

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年 12 月 9 日 (09.12.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/105515 A1

- (51) 国際特許分類: **A23L 1/236**, 1/22 (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/003140
- (22) 国際出願日: 2004 年 3 月 10 日 (10.03.2004)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2003-152064 2003 年 5 月 29 日 (29.05.2003) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 味の素株式会社 (AJINOMOTO CO., INC.) [JP/JP]; 〒1048315 東京都中央区京橋一丁目 1 5 番 1 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小野 恵理子 (ONO, Eriko) [JP/JP]; 〒2108681 神奈川県川崎市川崎区鈴木町 1 - 1 味の素株式会社内 Kanagawa (JP). 竹本 正 (TAKEMOTO, Tadashi) [JP/JP]; 〒2108681 神奈川県川崎市川崎区鈴木町 1 - 1 味の素株式会社内 Kanagawa (JP).
- (74) 代理人: 高橋 文子 (TAKAHASHI, Fumiko); 〒2108681 神奈川県川崎市川崎区鈴木町 1 - 1 味の素株式会社知的財産センター内 Kanagawa (JP).
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: SWEETENER COMPOSITION

(54) 発明の名称: 甘味料組成物

(57) Abstract: A sweetener composition which comprises an aspartyl dipeptide ester compound and a cyclodextrin. The solubility of the aspartyl dipeptide ester compound in aqueous solutions is significantly improved.

(57) 要約: アスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンとを含有する甘味料組成物。アスパルチルジペプチドエステル化合物の水溶液に対する溶解度が著しく改善される。



WO 2004/105515 A1

明 細 書

甘 味 料 組 成 物

技術分野

本発明は、特定のアスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンとを含有する溶解性に優れた甘味料組成物及び該組成物を含む飲食物に関する。

背景技術

近年、食生活の高度化に伴い特に糖分の摂取過多による肥満及びこれに伴う各種の疾病が問題となっており、砂糖に替わる低カロリー甘味料の開発が望まれている。このような低カロリー甘味料としては、安全性と甘味質の面で優れるアスパルテームが知られており、現在広汎に使用されている。一方、近年、アスパルテームよりも甘味度に優れるアスパルチルジペプチドエステル化合物が見いだされ、いくつか報告されている（国際公開第94/11391号パンフレット、国際公開第99/52937号パンフレット、国際公開第00/0000508号パンフレット、国際公開第00/17230号パンフレット及び国際公開第01/25261号パンフレット参照）。

しかしながら、これらのアスパルチルジペプチドエステル化合物は水溶液に対する溶解度が著しく低く、特に飲料や液状の食品に用いるのが困難である。このような甘味料を、特に飲料や液状の食品に用いる場合、通常まず甘味料の高濃度溶液を調製し、これを飲料や液状食品に添加することで所望の濃度に調整して最終製品を製造するため、該アスパルチルジペプチドエステル化合物の溶解度の低さは重大な問題となる。また、これらのアスパルチルジペプチドエステル化合物の粉末を水に加えて該化合物の水溶液を調製しようとした場合、粉末が凝集し、攪拌効率の高い攪拌機器を使用したとしても、均一の溶液を調製するのに長時間を要するという問題も生ずる。従って、該

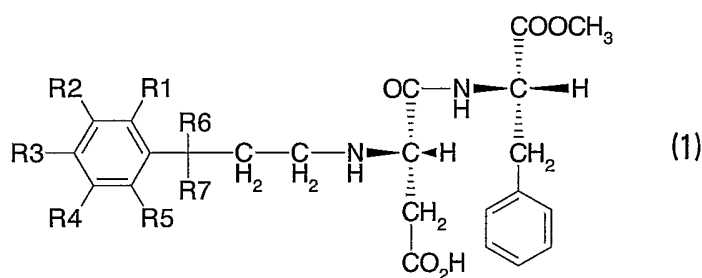
アスパルチルジペプチドエステル化合物の溶解度を改善する方法の開発が求められていた。

発明の開示

本発明の目的は、前記アスパルチルジペプチドエステル化合物の水溶液に対する溶解度を改善することにある。

本発明者らは、前記課題を解決すべく鋭意検討した結果、該アスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンを含む甘味料組成物が、該アスパルチルジペプチドエステル化合物の水溶液に対する溶解度を著しく向上させ、また溶解時の粉末の凝集もほとんど起こらないことを見だし、本発明を完成させた。すなわち本発明は以下の内容を含むものである。

[1] 式 (1)



[式 (1) 中、R 1、R 2、R 3、R 4 及び R 5 はそれぞれ相互に独立して、水素原子、ヒドロキシル基及びメトキシ基の何れかを示し、R 6 及び R 7 はそれぞれ相互に独立して、水素原子又はメチル基を示す。R 6 と R 7 が異なる置換基を表す場合、これらの置換基が結合する炭素原子の立体配位は (R)、(S) 及び (R S) の何れでもよい。]

で示されるアスパルチルジペプチドエステル化合物又はその塩とシクロデキストリンとを含有する甘味料組成物。

[2] 式 (1) 中、R 2 又は R 4 の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、R 3 がメトキシ基であり、R 1 及び R 5 ～ R 7 が水素原子である前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[3] 式 (1) 中、R 2 又は R 4 の何れか一方がヒドロキシル基で他方が

水素原子であり、R 3 がメトキシ基であり、R 6 及び R 7 がメチル基であり、R 1 及び R 5 が水素原子である前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[4] 式 (1) 中、R 1 又は R 5 の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、R 3 がメトキシ基であり、R 2 及び R 4 ~ R 7 が水素原子である前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[5] 式 (1) で示されるアスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンの配合割合がモル比で 1 : 0. 2 ~ 1 : 1 0 である前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[6] シクロデキストリンが β -シクロデキストリンである前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[7] アスパルチルジペプチドエステル化合物及びシクロデキストリンが溶解した溶液を晶析して得られた前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[8] アスパルチルジペプチドエステル化合物及びシクロデキストリンが溶解した溶液を凍結乾燥して得られた前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[9] アスパルチルジペプチドエステル化合物及びシクロデキストリンを混合粉碎して得られた前記 [1] 記載の甘味料組成物。

[1 0] 前記 [1] 乃至 [9] 記載の甘味料組成物を含有する飲食物。

[1 1] 前記 [1] 乃至 [9] 記載の甘味料組成物を含有する飲料。

発明を実施するための最良の形態

本発明におけるアスパルチルジペプチドエステル化合物は、公知化合物であり、例えば以下に挙げるような種々の公知の方法、またはこれらの方法に準じた方法により製造することができる。

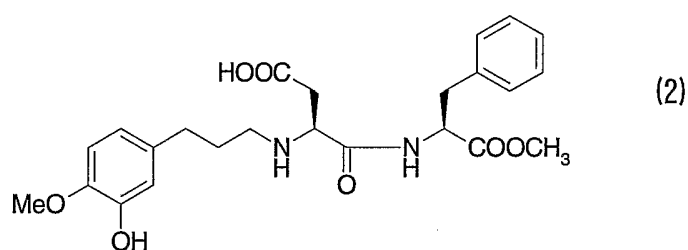
(1) アスパルテムを、種々の置換基を有するシンナムアルデヒドまたは 3-フェニルプロピオンアルデヒドと還元剤（例えば、水素／パラジウム炭素触媒）で還元的にアルキル化することによって製造する方法（国際公開第 WO 0 1 / 2 5 2 6 0 号パンフレット、国際公開第 WO 0 1 / 2 7 1 4 2 号パンフレット、国際公開第 WO 0 1 / 1 8 0 3 4 号パンフレット参照）

(2) β 位のカルボン酸に保護基を有するアスパルテーム化合物(例えば、 β -O-ベンジル- α -L-アスパルチル-L-フェニルアラニンメチルエステル)を、種々の置換基を有するシンナムアルデヒドと還元剤(例えば、 $\text{NaB}(\text{OAc})_3\text{H}$)とで還元的にアルキル化した後に保護基を除去する方法(A. F. Abdel-Magid ら, *Tetrahedron Letters*, 31, 5595 (1990) 参照)。

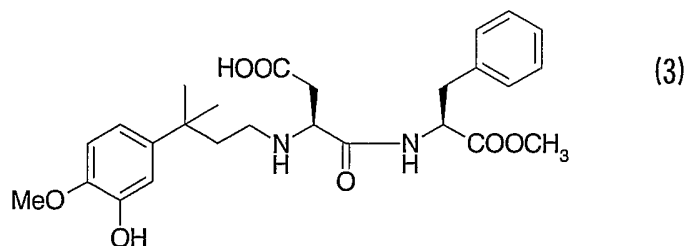
本発明における式(1)中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 はそれぞれ相互に独立して、水素原子、ヒドロキシル基及びメトキシ基の何れかを示し、 R_6 及び R_7 はそれぞれ相互に独立して、水素原子又はメチル基を示す。 R_6 と R_7 が異なる置換基を表す場合、これらの置換基が結合する炭素原子の立体配位は(R)、(S) 及び (RS) の何れでもよい。

本発明におけるアスパルチルジペプチドエステル化合物としては、以下に示す化合物1～3がより好ましい。

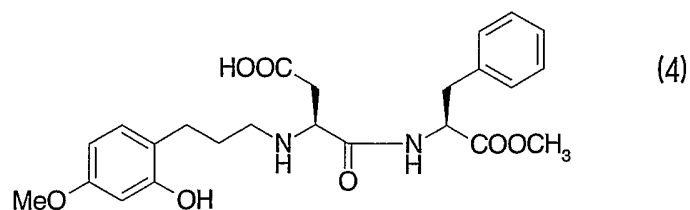
化合物1：式(1)中、 R_2 又は R_4 の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、 R_3 がメトキシ基であり、 R_1 及び $\text{R}_5 \sim \text{R}_7$ が水素原子である化合物(下記式(2)で表される化合物)。



化合物2：式(1)中、 R_2 又は R_4 の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、 R_3 がメトキシ基であり、 R_6 及び R_7 がメチル基であり、 R_1 及び R_5 が水素原子である化合物(下記式(3)で表される化合物)。



化合物 3 : 式 (1) 中、R 1 又は R 5 の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、R 3 がメトキシ基であり、R 2 及び R 4 ~ R 7 が水素原子である化合物 (下記式 (4) で表される化合物)。



本発明における式 (1) で表されるアスパルチルジペプチドエステル化合物は塩の形態であってもよく、また 2 種以上の化合物の混合物であってもよい。塩としては、食用として可能な塩の形態であれば特に限定されず、例えば、塩酸塩、ナトリウム塩、カリウム塩、アンモニウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩等が挙げられる。

本発明におけるシクロデキストリンは、 α -シクロデキストリン、 β -シクロデキストリン、 γ -シクロデキストリンのいずれでもよいが、 β -シクロデキストリンが特に好ましい。シクロデキストリンは 2 種以上の混合物であってもよい。

式 (1) で表されるアスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンの配合割合は、モル比で 1 : 0.2 ~ 1 : 10 であるのが好ましく、特に 1 : 1 ~ 1 : 5 であるのが好ましい。

式 (1) で表されるアスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンとから本発明の甘味料組成物を製造する方法は特に限定ないが、好ましくは、該化合物とシクロデキストリンが溶解した溶液を晶析する方法、該溶液を凍結乾燥する方法、または該化合物とシクロデキストリンを混合粉碎する方法が挙げられる。

晶析または凍結乾燥を行う場合、該アスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンを固体状態で混合し溶媒に溶解することもできるが、好ましくは該アスパルチルジペプチドエステル化合物およびシクロデキストリンをそれぞれ溶液状態とし、これを均一に混合して晶析に用いる溶液を調

製するのが好ましい。該アスパルチルジペプチドエステル化合物を溶解するための溶媒としては、メタノール、エタノール、イソプロパノール、アセトン、テトラヒドロフラン、アセトニトリル等の極性溶媒を挙げることができる。中でもメタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコールが好ましく、メタノールが特に好ましい。シクロデキストリンを溶解するための溶媒としては、水が好ましい。

各々の溶液を均一に混合して得られる、アスパルチルジペプチドエステル化合物及びシクロデキストリンが溶解した溶液を用いて晶析または凍結乾燥を行うことができる。

晶析の方法は特に限定されず、濃縮晶析、冷却晶析等を用いることができるが、好ましくは冷却晶析が採用される。晶析条件は特に限定されず、当業者は好ましい条件を適宜容易に設定することができる。晶析により得られたスラリーを濾過や遠心分離等の公知の方法により固液分離することで結晶を分離することができる。得られた結晶を、真空乾燥器、流動乾燥器、スプレードライヤー、マイクロンドライヤー等の公知の方法より乾燥することができる。以上のように、晶析工程を経て目的とする甘味料組成物を得ることができる。

凍結乾燥の方法は特に限定されず、公知の方法に従って当業者は好ましい条件を適宜容易に設定することができる。なお凍結乾燥においては、該化合物およびシクロデキストリンが溶解した溶液の溶媒量ができるだけ少ない、すなわちできるだけ高濃度の溶液を用いるのが好ましいため、該溶液を濃縮する、該溶液に有機溶媒が含まれる場合はそれを留去する等してから凍結乾燥を行うのがよい。

また該アスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンを混合粉碎する方法も特に限定されず、公知の方法に従って当業者は好ましい条件を適宜容易に設定することができる。

上記のようにして得られた結晶、凍結乾燥物、混合粉碎物としての甘味料組成物は必要により乾式造粒又は湿式造粒等の当業者に公知の方法に従って

造粒し、造粒物としてもよい。また、本発明の甘味料組成物は、糖類（ショ糖、転化糖、異性化糖、ブドウ糖、果糖、乳糖、麦芽糖等）、糖アルコール類（マルチトール、ソルビトール、マンニトール、エリスリトール、キシリトール、ラクチトール等）、オリゴ糖類、食物繊維、アスパルテーム、サッカリン、アセスルフェームK等の他の甘味料や香料を更に含んでもよい。

本発明の甘味料組成物は各種飲食物に配合して用いることができる。特に該アスパルチルジペプチドエステル化合物よりも遙かに溶解度が高いため容易に高濃度溶液を調製することができ、飲料、ゲル状食品、氷菓、アイスクリーム、アイスクャンディー等の液体から調製される食品の製造に好ましく用いることができる。飲料としては、珈琲飲料、野菜汁飲料、日本茶、中国茶、紅茶、乳飲料、スープ飲料、炭酸飲料、甘味飲料、果汁飲料、アルコール飲料等を挙げることができる。これらの他、粉末ジュース、粉末ココア、インスタント珈琲、チョコレート、チューインガム、健康食品、パン、ケーキ等の各種食品にも用いることができる。

以下実施例を示して本発明を具体的に説明するが、本発明はこれに限定されるものではない。

<実施例 1>

表 1 に示す比率で、N-[N-[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)プロピル]-L- α -アスパルチル]-L-フェニルアラニン-1-メチルエステル（化合物 1）、N-[N-[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)-3-メチルブチル]-L- α -アスパルチル]-L-フェニルアラニン-1-メチルエステル（化合物 2）、及び N-[N-[3-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)プロピル]-L- α -アスパルチル]-L-フェニルアラニン-1-メチルエステル（化合物 3）のそれぞれと、 β -シクロデキストリンとを所定の割合で混合粉碎し、表 1 に示される甘味料組成物 1～9 を得た。各甘味料組成物を、6 ml のサンプル瓶に入れ、水を 4 ml 添加し、20℃の恒温水槽中で一晚攪拌した。その後、未溶解物を濾過し、母液を HPLC で分析することによって、溶解度を測定した。結果

を表 1 に示す。

表 1

	モル比		組成物仕込 量 [mg]	水添加量 [ml]	溶解度 [重量%]
	化合物	β -CD			
化合物1	化合物1	1	0	4	0.10
甘味料組成物1			0.5		0.27
甘味料組成物2			1		0.48
甘味料組成物3			2		0.54
化合物2	化合物2	1	0	4	0.03
甘味料組成物4			0.5		0.11
甘味料組成物5			1		0.14
甘味料組成物6			2		0.20
化合物3	化合物3	1	0	4	0.03
甘味料組成物7			0.5		0.08
甘味料組成物8			1		0.11
甘味料組成物9			2		0.13

表 1 から、アスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンの混合粉碎物である甘味料組成物において、アスパルチルジペプチドエステル化合物の溶解度が著しく改善されているのが分かる。

<実施例 2>

5.00 g の β -シクロデキストリンを 50 ml の水に 55℃ で溶解させた。別途 5.00 g の N-[N-[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)プロピル]-L- α -アスパルチル]-L-フェニルアラニン-1-メチルエステル（化合物 1）を 16.7 ml のメタノールに溶解させ、先の溶液と混合し、攪拌しながら室温まで冷却した。その後、冷蔵庫で一晩冷却し晶析を行った。得られたスラリーを分離、乾燥することによって、9.02 g の化合物 1 と β -シクロデキストリンのモル比が 1 : 0.4 の甘味料組成物 10 を得た。

<実施例 3>

β -シクロデキストリンを 7.14 g、N-[N-[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)プロピル]-L- α -アスパルチル]-L-フェ

フェニルアラニン-1-メチルエステル（化合物1）を2.86g用いる他は、実施例2と同様の操作により、化合物1と β -シクロデキストリンのモル比が1:1の甘味料組成物11（8.60g）を得た。

<実施例4>

β -シクロデキストリンを8.33g、N-[N-[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)プロピル]-L- α -アスパルチル]-L-フェニルアラニン-1-メチルエステル（化合物1）を1.67g用いる他は、実施例1と同様の操作により、化合物1と β -シクロデキストリンのモル比率が1:2の甘味料組成物12（8.96g）を得た。

<実施例5>

β -シクロデキストリン（ β -シクロデキストリン）を9.09g、N-[N-[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)プロピル]-L- α -アスパルチル]-L-フェニルアラニン-1-メチルエステル（化合物1）を0.91g用いる他は、実施例1と同様の操作により、化合物1と β -シクロデキストリンのモル比率が1:4.6の甘味料組成物13（8.55g）を得た。

<実施例6>

実施例2～5で得られた甘味料組成物10～13を6mlのサンプル瓶に入れ、水を4ml添加し、20℃の恒温槽中で一晚攪拌した。その後、未溶解物を濾過し、母液をHPLCで分析することによって、溶解度を測定した。結果を表2に示す。

表2

	モル比		組成物仕込 量 [mg]	水添加量 [ml]	溶解度 [重量%]
	化合物1	CD			
化合物1	1	0	20	4	0.10
甘味料組成物10		0.4	200		0.33
甘味料組成物11		1			0.55
甘味料組成物12		2			0.62
甘味料組成物13		4.6	300		0.51

表 2 から、アスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンの混合溶液を晶析して得られた甘味料組成物において、アスパルチルジペプチドエステル化合物の溶解度が著しく改善されているのが分かる。

<実施例 7>

表 3 に示す比率で、N-[N-[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル)プロピル]-L- α -アスパルチル]-L-フェニルアラニン-1-メチルエステル(化合物 1)をメタノールに、各種シクロデキストリンを水にそれぞれ溶解し、これらを併せて混合溶液とした後に濃縮し、得られた濃縮溶液を凍結乾燥することによって、甘味料組成物 14~22 を得た。同様に、4.98 g の化合物 1 をメタノールに溶解し、水中に滴下して混合した後に濃縮し、得られた濃縮溶液を凍結乾燥することによって、化合物 1 の凍結乾燥品 1 を得た。得られた凍結乾燥品 1 を約 50 mg、及び甘味料組成物 14~22 を約 500 mg、それぞれ 20 ml のサンプル瓶に入れ、水を 10 ml 添加し、20℃の恒温水槽中で一晩攪拌した。その後、未溶解物を濾過し、母液を HPLC で分析することによって、溶解度を測定した。結果を表 3 に示す。

表 3

	モル比		組成物仕 込量 [m g]	水添加量 [ml]	溶解度 [重量 %]	
	シクロデキストリン	化合物 1				
甘味料組成物 14	α-CD	1	1	500	10	0.20
甘味料組成物 15		5				0.39
甘味料組成物 16		10				0.29
甘味料組成物 17	β-CD	1	1	500	10	0.56
甘味料組成物 18		5				0.62
甘味料組成物 19		10				0.53
甘味料組成物 20	γ-CD	1	1	500	10	0.57
甘味料組成物 21		5				0.45
甘味料組成物 22		10				0.21
凍結乾燥品 1	---	0	1	50	10	0.10

表 3 から、アスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンの混合溶液を凍結乾燥して得られた甘味料組成物において、アスパルチルジペプチドエステル化合物の溶解度が著しく改善されているのが分かる。

< 比較例 1 >

表 4 に示す比率で N - [N - [3 - (3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル) プロピル] - L - α - アスパルチル] - L - フェニルアラニン - 1 - メチルエステル (化合物 1) と、各添加物を混合粉碎し、得られた各混合物を 20 ml のサンプル瓶に入れ、水を 10 ml 添加し、20℃の恒温水槽中で一晩攪拌した。その後、未溶解物を濾過し、母液を HPLC で分析することによって、溶解度を測定した。結果を表 4 に示す。

表 4

	モル比		水添加量 [ml]	溶解度 [重量%]
	化合物1	添加物		
グルコース	1	1	10	0.10
スクロース				0.10
キシリトール				0.10
アラビトール				0.10
マンニトール				0.10
化合物1		0		0.10

表 4 から、シクロデキストリン以外の各種添加物とアスパルチルジペプチドエステルからなる甘味料組成物においては、該アスパルチルジペプチドエステル溶解度は改善されていないことが分かる。

< 参考例 1 >

実施例 3 ～ 5 で得られた甘味料組成物甘味料組成物 1 1 ～ 1 3 を用いて、下記条件に従って溶解速度を測定し、化合物 1 と比較した。結果を表 5 に示す。

< 日局 1 3 一般試験法 溶出試験法 パドル法 >

緩衝液 : 9 0 0 m l / 水

温度 : 2 5 ℃

攪拌回転数 : 1 0 0 r p m

サンプル投入量 : 化合物として 9 0 m g

表 5

	モル比		溶解時間 [分]	溶解初速度※
	化合物1	CD		
甘味料組成物11	1	1	13	1.00mg/dl・min
甘味料組成物12		2	6	0.99mg/dl・min
甘味料組成物13		4.6	8	0.99mg/dl・min
化合物1		0	60分以上	0.58mg/dl・min

※溶解初速度 = $\frac{\text{測定開始10分後の溶液濃度}}{10\text{分}}$ mg/dl・min

表 5 より、化合物 1 単独の場合に比べ、化合物 1 とシクロデキストリンを

含む溶液を晶析して得られた甘味料組成物 11～13 は、溶解時間、溶解初速度ともに著しく改善されていることが分かる。また、化合物 1 単独では水に溶解する際、粉末の凝集が観察されたが、甘味料組成物 11～13 では観察されなかった。

< 参考例 2 >

実施例 1 で得られた甘味料組成物 2、5、8 を用いて、参考例 1 で示した条件に従って、溶解速度を測定した。結果を表 6 に示す。

表 6

	モル比		溶解時間 [分]	溶解初速度※
	化合物	CD		
甘味料組成物2	化合物1	1	15	0.99mg/dl・min
化合物1		0	60分以上	0.58mg/dl・min
甘味料組成物5	化合物2	1	60分以上	0.45mg/dl・min
化合物2		0	60分以上	0.15mg/dl・min
甘味料組成物8	化合物3	1	60分	0.57mg/dl・min
化合物3		0	60分以上	0.36mg/dl・min

$$\text{※溶解初速度} = \frac{\text{測定開始10分後の溶液濃度}}{10\text{分}} \quad \text{mg/dl} \cdot \text{min}$$

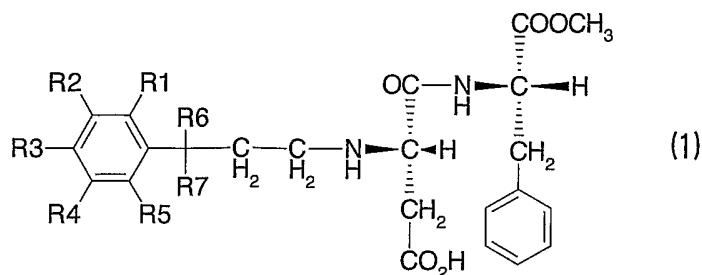
上記表 6 より、それぞれの化合物単独の場合に比べ、該化合物とシクロデキストリンからなる甘味料組成物は、溶解初速度が著しく改善されていることが分かる。

産業上の利用可能性

本発明によれば、アスパルチルジペプチドエステル化合物の水に対する溶解度が著しく改善された該化合物を含む甘味料組成物が提供される。

請求の範囲

1. 式(1)



[式(1)中、R1、R2、R3、R4及びR5はそれぞれ相互に独立して、水素原子、ヒドロキシル基及びメトキシ基の何れかを示し、R6及びR7はそれぞれ相互に独立して、水素原子又はメチル基を示す。R6とR7が異なる置換基を表す場合、これらの置換基が結合する炭素原子の立体配位は(R)、(S)及び(RS)の何れでもよい。]

で示されるアスパルチルジペプチドエステル化合物又はその塩とシクロデキストリンとを含有する甘味料組成物。

2. 式(1)中、R2又はR4の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、R3がメトキシ基であり、R1及びR5～R7が水素原子である請求項1記載の甘味料組成物。

3. 式(1)中、R2又はR4の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、R3がメトキシ基であり、R6及びR7がメチル基であり、R1及びR5が水素原子である請求項1記載の甘味料組成物。

4. 式(1)中、R1又はR5の何れか一方がヒドロキシル基で他方が水素原子であり、R3がメトキシ基であり、R2及びR4～R7が水素原子である請求項1記載の甘味料組成物。

5. 式(1)で示されるアスパルチルジペプチドエステル化合物とシクロデキストリンの配合割合がモル比で1:0.2～1:10である請求項1記載の甘味料組成物。

6. シクロデキストリンがβ-シクロデキストリンである請求項1記載の甘味料組成物。

7. アスパルチルジペプチドエステル化合物及びシクロデキストリンが溶解した溶液を晶析して得られた請求項 1 記載の甘味料組成物。
8. アスパルチルジペプチドエステル化合物及びシクロデキストリンが溶解した溶液を凍結乾燥して得られた請求項 1 記載の甘味料組成物。
9. アスパルチルジペプチドエステル化合物及びシクロデキストリンを混合粉碎して得られた請求項 1 記載の甘味料組成物。
10. 請求項 1 乃至 9 記載の甘味料組成物を含有する飲食物。
11. 請求項 1 乃至 9 記載の甘味料組成物を含有する飲料。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/003140

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ A23L1/236, A23L1/22

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)

Int.Cl⁷ A23L1/22-A23L1/236

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP 8-503206 A (Nofre Claude, TINTI, Jean-Marie), 09 April, 1996 (09.04.96), & WO 94/11391 A1	1-11
Y	JP 2-138950 A (Ajinomoto Co., Inc.), 28 May, 1990 (28.05.90), & JP 59-002671 A & DE 3368182 G & EP 97950 B2	1-11
Y	JP 62-114166 A (Showa Sangyo Co., Ltd.), 20 June, 1987 (20.06.87), (Family: none)	1-11

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ 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
04 June, 2004 (04.06.04)Date of mailing of the international search report
22 June, 2004 (22.06.04)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A23L1/236, A23L1/22

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A23L1/22~A23L1/236

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	JP 8-503206 A (ノル、クロウト、ティンチ、ジャン・マリ) 1996. 04. 09 & WO 94/11391 A1	1-11
Y	JP 2-138950 A (味の素株式会社) 1990. 05. 28 & JP 59-002671 A & DE 3368182 G & EP 97950 B2	1-11
Y	JP 62-114166 A (昭和産業株式会社) 1987. 06. 20 (ファミリーなし)	1-11

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

04. 06. 2004

国際調査報告の発送日

22. 6. 2004

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

鈴木 恵理子

4N

8114

電話番号 03-3581-1101 内線 3448