

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載  
 【部門区分】第3部門第2区分  
 【発行日】平成22年1月14日(2010.1.14)

【公表番号】特表2009-517385(P2009-517385A)  
 【公表日】平成21年4月30日(2009.4.30)  
 【年通号数】公開・登録公報2009-017  
 【出願番号】特願2008-542356(P2008-542356)  
 【国際特許分類】

A 6 1 K 47/26 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/10 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/18 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/34 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/26  
 A 6 1 K 47/10  
 A 6 1 K 47/18  
 A 6 1 K 47/34  
 A 6 1 K 47/02

【手続補正書】

【提出日】平成21年11月16日(2009.11.16)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

薬学的活性物質と甘味料組成物を含む医薬組成物であって、該甘味料組成物がレバウジオシドA組成物と甘み改善ポリオールを含み、

前記レバウジオシドA組成物が、レバウジオシドA及び他のステviolグリコシド類を含み、

前記レバウジオシドA組成物が、乾燥状態の重量で約50重量%から約99.5重量%レバウジオシドAである純度を有し、

前記レバウジオシドAが、無水レバウジオシドA多型体、レバウジオシドA溶媒和物多型体、非結晶レバウジオシドA、又はこれらの組合せを含み、

前記レバウジオシドA組成物及びポリオールが、前記甘味料組成物内に重量比で約1:50から約1:800の範囲で存在する、医薬組成物。

【請求項2】

薬学的活性物質と甘味料組成物を含む医薬組成物であって、該甘味料組成物がレバウジオシドA組成物と甘み改善炭水化物を含み、

前記レバウジオシドA組成物が、レバウジオシドA及び1つ又はそれ以上の他のステviolグリコシド類を含み、

前記レバウジオシドA組成物が、乾燥状態の重量で約50重量%から約99.5重量%レバウジオシドAである純度を有し、

前記レバウジオシドAが、無水レバウジオシドA多型体、レバウジオシドA溶媒和物多型体、非結晶レバウジオシドA、又はこれらの組合せを含み、

前記炭水化物が、前記甘味料組成物内に約1,000から約80,000ppmの量で

存在する、医薬組成物。

【請求項 3】

薬学的活性物質と甘味料組成物を含む医薬組成物であって、該甘味料組成物がレバウジ  
オシド A 組成物と甘み改善アミノ酸を含み、

前記レバウジオシド A 組成物が、レバウジオシド A 及び 1 つ又はそれ以上の他のステビ  
オルグリコシド類を含み、

前記レバウジオシド A 組成物が、乾燥状態の重量で約 50 重量% から約 99.5 重量%  
レバウジオシド A である純度を有し、

前記レバウジオシド A が、無水レバウジオシド A 多型体、レバウジオシド A 溶媒和物多  
型体、非結晶レバウジオシド A、又はこれらの組合せを含み、

前記アミノ酸が、前記甘味料組成物内に約 100 から約 25,000 ppm の量で存在  
する、医薬組成物。

【請求項 4】

薬学的活性物質と甘味料組成物を含む医薬組成物であって、前記甘味料組成物が、レバ  
ウジオシド A 組成物並びに少なくとも 1 つの有機酸、少なくとも 1 つの無機酸、少なくと  
も 1 つの有機塩及び少なくとも 1 つの無機塩からなる群から選択される 1 つ又はそれ以上  
の甘み改善組成物を含み、

前記レバウジオシド A 組成物が、レバウジオシド A 及び 1 つ又はそれ以上の他のステビ  
オルグリコシド類を含み、

前記レバウジオシド A 組成物が、乾燥状態の重量で約 50 重量% から約 99.5 重量%  
レバウジオシド A である純度を有し、

前記レバウジオシド A が、無水レバウジオシド A 多型体、レバウジオシド A 溶媒和物多  
型体、非結晶レバウジオシド A、又はこれらの組合せを含む、医薬組成物。

【請求項 5】

前記レバウジオシド A 組成物が、乾燥状態の重量で約 80 重量% から約 99.5 重量%  
レバウジオシド A である純度を有する、請求項 1 - 4 いずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記レバウジオシド A 組成物が、乾燥状態の重量で約 1 から約 5 重量% の量のレバウジ  
オシド B と、乾燥状態の重量で約 1 から約 10 重量% の量のレバウジオシド C と、乾燥状  
態の重量で約 0.1 から約 4 重量% の量のレバウジオシド E と、乾燥状態の重量で約 0.  
1 から約 4 重量% の量のレバウジオシド F と、乾燥状態の重量で約 0.1 から約 4 重量%  
の量のズルコシド A と、乾燥状態の重量で約 0.1 から約 4 重量% の量のズルコシド B と  
、乾燥状態の重量で約 0.5 から約 10 重量% の量のステビオシドと、乾燥状態の重量で  
約 0.1 から約 4 重量% の量のステビオルピオシドとをさらに含む、請求項 1 - 5 いずれ  
か 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記レバウジオシド A 組成物が、約 30% / 5 分より大きい溶解速度を有する、請求項  
1 - 5 いずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記レバウジオシド A 組成物及びポリオールが、前記甘味料組成物内に約 1 : 75 から  
約 1 : 150 の範囲の重量比で存在する、請求項 1、5 - 7 いずれか 1 項に記載の医薬組  
成物。

【請求項 9】

前記レバウジオシド A 組成物が、前記医薬組成物内に約 100 から約 3,000 ppm  
の量で存在する、請求項 1 - 8 いずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記ポリオールが、前記医薬組成物内に約 5,000 から約 35,000 ppm の量で  
存在する、請求項 1、5 - 9 いずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記ポリオールが、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、イノシトール、イソマルト、プロピレングリコール、グリセロール、又はこれらの組合せからなる群から選択される、請求項 1、5 - 10 いずれか 1 項に記載の医薬組成物。

**【請求項 1 2】**

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、ヌクレオチド、有機酸、無機酸、有機酸塩及び有機塩基塩を含む有機塩、無機塩、苦み化合物、香味料、渋み化合物、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、人工甘味料およびそれらの組み合わせから成る群から選択される少なくとも 1 つの他の甘み改善組成物をさらに含む、請求項 1 - 11 いずれか 1 項に記載の医薬組成物。

**【請求項 1 3】**

少なくとも 1 つの有機酸、少なくとも 1 つの無機酸、少なくとも 1 つの有機塩及び少なくとも 1 つの無機塩からなる群から選択される 1 つ又はそれ以上の甘み改善組成物をさらに含む、請求項 1 - 3、5 - 12 いずれか 1 項に記載の医薬組成物。

**【請求項 1 4】**

少なくとも 1 つの有機酸又は少なくとも 1 つの有機塩、又はこれらの組合せをさらに含む、請求項 1 - 3、5 - 12 いずれか 1 項に記載の医薬組成物であって、

前記少なくとも 1 つの有機酸が、乳酸、クエン酸、リンゴ酸、酒石酸、アスコルビン酸及びこれらの組合せからなる群から選択され、

前記少なくとも 1 つの有機塩が、塩化コリン、グルコン酸ナトリウム、グルコン酸カリウム、塩酸グアニジン、塩酸アミロライド、塩酸グルコサミン、グルタミン酸モノナトリウム、アデノシン 1 リン酸、グルコン酸マグネシウム、酒石酸カリウム、酒石酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム、クエン酸カリウム、乳酸ナトリウム、乳酸カリウム、リンゴ酸ナトリウム、リンゴ酸カリウム、及びこれらの組合せからなる群から選択される、医薬組成物。

**【請求項 1 5】**

少なくとも 1 つの無機塩又は少なくとも 1 つの無機酸、又はこれらの組合せをさらに含む、請求項 1 - 3、5 - 12 いずれか 1 項に記載の医薬組成物であって、

前記少なくとも 1 つの無機塩が、カリウム塩、ナトリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、及びこれらの組合せからなる群から選択される、医薬組成物。

**【請求項 1 6】**

少なくとも 1 つの有機酸又は少なくとも 1 つの有機塩、少なくとも 1 つの無機塩、及び少なくとも 1 つの無機酸をさらに含む請求項 1 - 3、5 - 12 いずれか 1 項に記載の医薬組成物であって、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも 1 つの有機酸又は少なくとも 1 つの有機塩の総量が、前記医薬組成物の約 10 から約 5,000 ppm の量であって、前記少なくとも 1 つの有機酸が、乳酸、クエン酸、リンゴ酸、酒石酸、アスコルビン酸及びこれらの組合せからなる群から選択され、前記少なくとも 1 つの有機塩が、塩化コリン、グルコン酸ナトリウム、グルコン酸カリウム、塩酸グアニジン、塩酸アミロライド、塩酸グルコサミン、グルタミン酸モノナトリウム、アデノシン 1 リン酸、グルコン酸マグネシウム、酒石酸カリウム、酒石酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム、クエン酸カリウム、乳酸ナトリウム、乳酸カリウム、リンゴ酸ナトリウム、リンゴ酸カリウム、及びこれらの組合せからなる群から選択され、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも 1 つの無機塩の総量が、前記医薬組成物の約 25 から約 5,000 ppm の量であって、前記少なくとも 1 つの無機塩が、カリウム塩、ナトリウム塩、カルシウム塩及びマグネシウム塩からなる群から選択され、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも 1 つの無機酸の総量が、前記医薬組成物の約 25 から約 5,000 ppm の量である、医薬組成物。

**【請求項 1 7】**

少なくとも 1 つの有機酸、少なくとも 1 つの無機酸、少なくとも 1 つの有機塩及び少な

くとも1つの無機塩とをさらに含む請求項1-3、5-12いずれか1項に記載の医薬組成物であって、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの有機酸の総量が、前記医薬組成物の約10から約5,000ppmの量であり、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの有機塩の総量が、前記医薬組成物の約20から約10,000ppmの量であり、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの無機酸の総量が、前記医薬組成物の約25から約5,000ppmの量であり、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの無機塩の総量が、前記医薬組成物の約25から約5,000ppmの量である、医薬組成物。

**【請求項18】**

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの有機酸が、前記医薬組成物の約40から約250ppmの量の乳酸、前記医薬組成物の約150から約460ppmの量のクエン酸、前記医薬組成物の約150から約460ppmの量のリンゴ酸及び前記医薬組成物の約150から約460ppmの量の酒石酸を含み、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの有機塩が、前記医薬組成物の約50から約350ppmの量であり、前記少なくとも1つの有機塩が塩化コリン、グルコン酸ナトリウム、グルコン酸カリウム、塩酸グアニジン、塩酸アミロライド、塩酸グルコサミン、グルタミン酸モノナトリウム、アデノシン1リン酸、グルコン酸マグネシウム、酒石酸カリウム、酒石酸ナトリウム、クエン酸ナトリウム、クエン酸カリウム、乳酸ナトリウム、乳酸カリウム、リンゴ酸ナトリウム、リンゴ酸カリウム、及びその組合せからなる群から選択され、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの無機塩が、前記医薬組成物の約50から約250ppmの量のカリウム塩、ナトリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、又はこれらの組合せを含む、請求項17に記載の医薬組成物。

**【請求項19】**

前記医薬組成物内に、少なくとも1つのアミノ酸をさらに前記医薬組成物の約100から約25,000ppmの量で含む、請求項1、2、4-18いずれか1項に記載の医薬組成物。

**【請求項20】**

前記少なくとも1つのアミノ酸が、アラニン、イソロイシン、グリシン又はこれらの組合せを含む、請求項19に記載の医薬組成物。

**【請求項21】**

少なくとも1つの有機酸又は少なくとも1つの有機塩、少なくとも1つの無機塩、少なくとも1つの無機酸及び少なくとも1つのアミノ酸をさらに含む請求項1、2、4-12いずれか1項に記載の医薬組成物であって、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの有機酸又は少なくとも1つの有機塩の総量が、前記医薬組成物の約10から約5,000ppmの量であり、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの無機酸の総量が、前記医薬組成物の約25から約5,000ppmの量であり、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つの無機塩の総量が、前記医薬組成物の約25から約5,000ppmの量であり、

前記医薬組成物内に存在する前記少なくとも1つのアミノ酸の総量が、前記医薬組成物の約100から約25,000ppmの量である、医薬組成物。

**【請求項22】**

前記レバウジオシドA組成物が10重量%のショ糖水溶液と等しい最大甘み強度を与えるのに十分な量で前記甘味料組成物の水溶液中に存在する場合に、前記1つ又はそれ以上の甘み改善組成物が、前記水溶液に10ミリオスモル/Lから500ミリオスモル/Lのオスモル濃度を与えるのに有効な量だけ、前記甘味料組成物内に存在する、請求項1-21いずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 23】

前記医薬組成物内に、少なくとも1つの炭水化物をさらに前記医薬組成物の約1,000から約100,000ppmの量で含む、請求項1、3-22いずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 24】

前記医薬組成物内に、少なくとも1つのポリマーをさらに前記医薬組成物の約30から約2,000ppmの量で含む、請求項1-23いずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 25】

前記医薬組成物内に、少なくとも1つの界面活性剤をさらに前記医薬組成物の約1から約5,000ppmの量で含む、請求項1-24いずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 26】

前記医薬組成物内に、少なくとも1つのポリアミノ酸をさらに前記医薬組成物の約30から約2,000ppmの量で含む、請求項1、2、4-25いずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 27】

前記医薬組成物内に、少なくとも1つのフラボノイドをさらに前記医薬組成物の約0.1から約1,000ppmの量で含む、請求項1-26いずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 28】

薬学的活性物質と甘味料組成物とを含む医薬組成物であって、前記甘味料組成物が、実質的に、レバウジオシドA組成物、ポリオール、並びに、少なくとも1つの有機酸、少なくとも1つの有機塩、少なくとも1つの無機酸及び少なくとも1つの無機塩からなる群から選択される1つ又はそれ以上の甘み改善組成物からなり、

前記レバウジオシドA組成物が、乾燥状態の重量で約80重量%レバウジオシドAより高い純度を有し、

前記ポリオールが、前記医薬組成物内に該医薬組成物の約5,000から約35,000ppmの量で存在し、

前記レバウジオシドA及びポリオールが、前記医薬組成物内に約1:50から約1:300の範囲の重量比で存在し、

前記少なくとも1つの有機酸が、前記医薬組成物内に該医薬組成物の約10から約5,000ppmの量で存在し、

前記少なくとも1つの有機塩が、前記医薬組成物内に該医薬組成物の約20から約10,000ppmの量で存在し、

前記少なくとも1つの無機酸が、前記医薬組成物内に該医薬組成物の約25から約5,000ppmの量で存在し、

前記少なくとも1つの無機塩が、前記医薬組成物内に該医薬組成物の約25から約5,000ppmの量で存在する、医薬組成物。

## 【請求項 29】

より砂糖に似た経時的プロファイル、より砂糖に似た香味プロファイル、又はその両方を医薬組成物に与えるための方法であって、薬学的活性物質とレバウジオシドA組成物を含む甘味料組成物をポリオールと混合する工程を含み、

前記レバウジオシドA組成物が、レバウジオシドA及び他のステビオルグリコシド類を含み、

前記レバウジオシドA組成物が、乾燥状態の重量で約50重量%から約99.5重量%レバウジオシドAである純度を有し、

前記レバウジオシドAが、無水レバウジオシドA多型体、レバウジオシドA溶媒和物多型体、非結晶レバウジオシドA、又はこれらの組合せを含み、

前記レバウジオシドA組成物及びポリオールが、前記甘味料組成物内に重量比で約1:50から約1:800の範囲で存在する、方法。

## 【請求項 30】

前記薬学的活性物質が、制酸剤、逆流抑止剤、整腸剤、抗ドーパミン作用薬、プロトンポンプ阻害剤、細胞保護剤、プロスタグランジン類似体、緩下剤、抗痙攣剤、下痢止め薬、胆汁酸抑制剤、オピオイド、ベータ受容体遮断剤、カルシウム・チャンネル遮断剤、利尿剤、強心配糖剤、不整脈予防剤、硝酸塩、抗狭心症剤、血管収縮剤、血管拡張剤、抹消活性剤、ACE阻害剤、アンギオテンシン受容体遮断剤、遮断剤、抗凝血剤、ヘパリン、抗血小板薬、線維素溶解剤、抗血友病因子、止血薬、脂質降下薬、スタチン、ハイノプテイクス、麻酔薬、抗精神病薬、抗鬱剤、制吐剤、鎮痙剤、抗癲癇剤、抗不安薬、鎮静剤、運動障害薬、興奮剤、ベンゾジアゼピン、シクロピロロン、ドーパミン拮抗剤、抗ヒスタミン剤、コリン作動薬、抗コリン作動薬、吐剤、カンナビノイド、鎮痛剤、筋肉弛緩剤、抗生物質、アミノ配糖体、抗ウィルス剤、抗真菌薬、抗炎症剤、抗緑内障薬、交感神経様作用剤、ステロイド、耳垢溶解薬、気管支拡張剤、NSAIDs、鎮咳薬、粘液溶解剤、充血除去剤、コルチコステロイド、アンドロゲン、抗アンドロゲン、ゴナドトロピン、成長ホルモン、インスリン、抗糖尿病薬、甲状腺ホルモン、カルシトニン、ジホスホネート、パソプレシン類似体、アルカリ化剤、キノロン、抗コリンエステラーゼ剤、シルデナフィル、経口避妊薬、ホルモン置換療法薬、骨調整剤、卵胞刺激ホルモン、黄体ホルモン、ガモレン酸、プロゲステゲン、ドーパミン作用薬、エストロゲン、プロスタグランジン、ゴナドレリン、クロミフェン、タモキシフェン、ジエチルスチルベストロール、抗ハンセン菌薬、抗結核薬、抗マラリア薬、駆虫薬、抗原虫薬、抗血清、ワクチン、インターフェロン、強壯剤、ビタミン、細胞毒性薬、性ホルモン、アロマターゼ阻害剤、ソマトスタチン阻害剤、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される物質を含む、請求項1 - 28いずれか1項に記載の医薬組成物又は請求項29に記載の方法。

【請求項31】

バルク甘味料をさらに含む、請求項1 - 28、30いずれか1項に記載の医薬組成物又は請求項29 - 30いずれか1項に記載の方法。

【請求項32】

前記天然の高効能甘味料が、前記医薬組成物の約50ppmから約3000ppmの範囲の量で前記医薬組成物内に存在する、請求項1 - 28、30、31いずれか1項に記載の医薬組成物又は請求項29 - 31いずれか1項に記載の方法。