

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第4384263号
(P4384263)

(45) 発行日 平成21年12月16日(2009.12.16)

(24) 登録日 平成21年10月2日(2009.10.2)

(51) Int. Cl.	F 1
A 2 3 L 1/236 (2006.01)	A 2 3 L 1/236
A 6 1 K 47/26 (2006.01)	A 6 1 K 47/26

請求項の数 6 (全 6 頁)

(21) 出願番号	特願平10-515183	(73) 特許権者	500175772
(86) (22) 出願日	平成9年8月9日(1997.8.9)		ズートツッカー アクチェンゲゼルシャフ
(65) 公表番号	特表2001-504687(P2001-504687A)		ト マンハイム/オクセンフルト
(43) 公表日	平成13年4月10日(2001.4.10)		ドイツ連邦共和国 ディー-68165
(86) 国際出願番号	PCT/EP1997/004346		マンハイム, マキシミリアンシュトラーセ
(87) 国際公開番号	W01998/012936		10
(87) 国際公開日	平成10年4月2日(1998.4.2)	(74) 代理人	100091096
審査請求日	平成15年10月1日(2003.10.1)		弁理士 平木 祐輔
審査番号	不服2007-17659(P2007-17659/J1)	(74) 代理人	100096183
審査請求日	平成19年6月25日(2007.6.25)		弁理士 石井 貞次
(31) 優先権主張番号	19639343.4	(74) 代理人	100118773
(32) 優先日	平成8年9月25日(1996.9.25)		弁理士 藤田 節
(33) 優先権主張国	ドイツ(DE)	(72) 発明者	ラップ, ナット, エム.
			ドイツ連邦共和国 ディー-67591
			オフスタイン, イン ケルネール 16
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 甘味料混合物を含む圧縮組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

1, 6 - G P S (6 - O - - D - グルコピラノシル - D - ソルビトール)、1, 1 - G P S (1 - O - - D - グルコピラノシル - D - ソルビトール) 及び 1, 1 - G P M (1 - O - - D - グルコピラノシル - D - マンニトール) からなる甘味料混合物を、圧縮しゃぶり錠剤の重量に対して 50 ~ 99 % 含む圧縮しゃぶり錠剤であって、該甘味料混合物が甘味料混合物の重量に対して 10 ~ 50 重量% の 1, 6 - G P S、2 ~ 20 重量% の 1, 1 - G P S 及び 30 ~ 70 重量% の 1, 1 - G P M を含む、上記圧縮しゃぶり錠剤。

【請求項 2】

圧縮しゃぶり錠剤がさらにモノサッカライド、ジサッカライド、モノサッカライドアルコール、ジサッカライドアルコール、でんぷん、でんぷん誘導体、セルロース、セルロース誘導体又はイヌリンを含む、請求項 1 に記載の圧縮しゃぶり錠剤。

【請求項 3】

圧縮しゃぶり錠剤がさらに強力甘味料、特にアセスルフェーム K、タウマチン、グリシリジン、サッカリン又はシクラメートを含む、請求項 1 又は 2 に記載の圧縮しゃぶり錠剤。

【請求項 4】

圧縮しゃぶり錠剤がさらに香料、特に果実若しくはペパーミント香料、着色料、又は重炭酸塩若しくはカルボキシメチルセルロースなどの崩壊剤を含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の圧縮しゃぶり錠剤。

10

20

【請求項 5】

圧縮しゃぶり錠剤がさらに薬学的に活性な成分、特に酵素、補酵素、抗生物質、殺菌若しくは殺カビ作用物質、ニコチン、カフェイン、メントール又はユーカリプトールを含む、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の圧縮しゃぶり錠剤。

【請求項 6】

圧縮しゃぶり錠剤がそしゃく錠剤の形である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の圧縮しゃぶり錠剤。

【発明の詳細な説明】

本発明は 1 - O - β - D - グルコピラノシル - D - ソルビトールを含む甘味料混合物を含む圧縮組成物に関する。特に本発明は、6 - O - β - D - グルコピラノシル - D - ソルビトール、1 - O - β - D - グルコピラノシル - D - ソルビトール及び 1 - O - β - D - グルコピラノシル - D - マンニトールからなる甘味料混合物を含む圧縮組成物、ならびにこの甘味料混合物の圧縮組成物への使用に関する。

10

圧縮組成物とは圧縮された成分からなる嗜好品、医薬品又は食品である。従って圧縮組成物は一般に担体又は希釈剤、結合剤、離型剤又は滑沢剤及び有効な活性成分、例えば矯味物質、薬物又は甘味料を含む。担体又は希釈剤としてしばしばシュクロース、ラクトース、グルコース、でんぷん又はマンニトールが使用される。これらの担体又は希釈剤の使用は、十分な圧縮性を保証するために、さらに結合剤が必要であるという欠点がある。

EP - B 1 0 0 2 8 9 0 5 は錠剤に希釈剤としてイソマルツロース (isomaltulose) を使用することを記載する。ところがイソマルツロースは比較的僅かな甘味しかない。

20

そこで本発明の根底にある技術的問題は、前記の欠点を克服し、特に改善された甘味、溶解性及び圧縮性を有する圧縮組成物を提供することである。

この技術的問題の解決策は、主請求項で特徴づけられ、1 - O - β - D - グルコピラノシル - D - ソルビトール (以下略して 1, 1 - G P S と称する) を含む圧縮組成物、特に 6 - O - β - D - グルコピラノシル - D - ソルビトール (以下略して 1, 6 - G P S と称する)、1 - O - β - D - グルコピラノシル - D - ソルビトール及び 1 - O - β - D - グルコピラノシル - D - マンニトール (以下略して 1, 1 - G P M と称する) からなる甘味料混合物を含む圧縮組成物に基づく。本発明の圧縮組成物は、1, 1 - G P S の含有、特に 1, 6 - G P S、1, 1 - G P S 及び 1, 1 - G P M からなる甘味料混合物の含有により、市販の Isomalt[®] (1, 6 - G P S と 1, 1 - G P S、水素化イソマルツロースの等モル混合物) を含む圧縮組成物に比して改善された溶解性と甘味を有する。本発明による圧縮組成物は、結合剤を使用せずに製造することができ、改善された圧縮性を有する、即ち所定の硬さを得るのに比較的小さなプレス圧力で済むという意外な利点を有する。本発明による圧縮組成物の改善された圧縮性に伴う別の利点は、比較的小さな主プレス圧力で大きな硬さが得られることである。

30

本発明のその他の有利な実施態様は従属請求項で明らかである。

本発明の好適な実施形態は、甘味料混合物の重量に対して 10 から 50 重量%の 1, 6 - G P S、2 から 20 重量%の 1, 1 - G P S 及び 30 から 70 重量%の 1, 1 - G P M からなる甘味料混合物を含む圧縮組成物に関する。本発明の他の特に好適な実施形態は、甘味料混合物の重量に対して 5 から 10 重量%の 1, 6 - G P S、30 から 40 重量%の 1, 1 - G P S 及び 45 から 60 重量%の 1, 1 - G P M からなる甘味料混合物を含む圧縮組成物に関する。後者の甘味料混合物は、1, 1 - G P S 含量を増加させ、1, 1 - G P M 含量を減少させたことによって、一層改善された甘味と水溶液での溶解性を圧縮組成物に付与する。

40

本発明の特に好適な実施形態では、圧縮組成物は圧縮組成物の重量に対して 50 から 99 重量%の 1, 1 - G P S 又は甘味料混合物を有する。圧縮組成物はさらにモノサッカライド、ジサッカライド、モノサッカライドアルコール、ジサッカライドアルコール、でんぷん、でんぷん誘導体、セルロース、セルロース誘導体又はイヌリンを含むことができる。圧縮組成物は特にソルビトール、マンニトール、水素化又は非水素化オリゴ糖、キシリトール又は糖、例えばシュクロース、グルコース、フルクトース又はキシロースを含むこと

50

ができる。しかしこれらは圧縮組成物の重量に対して30重量%未満、とりわけ5重量%未満の量であることが好ましい。但し特に有利な実施態様では、本発明による圧縮組成物は無糖であり、従ってカロリー値が減少されており、糖尿病患者に適する。

本発明の特に好適な実施形態では、圧縮組成物がさらに強力甘味料例えばアセスルフェームK (acesulfame-K)、アスパルテーム (aspartame)、シクラメート (cyclamate)、グリシルリジン (glycyrrhizin)、タウマチン、サッカリン又は類似物質等を含むものとする。本発明による圧縮組成物はそのほか矯味物質又は香料、例えばレモン又はペパーミント香料を含むことが好ましい。また本発明による圧縮組成物は食品適合性の酸、例えばアスコルビン酸又はクエン酸及び滑沢剤として脂肪酸又はその塩、例えばステアリン酸マグネシウム又はステアリン酸ナトリウムを含むことができる。最後に、本発明による圧縮組成物に着色料及び/又は崩壊剤例えば重炭酸塩又はカルボキシメチルセルロースが含まれるようにすることができる。

特に好適な実施形態では、薬学的に活性な成分を口腔及び咽腔へ運び、そこで放出することができる圧縮組成物を提供する。本発明の明細書において、薬学的に活性な成分とは、人間又は動物の身体に対して所望の予防又は治療効果を有する物質のことである。従ってこの物質は特に欠乏状態又は症状の予防又は治療に役立つ。本発明によれば、例えば酵素、補酵素、鉱物質、ビタミン、抗生物質、殺菌又は殺カビ作用物質、ニコチン、カフェイン、ユーカリプトール、コデイン、フェナセチン、アセチルサリチル酸、メントール又はその他の薬学的に活性な成分を圧縮組成物に封入することができる。薬学的に活性な成分は所望の薬学的効果を生じる量で用意しなければならない。本発明の圧縮組成物は、穏やかな消化と特殊な溶解挙動によって、薬学的に活性な成分を口腔及び咽腔へ運ぶのに特に適している。Isomalt[®]含有及び含糖圧縮組成物は比較的溶解しにくいので、活性成分の放出が遅れる。本発明による圧縮組成物の活性成分の放出は急速に始まって長く持続する利点がある。

本発明のさらなる実施形態はしゃぶり又はそしゃく錠剤の形態の圧縮組成物に関する。最後に本発明は、粉末混合物又はそれから作られる圧縮組成物でその圧縮性の改善のための1,1-GPS又は1,6-GPS、1,1-GPM及び1,1-GPSからなる甘味料混合物の使用に関する。

下記の実施例と図は本発明の詳細を説明する。

図は本発明による圧縮組成物と従来の圧縮組成物の溶解の動力学を図表の形で示す。

実施例1：しゃぶり錠剤(そしゃく錠剤)の調製

処方

甘味料混合物の重量に対し2重量%の1,1-GPS、37重量%の1,6-GPS及び53重量%の1,1-GPMを含む甘

味料混合物	19.54 kg
アセスルフェームK	30 g
アスパルテーム	30 g
ペパーミント香料	200 g
メントール	100 g
ステアリン酸マグネシウム	100 g

調製

成分を混合し、ロータリーペレットプレス、フェッテ(Fette)P1200で下記の条件でプレスする。

プレス力 20から70 kN

しゃぶり錠剤の製造には1,6-GPS含量を増加させた混合物を、そしゃく錠剤の製造には1,1-GPS含量を増加させた混合物を使用することが好ましい。いずれの場合も助剤は必要でない。

均質に圧縮成形された硬い、容易に溶解する圧縮組成物が得られる。

実施例2：圧縮組成物の溶解の動力学

本発明による1,1-GPSを含む圧縮組成物と、これと比較してIsomalt[®]及びシクロースを含む圧縮組成物との溶解挙動の比較のために、種々の圧縮組成物の溶解の動力学を記録した。Isomalt[®]を含む圧縮組成物は1,1-GPSを含まないで、次のような組成である。19.54kg Isomalt[®]、200gペパーミント香料、100gメントール、100gステアリン酸マグネシウム、30gアセスルフェームK、30gアスパルテーム。

シクロースを含む圧縮組成物は同じく1,1-GPSを含まないで、次のような組成である。19.6kgシクロース、200gユーカリプトール・メントール、100gメントール、100gステアリン酸マグネシウム。

本発明の1,1-GPSを含む圧縮組成物を実施例1により調製した。

10

溶解挙動をLMBG(食品及び生活必需品法)35条による溶液で37℃で決定した。圧縮組成物が完全に溶解すると10%溶液となるように、使用する溶剤と圧縮組成物の量を選定した。溶液の濃度は時間と濃度の関数として決定し、それから溶液(c、図を参照)100g当りの乾燥物gで濃度を決定した。

図は、1,1-GPSを含む圧縮組成物がIsomalt[®]を含む圧縮組成物に比して高い溶解性を有することを示す。また含糖圧縮組成物と比較して溶解の動力学の変化が生じる。即ち1,1-GPS含有圧縮組成物は特に溶解過程の初めに急速に溶解する。従って本発明による圧縮組成物は、例えば薬剤の適用のために利用可能な担体の範囲を拡張する利点がある。

実施例3: 圧縮試験

20

製造のために必要なプレス圧力と得られる硬さに関して、本発明による圧縮組成物とIsomalt[®]及びシクロースからなる圧縮組成物とを比較するために、次の圧縮試験を行った。

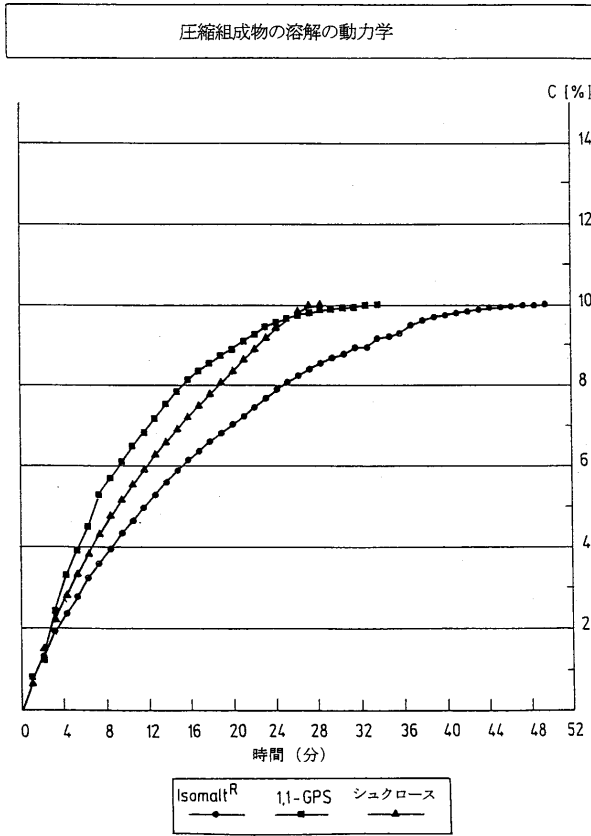
本発明による圧縮組成物の組成は、実施例1の処方に相当した。

対照圧縮組成物として、実施例2で記載した組成のIsomalt[®]及びシクロース混合物を使用した。

圧縮試験はロータリーペレットプレス、フェッテP1200で行い、プランジャは円形で面取りしてあった。プランジャの直径は20mmであった。ロータリーペレットプレスに円形のロッドホイールを装備した。

Isomalt[®]の圧縮成形のために24.3kNの予備プレス圧力と65.4kNの主プレス圧力が必要であって、硬さ76Nの圧縮組成物が得られた。シクロースの圧縮成形のために24.0kNの予備プレス圧力と65.0kNの主プレス圧力が必要であって、硬さ128Nの圧縮組成物が得られた。それと対照的に本発明の圧縮組成物の圧縮成形には28.3kNの予備プレス圧力と49.4kNの主プレス圧力が必要であり、得られた圧縮組成物は204Nの硬さを有した。それゆえ、本発明による圧縮組成物はより低い主プレス圧力で製造することができ、先行技術より硬い圧縮組成物が得られるという利点がある。

30



フロントページの続き

(72)発明者 ウィリバルド エトル, イングリッド
ドイツ連邦共和国 デー 7 6 8 2 9 ランドウ, アルツハイマー シュトラーセ 3 6

合議体

審判長 柳 和子

審判官 西川 和子

審判官 坂崎 恵美子

(56)参考文献 特開平 7 - 5 1 0 7 9 (J P , A)
特公昭 5 6 - 3 8 5 9 9 (J P , B 2)
特開平 7 - 2 4 1 1 7 4 (J P , A)
別冊フードケミカル4, (株)食品化学新聞社, 1990年12月20日, 171 - 188

(58)調査した分野(Int.Cl., D B名)

A23L1/236

A61K9/20

A61K47/26