミンと呼ばれることがあり、ユビキノン（補酵素 Q10）、パンガミン酸、ジメチルグリシン、タエストリル（ta est r i l e）、アミグダリン（a m y g d a l i n e）、フラボノイド、パラ - アミノ安息香酸、アデニン、アデニル酸、および s - メチルメチオニン等の化合物が含まれるが、これらに限定されない。本明細書で使用される場合、ビタミンという用語は、ブソイド - ビタミンを含む。

【 0 1 2 4 】

いくつかの実施形態では、ビタミンは、ビタミン A、D、E、K、およびこれらの組み

50

合わせから選択される脂溶性ビタミンである。

【0125】

他の実施形態では、ビタミンは、ビタミンB1、ビタミンB2、ビタミンB3、ビタミンB6、ビタミンB12、葉酸、ビオチン、パントテン酸、ビタミンC、およびこれらの組み合わせから選択される水溶性ビタミンである。

【0126】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、グルコサミンである。概して、本開示の特定の実施形態によると、グルコサミンは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【0127】

キトサミンとも呼ばれるグルコサミンは、糖化タンパク質および脂質の生化学的合成において重要な前駆体であると考えられるアミノ糖である。D-グルコサミンはグルコサミン-6-リン酸の形態で軟骨中に天然に存在し、フルクトース-6-リン酸およびグルタミンから合成される。しかしながら、グルコサミンは、他の形態でも入手可能であり、その限定されない例としては、グルコサミン塩酸塩、グルコサミン硫酸塩、N-アセチル-グルコサミン、または任意の他の塩形態、またはこれらの組み合わせが挙げられる。グルコサミンは、当業者に周知の方法を用いて、ロブスター、カニ、小エビ（shrimp）、またはテナガエビ（prawn）の殻の酸加水分解によって得ることができる。特定の実施形態では、グルコサミンは、米国特許公開第2006/0172392号に記載されるキチンを含有する真菌バイオマスに由来し得る。

10

20

30

40

50

【0128】

可食組成物（例えば飲料）は、コンドロイチン硫酸塩をさらに含むことができる。

【0129】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つのミネラルである。

【0130】

本明細書で使用される場合、少なくとも1つのミネラルは、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一のミネラルまたは複数のミネラルであり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つのミネラルは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【0131】

ミネラルは、本発明の教示によると、生体によって必要とされる無機化学元素を含む。ミネラルは、広範囲の組成で構成され（例えば、元素、単塩、および複合ケイ酸塩）、結晶構造も大きく異なる。これらは食品および飲料中に天然に存在し得るか、サプリメントとして添加し得るか、または食品もしくは飲料とは別個に消費または投与され得る。

【0132】

ミネラルは、比較的大量に必要とされる多量ミネラルか、または比較的少量で必要とされる微量ミネラルのいずれかに分類することができる。多量ミネラルは、概して、1日当たり約100mg以上の量で必要とされ、微量ミネラルは、1日当たり約100mg未満の量で必要とされるものである。

【0133】

本開示の特定の実施形態では、ミネラルは、多量ミネラル、微量ミネラル、またはこれらの組み合わせから選択される。多量ミネラルの限定されない例としては、カルシウム、塩素、マグネシウム、リン、カリウム、ナトリウム、および硫黄が挙げられる。微量ミネラルの限定されない例としては、クロム、コバルト、銅、フッ素、鉄、マンガン、モリブデン、セレン、亜鉛、およびヨウ素が挙げられる。ヨウ素は、概して、微量ミネラルに分類されるが、他の微量ミネラルよりも大量に必要とされ、多量ミネラルと分類されることが多い。

【0134】

本開示の他の特定の実施形態では、ミネラルは、ヒトの栄養に必要であると考えられる微量ミネラルであり、その限定されない例としては、ビスマス、ホウ素、リチウム、ニッ

ケル、ルビジウム、ケイ素、ストロンチウム、テルル、スズ、チタン、タングステン、およびバナジウムが挙げられる。

【0135】

本明細書において具体化されるミネラルは、当業者に知られている任意の形態であり得る。例えば、特定の実施形態では、ミネラルは、正または負電荷のいずれかを有するそのイオン形態であり得る。別の特定の実施形態では、ミネラルは、その分子形態であり得る。例えば、硫黄およびリンは、硫酸塩、硫化物、およびリン酸塩として天然に見出されることが多い。

【0136】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの保存剤である。本明細書で使用される場合、少なくとも1つの保存剤は、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一の保存剤または複数の保存剤であり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの保存剤は、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

10

【0137】

本開示の特定の実施形態では、保存剤は、抗菌剤、酸化防止剤、抗酵素剤、またはこれらの組み合わせから選択される。抗菌剤の限定されない例としては、亜硫酸塩、プロピオン酸塩、安息香酸塩、ソルビン酸塩、硝酸塩、亜硝酸塩、バクテリオシン、塩、糖、酢酸、二炭酸ジメチル（DMDc）、エタノール、およびオゾンが挙げられる。

20

【0138】

特定の実施形態によると、保存剤は亜硫酸塩である。亜硫酸塩には、二酸化硫黄、亜硫酸水素ナトリウム、および亜硫酸水素カリウムが含まれるが、これらに限定されない。

【0139】

別の実施形態によると、保存剤はプロピオン酸塩である。プロピオン酸塩には、プロピオン酸、プロピオン酸カルシウム、およびプロピオン酸ナトリウムが含まれるが、これらに限定されない。

【0140】

さらに別の特定の実施形態によると、保存剤は安息香酸塩である。安息香酸塩には、安息香酸ナトリウムおよび安息香酸が含まれるが、これらに限定されない。

30

【0141】

別の特定の実施形態によると、保存剤はソルビン酸塩である。ソルビン酸塩には、ソルビン酸カリウム、ソルビン酸ナトリウム、ソルビン酸カルシウム、およびソルビン酸が含まれるが、これらに限定されない。

【0142】

さらに別の特定の実施形態では、保存剤は、硝酸塩および/または亜硝酸塩である。硝酸塩および亜硝酸塩には、硝酸ナトリウムおよび亜硝酸ナトリウムが含まれるが、これらに限定されない。

【0143】

さらに別の特定の実施形態では、少なくとも1つの保存剤は、例えば、ナイシン等のバクテリオシンである。

40

【0144】

別の特定の実施形態では、保存剤はエタノールである。

【0145】

さらに別の特定の実施形態では、保存剤はオゾンである。

【0146】

本発明の特定の実施形態において保存剤として使用するのに適した抗酵素剤の限定されない例としては、アスコルビン酸、クエン酸、およびエチレンジアミン四酢酸（EDTA）等の金属キレート剤が挙げられる。

【0147】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの水和剤である。本明細書で

50

使用される場合、少なくとも 1 つの水和剤は、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一の水和剤または複数の水和剤であり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも 1 つの水和剤は、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【 0 1 4 8 】

水和生成物は、身体が排出により失われた流体を補充するのに役立つ。例えば、流体は、体温を調節するための汗として、老廃物質を排出するための尿として、および肺中の気体を交換するための水蒸気として失われる。流体の損失は広範囲の外因によって生じることもあり、その限定されない例としては、身体活動、乾燥空気への暴露、下痢、嘔吐、高体温、ショック、失血、および低血圧が挙げられる。流体損失を生じる疾患には、糖尿病、コレラ、胃腸炎、細菌性赤痢、および黄熱が含まれる。流体損失を生じる栄養失調の形態には、アルコールの過剰消費、電解質異常、絶食、および急速な体重減少が含まれる。

10

【 0 1 4 9 】

特定の実施形態では、水和生成物は、身体が運動中に失われる流体を補充するのに役立つ組成物である。したがって、特定の実施形態では、水和生成物は電解質であり、その限定されない例としては、ナトリウム、カリウム、カルシウム、マグネシウム、塩化物、リン酸塩、炭酸水素塩、およびこれらの組み合わせが挙げられる。本開示の特定の実施形態で用いるために好適な電解質はまた、米国特許第 5,681,569 号に記載されており、この開示は、参照により本明細書中に明示的に組み込まれる。特定の実施形態では、電解質は、その対応する水溶性塩から得られる。特定の実施形態で用いるための塩の限定されない例としては、塩化物、炭酸塩、硫酸塩、酢酸塩、炭酸水素塩、クエン酸塩、リン酸塩、リン酸水素塩、酒石酸塩、ソルビン酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、またはこれらの組み合わせが挙げられる。他の実施形態では、電解質は、ジュース、果実抽出物、野菜抽出物、茶、または茶抽出物によって提供される。

20

【 0 1 5 0 】

本開示の特定の実施形態では、水和生成物は、筋肉によって燃焼されるエネルギー貯蔵を補うための炭水化物である。本発明の特定の実施形態において使用するのに適した炭水化物は、米国特許第 4,312,856 号、同第 4,853,237 号、同第 5,681,569 号、および同第 6,989,171 号に記載されており、これらの開示は、参照により本明細書中に明示的に組み込まれる。好適な炭水化物の限定されない例としては、単糖、二糖、オリゴ糖、複合多糖、またはこれらの組み合わせが挙げられる。特定の実施形態で用いるための好適なタイプの単糖の限定されない例としては、トリオース、テトロース、ペントース、ヘキソース、ヘプトース、オクトース、およびノノースが挙げられる。具体的なタイプの好適な単糖の限定されない例としては、グリセルアルデヒド、ジヒドロキシアセトン、エリトロース、トレオース、エリトルロース、アラビノース、リキソース、リボース、キシロース、リブロース、キシルロース、アロース、アルトロース、ガラクトース、グルコース、グロース、イドース、マンノース、タロース、フルクトース、ブシコース、ソルボース、タガトース、マンノヘプツロース、セドヘルツロース (s e d o h e l t u l o s e)、オクトロース (o c t o l o s e)、およびシアロース (s i a l o s e) が挙げられる。好適な二糖類の限定されない例としては、スクロース、ラクトース、およびマルトースが挙げられる。好適なオリゴ糖の限定されない例としては、サッカロース、マルトオリオース、およびマルトデキストリンが挙げられる。他の特定の実施形態では、炭水化物は、コーンシロップ、甜菜糖、甘蔗糖、ジュース、または茶によって提供される。

30

【 0 1 5 1 】

別の特定の実施形態では、水和物は、細胞の再水和を提供するフラバノールである。フラバノールは、植物中に存在する天然物質の類であり、概して、1 つ以上の化学部分に結合した 2-フェニルベンゾピロン分子骨格を含む。本開示の特定の実施形態で用いるのに好適なフラバノールの限定されない例としては、カテキン、エピカテキン、ガロカテキン、エピガロカテキン、没食子酸エピカテキン、エピガロカテキン 3-ガラート、テアフラ

40

50

ビン、テアフラビン3-ガラート、テアフラビン3'-ガラート、テアフラビン3,3'ガラート、テアルビジン、またはこれらの組み合わせが挙げられる。フラバノールいくつかの共通の源には、茶樹、果実、野菜、および花が含まれる。好ましい実施形態では、フラバノールは緑茶から抽出される。

【0152】

特定の実施形態では、水和生成物は、運動の耐久性を高めるためのグリセロール溶液である。グリセロール含有溶液の摂取は、血液用量の拡大、心拍数の低下、および直腸温度の低下等の有利な生理学的効果を提供することが示されている。

【0153】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つのプロバイオティック、プレバイオティック、およびこれらの組み合わせから選択される。本明細書で使用される場合、少なくとも1つのプロバイオティックまたはプレバイオティックは、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一のプロバイオティックまたはプレバイオティックまたは複数のプロバイオティックまたはプレバイオティックであり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つのプロバイオティック、プレバイオティック、またはこれらの組み合わせは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【0154】

プロバイオティックは、本発明の教示によると、有効量で消費されたときに健康の利益になる微生物を含む。望ましくは、プロバイオティックは、人体の天然に存在する胃腸内細菌叢に有利な影響を与え、栄養とは別に、健康上の利益を付与する。プロバイオティックは、細菌、酵母、および真菌を含み得るが、これらに限定されない。

【0155】

特定の実施形態によると、プロバイオティックは、人体の天然に存在する胃腸内細菌叢に有利な影響を与え、栄養とは別に、健康上の利益を付与する有利な微生物である。プロバイオティックの例としては、ヒトに有益な効果を与えるラクトバチルス属（lactobacilli）、ビフィドバクテリウム属（bifidobacteria）、ストレプトコッカス属（streptococci）の細菌、またはこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。

【0156】

本開示の特定の実施形態では、少なくとも1つのプロバイオティックは、ラクトバチルス属から選択される。ラクトバチルス属（すなわち、ラクトバチルス属の細菌、以下「L.」）は、食品保存剤として、およびヒトの健康を増進するために数百年間使用されている。ヒトの腸管内に見られるラクトバチルス属の種の限定されない例としては、L.アシドフィルス（L. acidophilus）、L.カゼイ（L. casei）、L.ファーメンタム（L. fermentum）、L.サリバローズ（L. salivarius）、L.ブレビス（L. brevis）、L.ライヒマニ（L. leichmanni）、L.プランタルム（L. plantarum）、L.セロビオスス（L. cellobiosus）、L.ロイテリ（L. reuteri）、L.ラムノサス（L. rhamnosus）、L. GG、L.ブルガリクス（L. bulgaricus）、およびL.サーモフィルス（L. thermophilus）が挙げられる。

【0157】

本開示の他の特定の実施形態によると、プロバイオティックは、ビフィドバクテリウム属から選択される。ビフィドバクテリウム属もまた、炭水化物代謝の結果として短鎖の脂肪酸（例えば、酢酸、プロピオン酸、および酪酸）、乳酸、およびギ酸を生じることによって、ヒトの健康に有益な影響を与えることが知られている。ヒト胃腸管内で見出されるビフィドバクテリウム属の限定されない種には、B.アングラタム（B. angulatum）、B.アニマリス（B. animalis）、B.アステロイデス（B. asteroides）、B.ビフィダム（B. bifidum）、B.ボウム（B. boum）、B.ブレベ（B. breve）、B.カテヌラツム（B. catenulatum）、

10

20

30

40

50

B.コエリヌム(*B. choerinum*)、B.コリネフォルメ(*B. coryneforme*)、B.クニクリ(*B. cuniculi*)、B.デンティウム(*B. dentium*)、B.ガリクム(*B. gallicum*)、B.ガリナルム(*B. gallinarum*)、B.インディクム(*B. indicum*)、B.ロングム(*B. longum*)、B.マグナム(*B. magnum*)、B.メリシカム(*B. merycicum*)、B.ミニマム(*B. minimum*)、B.シュードカテヌラツム(*B. pseudocatenulatum*)、B.シュードロングム(*B. pseudolongum*)、B.サイクレロフィルム(*B. psychraerophilum*)、B.プロラム(*B. pullorum*)、B.ルミナンチウム(*B. ruminantium*)、B.サエクラレ(*B. saeculare*)、B.スカルドビ(*B. scardovii*)、B.シミエ(*B. simiae*)、B.サブチル(*B. subtile*)、B.サーマシドフィルム(*B. thermacidophilum*)、B.サーモフィルム(*B. thermophilum*)、B.ウリナリス(*B. urinalis*)、およびB.種が含まれる。

【0158】

本発明の他の特定の実施形態によると、プロバイオティックは、ストレプトコッカス属から選択される。ストレプトコッカス・サーモフィルスは、グラム陽性の通性嫌気性菌である。これは乳酸菌に分類され、一般に乳および乳製品中に見られ、ヨーグルトの製造において使用される。この細菌の他の限定されないプロバイオティック種には、ストレプトコッカス・サリバリウスおよびストレプトコッカス・クレモリスが含まれる。

【0159】

本開示に従って使用され得るプロバイオティックは当業者に公知である。プロバイオティクスを含む食材の限定されない例には、ヨーグルト、ザウアークラウト、ケフィア、キムチ、発酵野菜、および腸内マイクロバランスを改善することによって宿主動物に有益な影響を与える微生物要素を含有する他の食材が含まれる。

【0160】

プレバイオティックは、本発明の教示によると、腸内の有益な細菌の増殖を促進する組成物である。プレバイオティック物質は、関連のプロバイオティックによって消費され得るか、そうでなければ、関連のプロバイオティックを生きた状態に保つのに役立つか、またはその増殖を刺激することができる。有効な量で消費される場合、プレバイオティックも人体の天然に存在する胃腸内細菌叢に有益な効果を与える、それによって単なる栄養とは別に、健康上の利益を付与する。プレバイオティック食品は結腸に入り、内在細菌の基質としての役割を果たし、それにより、エネルギー、代謝基質、および必須微量栄養素を間接的に宿主に提供する。プレバイオティック食品の身体の消化および吸収は細菌の代謝活性に依存し、小腸内で消化および吸収を免れた栄養素から宿主のためにエネルギーを回収する。

【0161】

本開示の実施形態に従って、プレバイオティックには、ムコ多糖、オリゴ糖、多糖、アミノ酸、ビタミン、栄養素前駆体、タンパク質、およびこれらの組み合わせが含まれるが、これらに限定されない。

【0162】

本開示の特定の実施形態によると、プレバイオティックは、多糖およびオリゴ糖を含むが、これらに限定されない食物纖維から選択される。これらの化合物は、プロバイオティックの数を増大させる能力を有し、プロバイオティックにより与えられる利益をもたらす。本発明の特定の実施形態に従って、プレバイオティックに分類されるオリゴ糖の限定されない例としては、フラクトオリゴ糖、イヌリン、イソマルトオリゴ糖、ラクチロール(*lactilol*)、ラクトスクロース、ラクトロース、ピロデキストリン(*pyrrodextrin*)、大豆オリゴ糖、トランスガラクトオリゴ糖、およびキシロオリゴ糖が挙げられる。

【0163】

10

20

30

40

50

本開示の他の特定の実施形態によると、プレバイオティックはアミノ酸である。いくつかの既知のプレバイオティックは分解してプロバイオティックのための炭水化物を提供するが、いくつかのプロバイオティックは栄養素のためにアミノ酸も必要とする。

【0164】

プレバイオティックは様々な食品中に天然に見出され、バナナ、ベリー、アスパラガス、ニンニク、小麦、オート麦、大麦（および他の全粒）、亜麻仁、トマト、キクイモ（Jerusalem artichoke）、タマネギおよびチコリ、葉野菜（例えば、タンポポの若葉、ホウレン草、コラードの若葉、フダンソウ、ケール、カラシナ、カブラ菜）、ならびに豆類（例えば、レンズ豆、インゲン豆、ひよこ豆、白インゲン豆、白豆、黒豆）が含まれるが、これらに限定されない。

10

【0165】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの体重管理剤である。本明細書で使用される場合、少なくとも1つの体重管理剤は、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一の体重管理剤または複数の体重管理剤であり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの体重管理剤は、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

【0166】

本明細書で使用される場合、「体重管理剤」は、食欲抑制剤および/または熱発生剤が含まれる。本明細書で使用される場合、「食欲抑制剤」、「食欲満足組成物」、「満腹剤」、および「満腹成分」という語句は同義である。「食欲抑制剤」という語句は、有効量で送達されたときに、人の食欲を抑制、阻害、低減するか、そうでなければ削減する主要栄養素、ハーブ抽出物、外因性ホルモン、食欲低下薬、食欲不振誘発薬、薬学的薬物、およびこれらの組み合わせを説明する。「熱発生剤」という語句は、有効量で送達されたときに、人の熱発生または代謝を活性化するか、そうでなければ増強する主要栄養素、ハーブ抽出物、外因性ホルモン、食欲低下薬、食欲不振誘発薬、薬学的薬物、およびこれらの組み合わせを説明する。

20

【0167】

好適な体重管理剤には、タンパク質、炭水化物、食事性脂肪、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される主要栄養素が含まれる。タンパク質、炭水化物、および食事性脂肪の消費は、食欲抑制効果のあるペプチドの放出を刺激する。例えば、タンパク質および食事性脂肪の消費は、消化管ホルモンのコレサイトカイニン（cholecytokinin）（CCK）の放出を刺激するが、炭水化物および食事性脂肪の消費は、グルカゴン様ペプチド1（GLP-1）の放出を刺激する。

30

【0168】

好適な主要栄養素体重管理剤はまた、炭水化物も含む。炭水化物は、概して、エネルギーのために身体によりグルコースに変換される糖、デンプン、セルロース、およびガムを含む。炭水化物は、消化可能な炭水化物（例えば、単糖、二糖、およびデンプン）と、非消化性の炭水化物（例えば食物纖維）との2つの種類に分類されることが多い。非消化性炭水化物、ならびに小腸内での吸収および消化性が低減された複合高分子炭水化物は、食物摂取を阻害する生理学的応答を刺激するという研究が示されている。したがって、本明細書において具体化される炭水化物は、望ましくは、非消化性の炭水化物または消化性が低減された炭水化物を含む。このような炭水化物の限定されない例としては、ポリデキストロース；イヌリン；エリスリトール、マンニトール、キシリトール、およびソルビトール等の単糖由来のポリオール；イソマルト、ラクチトール、およびマルチトール等の二糖由来のアルコール；ならびに水素化デンプン加水分解物が挙げられる。炭水化物については本明細書中で以下により詳細に説明される。

40

【0169】

別の特定の実施形態では、体重管理剤は食事性脂肪である。食事性脂肪は、飽和脂肪酸および不飽和脂肪酸の組み合わせを含む脂質である。多価不飽和脂肪酸はモノ不飽和脂肪酸よりも大きい満腹力を有することが示されている。したがって、本明細書において具体

50

化される食事性脂肪は、多価不飽和脂肪酸を含むことが望ましく、その限定されない例としては、トリアシルグリセロールが挙げられる。

【0170】

特定の実施形態では、体重管理剤はハーブ抽出物である。多数のタイプの植物からの抽出物は、食欲抑制特性を有することが確認されている。その抽出物が食欲抑制特性を有する植物の限定されない例としては、フーディア (*Hoodia*) 属、トリコカウロン (*Trichocaulon*) 属、カラルマ (*Caralluma*) 属、スタペリア (*Stapelia*) 属、オルベア (*Orbea*) 属、アスクレピアス (*Asclepias*) 属、およびカメリア (*Camelia*) 属の植物が挙げられる。他の実施形態には、ギムネマ・シルベストル (*Gymnema Sylvestre*)、コーラ・ナット (*Kola Nut*)、シトラス・アウランチウム (*Citrus Aurantium*)、イエルバ・マテ (*Yerba Mate*)、グリフォニア・シンプリシフォリア (*Griffonia Simplicifolia*)、ガラナ、ミルラ、ググル脂質 (*guggul Lipid*)、およびクロフサスグリ種子油から得られる抽出物が含まれる。

10

【0171】

ハーブ抽出物は、任意のタイプの植物材料または植物バイオマスから調製され得る。植物材料およびバイオマスの限定されない例としては、茎、根、葉、植物材料から得られる乾燥粉末、および樹液または乾燥樹液が挙げられる。ハーブ抽出物は、概して、植物から樹液を抽出し、次いで、樹液をスプレー乾燥することによって調製される。あるいは、溶媒抽出手順が使用されてもよい。初期抽出に続いて、活性が増強されたハーブ抽出物を得るために、初期抽出物をさらに分画する（例えば、カラムクロマトグラフィーによる）ことが望ましいかもしれない。このような技術は、当業者には公知である。

20

【0172】

特定の実施形態では、ハーブ抽出物はフーディア属の植物に由来し、その種には、*H. alstonii*、*H. currorii*、*H. dregei*、*H. flava*、*H. gordoni*、*H. jутatae*、*H. mosamedensis*、*H. officinalis*、*H. parviflora*、*H. pedicellata*、*H. pilifera*、*H. ruschii*、および*H. triebneri* が含まれる。フーディア植物は、南アフリカ原産の茎多肉植物である。P57として知られているフーディアのステロールグリコシドは、フーディア種の食欲抑制効果の原因であると考えられている。

30

【0173】

別の特定の実施形態では、ハーブ抽出物はカラルマ属の植物に由来し、その種には、*C. indica*、*C. fimbriata*、*C. attenuata*、*C. tuberculata*、*C. edulis*、*C. adscendens*、*C. stalagmifera*、*C. umbellata*、*C. penicillata*、*C. russelliana*、*C. retrospiccens*、*C. arabica*、および*C. lasiantha* が含まれる。カラルマ植物は、フーディアと同じサブファミリーのガガイモ科に属する。カラルマは、概して、グリコシドのブレグナン群に属するグリコシドに起因する食欲抑制等の医薬特性を有するインド原産の小型で直立した多肉質の植物であり、その限定されない例としては、カラツベルシドA、カラツベルシドB、ボウセロシドI、ボウセロシドII、ボウセロシドIII、ボウセロシドIV、ボウセロシドV、ボウセロシドVI、ボウセロシドVII、ボウセロシドVIII、ボウセロシドIX、およびボウセロシドXが挙げられる。

40

50

【0174】

別の特定の実施形態では、少なくとも1つのハーブ抽出物は、トリコカウロン属の植物に由来する。トリコカウロン植物は、フーディアと同様に、概して、南アフリカ原産の多肉植物であり、*T. piliferum* (*T. piliferum*) 種およびオフィシナレ (*T. officinalis*) 種が含まれる。

【0175】

別の特定の実施形態では、ハーブ抽出物は、スタペリア属またはオルベア属の植物に由来し、その種にはそれぞれ、*S. gigantean* (*S. gigantean*) および *O. variiegata* (*O. variiegata*) が含まれる。スタペリアおよびオルベア植物は両方ともフーディアと同じサブファミリーのガガイモ科に属する。いかなる理論により拘束されることは望まないが、食欲抑制活性を示す化合物はプレグナングリコシド等のサポニンであると考えられ、これには、スタバロシド (*stavaroside*) A、B、C、D、E、F、G、H、I、J、およびKが含まれる。

10

【0176】

別の特定の実施形態では、ハーブ抽出物は、アスクレピアス属の植物に由来する。アスクレピアス植物もまた、ガガイモ科の植物に属する。アスクレピアス植物の限定されない例としては、*A. incarnata* (*A. incarnata*)、*A. clausa* (*A. clausa*)、*A. syriaca* (*A. syriaca*)、および *A. tuberosa* (*A. tuberosa*) が挙げられる。いかなる理論により拘束されることは望まないが、抽出物は、プレグナングリコシドおよびプレグナンアグリコン等の食欲抑制効果を有するステロイド系化合物を含むと考えられている。

20

【0177】

特定の実施形態では、体重管理剤は、体重管理効果を有する外因性ホルモンである。このようなホルモンの限定されない例としては、CCK、ペプチドYY、グレリン、ポンベシン、およびガストリン放出ペプチド (GRP)、エンテロスタチン、アポリポタンパク質 A - IV、GLP - 1、アミリン、ソマスタチン (*somatostatin*)、ならびにレブチンが挙げられる。

【0178】

別の実施形態では、体重管理剤は薬学的薬物である。限定されない例としては、フェンテニム (*phentermine*)、ジエチルプロピオン、フェンジメトラジン、シブトラミン、リモナバン、オキシントモジュリン、フロキセチン (*floxetine*) 塩酸塩、エフェドリン、フェネチルアミン、または他の刺激薬が挙げられる。

30

【0179】

少なくとも1つの体重管理剤は、本開示で提供される甘味料組成物 (例えば飲料) のための機能性成分として個々に利用されてもよいし、あるいは組み合わせて利用されてもよい。

【0180】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの骨粗鬆症管理剤である。本明細書で使用される場合、少なくとも1つの骨粗鬆症管理剤は、本明細書に提供される可食組成物 (例えば飲料) のための機能性成分として単一の骨粗鬆症管理剤または複数の骨粗鬆症管理剤であり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの骨粗鬆症管理剤は、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物 (例えば飲料) 中に存在する。

40

【0181】

骨粗鬆症は、骨強度が低下した骨障害であり、骨折の危険性の増大をもたらす。概して、骨粗鬆症は、骨ミネラル密度 (BMD) の低下、骨微細構造の破壊、ならびに骨中の非コラーゲン性タンパク質の量および種類の変化を特徴とする。

【0182】

ある特定の実施形態では、骨粗鬆症管理剤は、少なくとも1つのカルシウム源である。特定の実施形態によると、カルシウム源は、塩錯体、可溶化種、および他の形態のカルシ

50

ウムを含むカルシウムを含有する任意の化合物である。カルシウム源の限定されない例としては、アミノ酸キレートカルシウム、炭酸カルシウム、酸化カルシウム、水酸化カルシウム、硫酸カルシウム、塩化カルシウム、リン酸カルシウム、リン酸水素カルシウム、リン酸二水素カルシウム、クエン酸カルシウム、リンゴ酸カルシウム、クエン酸リンゴ酸カルシウム、グルコン酸カルシウム、酒石酸カルシウム、乳酸カルシウム、これらの可溶化種、およびこれらの組み合わせが挙げられる。

【0183】

特定の実施形態によると、骨粗鬆症管理剤はマグネシウム源である。マグネシウム源は、塩錯体、可溶化種、および他の形態のマグネシウムを含むマグネシウムを含有する任意の化合物である。マグネシウム源の限定されない例としては、塩化マグネシウム、クエン酸マグネシウム、グルセプト酸マグネシウム、グルコン酸マグネシウム、乳酸マグネシウム、水酸化マグネシウム、マグネシウムピコラート (magnesium picolinate)、硫酸マグネシウム、これらの可溶化種、およびこれらの混合物が挙げられる。別の特定の実施形態では、マグネシウム源は、アミノ酸キレートまたはクレアチンキレートマグネシウムが挙げられる。

10

【0184】

他の実施形態では、骨粗鬆症剤は、ビタミンD、C、K、これらの前駆体および／またはベータ-カロテン、ならびにこれらの組み合わせから選択される。

【0185】

多数の植物および植物抽出物もまた、骨粗鬆症の予防および治療において有効であることが確認されている。いかなる理論により拘束されることは望まないが、植物および植物抽出物は骨形態形成タンパク質を刺激し、かつ／または骨吸収を阻害し、それによって、骨の再生および強度を刺激すると考えられている。骨粗鬆症管理剤として適切な植物および植物抽出物の限定されない例としては、米国特許公開第2005/0106215号に開示される、タンポポ (*Taraxacum*) 属およびザイフリボク (*Amelanchier*) 属の種、ならびに米国特許公開第2005/0079232号に開示される、クロモジ (*Lindera*) 属、ヨモギ (*Artemisia*) 属、ショウブ (*Acorus*) 属、ベニバナ (*Cardthamus*) 属、カルム (*Carum*) 属、ハマゼリ (*Cnidium*) 属、クルクマ (*Curcuma*) 属、カヤツリグサ (*Cyperus*) 属、ビャクシン (*Juniperus*) 属、サクラ (*Prunus*) 属、アヤメ (*Iris*) 属、キクニガナ (*Cichorium*) 属、ドドナエア (*Dodonaea*) 属、イカリソウ (*Epimedium*) 属、エリゴヌム (*Erigonum*) 属、ダイズ (*Soya*) 属、メンタ (*Mentha*) 属、オシマム (*Ocimum*) 属、ティムス (*thymus*) 属、タナセタム (*Tanacetum*) 属、オオバコ (*Plantago*) 属、スペアミント (*Spearmint*) 属、ベニノキ (*Bixa*) 属、ビティス (*Vitis*) 属、ロスマリヌス (*Rosemarinus*)、ヌルデ (*Rhus*) 属、およびイノンド (*Anethum*) 属の種が挙げられる。

20

30

【0186】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの植物エストロゲンである。本明細書で使用される場合、少なくとも1つの植物エストロゲンは、本明細書に提供される可食組成物（例えば飲料）のための機能性成分として単一の植物エストロゲンまたは複数の植物エストロゲンであり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの植物エストロゲンは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物（例えば飲料）中に存在する。

40

【0187】

植物エストロゲンは植物中に見られる化合物であり、一般には、植物エストロゲンを有する植物または植物部分の摂取によって人体内に送達され得る。本明細書で使用される場合、「植物エストロゲン」は、体内に導入された場合に任意の程度のエストロゲン様の効果を引き起こす任意の物質を指す。例えば、植物エストロゲンは、体内のエストロゲン受容体に結合して、小さいエストロゲン様の効果を有することができる。

50

【0188】

本開示の実施形態のために好適な植物エストロゲンの例としては、イソフラボン、スチルベン、リグナン、レスルシル酸ラクトン (resorcylic acid lactone)、クメスタン、クメストロール (coumestrol)、エコール、およびこれらの組み合わせが挙げられるが、これらに限定されない。好適な植物エストロゲンの源には、全粒、穀類、纖維、果実、野菜、ブラックコホシュ、リュウゼツランの根、クロフサスグリ、ブラックホウ (black haw)、チェストベリーベリー、クランプバーク、ドンクアイの根、デビルスクラブ (devil's club) の根、フォルスユニコーンの根、朝鮮人参の根、グランドセルハーブ、甘草、ライフルート (liferoott) ハーブ、マザーワートハーブ、シャクヤクの根、ラズベリー葉、バラ科植物、セージ葉、サルサパリラの根、ソーパルメットベリー (saw palmetto berryied)、自然薯の根、ノコギリソウの花、豆類、大豆、大豆製品 (例えば、みそ、大豆粉、豆乳、大豆ナツツ、大豆タンパク質単離物、テンペ (tempeh)、または豆腐)、ひよこ豆、ナツツ、レンズ豆、種子、クローバー、ムラサキツメクサ、タンボボ葉、タンボボ根、コロハ種子、緑茶、ホップ、赤ワイン、亜麻仁、ニンニク、タマネギ、アマニ、ルリヂサ、ヤナギトウワタ、キャラウェー、チェストツリー、バイテックス、ナツメヤシ、ディル、フェネル種子、ゴツ・コラ (gotukola)、オオアザミ、ペニーロイアル、ザクロ、サザンウッド、大豆粉、ヨモギギク、およびクズの根 (ブエラリア根) 等、ならびにこれらの組み合わせが含まれるが、これらに限定されない。

10

【0189】

イソフラボンは、ポリフェノールと呼ばれる植物性栄養素の群に属する。一般に、ポリフェノール (「ポリフェノール類」としても知られている) は、1分子当たり1つを超えるフェノール基の存在を特徴とする、植物中に見られる化学物質の群である。

20

【0190】

本開示の実施形態に従って、好適な植物エストロゲンのイソフラボンには、ゲニステイン、ダイゼイン、グリシテイン、ビオカニンA、フォルモノネチン、これらのそれぞれの天然に存在するグリコシドおよびグリコシド抱合体、マタイレシノール、セコイソラリシレシノール、エンテロラクトン、エンテロジオール、テクスチャード植物性タンパク質、ならびにこれらの組み合わせが含まれる。

30

【0191】

本開示の実施形態のためのイソフラボンの好適な源には、大豆、大豆製品、豆類、アルファルファもやし、ひよこ豆、ピーナツ、およびムラサキツメクサが含まれるが、これらに限定されない。

30

【0192】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの長鎖第1級脂肪族飽和アルコールである。本明細書で使用される場合、少なくとも1つの長鎖第1級脂肪族飽和アルコールは、本明細書に提供される可食組成物 (例えば飲料) のための機能性成分として単一の長鎖第1級脂肪族飽和アルコールまたは複数の長鎖第1級脂肪族飽和アルコールであり得る。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの長鎖第1級脂肪族飽和アルコールは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物 (例えば飲料) 中に存在する。

40

【0193】

長鎖第1級脂肪族飽和アルコールは、有機化合物の多様な群である。アルコールという用語は、これらの化合物が炭素原子に結合したヒドロキシル基 (-OH) を特徴とするという事実を指す。第1級という用語は、これらの化合物において、ヒドロキシル基に結合した炭素原子が、ただ1つの他の炭素原子に結合されているという事実を指す。飽和という用語は、これらの化合物が炭素-炭素パイ結合を持たないことを特徴とするという事実を指す。脂肪族という用語は、これらの化合物中の炭素原子が環ではなく直鎖または分枝鎖に結合されているという事実を指す。長鎖という用語は、これらの化合物中の炭素原子の数が少なくとも8個の炭素であるという事実を指す)。

50

【0194】

本開示の特定の実施形態で用いるための特定の長鎖第1級脂肪族飽和アルコールの限定されない例としては、8個の炭素原子の1-オクタノール、9個の炭素の1-ノナノール、10個の炭素原子の1-デカノール、12個の炭素原子の1-ドデカノール、14個の炭素原子の1-テトラデカノール、16個の炭素原子の1-ヘキサデカノール、18個の炭素原子の1-オクタデカノール、20個の炭素原子の1-エイコサノール、22個の炭素の1-ドコサノール、24個の炭素の1-テトラコサノール、26個の炭素の1-ヘキサコサノール、27個の炭素の1-ヘプタコサノール、28個の炭素の1-オクタノソール、29個の炭素の1-ノナコサノール、30個の炭素の1-トリアコンタノール、32個の炭素の1-ドトリアコンタノール、および34個の炭素の1-テトラコンタノールが挙げられる。

10

【0195】

本開示の特定の望ましい実施形態では、長鎖第1級脂肪族飽和アルコールはポリコサノールである。ポリコサノールは、主に、28個の炭素の1-オクタノソールおよび30個の炭素の1-トリアコンタノールと、より低濃度の他のアルコール、例えば、22個の炭素の1-ドコサノール、24個の炭素の1-テトラコサノール、26個の炭素の1-ヘキサコサノール、27個の炭素の1-ヘプタコサノール、29個の炭素の1-ノナコサノール、32個の炭素の1-ドトリアコンタノール、および34個の炭素の1-テトラコンタノールとで構成される長鎖第1級脂肪族飽和アルコールの混合物に対する用語である。

20

【0196】

長鎖第1級脂肪族飽和アルコールは、天然脂肪および油に由来する。これらは、当業者に公知である抽出技術を用いることによって、これらの源から得ることができる。ポリコサノールは、サトウキビ(サッカルム・オフィシナリウム(*Saccharum officinarium*))、ヤムイモ(例えば、ディオスコレア・オブボシテ(*Dioscorea opposita*))、米(例えば、オリザ・サティバ(*Oryza sativa*))のぬか、および蜜ろうを含む様々な植物および材料から単離することができる。ポリコサノールは、当業者に公知である抽出技術を用いることによって、これらの源から得ることができる。このような抽出技術の説明は、米国特許出願第2005/0220868号に見出され得、この開示は、参照により明示的に組み込まれる。

30

【0197】

ある特定の実施形態では、機能性成分は、少なくとも1つの植物ステロール、フィトステノール、またはこれらの組み合わせである。概して、本開示の特定の実施形態によると、少なくとも1つの植物ステロール、フィトステノール、またはこれらの組み合わせは、健康状態および健康を促進するのに十分な濃度で可食組成物(例えば飲料)中に存在する。

30

【0198】

本明細書で使用される場合、「スタノール」、「植物スタノール」、および「フィトステノール(phytosterol)」という語句は同義である。

【0199】

植物ステロールおよびスタノールは、多くの果実、野菜、ナッツ、種子、穀類、豆類、植物油、木の皮、および他の植物源において、少量で天然に存在する。人々は、通常、植物ステロールおよびスタノールを毎日消費するが、消費される量は、著しいコレステロールを低下させる効果または他の健康上の利益をもたらすには不十分である。したがって、食品および飲料に植物ステロールおよびスタノールを補うことが望ましいであろう。

40

【0200】

ステロールは、C-3にヒドロキシル基を有するステロイドのサブグループである。概して、植物ステロールは、コレステロールのようにステロイド核内に二重結合を有するが、植物ステロールは、C-24にエチル基もしくはメチル基等の置換側鎖(R)、または付加的な二重結合を含んでもよい。植物ステロールの構造は当業者に公知である。

【0201】

50

少なくとも 44 の天然に存在する植物ステロールが発見されており、概して、コーン、大豆、小麦、および木油等の植物に由来するが、これらはまた、天然のものと同一であるか、または天然に存在する植物ステロールと同様の特性を有する組成物を形成するよう、合成的に生成されてもよい。本開示の特定の実施形態によると、当業者に公知の植物ステロールの限定されない例としては、4-デスマチルステロール（例えば、-シトステロール、カンペステロール、スチグマステロール、プラシカステロール、22-デヒドロプラシカステロール、および 5-アベナステロール）、4-モノメチルステロール、および 4,4-ジメチルステロール（トリテルペンアルコール）（例えば、シクロアルテノール、24-メチレンシクロアルタノール、およびシクロプラノール）が挙げられる。

【0202】

10

本明細書で使用される場合、「スタノール」、「植物スタノール」、および「フィトスタノール（phytosterol）」という語句は同義である。フィトスタノールは、天然にほんの微量しか存在しない飽和ステロールアルコールであり、植物ステロールの水素化等によって合成的に生成されてもよい。本開示の特定の実施形態によると、フィトスタノールの限定されない例としては、-シトステロール、カンペスタノール、シクロアルタノール、および他のトリテルペンアルコールの飽和形態が挙げられる。

【0203】

植物ステロールおよびフィトスタノールは両方とも、本明細書で使用される場合、および異性体等の種々の異性体を含む（例えば、哺乳動物の血清コレステロールを低下させるために最も有効な植物ステロールおよびフィトスタノールの 1 つをそれぞれ含む、-シトステロールおよび -シトスタノール）。

20

【0204】

本開示の植物ステロールおよびフィトスタノールはまた、そのエステル形態であってもよい。植物ステロールおよびフィトスタノールのエステルを誘導するための好適な方法は当業者に公知であり、米国特許第 6,589,588 号、同第 6,635,774 号、同第 6,800,317 号、および米国特許公開第 2003/0045473 号に開示されており、これらの開示は、それらの全体が参照により本明細書中に組み込まれる。好適な植物ステロールおよびフィトスタノールのエステルの限定されない例としては、酢酸シトステロール、オレイン酸シトステロール、オレイン酸スチグマステロール、およびこれらの対応するフィトスタノールエステルが挙げられる。本開示の植物ステロールおよびフィトスタノールはまた、それらの誘導体も含み得る。

30

【0205】

概して、甘味料組成物（例えば飲料）中の機能性成分の量は、特定の甘味料組成物（例えば飲料）および所望の機能性成分に応じて大きく異なる。当業者は、各飲料のための機能性成分の適切な量を容易に確認するであろう。

【0206】

40

いくつかの実施形態では、可食組成物は、本明細書で論じられるように、可溶化剤をさらに含む。甘味調節剤等の化合物は、水溶液中の特定の溶解度を有する。当業者に明白であり得るように、化合物の溶解度は、化合物の化学構造、溶媒、溶媒の pH 等が挙げられるが、これらに限定されない、多くの要因に応じて異なる。可溶化剤は、特定の量の溶媒中に溶解され得る、甘味調節剤等の化合物または甘味調節剤の組み合わせの量を増加させるために使用され得る。

【0207】

50

本発明の化合物を可溶化するための方法としては、化学的、物理的、または機械的手段が挙げられるが、これらに限定されない。添加剤、可溶化剤、または安定剤は、溶液中の本発明の化合物の濃度を増加させるための化学的手段を提供し得る。本発明の化合物のせん断、分散、または乳化をもたらす機械力の適用はまた、溶液中の本発明の化合物の濃度の増加をもたらし得る。温度、圧力、および / または pH の変化は、本発明の化合物の溶解度を増加させる、および / または溶液中の化合物を維持するための限定されない物理的手段である。機械的、物理的、または化学的手段は、共溶媒、界面活性剤系、錯化剤の存

在または不在下で、組み合わせて使用され得、これには、自己集合ナノミセル、ナノ懸濁液、微粉化、および共結晶作用も含まれる。溶液中の化合物の溶解度を増加する方法およびその重要性は、例えば、“Drug solubility: importance and enhancement techniques”, ISRN Pharmaceutics, volume 2012, article ID 195727, Ketan T. Savjani, Anuradha K. Gajjar and Jignasa K. Savjani等の当該技術分野において公知である。

【0208】

可溶化剤としては、糖タンパク質 - 多糖、例えばアラビアゴム；ホモポリマー、例えばポリ (N - ビニル - ピロリドン)；中鎖モノ - およびジグリセリド、例えばCapmul 10

MCM；オリゴ糖、例えば、Hp - ベータ - シクロデキストリン、アルファ - シクロデキストリン、ベータ - シクロデキストリン、またはガンマ - シクロデキストリン、およびセルロース；ポリグリセロールエステル、例えば、Caprol PEG 860 (登録商標)、Caprol 10G40 (登録商標)、またはDrewpol 10-1-CC (登録商標)；ポリソルベート、例えば、Tween 20 (登録商標) (ポリソルベート 20)、Tween 60 (登録商標) (ポリソルベート 60)、およびTween 80 (登録商標) (ポリソルベート 80)；ならびにサポニン / トリテルペングリコシド、例えば、quillaja サポニンまたはQ - NATURALE (登録商標) が挙げられるが、これらに限定されない。例えば、可溶化剤としては、GRINDSTED (登録商標) ACETEM、アルファ - シクロデキストリン、ベータ - シクロデキストリン、20

DATTEM、デカグリセロールジオレエート、デカグリセロールモノオレエート、デカグリセロールモノステアレート、エトキシル化モノグリセリド、ガンマ - シクロデキストリン、グリセロールモノレエート、グリセロールモノステアレート、グリセロールジオレエート、アラビアゴム、ヘキサグリセロールジオレエート、Hp - ベータ - シクロデキストリン、レシチン、メチルセルロース、オレイン酸、ポリ (N - ビニル - ピロリドン)、ポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノオレエート、ポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノパルミテート、ポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノステアレート、ポリオキシエチレン (20) ソルビタントリオレエート、ポリオキシエチレン (20) ソルビタントリステアレート、多糖、ポリソルベート 20、ポリソルベート 60、ポリソルベート 80、オレイン酸カリウム、プロピレングリコールモノステアレート、プロピレングリコールモノラウレート、Quillaja サポニン、ラウリル硫酸ナトリウム、オレイン酸ナトリウム、ステアロイル乳酸ナトリウム、ソルビタンモノラウレート、ソルビタントリオレエート、ソルビタントリステアレート、ソルビタンモノオレエート、ソルビタンモノステアレート、スクロースモノエステル、またはスクロースモノラウレートが挙げられるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、アルファ - シクロデキストリン、ベータ - シクロデキストリン、ガンマ - シクロデキストリン、アラビアゴム、Hp - ベータ - シクロデキストリン、レシチン、メチルセルロース、ポリ (N - ビニル - ピロリドン)、またはQuillaja サポニン (Q - NATURALE (登録商標)) である。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、アルファ - シクロデキストリンである。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、ベータ - シクロデキストリンである。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、ガム - シクロデキストリンである。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、アラビアゴムである。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、Hp - ベータ - シクロデキストリンである。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、レシチンである。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、メチルセルロースである。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、ポリ (N - ビニル - ピロリドン) である。いくつかの実施形態では、可溶化剤は、Quillaja サポニンである。可溶化剤は、本発明の化合物を可溶化するために、0.001% ~ 50% の濃度で使用され得る。いくつかの実施形態では、最終生成物中の可溶化剤の濃度は、約 0.05% ~ 約 2% の範囲に及ぶ。

【0209】

本発明の甘味調節剤の組み合わせの甘味調節剤を溶解するための溶媒としては、1, 3

10

20

30

40

50

- ブチレングリコール、酢酸アミル、ベンジルアルコール、ブタン-1,3-ジオール、ヒマシ油、酒石酸ジエチル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、酢酸エチル、エチルアルコール、グリセリン、グリセロール、グリセロールジアセタート、イソプロピルアルコール、NEOBEE (登録商標) M-5油、プロピレングリコール、およびトリアセチンが挙げられるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態では、溶媒は、1,3-ブチレングリコールである。いくつかの実施形態では、溶媒は、酢酸アミルである。いくつかの実施形態では、溶媒は、ベンジルアルコールである。いくつかの実施形態では、溶媒は、ブタン-1,3-ジオールである。いくつかの実施形態では、溶媒は、ヒマシ油である。いくつかの実施形態では、溶媒は、酒石酸ジエチルである。いくつかの実施形態では、溶媒は、ジエチレングリコールモノエチルエーテルである。いくつかの実施形態では、溶媒は、酢酸エチルである。いくつかの実施形態では、溶媒は、エチルアルコールである。いくつかの実施形態では、溶媒は、グリセリンである。いくつかの実施形態では、溶媒は、グリセロールである。いくつかの実施形態では、溶媒は、イソプロピルアルコールである。いくつかの実施形態では、溶媒は、プロピレングリコールである。いくつかの実施形態では、溶媒は、トリアセチンである。溶媒は、本発明の化合物を可溶化するために、0.001%～50%の濃度で使用され得る。いくつかの実施形態では、最終生成物中の溶媒濃度は、約0.05～約2%の範囲に及ぶ。

10

20

30

40

50

【0210】

いくつかの実施形態では、可食組成物は、甘味調節剤として、本開示の化合物または化合物の組み合わせの有効性を増加または軽減するための界面活性剤をさらに含む。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、スルホサクシネートおよびレシチン）、ならびに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、これらに限定されない。

【0211】

本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの放出速度は、制御され得る。本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの放出速度は、例えば、水中のその溶解度を変化させることによって変化させることができる。急速な放出は、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを高い水溶性を有する材料を用いて封入することによって達成することができる。本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの遅延放出は、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを低い水溶性を有する材料を用いて封入することによって達成することができる。本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、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。本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの放出速度はまた、封入率によって制御することができる。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、完全に封入される。他の実施形態では、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせは、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、甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを用いて放出するように制御され得る。いくつかの実施形態では、放出速度は、甘味料および甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせの構造によって異なる方法で制御され得る。

【0212】

本開示の可食組成物は、当該技術分野において公知の技術に従って調製される。一般に、本開示の可食組成物は、甘味料等の可食組成物の構成成分または成分を、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせと共に混合することによって調製される。あるいは、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせを、甘味料を含む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、甘味料は、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせと同時にまたは連続して添加される。連続的である場合、甘味料は、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わ

せ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、薬学的組成物である。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、可食組成物は、例えば、ガム、薬用キャンディー、ソース、香辛料、肉マトリックス、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】

本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせ、および可食組成物中で使用される甘味料の両方の量は、組成物の目的および甘味の所望のまたは許容される知覚を含む、様々な要因に応じて異なる。この量は、添加される可食組成物の性質、特定の化合物または甘味調節化合物の組み合わせ、甘味料、組成物中に存在する他の化合物、調製の方法（使用される加熱の量を含む）、および可食組成物のpHに応じて異なり得る。当業者であれば、所望の味覚（複数を含む）を得るために必要とされる量を決定する方法を周知であろう。

10

【0214】

可食組成物が口腔を介して摂取のために製剤化されるときに、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせは、上記の甘味料の甘みを調節するために有効な濃度のうちのいずれかで存在し得る。

【0215】

いくつかの実施形態では、可食組成物は、消費前の希釈用である、濃縮物として製剤化される。かかる濃縮物には、シロップ、冷凍濃縮物、乾燥混合物、および食品添加剤が含まれる。濃縮物中に存在するときに、本明細書に記載される、式（I）の甘味調節化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせは、本明細書で論じられる有効な濃度のうちのいずれかを約2倍、約3倍、約4倍、約5倍、約6倍、約7倍、約8倍、約9倍、約10倍、約15倍、約20倍、約25倍、約30倍、約35倍、約40倍、約45倍、約50倍、約55倍、約60倍、約65倍、約70倍、約75倍、約80倍、約85倍、約90倍、約95倍、または約100倍超の濃度で存在する。したがって、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせは、約1ppm～約5000ppmの濃度で、後の希釈のために濃縮物中に存在し得る。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節剤（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、約1ppm～約3000ppm、約10ppm～約1000ppm、約50ppm～約500ppm、約50ppm～約250ppm、約50ppm～約100ppm、約100ppm～約500ppm、約500ppm～約1000ppm、約1000ppm～約3000ppm、約500ppm～約1000ppm、約500ppm～約3000ppm、または約1000ppm～約3000ppmの濃度で存在し得る。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節剤（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、約50ppm～約3000ppm、約50ppm～約1000ppm、または約50ppm～約500ppmの濃度で希釈用の濃縮物中に存在し得る。さらなる実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、約1ppm～約500ppm、約1ppm～約250ppm、約1ppm～約100ppm、約1ppm～約50ppm、約10ppm～約500ppm、約10ppm～約250ppm、約10ppm～約100ppm、約10ppm～約50ppm、約10ppm～約3000ppm、約10ppm～約1000ppm、約10ppm～約500ppm、約10ppm～約3000ppm、または約10ppm～約5000ppmの濃度で存在し得る。

20

30

40

50

50 ppm～約500 ppm、約50 ppm～約250 ppm、または約50 ppm～約100 ppmの濃度で希釈用の濃縮物中に存在し得る。

【0216】

本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせ（例えば、式（I）の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ）は、約50 ppm、約75 ppm、約100 ppm、約150 ppm、約200 ppm、約250 ppm、約300 ppm、約350 ppm、約400 ppm、約450 ppm、約500 ppm、約550 ppm、約600 ppm、約650 ppm、約700 ppm、約750 ppm、約800 ppm、約850 ppm、約900 ppm、約950 ppm、約1000 ppm、約1050 ppm、約1100 ppm、約1150 ppm、約1200 ppm、約1250 ppm、約1300 ppm、約1350 ppm、約1400 ppm、約1450 ppm、約1500 ppm、約1550 ppm、約1600 ppm、約1650 ppm、約1700 ppm、約1750 ppm、約1800 ppm、約1850 ppm、約1900 ppm、約1950 ppm、約2000 ppm、約2050 ppm、約2100 ppm、約2150 ppm、約2200 ppm、約2250 ppm、約2300 ppm、約2350 ppm、約2400 ppm、約2450 ppm、約2500 ppm、約2550 ppm、約2600 ppm、約2650 ppm、約2700 ppm、約2750 ppm、約2800 ppm、約2850 ppm、約2900 ppm、約2950 ppm、または約3000 ppmの濃度で希釈用の濃縮物中に存在し得る。

10

20

30

40

50

いくつかの実施形態では、可食組成物は、甘味改善組成物をさらに含む。

【0218】

好ましい助剤または担体としては、マルトデキストリン、デンプン、天然または人工の多糖類、および／または植物ガム、例えば、変性デンプンもしくはアラビアガム、着色剤、例えば、許可される食材用染料、着色用植物抽出物、安定剤、保存剤、酸化防止剤、粘度に影響を与える物質が含まれる。

【0219】

可食組成物は、パッケージに包含され得る。任意に、可食組成物は、まとめてパッケージされ、この場合、パッケージは、典型的に単一の料理または食物もしくは飲料の給仕のために使用され得る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であり得る。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。

【0220】

パッケージは、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせおよび甘味料を含む可食組成物を含有し得る。いくつかの実施形態では、パッケージは、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせおよびカロリー炭水化物甘味料を含む可食組成物を含有する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせ、およびグルコース、フルクトース、スクロース、またはこれらの混合物を含む可食組成物を含有する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせおよびカロリー炭水化物甘味料を含む可食組成物を含有する。いくつかの実施形態では、パッケージは、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせおよび天然の高効能甘味料を含む可食組成物を含有する。

【0221】

可食組成物は、医薬または衛生目的のために、例えば、口腔洗浄薬、薬剤、医薬品、咳止めシロップ、喉スプレー、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）、ならびに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。

【0222】

本開示のいくつかの実施形態では、甘味料組成物は、式(I)による少なくとも1つの甘味調節剤、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、またはその光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ、少なくとも1つの甘味料少なくとも1つの增量剤、ならびに任意に、改善された経時および/または風味プロファイルを有する、少なくとも1つの甘味改善組成物および/または固化防止剤を含む、卓上甘味料組成物の形態である。

【0223】

例えば、好適な「增量剤」としては、マルトデキストリン(10 DE、18 DE、または5 DE)、コーンシロップ固体物(20または36 DE)、スクロース、フルクトース、グルコース、転化糖、ソルビトール、キシロース、リボース、マンノース、キシリトール、マンニトール、ガラクチトール、エリスリトール、マルチトール、ラクチトール、イソマルト、マルトース、タガトース、ラクトース、イヌリン、グリセロール、プロピレン glycole、ポリオール、ポリデキストロース、フルクトオリゴ糖、セルロースとセルロース誘導体、およびこれらの混合物が挙げられるが、これらに限定されない。さらに、少なくとも1つの增量剤は、グラニュー糖(スクロース)、または他のカロリー甘味料、例えば、結晶性フルクトース、他の炭水化物、および糖アルコールから選択される。一実施形態では、增量剤は、甘味改善組成物として使用され得る。

10

【0224】

本明細書で使用される場合、「固化防止剤」という語句は、少なくとも1つの甘味料分子が他の甘味料分子に対して付着、結合、または接触するのを防止、減少、阻害、または抑制する任意の組成物を意味することを理解されたい。あるいは、「固化防止剤」は、成分の均一性および均一溶解を補助する任意の組成物を指し得る。いくつかの実施形態によると、固化防止剤の限定されない例としては、酒石英、ケイ酸カルシウム、二酸化ケイ素、微結晶性セルロース(Avicide, FMC Biopolymer, Philadelphia, Pa.)、およびリン酸三カルシウムが挙げられる。少なくとも1つの実施形態では、固化防止剤は、卓上甘味料組成物中に約0.001~約3重量%の量で存在する。

20

【0225】

卓上甘味料組成物は、多くの異なる形態において実装され、包装され得、当該技術分野において周知の任意の形態であり得る。例えば、限定されるものではないが、卓上甘味料組成物は、粉末、顆粒、小包、錠剤、小袋、ペレット、キューブ、固体、または液体の形態であり得る。

30

【0226】

可食組成物を調製する方法

別の態様では、本開示は、可食組成物を調製する方法を提供する。本方法は、(a)甘味料を提供することと、(b)(a)の甘味料に、本明細書に記載される式(I)の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを添加することと、を含む。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節剤は、さらなるステップ(b)の前に可溶化されている。他の実施形態では、可溶化剤は、組成物に添加される。いくつかの実施形態では、ステップ(a)の甘味料は、食用として許容される担体中に提供される。当業者は、方法のステップ(a)および(b)は、任意の順序で行うことができる事が理解されよう、すなわち、本方法は、(a)本明細書に記載される式(I)の化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを添加することと、(b)甘味料を、(a)の化合物(複数を含む)に添加することと、を含み得る。

40

【0227】

一般に、本開示の可食組成物を調製する方法は、甘味料等の可食組成物の構成成分また

50

は成分を、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせと共に混合することを含む。あるいは、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせを、甘味料を含む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、甘味料は、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせと同時にまたは連続して可食組成物に添加される。連続的である場合、甘味料は、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの前後に添加され得る。可溶化剤を使用するときに、本方法は、どの時点であっても可溶化剤の添加を含む。例えば、組成物が3つの構成成分（甘味料、甘味調節剤、または甘味調節剤の組み合わせ）、および可溶化化合物を含む場合、可溶化化合物は、第1、第2、または第3の構成成分として添加され得る。可溶化剤はまた、任意の他の構成成分と同時に添加され得る。

10

【0228】

いくつかの実施形態では、可食組成物を調製する方法は、少なくとも1つのさらなる添加剤、例えば、甘味改善組成物および/または甘味改善添加剤を添加することをさらに含む。

【0229】

可食組成物は、食品、薬学的組成物、および消費者製品であり得る。いくつかの実施形態では、可食組成物は、例えば、ガム、薬用キャンディー、ソース、香辛料、肉マトリックス、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。

20

【0230】

甘味の知覚を増強または増進する方法

別の態様によれば、本開示は、対象における甘味の知覚を増強させる方法を提供する。本方法は、本開示の可食組成物の使用を含み、可食組成物は、本明細書に記載される式（I）による化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを含む。任意に、可食組成物は、（i）本明細書に記載される式（I）による化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ、（ii）甘味料、および任意に、（iii）可溶化剤を含む。

【0231】

「甘味の知覚」、「甘味の知覚」、「風味の知覚」という用語および類似の用語は、特定の味覚または風味の対象の自覚を指す。

30

【0232】

「対象」という用語は、哺乳動物を指す。好ましい実施形態では、対象は、ヒトである。いくつかの実施形態では、対象は、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、およびフェレットが挙げられるが、これらに限定されない、飼育または実験動物である。いくつかの実施形態では、対象は、家畜動物である。家畜動物の限定されない例としては、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、およびヤクが挙げられる。

40

【0233】

本方法は、食材、食品、薬学的組成物、または消費者製品を含む、任意の可食組成物中の甘味を増強または増進するために使用することができる。可食組成物は、任意の形態であり得る。いくつかの実施形態では、組成物は、例えば、ガム、薬用キャンディー、ソース、香辛料、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。

【0234】

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得る。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを含む可食組成物は、甘味料を含む、食材、食品、薬学的組成物、または消費者製品等の可食組成物の前に、

50

口腔内に置かれるか、または摂取されるが、他の実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを含む可食組成物は、甘い食材、食品、薬学的組成物、または消費者製品の後に、口腔内に置かれるか、または摂取される。他の実施形態では、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを含む可食組成物は、甘い食材、食品、薬学的組成物、または消費者製品と同時に、別々の可食組成物として、または甘い食材、食品、薬学的組成物、または消費者製品への組み入れにより、口腔内に置かれるか、または摂取される。例えば、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、食材または食品と組み合わせて、食材または食品の甘味を増強または増進することができる。あるいは、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせは、例えば、甘い食材、食品、薬学的組成物、または消費者製品への曝露後に使用するために、薬用キャンディーまたはガム中で使用することができる（例えば、甘い後味を増強または増進させるため）。

10

【0235】

可食組成物中の甘味料の量を低減する方法

その可食組成物のカロリー含有量の量を低減するための可食組成物中のカロリー甘味料の量を低減することが望ましくあり得る。また、合成甘味料または非天然の高効能甘味料と関連する望ましくない味覚または後味を軽減するために、可食組成物中の合成甘味料または非天然の高効能甘味料の量を軽減させることができることが望ましくあり得る。したがって、本開示の別の態様は、食品、薬学的組成物、または消費者製品等の可食組成物中の甘味料の量を低減する方法を提供する。可食組成物中のある量の甘味料は、式（I）による甘味調節剤、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせと置き換えられ得る。かかる方法では、ある量の可溶化剤はまた、本明細書に記載される、可食組成物に添加され得る。

20

【0236】

「置き換える」または「置き換えられている」という用語は、例えば、食品等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指す。これは、完全および部分置換または代替を含む。

30

【0237】

いくつかの実施形態では、本方法は、（a）可食組成物を調製する際に使用されるある量の甘味料を、ある量の、式（I）による甘味調節剤、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせと置き換えることを含む。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節化合物は、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせを含む可食組成物の形態で添加される。かかる方法では、ある量の可溶化剤はまた、本明細書に記載される、可食組成物に添加され得る。

40

【0238】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の甘味料の量を低減させる方法は、（a）甘味料の量が低減されている第1の可食組成物を摂取するステップと、（b）本開示の甘味調節剤化合物または甘味調節化合物の組み合わせを含む第2の可食化合物を摂取するステップと、を含む。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。かかる方法では、ある量の可溶化剤はまた、本開示の甘味調節剤または甘味調節剤の組み合わせと共に添加してもよい。

50

【0239】

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、薬学的組成物である。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。置き換えられる甘味料は、天然のカロリー甘味料、天然の高効能甘味料、合成甘味料、またはこれらの組み合わせであり得る。置き換えられる甘味料が天然のカロリー甘味料であるときに、この甘味料は、スクロース、フルクトース、グルコース、エリトリト

ル、高フルクトースコーン／デンプンシロップ、およびこれらの混合物であり得る。置き換えられる甘味料が合成甘味料であるときに、この甘味料は、スクラロース、アスパルテーム、カリウムアセサルフェーム、およびこれらの混合物であり得る。本方法はまた、ある量の天然のカロリー甘味料を、合成または天然の高効能甘味料、および本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせと置き換え、それによって、合成または天然の高効能甘味料と関連する任意の異味または後味を低減または排除することも含む。かかる実施形態では、「置き換えられた甘味料」は、天然のカロリー甘味料である。

【0240】

いくつかの実施形態では、対象の砂糖の摂取を低減する方法は、それを必要とする対象を特定するステップをさらに含む。当業者は、砂糖の摂取の低減を必要とする対象を特定することができるであろう。かかる対象の限定されない例としては、糖尿病、前糖尿病、インスリン耐性、肥満、過度の体重、および高血糖のような障害のうちのいずれか1つ以上に悩まされている対象が挙げられる。

10

【0241】

いくつかの実施形態では、ステップ(a)において可食組成物中の置き換えられる甘味料の量は、対象の健康を維持または回復させるのに十分な量である。例えば、可食組成物中の置き換えられる甘味料の量は、対象における糖尿病、前糖尿病、インスリン耐性、肥満、過度の体重、および高血糖を軽減させるのに十分な量であり得る。置き換えられる甘味料の量は、最大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99%であり得る。これらの量は、限定することを意図するものではなく、言及された割合の間の増分が本開示の一部として特に想定される。

20

【0242】

いくつかの実施形態では、ステップ(b)において添加される、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、対象における甘味の知覚を増強するのに有効である。

【0243】

いくつかの実施形態では、ステップ(b)において添加される、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、可食組成物中に存在する甘味料の量の最大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99%の置き換えを可能にするのに十分である。これらの量は、限定することを意図するものではなく、言及された割合の間の増分が本開示の一部として特に想定される。いくつかの実施形態では、ステップ(b)において添加される、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、可食組成物中に存在する甘味料の量の最大25%の置き換えを可能にするのに十分である。他の実施形態では、ステップ(b)において添加される、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、可食組成物中に存在する甘味料の量の最大50%の置き換えを可能にするのに十分である。他の実施形態では、ステップ(b)において添加される、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、可食組成物中に存在する甘味料の量の最大75%の置き換えを可能にするのに十分である。さらに他の実施形態では、ステップ(b)において添加される、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、可食組成物中に存在する甘味料の量の最大99%の置き換えを可能にするのに十分である。

30

【0244】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の甘味料の量を低減する方法は、甘味改善組成物および/または甘味改善添加剤等の少なくとも1つのさらなる添加剤を添加することをさらに含む。

40

【0245】

カロリー摂取量を低減する方法

50

本開示の別の態様は、対象のカロリー摂取量を低減する方法を提供する。いくつかの実施形態では、本方法は、可食組成物を対象に提供するステップを含み、可食組成物中の天然のカロリー甘味料のすべてまたはその一部は、(a) 本明細書に記載される式(I)による甘味調節化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせ、あるいは(b) 1つ以上の合成もしくは天然の高効能甘味料、および本明細書に記載される式(I)による甘味調節化合物、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、または化合物1、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせと置き換えられる。可食組成物は、食品、薬学的組成物、および消費者製品であり得る。かかる方法では、ある量の可溶化剤はまた、本明細書に記載される、可食組成物に添加され得る。

10

【0246】

対象のカロリー摂取量を低減する方法は、それを必要とする対象を特定するステップをさらに含み得る。当業者は、砂糖の摂取の低減を必要とする対象を特定することができるであろう。かかる対象の限定されない例としては、糖尿病、前糖尿病、インスリン耐性、肥満、過度の体重、および高血糖のような障害のうちのいずれか1つ以上に悩まされている対象が挙げられる。

【0247】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の置き換えられる天然のカロリー甘味料の量は、対象の健康を維持または回復させるのに十分な量である。例えば、可食組成物中の置き換えられる天然のカロリー甘味料の量は、対象における体重減少をもたらすのに十分な量であり得る。あるいは、可食組成物中の置き換えられる天然のカロリー甘味料の量は、対象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)の影響を緩和する、またはそれを治療するのに十分な量であり得る。いくつかの実施形態では、可食組成物中の置き換えられる天然のカロリー甘味料の量は、最大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99%である。これらの量は、限定することを意図するものではなく、言及された割合の間の増分が本開示の一部として特に想定される。いくつかの実施形態では、本方法は、250g/日未満、200g/日未満、175g/日未満、150g/日未満、125g/日未満、100g/日未満、75g/日未満、50g/日未満、25g/日未満、20g/日未満、15g/日未満、10g/日未満、または25g/日未満の、対象の1日の天然のカロリー甘味料の摂取量をもたらす。

20

【0248】

いくつかの実施形態では、可食組成物に添加される、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、対象の天然のカロリー甘味料の摂取量を最大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99%低減させるのに十分である。これらの量は、限定することを意図するものではなく、言及された割合の間の増分が本開示の一部として特に想定される。いくつかの実施形態では、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、対象の天然のカロリー甘味料の摂取量を最大25%低減させるのに十分である。他の実施形態では、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、対象の天然のカロリー甘味料の摂取量を最大50%低減させるのに十分である。他の実施形態では、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、対象の天然のカロリー甘味料の摂取量を最大75%低減させるのに十分である。さらに他の実施形態では、本開示の甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの量は、対象の天然のカロリー甘味料の摂取量を最大99%低減させるのに十分である。

40

【0249】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の甘味料の量を低減する方法は、甘味改善組成

50

物および / または甘味改善添加剤等の少なくとも 1 つのさらなる添加剤を添加することをさらに含む。

【 0 2 5 0 】

可食組成物の甘味を増強する方法

別の実施形態によると、本開示は、可食組成物中の甘味を増強または増進する方法を提供する。可食組成物は、食品、薬学的組成物、および消費者製品であり得る。

【 0 2 5 1 】

一実施形態では、本方法は、(a) 有効量の、本明細書に記載される式(I)による風味料等級の甘味調節化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを、甘味料を含む可食組成物に添加し、それによって、甘味料の甘味強度の知覚を増強させることを含む。いくつかの実施形態では、甘味料は、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの前に、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせと同時に、あるいは甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせの後に、可食組成物に添加される。他の実施形態では、甘味料は、甘味調節化合物または甘味調節化合物の組み合わせが添加されるときに、可食組成物中に天然にまたは固有に存在する。かかる方法では、ある量の可溶化剤はまた、本明細書に記載される、可食組成物に添加され得る。

【 0 2 5 2 】

あるいは、本方法は、(a) 有効量の、本明細書に記載される式(I)による甘味調節化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせを、可食組成物の前、それと共に、またはその後に添加し、それによって、甘味料の甘味強度の知覚を増強させることを含む。かかる方法では、ある量の可溶化剤はまた、本明細書に記載される、可食組成物に添加され得る。

〔 0 2 5 3 〕

可食組成物は、甘味料、例えば、天然のカロリー甘味料、天然の高効能甘味料、合成甘味料、またはこれらの組み合わせを含み得る。甘味料が天然のカロリー甘味料であるときに、この甘味料は、スクロース、フルクトース、グルコース、エリトリトール、高フルクトースコーン／デンプンシロップ、およびこれらの混合物であり得る。甘味料が合成甘味料であるときに、この甘味料は、スクラロース、アスパルテーム、カリウムアセサルフェーム、およびこれらの混合物であり得る。

〔 0 2 5 4 〕

いくつかの実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、最大 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 % 増強される。いくつかの実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、100 % を超えて、例えば、125 %、150 %、175 %、200 %、225 %、250 %、275 %、300 %、325 %、350 %、375 %、400 %、425 %、450 %、475 %、500 %、または列挙されるものの間での増加量を超えて増強される。これらの量は、限定することを意図するものではなく、言及された割合の間の増分が本開示の一部として特に想定される。いくつかの実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、最大 25 % 増強される。他の実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、最大 50 % 増強される。他の実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、最大 75 % 増強される。他の実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、最大 100 % 増強される。いくつかの実施形態では、甘味料の甘味強度の知覚は、約 5 % ~ 約 100 %、約 5 % ~ 約 90 %、約 5 % ~ 約 80 %、約 5 % ~ 約 70 %、約 5 % ~ 約 60 %、約 5 % ~ 約 50 %、約 5 % ~ 約 40 %、約 5 % ~ 約 30 %、約 10 % ~ 約 30 %、約 10 % ~ 約 25 %、約 20 % ~ 約 80 %、約 20 % ~ 約 70 %、約 20 % ~ 約 60 %、約 20 % ~ 約 50 %、約 20 % ~ 約 40 %、約 20 % ~ 約 30 %、約 25 % ~ 約 80 %、約 25 % ~ 約 70 %、約 25 % ~ 約 60 %、約 25 % ~ 約 50 %、約 25 % ~ 約 40 %、約 25 % ~ 約 30 %、約 30 % ~ 約 80 %、約 30 % ~ 約 70 %、約 30 % ~ 約 60 %、約 30 % ~ 約 50 %、約 30 % ~ 約 40 %、約 30 % ~ 約 30 %、約 35 % ~ 約 80 %、約 35 % ~ 約 70 %、約 35 % ~ 約 60 %、約 35 % ~ 約 50 %、約 35 % ~ 約 40 %、約 35 % ~ 約 30 %、約 40 % ~ 約 80 %、約 40 % ~ 約 70 %、約 40 % ~ 約 60 %、約 40 % ~ 約 50 %、約 40 % ~ 約 40 %、約 40 % ~ 約 30 %、約 45 % ~ 約 80 %、約 45 % ~ 約 70 %、約 45 % ~ 約 60 %、約 45 % ~ 約 50 %、約 45 % ~ 約 40 %、約 45 % ~ 約 30 %、約 50 % ~ 約 80 %、約 50 % ~ 約 70 %、約 50 % ~ 約 60 %、約 50 % ~ 約 50 %、約 50 % ~ 約 40 %、約 50 % ~ 約 30 %、約 55 % ~ 約 80 %、約 55 % ~ 約 70 %、約 55 % ~ 約 60 %、約 55 % ~ 約 50 %、約 55 % ~ 約 40 %、約 55 % ~ 約 30 %、約 60 % ~ 約 80 %、約 60 % ~ 約 70 %、約 60 % ~ 約 60 %、約 60 % ~ 約 50 %、約 60 % ~ 約 40 %、約 60 % ~ 約 30 %、約 65 % ~ 約 80 %、約 65 % ~ 約 70 %、約 65 % ~ 約 60 %、約 65 % ~ 約 50 %、約 65 % ~ 約 40 %、約 65 % ~ 約 30 %、約 70 % ~ 約 80 %、約 70 % ~ 約 70 %、約 70 % ~ 約 60 %、約 70 % ~ 約 50 %、約 70 % ~ 約 40 %、約 70 % ~ 約 30 %、約 75 % ~ 約 80 %、約 75 % ~ 約 70 %、約 75 % ~ 約 60 %、約 75 % ~ 約 50 %、約 75 % ~ 約 40 %、約 75 % ~ 約 30 %、約 80 % ~ 約 80 %、約 80 % ~ 約 70 %、約 80 % ~ 約 60 %、約 80 % ~ 約 50 %、約 80 % ~ 約 40 %、約 80 % ~ 約 30 %、約 85 % ~ 約 85 %、約 85 % ~ 約 75 %、約 85 % ~ 約 65 %、約 85 % ~ 約 55 %、約 85 % ~ 約 45 %、約 85 % ~ 約 35 %、約 90 % ~ 約 90 %、約 90 % ~ 約 80 %、約 90 % ~ 約 70 %、約 90 % ~ 約 60 %、約 90 % ~ 約 50 %、約 90 % ~ 約 40 %、約 90 % ~ 約 30 %、約 95 % ~ 約 95 %、約 95 % ~ 約 85 %、約 95 % ~ 約 75 %、約 95 % ~ 約 65 %、約 95 % ~ 約 55 %、約 95 % ~ 約 45 %、約 95 % ~ 約 35 %、約 100 % ~ 約 100 %、約 100 % ~ 約 90 %、約 100 % ~ 約 80 %、約 100 % ~ 約 70 %、約 100 % ~ 約 60 %、約 100 % ~ 約 50 %、約 100 % ~ 約 40 %、約 100 % ~ 約 30 %、約 100 % ~ 約 20 %、約 100 % ~ 約 10 %、約 100 % ~ 約 0 %

10

20

30

40

50

60%、約25%～約50%、約25%～約40%、または約25%～約30%増強される。これらの量は、限定することを意図するものではなく、言及された割合の間の増分が本開示の一部として特に想定される。

【0255】

いくつかの実施形態では、可食組成物中の甘味料に起因する甘味を増強する方法は、甘味改善組成物および／または甘味改善添加剤等の少なくとも1つのさらなる添加剤を添加することをさらに含む。

【0256】

甘味受容体の活性化を増強する方法

本開示の別の態様は、甘味受容体の活性化および／またはシグナル伝達を増強または増進する方法を提供する。いくつかの実施形態では、本方法は、甘味料の存在下で、甘味受容体を、本明細書に記載される式(I)による化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせと接触させることを含む。

10

【0257】

いくつかの実施形態では、本方法は、甘味料の存在下で、甘味受容体を、本明細書に記載される式(I)による化合物、または化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれか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。可食組成物は、食品、薬学的組成物、および消費者製品であり得る。かかる方法では、ある量の可溶化剤はまた、本明細書に記載される、可食組成物中に存在し得る。

20

【0258】

様々な実施形態では、甘味受容体は、例えば、アッセイにおいて存在するエクスピボまたはインビボ受容体である。甘味受容体はまた、対象において存在するインビボ受容体であってもよい。かかる実施形態では、甘味受容体は、典型的には、対象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、甘味受容体は、ヒトの口腔内に存在する。あるいは、甘味受容体は、非ヒト動物、例えば、動物モデルの口腔内に存在する。

【0259】

インビボ甘味反応アッセイは、甘さの増加した知覚の評価が帰属され得るアッセイを意味する。そのようなアッセイは、例えば、限定されないが、ヒト知覚記述分析パネル、ヒト知覚識別パネル、および／または熟練したフレーバリスト評価であり得る。甘味反応の非ヒト評価としては、甘味知覚のオペラント条件付け動物研究および／または瓶を舐める速度／量の選好試験が挙げられるが、これらに限定されない。

30

【0260】

インビトロ甘味反応アッセイは、増加した甘味反応または相互作用の評価が帰属され得るアッセイを指す。このようなアッセイの例としては、インビトロ受容体結合アッセイ、インビトロ受容体細胞系アッセイ、および／または電子舌味覚分析であり得るが、これらに限定されない。

40

【0261】

いくつかの実施形態では、甘味受容体の活性化の増強は、生理学的プロセスまたは状態に影響を及ぼすであろう。甘味受容体の活性化の増強により影響される生理学的プロセスまたは状態の限定されない例としては、甘味、胃腸管への影響、食欲、栄養、栄養分の吸収、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。

【0262】

不快な味覚の遮断するまたは隠すための方法および調製

甘さの調節に加えて、式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせは、不快な味覚、具体的には、苦味物質の苦味覚を隠すまたは低減するのに適し得る。式(I)の化合物、化合物1、またはその食用としてもしくは生物学

50

的に許容される塩、溶媒和物、もしくは光学異性体、あるいは前述の化合物のうちのいずれかの組み合わせは、相乗的に、ステビオールグリコシド（例えばステビア亜種において天然に存在する）のような甘味料の甘味覚を増強し、かつ、かかるステビオールグリコシドまたは他の苦味がある甘味料、例えば、アセサルフェーム-K、サッカリン、ステビオシド、またはレバウジオシドの苦味覚を隠すまたは低減させることができる。本開示の苦味を遮断する化合物または苦味を遮断する化合物の組み合わせを含む調製は、本開示の甘味を増強させる調製を含む調製と同じまたは類似の方法および濃度で行うことができる。

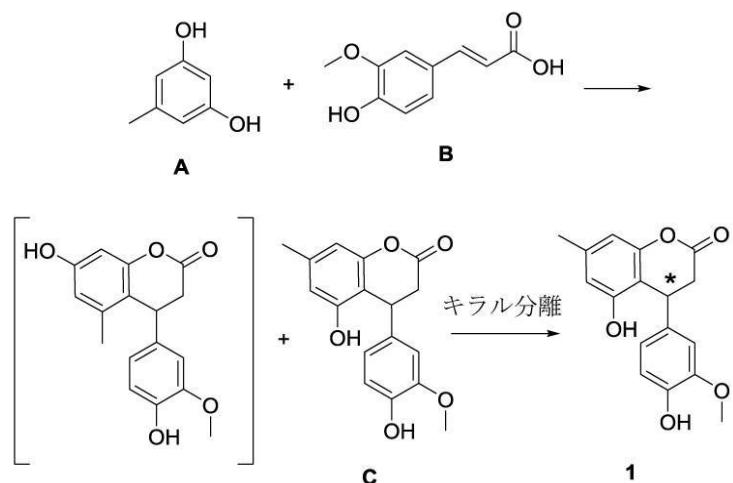
【0263】

本発明の化合物の調製

一実施形態では、化合物1は、以下に記載される複数のステップによって調製される。当業者は、式(I)の化合物のうちのいずれかの合成のために記載される条件を容易に適用することができ得る。

1:5-ヒドロキシ-4-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-7-メチルクロマン-2-オン：の調製

【化4】



オルシノールA(12.4g、100.0mmol)およびフェルラ酸B(19.4g、100.0mmol)を、250mLのフラスコ中の1,4-ジオキサン(100mL)中で室温で懸濁した。濃硫酸(98%、5mL)を、15分間にわたってゆっくりと添加した。懸濁液を110℃に一晩加熱した。濃い熱溶液を氷水に注ぎ入れ、酢酸エチル/ジエチルエーテル(2:1)を2回抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空下で蒸発させて、固体を得、これをヘキサン中の0~40%酢酸エチルを用いた330gのカラムで精製して、23.6gの2つの位置異性体の混合物(LC-MSによる1:1の比)を得た。固体混合物を、DMSO中に取り込み、水/MeCN(60/40、v/v、水に添加された0.1%ギ酸)の定組成勾配で、100mL/分の流量で、分取C18カラム(250mm×50mm、Xbridge, Waters, USA)を用いたHPLCによって分離した。所望の位置異性体を、6.5分~7.5分間収集した。純粋な画分を合わせ、真空下で蒸発させて、MeCNを除去した。水性懸濁液を、酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空下で蒸発させて、白色固体として化合物Cを得た。LC-MS(保持時間: 2.28分、301[M+1])。¹H NMR(DMSO-D₆): 9.87(s, 1H), 8.92(s, 1H), 6.80(d, J=1.9Hz, 1H), 6.64(d, J=8.0Hz, 1H), 6.51(s, 1H), 6.46(s, 1H), 6.32(dd, J=8.1, 2.0Hz, 1H), 4.44(d, J=6.1Hz, 1H), 3.72(s, 3H), 2.84-3.19(m, 2H), 2.26(s, 3H)。

【0264】

2.83gのラセミ試料の化合物Cを、SFCキラルクロマトグラフィーによって分離

10

20

30

40

50

して、98%超のエナンチオマー過剰率の化合物2 [] $^{20}_{D} = +20$ (c = 1.0 mg / mL、エタノール) を有する1.3gの光学異性体、化合物1(キラルカラム: CHIRALPAK AD-H 25 × 3 cm、イソプロパノール / CO₂ (20/80)、100バール、流量: 31.5 mL / 分)を得た。化合物1は、(+)-5-ヒドロキシ-4-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-7-メチルクロマン-2-オンであり、結晶学的に、(R)-5-ヒドロキシ-4-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル)-7-メチルクロマン-2-オンであると判定された。

【実施例】

【0265】

本開示を十分に理解することができるよう、以下の例を記述する。これらの例は、説明のためだけのものにすぎず、いかなる点においても、本開示の範囲を制限するものとして解釈されるべきではない。

10

【0266】

以下の例に使用される試験化合物は、上に開示される合成方法から得られ得る。

【0267】

実施例1において使用される味覚試験のパネリストは、感覚の鋭敏さ (sensory acuity) スクリーニングプログラムを用いて選択された。候補の味覚パネリストは、プレスクリーニングおよび個人面接により採用され、標準化された鋭敏さ試験の一部として基本的な味覚属性またはこれらの混合物を検出、認識、および分化する能力について評価された。これには、甘味、酸味、塩味、苦味、および旨味の基本的な味覚、ならびに感覚特性の特定の態様に焦点を合わせる能力を有する、例えば、知覚した様々な味覚を等級付けし、閾値レベルで提示される基本的な味覚を特定することが含まれた。

20

【0268】

対象における味覚認識の複雑性および以下の実験の固有の主観性により、個々の味覚テスト試験は、所与の化合物に対して異なる結果をもたらし得る。以下の例に提示されるデータは、観察された味覚試験の結果を示す。

【0269】

以下の味覚試験実験は、サイズの異なるパネル(すなわち、異なる数のパネリストを含むパネル)を用いて行われた。

30

【0270】

例1：二肢強制選択法

二肢強制選択法(2 AFC)による高フルクトースコーンシロップ(HFCS)の甘味の知覚に対する試験化合物の効果

ヒトにおける水溶液の甘味料の甘味の知覚に対する試験化合物の効果は、二肢強制選択「一口入れて吐き出す(sip and spit)」方法(2 AFC)を用いて評価された。

【0271】

味覚試験のための試料の調製：

水性甘味料溶液を、(重量で)スクロース当量(SE)の量の高フルクトースコーンシロップ(HFCS)を、水に添加することによって調製して、所望の濃度を達成した。水溶液は、pH 2.5 ~ pH 7の範囲に及んだ。化合物は、まず、100%エタノール中で500倍に濃縮されたストック溶液として調製した。次いで、これらの濃縮されたストックを水性甘味料溶液に添加して、0.2%の最終エタノール濃度を得た。対照(陽性および陰性)試料もまた、0.2%エタノールに正規化した。このエタノールレベルは、いかなる知覚した甘さの一因となると見られなかった。

40

【0272】

感覚方法論：2 AFC方法を用いた甘さ知覚の評価

化合物の評価のために使用された2 AFC試験は、味覚パネリスト(n = 15)が一度に一対の甘味料溶液を評価する二重盲検ランダム化試験であった。つまり、ある試料は、水性甘味料 + 化合物を含有する(すなわち、試験)が、もう一方は、化合物を含まずによ

50

り高い濃度で水性甘味料を含有する（すなわち、陽性対照）。各試験試料を、陽性対照に対して比較した。例えば、試験試料が化合物を含めて1倍の甘味料濃度（例えば、化合物を含んで5 b r i x H F C S）を含んだ場合、陽性対照試料は、1.1倍の甘味料濃度（例えば、化合物を含まずに5.5 b r i x H F C S）を含んだ。このように、単に知覚した甘さの増加に対してではなく、知覚した甘さにおける陽性対照を上回る著しい増加について、化合物を評価した。

【0273】

パネリストは、試験の少なくとも1時間前に飲食しない（水を除く）ように指示された。試験期間中、パネリストは、各試料を一口含み、口の中で転がし、吐き出すように指示された。その対で各試料を試飲した後、パネリストは、味覚における「甘味」について試料を記録するように指示された。パネリストは、水ですすぎ、クラッカーを食べ、試料間で約5分間待つことによって口蓋を洗浄した。すべての試料は、周囲温度で試験された。データは、二項確率を用いて分析された。2 AFC分析の結果を以下の表1に示す。

【表2】

表1. 知覚甘さの増加の2AFCの評価の感覚データの概略

化合物番号	化合物を含有する試料（試験試料）に対する甘味料濃度	試験試料が上回る陽性対照の甘味料濃度	陽性2AFCの結果を有する化合物濃度(ppm)	知覚した甘さの増加倍率
1	5brix HFCS	7.5brix HFCS	15	1.5倍超

表2の5列目の甘さ増強のおよそのレベルを以下のように計算した。

【0274】

甘さ増強のおよそのレベル = 試験試料が上回る陽性対照の甘味料濃度を、化合物を含有する試料に対する甘味料濃度で割ったもの（例えば $1.5 \times 7.5 \text{ brix HFCS} / 5 \text{ brix HFCS}$ ）。これは、知覚の増加が陽性対照よりも大きいことのみを示すが、陽性対照濃度が上回った度合いは示さない。

【0275】

例2：固有の甘さ

固有の甘さ評価

味覚試験のための試料の調製：

水性甘味料溶液を、（重量で）スクロース当量（S E）の量のH F C Sを、水に添加することによって調製して、所望の濃度を達成した。水溶液は、p H 2.5 ~ p H 7の範囲に及んだ。

【0276】

化合物は、まず、100%エタノール中で500倍に濃縮されたストック溶液として調製した。次いで、これらの濃縮されたストックを水性甘味料溶液に添加して、0.2%の最終エタノール濃度を得た。対照（陽性および陰性）試料もまた、0.2%エタノールに正規化した。このエタノールレベルは、いかなる知覚した甘さの一因となると見られなかった。

【0277】

感覚方法論：2 AFC方法を用いた固有の甘さ評価

ヒトにおける水溶液中の甘味料の甘味の知覚に対する試験化合物の固有の効果は、2 AFC方法を用いて評価された。この試験は、味覚パネリスト（n = 20）が一度に一対の甘味料溶液を評価する二重盲検ランダム化試験であった。つまり、ある試料は、甘味料を含まずに水性甘味料 + 化合物を含有する（すなわち、試験）が、もう一方は、1.5%スクロース当量（S E）のH F C Sを含有する（すなわち、対照）。各試験試料は、試験物が対照試料よりも著しく甘味が少ないかを観察するために、甘味料対照に対して比較される。

10

20

30

40

50

【0278】

パネリストは、試験の少なくとも1時間前に飲食しない（水を除く）ように指示された。試験期間中、パネリストは、各試料を一口含み、口の中で転がし、吐き出すように指示された。その対で各試料を試飲した後、パネリストは、味覚における「甘味」について試料を記録するように指示された。パネリストは、水ですすぎ、クラッカーを食べ、試料間で約5分間待つことによって口蓋を洗浄した。各対は、2回味見された。すべての試料は、周囲温度で試験された。データは、二項確率を用いて分析された。

【0279】

固有の甘さ分析の結果を以下の表2に示す。

【表3】

10

表2. 感覚データ: 固有の甘さ評価

化合物番号	試験した化合物濃度 (ppm)	総パネリストの数	選別対照の数	逆相のP値 (対照)
1	15	20	15	0.021

表2中に列挙された化合物に関しては、1.5% S E H F C Sの対照試料が、試験試料よりも著しく甘い。

【0280】

20

例3：記述的分析

訓練を受けた記述的分析 (DA) パネルを用いたヒトにおける甘味の知覚に対する試験化合物の効果

炭水化物甘味料の存在下で、風味付けされた水性環境における甘味の知覚に対する試験化合物の効果は、次のように訓練を受けたパネリストグループによる記述的分析方法を用いて評価された。

【0281】

30

候補のパネリストは、プレスクリーニングおよび個人面接により採用され、標準化された鋭敏さ試験の一部として基本的な味覚属性またはこれらの混合物を検出、認識、および分化する能力について評価された。これらの候補のパネリストはまた、風味を特定し、強度スケールにおいて等級付けする潜在的な能力についても評価された。評価の一部として嗅覚および視覚等の他の感覚もまた、含まれた。候補はまた、試料の味覚、嗅覚、および視覚についての見解を説明するおよび述べるために言語を使用する能力についてスクリーニングされた。

【0282】

40

選択された候補は、(1)語彙生成、(2)概念の調整、および(3)等級記述子の3つの段階における一群として訓練を受けるために進んだ。語彙生成中、パネリストは、風味、味覚、芳香性、三叉神経、および時間的属性を説明する用語を生成し、調整するためには研究で用いるのに適している生成物を評価した。概念の調整中、各属性を適切に定義する参考標準を用いて語彙生成中に精製された属性を明確にし、確認するために、上述された生成物を評価し、これらは、物理的参照（例えばスクロース溶液）または言語的説明（例えば全体的な風味）である。生成物の条件および概念は、この本研究期間中、有効であった。

【0283】

最後の段階である等級の記述子では、一連の課題に参加したパネルは、相対的属性強度に従って試料を順序付けし、等級付けすること、ライൻスケールの定義された長さを用いて属性強度を測定することに焦点を当てた。可能なときに、参考の異なるレベルまたは濃度を、スケールの使用を促すためのアンカーとして使用した。パネリストは、スケールの理解および知覚を評価するためにこの段階で盲目的参照が与えられた。

【0284】

50

この例に使用されたパネルは、絶対方法において甘味属性を参照するために訓練され、

それによって、甘味料の特定の濃度は、常に、各 cm が、0 % ~ 15 % の範囲のスクリースを網羅するために、スクリースの1 % の増加を表す、15 cm のライൻスケールを用いて同じ時点でパネリストによって測定される。属性の残りについては、パネルは、当業者に周知の記述的分析方法の間でハイブリッド手法を用いて訓練された。パネル性能は、一定間隔で測定され、表されたデータについては、12人のパネリストのコホートは、82 % のパネル平均として測定された再現性における良好な性能を示し、グループ性能に相当する再現性を有する属性の数 ($p < 0.05$) として定義され、識別が 87 % のパネル平均として測定され、個々に、90 % の信頼水準で有意に異なる属性の数 ($p < 0.1$) として定義され、一致が 75 % のコホート平均で測定され、そのパネルの一致によい相関がある属性の数 ($R > 0.7$) として定義された。

10

【0285】

次いで、訓練を受けたパネルを、風味付けされたレモンライムマトリックスにおける化合物の記述的分析評価のために使用した。化合物は、高フルクトースコーンシロップ (H F C S) で甘味付与したレモンライムマトリックスにおける甘さの増強について 20 ppm の用量で評価された。

【0286】

風味付けされた甘味料溶液を、(重量で)スクリース当量の量の H F C S を、レモンライムマトリックスに添加することによって調製して、所望の濃度を達成した。化合物は、まず、100 % エタノール中で 500 倍に濃縮されたストック溶液として調製した。次いで、この濃縮されたストックを風味付けされた甘味料溶液に添加して、0.2 % の最終エタノール濃度を得た。対照 (陽性および陰性) 試料もまた、0.2 % エタノールに正規化した。このエタノールレベルは、いかなる知覚した甘さの一因となると見られなかった。

20

【0287】

対照 (化合物を含まない風味付けされた甘味料溶液) および変異体 (化合物を含む風味付けされた甘味料溶液) 試料は両方とも、盲目かつランダム化であった。試料は、単項順で表され、パネリストは、試料を一口含み、口の中で転がし、吐き出すように指示された。甘味、苦味、酸味、甘草、および濃さを含む合計 7 つの属性が、各試料について評価された。甘味属性については、パネリストは、各 cm が、0 % ~ 15 % の範囲のスクリースを網羅するために、スクリースの1 % の増加を表す、15 cm のライൻスケール上で絶対採点法を行った。各試料評価後、パネリストは、標準的な口蓋を洗浄するプロトコルを行い、試料内の間隔時間 (I S I) を観察した。すべての試料は、周囲温度で評価された。

30

【0288】

データを収集し、FIZZ 感覚ソフトウェアを用いて電子的にエキスポートした。データ分析は、ツールを使用する S E N P A Q バージョン 5.0 のソフトウェア、例えば、A N O V A、F i s h e r の最小有意差、パネル性能を決定するための相関関係、および試料と属性との間の有意な差を用いて行った。

この D A 評価の例示的な結果を表 3 に示す。

【表4】

表3. レモンライム風味付けされたマトリックスにおける化合物2の甘さを増強する効果のDA評価

試料	レモンライムマトリックスにおける甘味料濃度	化合物1	ANOVAを用いた平均の甘味強度スコア(15cmのスケールにおける)	標準誤差	対照試料と比較した甘味知覚の増強倍率
1 (陰性対照)	6. 67brix HFCS		7. 2 ^c	0. 09	0. 76倍
2 (変異体)	6. 67brix HFCS	20ppmで	10. 5 ^a	0. 30	1. 11倍
3 (陽性対照)	10brix HFCS		9. 4 ^b	0. 12	1. 0倍

【0289】

化合物を含有する溶液(すなわち、変異体)について観察された甘味強度は、ANOVAによって決定されるように、対照溶液とは大いに異なった。増強倍率(知覚した甘味の増加)は、変異体試料について観察されたDAパネルの平均強度スコアを、陰性対照試料について観察されたもので割ることによって計算された。

【0290】

訓練を受けた記述的分析(DA)パネルを用いたヒトにおける非甘味属性の知覚に対する試験化合物の効果

炭水化物甘味料の存在下で、風味付けされた水性環境における非甘味属性(苦味等)の知覚に対する試験化合物の効果は、次のように訓練を受けたパネリストグループによる記述的分析方法を用いて評価された。これは、例3において前述されたDA評価の一部として生じた。

【0291】

候補パネリストは、上の例3において前述されたように採用され、訓練を受けた。

【0292】

次いで、訓練を受けたパネルを、20ppmの試験用量で、高フルクトースコーンシロップ(HFCS)で甘味付与した、レモンライム風味付けされたマトリックスにおける化合物1の記述的分析評価のために使用した。

【0293】

すべての対照および変異体試料は、例3に記載されるように調製された。対照(化合物を含まない風味付けされた甘味料溶液)および変異体(化合物を含む風味付けされた甘味料溶液)試料は両方とも、盲目かつランダム化であった。試料は、単項順で表され、パネリストは、試料を一口含み、口の中で転がし、吐き出すように指示された。甘味、苦味、酸味、甘草、および渋味を含む合計7つの属性が、各試料について評価された。各試料評価後、パネリストは、標準的な口蓋を洗浄するプロトコルを行い、試料内の間隔時間(ISI)を観察した。すべての試料は、周囲温度で評価された。

【0294】

データを収集し、FIZZ感覚ソフトウェアを用いて電子的にエキスポートした。データ分析は、ツールを使用するSENPAQバージョン5.0のソフトウェア、例えば、ANOVA、Fisherの最小有意差、パネル性能を決定するための相関関係、および試料と属性との間の有意な差を用いて行った。

10

20

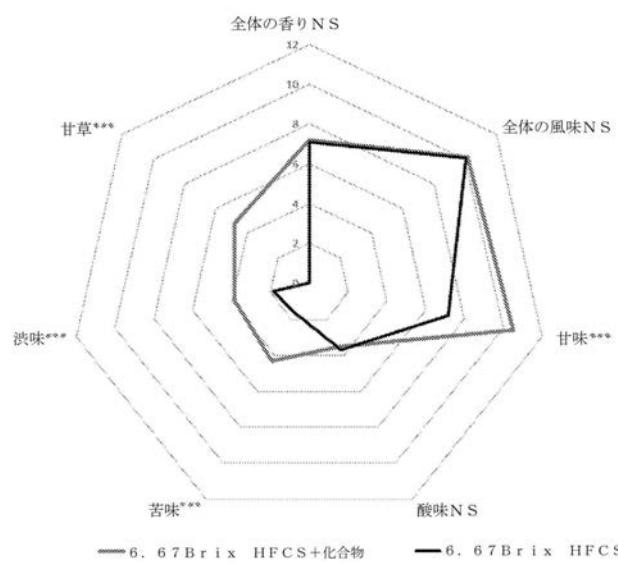
30

40

50

この D A 評価の例示的な結果を図 1 中の感覚スパイダープロットとして表される。

【図 1】



【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No. PCT/US2016/013269
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC(8) - C07D 311/58 (2016.01) CPC - A23L 1/09; A23L 1/097; A23L 1/236; A23L 1/22091 (2016.02) According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC(8) - A23L 2/60, 27/30; C07D 311/16; 311/22, 311/32, 311/58 (2016.01) CPC - A23L 1/09, 1/097, 1/236, 1/22091, 2/60; A23V 2002/00; C07D 311/22, 311/32 (2016.02)		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched USPC - 426/548; 549/403; IPC(8) - A23L 2/60, 27/30; C07D 311/16; 311/22, 311/32, 311/58; CPC - A23L 1/09, 1/097, 1/236, 1/22091, 2/60; A23V 2002/00; C07D 311/22, 311/32 (keyword delimited)		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) Orbit, Google Patents, Google, STN, PubChem, SureChem Search terms used: (R)5-hydroxy-4-(4-hydroxy-3-methoxyphenyl)-7-methylchroman-2-one, neoflavanoid, flavone, sweetener.		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	AOKI et al. A convenient synthesis of dihydrocoumarins from phenols and cinnamic acid derivatives. <i>Tetrahedron</i> 61(39): 9291-9297, 2005. [retrieved on 17 February 2016]. Retrieved from the Internet. <URL: http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S004040200501255X > entire document	1-14, 25, 28-39
A	US 2013/0084252 A1 (BACKES et al) 04 April 2013 (04.04.2013) entire document	1-14, 25, 28-39
A	WO 2014/153000 A1 (CHROMOCELL CORPORATION) 25 September 2014 (25.09.2014) entire document	1-14, 25, 28-39
A	US 8,133,887 B2 (TAUGERBECK et al) 13 March 2012 (13.03.2012) entire document	1-14, 25, 28-39
A	US 6,441,173 B1 (WOOD et al) 27 August 2002 (27.08.2002) entire document	1-14, 25, 28-39
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 11 April 2016	Date of mailing of the international search report 11 MAY 2016	
Name and mailing address of the ISA/ Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents P.O. Box 1450, Alexandria, VA 22313-1450 Facsimile No. 571-273-8300	Authorized officer Blaine R. Copenheaver PCT Helpdesk: 571-272-4300 PCT OSP: 571-272-7774	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No. PCT/US2016/013269
Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)		
This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:		
1.	<input type="checkbox"/>	Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2.	<input type="checkbox"/>	Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3.	<input checked="" type="checkbox"/>	Claims Nos.: 15-24, 26, 27 because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)		
This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:		
See Extra Sheet		
1.	<input type="checkbox"/>	As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.	<input type="checkbox"/>	As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3.	<input type="checkbox"/>	As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.	<input checked="" type="checkbox"/>	No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: 1-14, 25, 28-39
Remark on Protest		<input type="checkbox"/> The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee. <input type="checkbox"/> The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation. <input type="checkbox"/> No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No. PCT/US2016/013269

Continued from Box No. III Observations where unity of invention is lacking

Claims 1-14, 25, and 28-39 have been analyzed subject to the restriction that the claims read on a compound of Formula (I) where the first instance of R is OH and the second instance of R is C1 alkyl; m is 2; wherein the compound of Formula (I) is Compound 1 having the structure as shown in claim 2 of the instant invention; or a comestibly acceptable salt, enantiomer, derivative, or solvate thereof; compositions thereof; and methods thereof. It is believed that claims 1-14, 25, and 28-39 read on this first named invention and thus these claims will be searched without fee to the extent that they read on the above embodiment.

This application contains the following inventions or groups of inventions which are not so linked as to form a single general inventive concept under PCT Rule 13.1. In order for all inventions to be examined, the appropriate additional examination fees need to be paid.

Group I+: claims 1-14, 25, and 28-39 are drawn to compounds of Formula (I), or a comestibly acceptable salt, enantiomer, derivative, or solvate thereof, compositions thereof, and methods thereof.

The first invention of Group I+ is restricted based on the proviso that at least one of R is not OH and is restricted to a compound of Formula (I) where the first instance of R is OH and the second instance of R is C1 alkyl; m is 2; wherein the compound of Formula (I) is Compound 1 having the structure as shown in claim 2 of the instant invention; or a comestibly acceptable salt, enantiomer, derivative, or solvate thereof; compositions thereof; and methods thereof. It is believed that claims 1-14, 25, and 28-39 read on this first named invention and thus these claims will be searched without fee to the extent that they read on the above embodiment.

Applicant is invited to elect additional formula(e) for each additional compound to be searched in a specific combination by paying an additional fee for each set of election. Each additional elected formula(e) requires the selection of a single definition for each compound variable. An exemplary election would be a compound of Formula (I) where R is formyl; m is 3; or a comestibly acceptable salt, enantiomer, derivative, or solvate thereof; compositions thereof; and methods thereof. Additional formula(e) will be searched upon the payment of additional fees. Applicants must specify the claims that read on any additional elected inventions. Applicants must further indicate, if applicable, the claims which read on the first named invention if different than what was indicated above for this group. Failure to clearly identify how any paid additional invention fees are to be applied to the "+" group(s) will result in only the first claimed invention to be searched/examined.

The inventions listed in Groups I+ do not relate to a single general inventive concept under PCT Rule 13.1, because under PCT Rule 13.2 they lack the same or corresponding special technical features for the following reasons:

The Groups I+ formulas do not share a significant structural element requiring the selection of alternatives for the compound variables R and m.

The Groups I+ share the technical features of a compound of Formula (I); or a comestibly acceptable salt, enantiomer, derivative, or solvate thereof; a composition comprising a compound of Formula (I), Compound 1, or a comestibly or biologically acceptable salt, solvate, enantiomer, or derivative thereof, or a combination of any of the foregoing compounds, wherein said composition is edible and capable of enhancing the sweet taste of a sweetener; a method of enhancing the sweet taste of a sweetener in an edible composition, wherein said method comprises adding an effective amount of a compound of Formula (I), Compound 1, or a comestibly or biologically acceptable salt, solvate, enantiomer, or derivative thereof, or a combination of any of the foregoing compounds, to said edible composition, such that the perception of sweetness intensity of said sweetener is enhanced; a method of reducing the bitter taste of a bitter tastant in an edible composition, wherein said method comprises adding an effective amount of a compound of Formula (I), Compound 1, or a comestibly or biologically acceptable salt, solvate, enantiomer, or derivative thereof, or a combination of any of the foregoing compounds; and a method of preparing an edible composition comprising: (a) providing a comestibly acceptable carrier; and (b) adding to said comestibly acceptable carrier a compound of Formula (I), Compound 1, or a comestibly or biologically acceptable salt, solvate, enantiomer, or derivative thereof, or a combination of any of the foregoing compounds; a tabletop sweetener composition comprising a sweetener and a sweet taste modulator according to Formula (I), Compound 1, or a comestibly or biologically acceptable salt, solvate, enantiomer, or derivative thereof, or a combination of any of the foregoing compounds; and a delivery system selected from the group consisting of a co-crystallized flavor composition with a sugar or a polyol, an agglomerated flavor composition, a compacted flavor composition, a dried flavor composition, a particle flavor composition, a spheroidized flavor composition, a granular flavor composition or a liquid flavor composition, wherein the flavor composition comprises a compound of Formula (I), Compound 1, or a comestibly or biologically acceptable salt, solvate, enantiomer, or derivative thereof, or a combination of any of the foregoing compounds. However, these shared technical features do not represent a contribution over the prior art.

Specifically, "A convenient synthesis of dihydrocoumarins from phenols and cinnamic acid derivatives" to Aoki et al. teach a compound of Formula (I); where R is C1 alkyl; m is 2 (See Pg. 9293, Fig. 1, Compound 3cf; ... see shown structure...).

Additionally, US 2013/0084252 A1 to Backes et al. teach a compound having the core structure of Formula (I) (See Para. [0033], Compound 1; ... see shown structure...); a composition (See Para. [0014]) comprising a compound having the core structure of Formula (I), wherein said composition is edible and capable of enhancing the sweet taste of a sweetener (See Para. [0014]); a method of enhancing the sweet taste of a sweetener in an edible composition (See Para. [0001]; Claim 14), wherein said method comprises adding an effective amount of a compound having the core structure of Formula (I), to said edible composition, such that the perception of sweetness intensity of said sweetener is enhanced (See Paras. [0180] through [0184]); a method of reducing the bitter taste of a bitter tastant in an edible composition (See Paras. [0162] through [0177]), wherein said method comprises adding an effective amount of a compound having the core structure of Formula (I), to said edible composition (See Paras. [0165] and [0177]), such that the perception of bitter taste of said bitter tastant is reduced (See Paras. [0162] through [0177], ... one or a plurality of further substances for masking or reducing an unpleasant, in particular a bitter taste impression...); a method of preparing an edible composition comprising: (a) providing a comestibly acceptable carrier; and (b) adding to said comestibly acceptable carrier a compound having the core structure of Formula (I) reduced (See Paras. [0162] through [0177]); a tabletop sweetener composition comprising a sweetener and a sweet taste modulator according to a compound having the core structure of Formula (I) (See Para. [0364]). The semifinished products A through H can be used as a sweetener, e.g. also directly for coffee or tea; and a delivery system selected from the group consisting of a dried flavor composition (See Paras. [0365] through [0366], Spray-Dried Preparation as Semifinished Product for Flavoring Finished Products), wherein the flavor composition comprises a compound having the core structure of Formula (I) (See Paras. [0365] through [0366], Spray-Dried Preparation as Semifinished Product for Flavoring Finished Products).

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/US2016/013269

The inventions listed in Groups I+ therefore lack unity under Rule 13 because they do not share a same or corresponding special technical feature.

フロントページの続き

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,R0,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,D0,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JP,KE,KG,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US

(72)発明者 チョウ、ハオ

アメリカ合衆国、ニュージャージー、パラマス、エドスタン ウェイ 325

(72)発明者 ヘイデン、スチュワート

アメリカ合衆国、ニュージャージー、マナラパン、セント アンドリューズ ブレイス 380

(72)発明者 シャー、プルヴィ

アメリカ合衆国、ニュージャージー、ブリッジウォーター、ハリー ロード 37

F ターム(参考) 4B047 LB03 LB08 LB09 LG05 LG13 LG14 LG17 LG21 LG22 LG23

LG24 LG25 LG27 LG31 LG32 LG37 LG38 LP01

4C062 EE22