



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 103781367 A

(43) 申请公布日 2014. 05. 07

(21) 申请号 201280027081. 3

阮世英 努·万德赖

(22) 申请日 2012. 06. 01

(74) 专利代理机构 上海胜康律师事务所 31263

代理人 李献忠

(30) 优先权数据

11168468. 4 2011. 06. 01 EP

61/492, 073 2011. 06. 01 US

(51) Int. Cl.

A23L 1/236(2006. 01)

C07H 15/256(2006. 01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2013. 12. 02

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2012/060344 2012. 06. 01

(87) PCT国际申请的公布数据

W02012/164062 DE 2012. 12. 06

(71) 申请人 西姆莱斯股份公司

地址 德国霍尔茨明登

(72) 发明人 雅各布·雷 凯塔琳娜·里奇特

卡特娅·奥布斯特

卢德格尔·威斯约翰

赛宾·威斯约翰 德兰·万宋

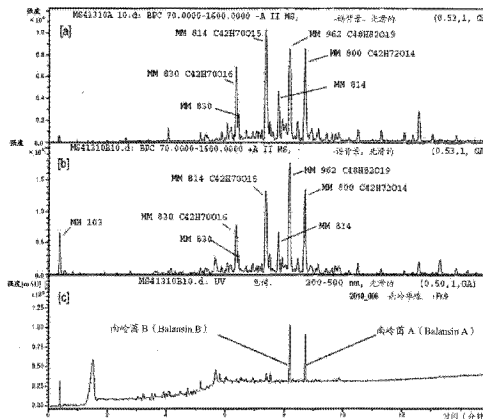
权利要求书6页 说明书54页 附图2页

(54) 发明名称

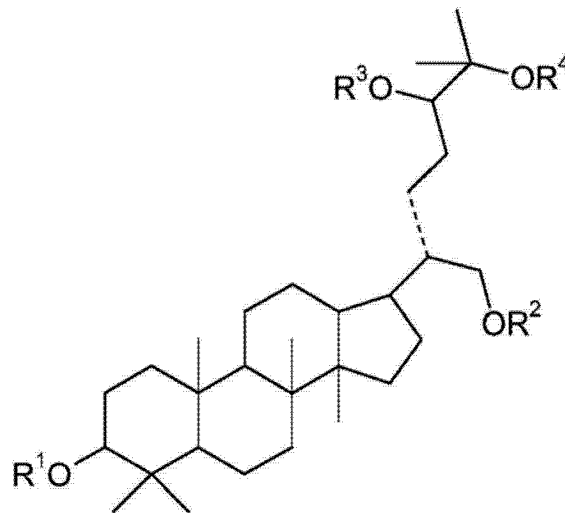
包含一些甜味三萜类和三萜甙类的口服制剂

(57) 摘要

本发明涉及式(I)的三萜类或三萜甙和/或其生理上可接受的盐,优选地,来自 Mycetia balansae 的天然生成的三萜类和三萜甙和/或其生理上可接受的盐以及含有一种或多种这种三萜类和三萜甙和/或其生理上可接受的盐的口服制剂。本发明还涉及这些三萜类和三萜甙和/或其生理上可接受的盐,优选地, Mycetia balansae 的提取物在生成口服制剂中的甜味印象或加强含有至少一种其它的、优选天然生成的甜味物质的口服制剂的甜味印象方面的用途。最后,本发明还涉及生产口服制剂的方法以及生成和/或加强口服制剂中的甜味印象的方法。



1. 式(I)的化合物或式(I)的化合物的生理上可接受的盐



(I)

其中,

虚线表示单键或双键,以及

R^1 , R^2 , R^3 和 R^4 分别彼此独立地表示氢或糖残基,优选地,单糖残基或寡糖残基,

其特征在于,优选地,所述式(I)的化合物的生理上可接受的盐的配对阳离子选自来自第一级基团和二级基团的带正电荷的单价阳离子、铵离子、三烷基铵离子、来自第二二级基团的二价阳离子、来自第三级基团和二级基团的三价阳离子,优选地,选自 Na^+ 、 K^+ 、 NH_4^+ 、 Ca^{2+} 、 Mg^{2+} 、 Al^{3+} 和 Zn^{2+} 。

2. 根据权利要求1所述的式(I)的化合物或式(I)的化合物的生理上可接受的盐,其特征在于,残基 R^1 , R^2 , R^3 和 R^4 中的至少一个表示氢,以及

所述残基 R^1 , R^2 , R^3 和 R^4 中的至少一个表示糖残基,优选地,所述糖残基选自以下物质,或者优选地,所述糖残基分别彼此独立地选自以下物质:

(i) 单糖残基葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基、鼠李糖基、岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基,以及

(ii) 2至10个简单糖组建结构的寡糖残基,优选地,所述简单糖组建结构选自葡萄糖、甘露糖、半乳糖、鼠李糖、岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

3. 根据权利要求1或2所述的化合物或生理上可接受的盐,其特征在于,残基 R^2 , R^3 和 R^4 中的两个或三个表示氢,以及

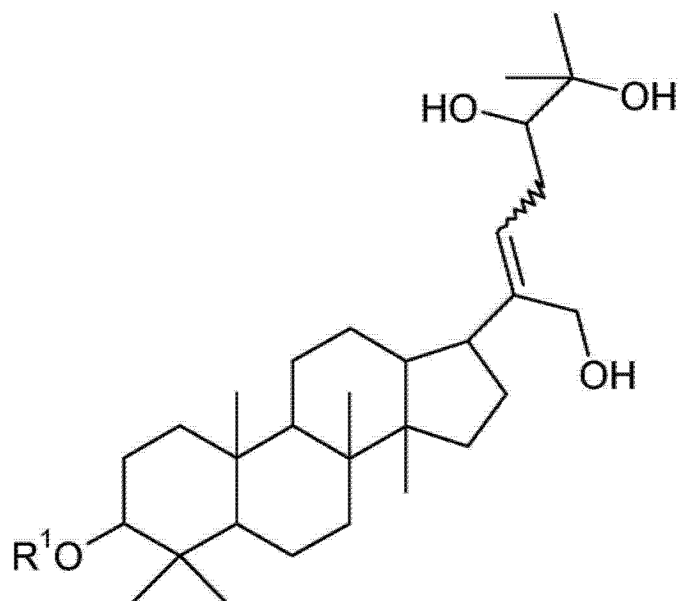
所述 R^2 , R^3 和 R^4 中的任选一个和残基 R^1 表示糖残基,优选地,所述糖残基选自以下物质,且优选地,所述糖残基分别彼此独立地选自以下物质:

(i) 单糖残基吡喃葡萄糖基、吡喃甘露糖基、吡喃半乳糖基、吡喃鼠李糖基、吡喃岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基,以及

(ii) 2至8个简单糖组建结构的寡糖残基,优选地,所述简单糖组建结构选自吡喃葡萄糖、吡喃甘露糖、吡喃半乳糖、吡喃鼠李糖、吡喃岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

4. 根据上述权利要求中任一项所述的化合物或生理上可接受的盐,其特征在于,所述化合物为式(II)的化合物或者所述生理上可接受的盐为式(II)的化合物的生理上可接受

的盐，



(II)

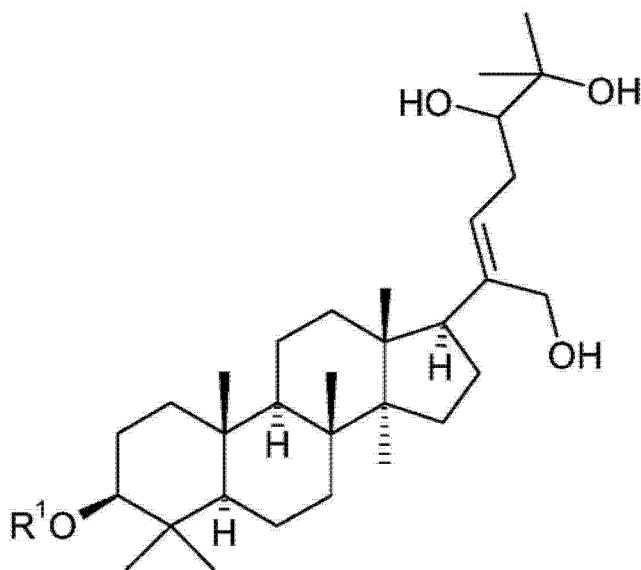
其特征在于，

R^1 为单糖残基、二糖残基、三糖残基、四糖残基或戊糖残基，优选地， R^1 选自：

(i) 葡糖基、甘露糖基、半乳糖基、鼠李糖基、岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基，以及

(ii) 2 至 5 个简单糖组建结构的寡糖残基，所述简单糖组建结构选自葡萄糖、甘露糖、半乳糖、鼠李糖、岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

5. 根据上述权利要求中任一项所述的化合物或生理上可接受的盐，其特征在于，所述化合物为式(III)的化合物或者所述生理上可接受的盐为式(III)的化合物的生理上可接受的盐，



(III)

其中, R^1 为单糖残基、二糖残基、三糖残基、四糖残基或戊糖残基, R^1 选自:

(i) 葡糖基、甘露糖基、半乳糖基、鼠李糖基、岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基, 以及

(ii) 2 至 5 个简单糖组建结构的寡糖残基, 所述简单糖组建结构选自葡萄糖、甘露糖、半乳糖、鼠李糖、岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

6. 根据权利要求 5 所述的式(III)的化合物或式(III)的化合物的生理上可接受的盐, 其特征在于,

R^1 为单糖残基、二糖残基、三糖残基、四糖残基或戊糖残基, 选自:

(i) 葡糖基、半乳糖基和鼠李糖基, 以及

(ii) 2 至 4 个简单糖组建结构的寡糖残基, 所述简单糖组建结构选自葡萄糖、甘露糖和鼠李糖, 优选地, 所述简单糖组建结构的部分在 2、4 和 / 或 6 位彼此结合。

7. 含有如下物质或由下述物质组成的混合物:

两种、三种或多种根据上述权利要求中任一项所述的化合物, 或者

一种、两种或多种根据上述权利要求中任一项所述的不同化合物以及一种、两种或多种根据上述权利要求中任一项所述的不同化合物的一种、两种或多种不同的生理上可接受的盐, 或者

根据上述权利要求中任一项所述的化合物的两种、三种或多种生理上可接受的盐,

其特征在于, 如果一种或多种根据上述权利要求中任一项所述的化合物的一种或多种生理上可接受的盐以混合物的形式提供, 优选地, 根据上述权利要求中任一项所述的化合物的所有生理上可接受的盐的配对阳离子选自 Na^+ 、 K^+ 、 NH_4^+ 、 Ca^{2+} 、 Mg^{2+} 、 Al^{3+} 和 Zn^{2+} 。

8. 植物提取物, 优选地, *Mycetia balansae* 的植物提取物, 所述植物提取物包含一种或多种根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物或根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物的生理上可接受的盐, 或者根据权利要求 7 所述的混合物, 其特征在于, 优选地, 这些化合物的总量以及这些化合物的生理上可接受的盐的总量占所述提取物的干质量的 0.00001wt% 至 99wt%, 优选地, 0.0001wt% 至 95wt%, 尤其优选地, 0.0005wt% 至 80wt%, 最优选地, 0.001wt% 至 30wt%。

9. 根据权利要求 8 所述的提取物, 其能通过具有下述步骤的方法获得:

a) 用提取剂一次或多次提取来自 *Mycetia balansae* 的植物原料, 所述提取剂优选为液体, 选自水、乙醇、甲醇、1-丙醇、2-丙醇、丙三醇、1,2-丙二醇、超临界二氧化碳、乙酸乙酯及其混合物,

并且, 如果需要的话, 还包括如下一个或多个其它步骤:

b) 如果需要的话, 浓缩步骤 a) 中获得的初级提取物, 优选地, 通过一种或多种蒸发或渗透蒸发的方式进行,

c) 如果需要的话, 用吸附剂或通过吸附剂处理初级提取物, 如果需要的话, 在步骤 b) 中进行处理, 优选地, 所述吸附剂选自硅胶、改良硅胶、活性炭、沸石、膨润土、硅藻土、氧化铝、碱性或酸性或中性, 优选大孔的离子交换剂, 优选地, 以分批法或柱式法, 如果需要的话, 在其它提取剂的辅助下, 以获得纯化的提取物(二级提取物),

d) 如果需要的话, 干燥步骤 c) 中获得的二级提取物, 优选地, 通过蒸发或渗透蒸发的方式进行,

e) 如果需要的话, 使步骤 d) 中获得的干燥的二级提取物与合适的稀释剂混合或使步

骤 d) 中获得的干燥的二级提取物与两种或多种稀释剂的混合物混合, 优选地, 所述稀释剂选自乙醇、异丙醇、1, 2- 丙二醇、植物油甘油三酯、甘油二乙酸酯、甘油三乙酸酯和丙三醇, 以优选地, 获得溶液。

10. 口服制剂, 其包含感官活性量的根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物和 / 或根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物的生理上可接受的盐, 根据权利要求 7 所述的混合物和 / 或根据权利要求 8 或 9 所述的提取物, 其特征在于, 优选地, 所述口服制剂选自营养制剂、膳食补充制剂、刺激性制剂、口服药物制剂、口腔护理产品、调味料组合物和美容制剂。

11. 根据权利要求 10 所述的口服制剂, 其还包含一种、两种、三种、四种、五种、六种、七种、八种、九种、十种或多种其它物质, 所述物质选自下列 (a1) 至 (a5) 组:

(a1) 调味料, 优选地, 一种、两种、三种、四种、五种或多种选自以下物质的调味料: 香草醛、乙基香草醛、2- 羟基 -4- 甲氧基苯甲醛、异丁酸乙基香兰酯 (=3 乙氧基 -4- 异丁酰氧苯甲醛)、**furaneol**[®] (2, 5- 二甲基 -4- 羟基 -3 (2H) - 呋喃酮) 及衍生物 (例如酱油酮、2- 乙基 -4- 羟基 -5- 甲基 -3 (2H) - 呋喃酮)、环高呋喃酮 (2- 乙基 -5- 甲基 -4- 羟基 -3 (2H) - 呋喃酮和 5- 乙基 -2- 甲基 -4- 羟基 -3 (2H) - 呋喃酮)、麦芽酚及其衍生物 (例如乙基麦芽酚)、香豆素及其衍生物、 γ - 内酯 (例如 γ - 十一碳内酯、 γ - 壬内酯)、 δ - 内酯 (例如 4- 甲基 δ - 内酯、芳香薄荷内酯、 δ 癸内酯、结节内酯)、山梨酸甲酯、双香草醛、4- 羟基 -2 (或 5) - 乙基 -5 (或 2) - 甲基 -3 (2H) 呋喃酮、2- 羟基 -3- 甲基 -2- 环戊烯酮、3- 羟基 -4, 5- 二甲基 -2 (5H) - 呋喃酮、果实酯类和果实内酯 (例如乙酸正丁酯、乙酸异戊酯、丙酸乙酯、丁酸乙酯、丁酸正丁酯、丁酸异戊酯、3- 甲基 - 丁酸乙酯、正己酸乙酯、正己酸烯丙酯、正己酸正丁酯、正辛酸乙酯、乙基 -3- 甲基 -3- 苯基环氧丙酸酯、乙基 -2- 反式 -4- 顺式 - 癸二烯酸酯)、4- (p- 羟苯基) -2- 丁酮、1, 1- 二甲氧基 -2, 2, 5- 三甲基 -4- 己烷, 2, 6- 二甲基 -5- 庚烯 -1- 醛和苯乙醛;

(a2) 选自下列物质的糖类: 蔗糖、海藻糖、乳糖、麦芽糖、松三糖、蜜二糖、棉子糖、帕拉金糖、乳果糖、D- 果糖、D- 葡萄糖、D- 半乳糖、L- 鼠李糖、D- 山梨糖、D- 甘露糖、D- 塔格糖、D- 阿拉伯糖、L- 阿拉伯糖、D- 核糖、D- 甘油醛、麦芽糊精和含有一种或多种上述糖类的植物制剂, 优选地, 所述糖类的比例为至少 5wt%, 优选地, 至少 15wt%, 其中, 所述糖类还可作为天然生成的或合成的混合物提供, 在该情况下, 尤其可作为蜂蜜、转化糖浆或来自玉米淀粉的高富集的果糖浆以及这些糖类的生理上可接受的盐, 尤其是钠盐、钾盐、钙盐或铵盐提供;

(a3) 糖醇, 优选地为选自以下物质的天然生成的糖醇: 丙三醇、赤藓糖醇、苏糖醇、阿糖醇、核糖醇、木糖醇、山梨醇、甘露醇、麦芽糖醇、异麦芽糖醇、半乳糖醇、乳糖醇以及这些糖醇的生理上可接受的盐, 尤其是钠盐、钾盐、钙盐或铵盐;

(a4) 天然生成的甜味剂, 优选地, 所述甜味剂选自:

(a4-1) 神秘果素、莫内林、马宾灵、奇异果甜蛋白、仙茅甜蛋白、布拉齐因、皮泰亭、D- 苯丙氨酸、D- 色氨酸以及获自含有这些氨基酸和 / 或蛋白质的自然资源中得到的提取物或片段以及这些氨基酸和 / 或蛋白质的生理上可接受的盐, 尤其是钠盐、钾盐、钙盐或铵盐;

(a4-2) 新橙皮苷二氢查尔酮、柚苷二氢查尔酮、甜菊苷、甜菊双糖苷、莱鲍迪苷, 尤其是莱鲍迪苷 A、莱鲍迪苷 B、莱鲍迪苷 C、莱鲍迪苷 D、莱鲍迪苷 E、莱鲍迪苷 F、莱鲍迪苷 G、莱鲍

迪昔 H, 杜尔可昔和甜叶悬钩子昔、甜茶昔 A、甜茶昔 B、甜茶昔 G、甜茶昔 H、甜茶昔 I、甜茶昔 J、白元参昔 1 白元参昔 2、糙苏昔 1、糙苏昔 2、糙苏昔 3 和糙苏昔 4、相思子三萜甙 A、相思子三萜甙 B、相思子三萜甙 C、相思子三萜甙 D、环卡司 A 和环卡司 I、奥斯雷丁、聚波朵昔 A、丝甜奇 1、丝甜奇 2、丝甜奇 4、赛桂因 A、二氢槲皮素-3-醋酸酯、紫苏萜、特洛莫思 A₁₅、巴西甘草甜素 I-V、蝶卡昔、环卡司、木库罗昔、反式茴香脑、反式肉桂醛、布赖斯、布赖诺斯、布赖诺卡斯、肉质雪胆皂昔、司地诺斯、绞股蓝皂昔、三叶昔、根皮昔、二氢黄烷醇、苏木精、青色素、绿原酸、合欢皂素、特洛莫思、甘查奥思、罗汉果昔、罗汉果昔 V、荷兰度辛、莽那亭、叶甜素、甘草次酸及甘草次酸的衍生物, 尤其是甘草次酸的昔类, 例如甘草甜素, 以及这些化合物的生理上可接受的盐, 尤其是钠盐、钾盐、钙盐或铵盐;

(a4-3) 提取物或提取物的富集片段, 选自: 奇异果提取物(卡特莫夫灌木)、甜叶菊种(尤其是 *Stevia rebaudiana*) 的提取物、swingle 提取物(苦瓜属 *Momordica* 或 *Siratia grosvenorii*, 罗汉果)、*Glycyrrhiza* ssp. (尤其是 *Glycyrrhiza glabra*) 的提取物、悬钩子属(*Rubus* ssp., 尤其是 *Rubus suavissimus*) 的提取物、柑橘提取物以及 *Lippia dulcis* 的提取物;

(a5) 合成的甜味物质, 优选地, 选自下列物质: 唛甘浦、环拉酸钠或环拉酸的其它生理上可接受的盐、安赛蜜 K 或其它生理上可接受的盐、新橙皮苷二氢查尔酮、柚苷二氢查尔酮、沙卡林、沙卡林-钠盐、阿斯巴甜、超级阿斯巴甜、纽甜、阿力甜、糖精、紫苏萜、三氯蔗糖、胍乙酸、卡瑞来、苏洛内特和苏洛奥内特。

12. 根据权利要求 10 或 11 所述的口服制剂, 其特征在于, 式(I) 的化合物的总量占所述制剂的总质量的 0.01ppm 至 95wt%, 优选地, 0.1ppm 至 90wt%, 优选地, 1ppm 至 50wt%, 更优选地, 1ppm 至 20wt%, 最优选地 1ppm 至 5wt%。

13. (a) 赋予甜味印象和 / 或加强一种、两种或多种甜味物质的甜味印象和 / 或 (b) 生产根据权利要求 10 至 12 中任一项所述的口服制剂的方法, 所述方法包括以下步骤:

a) 提供根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物和 / 或根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物的生理上可接受的盐, 根据权利要求 7 所述的混合物和 / 或根据权利要求 8 或 9 所述的提取物;

b) 提供口服制剂, 优选地, 所述口服制剂包含一种、两种或多种其它甜味物质,

c) 使在步骤 a) 和 b) 中提供的组分接触或混合。

14. 根据权利要求 13 所述的方法, 其包括以下步骤:

a-i) 通过提取植物材料生产提取物, 所述提取物含有根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物、根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物的生理上可接受的盐或根据权利要求 7 所述的混合物, 优选地, 所述提取物为根据权利要求 8 或 9 所述的提取物, 优选地, 所述植物材料来自 *Mycetia balansae*;

a-ii) 任选地将步骤(a-i) 中生产的提取物进一步加工成含有根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物、权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物的生理上可接受的盐, 或根据权利要求 7 所述的混合物的进一步加工的产品,

b) 提供口服制剂, 优选地, 所述口服制剂包含一种、两种或多种其它甜味物质,

c) 使来自步骤 b) 的口服制剂与步骤 a-i) 中生产的提取物和 / 或步骤 a-ii) 中生产的进一步加工的产品接触或混合, 优选地, 所述口服制剂包含一种、两种或多种其它甜味物

质。

15. 根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物和 / 或根据权利要求 1 至 6 中任一项所述的化合物的生理上可接受的盐、根据权利要求 7 所述的混合物或根据权利要求 8 或 9 所述的提取物在生成口服制剂中的甜味印象或加强含有至少一种其它的、优选天然生成的甜味物质的口服制剂的甜味印象中的应用。

包含一些甜味三萜类和三萜甙类的口服制剂

技术领域

[0001] 本发明涉及下列式(I)的三萜类和三萜甙类和/或其生理上可接受的盐,优选天然存在的 *Mycetia balansae* (南岭华腺)的三萜类和三萜甙类和/或其生理上可接受的盐,以及包括一种或多种这些三萜类和三萜甙类和/或其生理上可接受的盐的口服制剂。本发明还涉及这些三萜类和三萜甙类和/或其生理上可接受的盐(优选 *Mycetia balansae* 的提取物)在口服制剂中生成甜味印象或在加强包含至少一种另外的、优选天然存在的甜味料的口服制剂的甜味印象中的用途。最后,本发明还涉及制造口服制剂的方法以及生成和/或加强口服制剂的甜味印象的方法。

背景技术

[0002] 由于含糖量高(尤其是蔗糖、乳糖、葡萄糖或果糖或其混合物)的食物或刺激剂的味道甜蜜,消费者通常非常偏爱这种食物或刺激剂。另一方面,众所周知高含量的容易代谢的糖类引起血糖水平大幅度提高,导致脂肪沉着体的形成,并且最终可导致诸如超重、肥胖、胰岛素耐受、成年性糖尿病及其晚期并发症之类的健康问题。使情况尤其严重的是,上述糖类中的许多还可损害牙齿健康,因为,例如,它们被口腔中的一些类型的细菌分解成乳酸,可腐蚀青少年或成人牙齿的牙釉质(龋齿)。

[0003] 因此,尽可能多地降低食物和/或刺激剂中的糖含量是一个长期目标,优选目标为通过最小程度地降低甜味印象来实现糖含量的降低。合适的措施在于使用甜味剂:所述甜味剂为本身没有热值或只有非常低的热值并且同时导致较强甜味印象的化学均匀的物质;所述物质一般无致龋性(例如,可在 *Journal of the American Dietetic Association* 2004, 104(2), 255-275 中找到综述)。从一定程度上看,诸如山梨醇、甘露醇或其它糖醇之类的所谓的增量甜味剂确实为优良的甜味剂,还可部分替代糖的剩余营养性质,但是,过于频繁摄入会在一部分人群中导致渗透诱发型消化问题。由于使用浓度低,因此非营养的、高强度的甜味剂非常适用于向食物中引入甜味。然而,许多这种甜味剂不是天然来源的(三氯蔗糖、甜蜜素、安赛蜜 K、糖精、阿斯巴甜),许多这种甜味剂与糖相比通过不同的时间-强度曲线显示出味觉问题(例如,三氯蔗糖、甜菊糖苷、甜蜜素)、与苦和/或涩余味相比通过不同的时间-强度曲线显示出味觉问题(例如,安赛蜜 K、糖精、甜菊糖苷、rebaudiosides),以及与明显的其它甜味印象相比通过不同的时间-强度曲线显示出味觉问题(例如,glycerrhizic 酸铵盐)。一些甜味剂热稳定性不好(例如,索马甜、布拉齐因、莫内林),一些甜味剂不是在所有应用中都稳定(例如,阿斯巴甜),一些甜味剂部分地具有持续非常长时间的甜味效应(强甜余味,例如,糖精、三氯蔗糖、甜菊糖苷、rebaudiosides、纽甜、advantame、超级阿斯巴甜)。

[0004] 出于这种原因,理想地是找到具有或给予类似于蔗糖的加强的甜味的甜味剂,该甜味剂还优选为天然存在的或容易从天然存在的物质中得到的,此外,该甜味剂优选为稳定的和/或可广泛用于口服制剂。

[0005] 用于降低食物或饮料中的热值含量的另一可能情况-不使用非营养性甜味剂-在

于降低食物和 / 或刺激剂中的糖含量并添加感觉上较弱的或感觉不到的物质,该物质直接或间接加强甜味,所述物质例如 W02005/041684 中描述的物质。然而,W02005/041684 中描述的物质明确地为非天然来源的物质,并且从毒理学上来看,所述物质会因此比天然来源的物质更加难于评估,特别是当所述天然来源的物质存在于食物或刺激剂中或来源于获得食物或刺激剂的原材料中时。这些天然来源的物质(吡啶甜菜碱)在 EP1291342 中记载;尽管所述物质不是选择性地具有甜味,但是还具有受所述物质影响的诸如鲜味或咸味之类的其它味道。此外,所公开的物质的纯化需要相当大的支出和 / 或它们难以合成生产。

[0006] W02007/0148979A1 中推荐使用橙皮素以及 W02007/107596A1 中推荐使用根皮素作为减少糖的营养制剂或刺激剂的甜味加强剂。然而,当使用橙皮素和根皮素时,食物和刺激剂中较不显著的效果、高比例的蛋白质,特别是诸如酸奶产物之类的变性蛋白或多糖偶尔为不利的。此外,橙皮素在诸如柠檬水或可乐饮料之类的非常酸的或碳酸化应用方面具有不充分有效的不利之处。

[0007] 基于该原因,理想的是找到在保留相同甜味印象的同时能够降低口服制剂中甜味化合物含量的替代物,以便研发降低糖含量的制剂。具体而言,需要加强给定的甜味印象的制剂,特别是超出纯粹累加效应或在纯粹的累加效应之上的药剂。

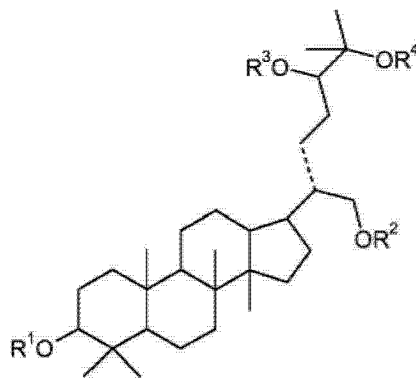
发明内容

[0008] 因此,本发明的主要目的是找到可产生甜味印象(即具有固有甜味)和 / 或能够加强其它甜味物质的甜味印象的物质(独立的物质或混合物)。

[0009] 此外,应当显示合适的口服制剂具有以下性质:在另外的甜味化合物的浓度显著不变的条件下,其中甜味印象由这些物质产生或者其甜味印象由这些物质加强,或者其中在保留相同甜味印象的同时,产生甜味印象的其它化合物的含量减少,由此优选地,没有或仅有可忽略程度的感觉不到的副作用。

[0010] 在这种情况下,如果这些物质天然存在或可由天然且可持续发展的物质或原材料制得是有利的。具体而言,优选地,赋予理想的甜味印象或加强甜味印象的物质在低浓度条件下应当就是活性的。此外,理想的物质应当具有可能的最宽范围的应用,即,能够整合到许多不同的可用于口服的应用类型和产品类型中,因此,可与许多不同的口服的起始物质、辅助物质、载体物质、附加物质和 / 或活性物质组合和相容。

[0011] 该目的根据本发明通过式(I)的化合物(本文中称作南岭茵(balansin))或式(I)的化合物的生理上可接受的盐实现,所述式(I)为



(I)

[0012] 其中，

[0013] 虚线表示单键或双键，以及

[0014] R^1, R^2, R^3 和 R^4 彼此独立地分别表示氢或糖残基，优选单糖残基或寡糖残基，特征为式(I)的化合物的生理上可接受的盐的配对阳离子优选为选自第一一级和二级基团的带单价正电荷的阳离子、铵离子、三烷基铵离子、来自第二二级基团的二价阳离子、来自第三一级和二级基团的三价阳离子，优选地选自 $Na^+, K^+, NH_4^+, Ca^{2+}, Mg^{2+}, Al^{3+}$ 和 Zn^{2+} 。

[0015] 根据式(I)的本发明的化合物，以及根据下述式(II)和(III)的本发明的优选的化合物可以其不同的可能的立体异构体和不同的可能的立体异构体的随机混合物的形式提供，并且可在本发明的范围内使用。

[0016] 本发明提供的式(I)的化合物包含一种或多种糖残基，在各自彼此独立的情况下，所述糖残基可为 α -或 β -结构。这用于与氧原子结合(通过所述氧原子残基 R^1, R^2, R^3 和 R^4 结合至三萜烯骨架)，也用于各简单糖组建结构(simple sugar building block)的彼此结合，由此形成各自的糖残基。

[0017] 在式(I)中，残基 R^1, R^2, R^3 和 R^4 中的一个、两个或三个优选地表示氢，以及残基 R^1, R^2, R^3 和 R^4 中的一个、两个或三个优选地表示糖残基。

[0018] 式(I)的优选化合物和/或式(I)的化合物的生理上可接受的盐为如下的那些化合物：所述化合物中，残基 R^1, R^2, R^3 和 R^4 中的至少一个表示氢，优选地，残基 R^1, R^2, R^3 和 R^4 中的至少两个表示氢以及残基 R^1, R^2, R^3 和 R^4 中的至少一个表示糖残基，所述糖残基优选为或者所述糖残基彼此独立地优选为：

[0019] (i) 单糖残基，葡糖基、甘露糖基、半乳糖基、鼠李糖基、岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基，以及

[0020] (ii) 2至10个简单糖组建结构的寡糖残基，所述简单糖组建结构优选为吡喃葡萄糖、吡喃甘露糖、吡喃半乳糖、吡喃鼠李糖、吡喃岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

[0021] 式(I)中的残基 R^2, R^3 和 R^4 中的一个、两个或三个表示氢并且残基 R^2, R^3 和 R^4 中的任选一个和残基 R^1 表示糖残基，优选地，所述糖残基选自以下物质，且优选地，所述糖残基分别彼此独立地选自以下物质：

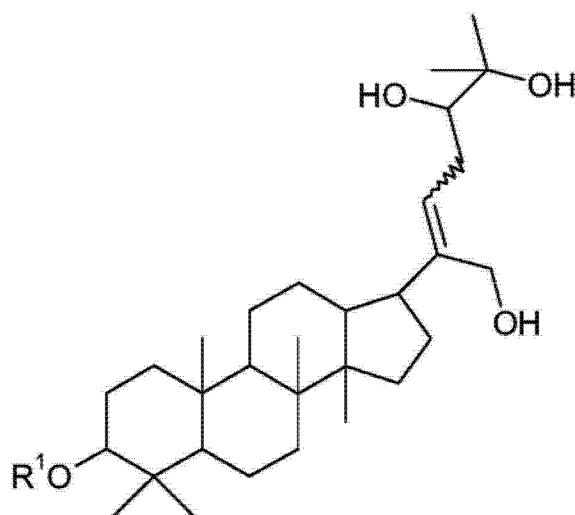
[0022] (i) 单糖残基，吡喃葡萄糖基、吡喃甘露糖基、吡喃半乳糖基、吡喃鼠李糖基、吡喃岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基，以及

[0023] (ii) 2至8个简单糖组建结构的寡糖残基，优选地，所述简单糖组建结构选自吡喃葡萄糖、吡喃甘露糖、吡喃半乳糖、吡喃鼠李糖、吡喃岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

[0024] 残基 R^2, R^3 和 R^4 中一个、两个或全部优选地表示氢

[0025] 式(I)中的虚线优选地表示双键。

[0026] 根据本发明，式(II)的化合物或式(II)的化合物的生理上可接受的盐为优选的。



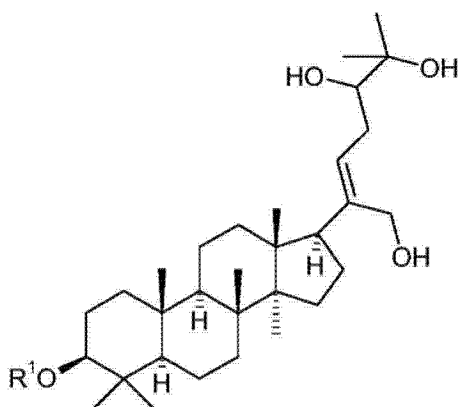
(II)

[0027] 其中，

[0028] R^1 为单糖、二糖、三糖、四糖或戊糖残基，优选地选自(i)葡糖基、甘露糖基、半乳糖基、鼠李糖基、岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基，以及(ii)2至5个简单糖组建结构的寡糖残基，所述简单糖组建结构选自葡萄糖、甘露糖、半乳糖、鼠李糖、岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

[0029] 在这种情况下，根据一般绘图习惯，式(II)中的Z字型曲线表示(E)-或(Z)结构的双键。

[0030] 根据本发明，尤其优选式(III)的化合物或式(III)的化合物的生理上可接受的盐。



(III)

[0031] 其中，

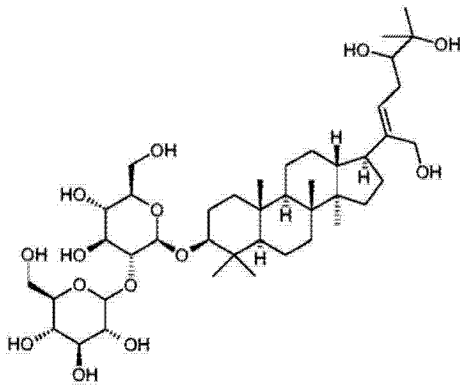
[0032] R^1 为单糖、二糖、三糖、四糖或戊糖残基，选自(i)葡糖基、甘露糖基、半乳糖基、鼠李糖基、岩藻糖基、阿拉伯糖基和核糖基，以及(ii)2至5个简单糖组建结构的寡糖残基，所述简单糖组建结构选自葡萄糖、甘露糖、半乳糖、鼠李糖、岩藻糖、阿拉伯糖和核糖。

[0033] 根据本发明，上式(III)的化合物或上式(III)的化合物的生理上可接受的盐为进一步优选的，其中，

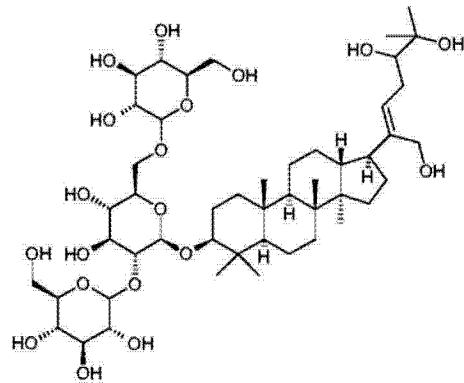
[0034] R^1 为单糖、二糖、三糖、四糖或戊糖残基，选自(i)吡喃葡萄糖基、吡喃半乳糖基和吡喃鼠李糖基，以及(ii)2至4个简单糖组建结构的寡糖残基，所述简单糖组建结构选自吡

喃葡萄糖、吡喃半乳糖和吡喃鼠李糖,所述简单糖组建结构的部分优选地在 2, 4 和 / 或 6 位彼此结合。

[0035] 根据本发明,下列两种化合物和 / 或其立体异构体或这些化合物(下文分别称为 A 和 B)的生理上可接受的盐最优选。

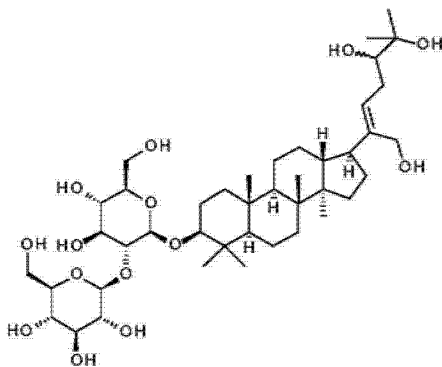


A

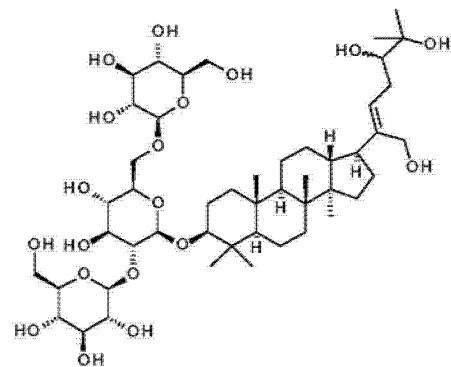


B

[0036] 根据本发明,化合物 A 和 B 的下列两种立体异构体(下文称为南岭茵 A (Balansin A) 和南岭茵 B (Balansin B))最优选。



Balansin A



Balansin B

[0037] 根据本发明,也可使用两种、三种或三种以上的式(I)、(II)或(III)的不同化合物的混合物,优选地,这种混合物包含上述优选的化合物中的两种、三种或三种以上。

[0038] 优选地,根据式(I)、(II)和 / 或(III)的本发明的化合物还可作为单价阴离子或者,例如在几个羟基的情况下,作为多价阴离子存在,第一级和二级基团的带正电荷的单价阳离子、铵离子、三烷基铵离子、第二二级基团的二价阳离子以及第三级和二级基团的三价阳离子优选作为配对阳离子,优选 Na^+ , K^+ , NH_4^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , Al^{3+} 和 Zn^{2+} 。

[0039] 如果在本文范围内引用优选的和 / 或尤其优选的式(I)、(II)和 / 或(III)的化合物,根据本发明的这些化合物的盐显然也是优选的和 / 或尤其特别优选的。

[0040] 因此,根据本发明,一种、两种或多种上述式(I)、(II)和 / 或(III)的不同化合物的一种、两种或多种不同的盐,或者一种、两种或多种上述式(I)、(II)和 / 或(III)的不同化合物与一种、两种或多种上述式(I)、(II)和 / 或(III)的不同化合物的一种、两

种或多种不同的盐的混合物是优选的,特征在于一种、多种或所有盐的配对阳离子优选为 Na^+ , K^+ , NH_4^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , Al^{3+} 和 Zn^{2+} 。

[0041] 因此,本发明还涉及包含下列化合物或由下列化合物组成的混合物:优选地在一种优选的实施方式中的两种、三种或多种如上所述的化合物;或者,优选地在一种优选的实施方式中的一种、两种或多种不同的如上所述的化合物以及一种、两种或多种不同的如上所述的化合物的一种、两种或多种不同的生理上可接受的盐;或者,优选地在一种优选的实施方式中的如上所述化合物的两种、三种或多种生理上可接受的盐,

[0042] 由此,本发明提供的一种或多种上述化合物的一种或多种生理上可接受的盐可用于混合物中,优选地,上述化合物的所有生理上可接受的盐的配对阳离子选自 Na^+ , K^+ , NH_4^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , Al^{3+} 和 Zn^{2+} 。

[0043] 根据本发明的尤其优选的混合物包括 Balansin A 和 / 或 Balansin B, 优选 Balansin A 和 Balansin B, 优选 Balansin A 和 Balansin B 以及任选地, 一种、两种、三种或三种以上式(I)、(II)和 / 或(III)的化合物和 / 或任选地, 一种或多种式(I)、(II)和 / 或(III)的化合物的一种、两种、三种或多种生理上可接受的盐。

[0044] 根据本发明的尤其优选的混合物包括 Balansin A 和 / 或 Balansin B 的生理上可接受的盐, 优选 Balansin A 和 Balansin B 的 Na^+ , K^+ , NH_4^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , Al^{3+} 或 Zn^{2+} 盐以及任选地, 一种或多种式(I)、(II)和 / 或(III)的化合物的一种、两种、三种或多种其它生理上可接受的盐。

[0045] 式(I)、(II)和(III)的化合物可获自植物 *Mycetia balansae* Drake, 例如, 可由 *Mycetia balansae* Drake 的提取物富集或分离, 或者例如, 可通过水合作用、苷化作用、糖酵解、成盐以及本领域技术人员公知的类似方法由存在于该植物中的或可从所述提取物中得到的三萜类和 / 或三萜甙类衍生或转化生成。

[0046] 具体而言, 例如, 在合适的酶(例如, 通过使用糖苷酶或转移糖苷酶)的帮助下, 糖苷形式可通过苷化作用或糖基转移作用或者, 更准确地, 转移苷化作用改变, 或者还使用诸如具有适当活性的细菌(例如, 根据 KR888694)之类的微生物。在该情况下, 根据本发明不优选的其它糖苷或多糖可用作反应物, 但是优选的糖苷或多糖为由葡萄糖、甘露糖、半乳糖、鼠李糖、岩藻糖、阿拉伯糖和核糖制备的那些糖苷或多糖。

[0047] 其中虚线表示单键的式(I)的化合物可通过本领域技术人员公知的均质或异质金属催化的水合作用或转移水合作用或通过由酶或微生物完成的氢化作用由相应的其中虚线表示双键的式(I)的化合物生成。

[0048] *Mycetia balansae* Drake (茜草科, 腺萼木属; 全球生物多样性资讯机构(Global Biodiversity Information Facility): 由 Kew Garden 确定, 记录号 Kew-130690, <http://data.gbif.org/species/14242490/>) 为东南亚常见植物。

[0049] 文献中没有关于 *Mycetia balansae* Drake 被食用的描述。如果有, 也只是当地人群咀嚼新鲜树叶(即, 不是干树叶)的口头传闻证据。这不包括其被用于使诸如食物或刺激剂之类的口服制剂变甜的报道。同样地, *Mycetia balansae* Drake 种的化学成分或其它腺萼木属植物的化学成分还未经描述。因此, 式(I)的 balansin 是新的。到目前为止, 式(I)的化合物及其盐还未作为 *Mycetia balansae* 的成分被描述过, 也未从其它自然资源或合成资源中见到。

[0050] 因此,本领域技术人员意想不到且无法预料的是,式(I)的根据本发明的上述 balansin 可引起强烈的甜味印象或使其它甜味物质(例如,水性蔗糖溶液)的甜味印象加强至明显且显著的程度。

[0051] 与植物各部分相比,尤其是与 *Mycetia balansae* (优选新鲜的)树叶相比,根据本发明,式(I)、(II)和/或(III)的根据本发明的化合物和/或其盐和/或根据本发明的混合物(如上述)以富集形式优选地使用,优选地以纯化或分离形式使用。

[0052] 新鲜或干燥的植物 *Mycetia balansae* 本身不是本发明的目的。新鲜或干燥的 *Mycetia balansae* 本身的植物部分(例如,树叶)也不是本发明的目的,在该情况下,本发明的目的尤其不是新鲜或干燥的 *Mycetia balansae* 树叶。

[0053] 优选地,通过咀嚼,尤其通过人咀嚼 *Mycetia balansae* 的新鲜树叶得到的混合物也不是本发明的目的。优选地,通过咀嚼 *Mycetia balansae* 的新鲜树叶得到的唾液提取物(优选非人类唾液提取物)也不是本发明的目的。在优选的实施方式中,根据本发明的口服制剂不含人类唾液,优选地,不含唾液。

[0054] 根据本发明,*Mycetia balansae* 植物或植物的一部分还可以干燥和研磨的形式使用,优选地,以粉末形式使用。

[0055] 例如,根据本发明的口服制剂(例如,半成品形式的口服制剂)可包含 *Mycetia balansae* 植物或 *Mycetia balansae* 植物的一部分(优选地,干燥形式和粉末形式)和一种或多种适于食用的添加剂、载体和/或辅助物质。优选地,根据本发明的半成品包括一种或多种式(I)的化合物和/或一种或多种式(I)的化合物的生理上可接受的盐以及一种或多种在 20°C 和 1013mbar 的条件下稳定的适于食用的添加剂、载体和/或辅助物质。

[0056] 本发明还涉及植物提取物(优选 *Mycetia balansae* 的植物提取物),所述植物提取物包含一种或多种式(I)的化合物或式(I)的化合物的生理上可接受的盐,或者根据本发明的混合物,优选地,这些化合物的总量以及这些化合物的生理上可接受的盐的总量范围为提取物的干质量的 0.00001wt% 至 99wt%, 优选地,0.0001wt% 至 95wt%, 尤其优选地,0.0005wt% 至 80wt%, 最为优选地,0.001wt% 至 30wt%。

[0057] 较广义的术语“干质量”是指不含水和提取剂的根据本发明的提取物的质量。例如,该质量可在完成提取步骤或根据本发明的提取方法的步骤(见下文)之后通过蒸馏或其它蒸发方式完全除去提取剂(包括可能来源于植物原料的水)获得。

[0058] 较狭义的术语“干质量”是指在 20°C, 1013mbar 的条件下的所有提取物固体的总质量。

[0059] 在本文的范围之内,“固体”状态和术语“固体物质”涉及 20°C, 1013mbar。

[0060] 例如,适用于食物和刺激剂部分的提取剂为水、乙醇、甲醇、1-丙醇、2-丙醇、1,2-丙二醇、丙三醇、丙酮、二氯甲烷、乙酸乙酯(乙基乙酸酯)、二乙醚、己烷、庚烷、甘油三乙酸酯、植物油、超临界二氧化碳及其混合物。在该情况下,尤其优选的是水、乙醇、甲醇、1-丙醇、2-丙醇、丙三醇、1,2-丙二醇或者上述非水性提取剂与水的混合物。

[0061] 根据本发明的优选的植物提取物可通过具有下述步骤的方法获得:

[0062] a) 用(优选液体的)提取剂一次或多次提取来自 *Mycetia balansae* 的植物原料,所述提取剂选自水、乙醇、甲醇、1-丙醇、2-丙醇、丙三醇、1,2-丙二醇、超临界二氧化碳、乙酸乙酯及其混合物。

[0063] 并且,如果需要的话,还包括如下多个其它步骤:

[0064] b) 如果需要的话,优选地,通过一种或多种蒸发或渗透蒸发的方式浓缩步骤 a) 中获得的初级提取物;

[0065] c) 如果需要的话,用吸附剂或通过吸附剂处理初级提取物(如果需要的话,在步骤 b) 中浓缩),优选地,所述吸附剂选自硅胶、改良硅胶、活性炭、泡沸石、膨润土、硅藻土、氧化铝、碱性或酸性或中性(优选地大孔的)离子交换剂,优选地,以分批法或柱式法,如果需要的话,在其它提取剂的辅助下,以获得纯化的提取物(二级提取物);

[0066] d) 如果需要的话,优选地,通过蒸发或渗透蒸发的方式干燥步骤 c) 中获得的二级提取物;

[0067] e) 如果需要的话,使步骤 d) 中获得的干燥的二级提取物与合适的稀释剂混合或使步骤 d) 中获得的干燥的二级提取物与两种或多种稀释剂的混合物混合,优选地,所述稀释剂选自乙醇、异丙醇、1,2-丙二醇、植物油甘油三酯、甘油二乙酸酯、甘油三乙酸酯和丙三醇,以优选地,获得溶液。

[0068] 优选地, *Mycetia balansae* 的根据本发明的提取物(优选地,用于生产根据本发明的口服制剂)可通过提取的方式获自 *Mycetia balansae* 的新鲜和/或干燥植物或其一部分(例如,根、茎秆、外皮、髓、叶、花和/或果实),优选地,获自干燥的植物的地上部分(本文优选叶、茎秆、花和/或果实)。

[0069] *Mycetia balansae* 的植物或植物的一部分也可以干燥和研磨的形式(优选地,粉末形式)用于根据本发明的提取物的生产。

[0070] 优选地,根据本发明的植物提取物(优选地, *Mycetia balansae* 的植物提取物)通过根据本发明的提取方法优选地从 *Mycetia balansae* 中获得。

[0071] 在优选实施方式中,除了一种或多种式(I)的化合物之外,根据本发明的植物提取物另外还且只包含这样的化合物,这样的化合物在 20°C 和 1013mbar 下为固体,并且优选地,所述化合物不为游离的糖类,尤其不为甜味的游离糖类。

[0072] 优选地,根据本发明的植物提取物只包括根据上述的这样的化合物,这样的化合物可通过乙酸乙酯、乙醇或甲醇以及通过甲醇-乙醇、甲醇-水、甲醇-乙醇-水或乙醇-水混合物或超临界二氧化碳(如果需要的话,结合诸如乙醇之类的极性增强剂)从 *Mycetia balansae* 中提取。

[0073] 优选地,提取步骤的提取时间为每一步 5 分钟至 24 小时,优选地,每一步 15 分钟至 18 小时。

[0074] 优选地,步骤 a) 通过搅拌、索氏(S Soxhlet)提取、高压提取、微波加速提取、超声加速提取、逆流提取、浸透的提取方法或筛篮法实施。

[0075] 优选地,根据本发明的方法中的一种、多种或所有提取(提取步骤)在每一情况中在如下条件下实施:温度为 -80°C 至相应的提取剂或提取剂混合物的沸点(优选 0 至 200°C),如果需要的话,压强为 1bar 至 1000bar。优选地,每一提取步骤持续 5 分钟至 24 小时的时间段,优选地,通过搅拌(优选简单搅拌)、高压提取、微波加速提取、超声加速提取、浸透或逆流提取进行。

[0076] 在该情况下,例如,蒸发或渗透蒸发的方法可为蒸馏、升华、蒸汽蒸馏、冷冻干燥、渗透蒸发膜法或喷雾干燥,由此,还可在该方法之前和/或该方法中向其中添加合适的辅

助物质和 / 或载体物质。

[0077] 优选地,提取步骤可通过搅拌(例如简单搅拌)、高压提取、微波加速提取、超声加速提取、浸透和 / 或逆流提取实施。

[0078] 优选地, *Mycetia balansae* 的根据本发明的植物提取物获自新鲜和 / 或干燥的植物地上部分, 优选叶、茎秆、花和 / 或果实(优选干燥和粉末形式), 包括下列步骤:

[0079] a) 用液体提取剂从 *Mycetia balansae* 中提取植物原料, 所述提取剂选自水、乙醇、甲醇、1-丙醇、2-丙醇、丙三醇、1, 2-丙二醇、乙酸乙酯及其混合物, 优选地, 所述提取在温度为 0℃ 至所使用的提取剂或提取剂混合物的沸点, 任选地, 压强为 1bar 至 1000bar 的条件下进行。

[0080] 优选地, 提取剂或提取剂混合物可独立地或以两种混合或三种混合的方式用于每一情况下, 或者还可以极性增加或降低的顺序连续用于每一情况下。

[0081] 用于生产根据本发明的植物提取物的根据本发明的提取方法包括用低极性, 优选地非极性提取剂进行提取的步骤, 该步骤在步骤 a) 之前实施。通过这种方法, 在步骤 a) 之前的这种预处理步骤中, 首先从植物原料中提取并分离诸如油脂和蜡之类的不期望的伴随物质, 以使在本发明的该方法中获得的植物提取物更易于进一步加工。

[0082] 此外, 我们在研究中意外发现大量诸如明显苦味之类具有不良味道记录的伴随物质和副产物不或不再存在于根据连续提取的该方法的步骤 a) 中出现的提取物中。在优选的实施方式中, 以该方法除去或避免所有具有不良味道记录的物质。

[0083] 在根据步骤 a) 进行提取之前, 可通过低极性药剂对植物原料进行提取。对植物原料的这种预处理而言, 尤其优选的是低极性提取剂, 例如丁烷、丙烷、异丁烷、叔丁基甲基醚、二氯甲烷、正庚烷、正己烷或其混合物, 优选地, 所述提取在温度为 -80℃ 至相应的提取剂或提取剂混合物的沸点的条件下, 在提取步骤中所使用的压强条件下实施。用于预处理植物原料的提取步骤中的压强优选为 0.1bar 至 1000bar, 优选地, 0.5bar 至 250bar。

[0084] 优选地, 用于预处理植物原料的提取在进行根据步骤 a) 的提取之前在 -80℃ 至 200℃ 的温度下实施。

[0085] 例如, 在用超临界二氧化碳、丙烷、丁烷或异丁烷提取的过程中, 如果需要的话, 在添加其它提取剂和 / 或溶剂的条件下, 如果达到提取剂或提取剂混合物的临界点, 则最高温度还可选择高于 200℃。特别地, 用水性混合物进行的提取还可在存在调节 pH 的酸、碱或缓冲混合物的条件下进行。

[0086] 具有两个、三个、四个或多个连续实施的提取的连续提取方法为优选的, 优选地, 所用的提取剂对于每一随后的提取, 极性递增。在此, 优选地, 以非极性提取剂开始, 用非极性提取剂对待提取的植物部分进行提取。在第一次提取完成之后除去非极性提取剂, 从该提取步骤获得初级提取物。接着, 至少在另一步骤中重复提取已进行第一次提取步骤的植物部分, 使用较高极性的提取剂, 从该提取阶段获得相应的初级提取物。

[0087] 在该情况下, 连续提取可包括多个提取步骤, 优选地, 最后一个提取步骤为用水、乙醇、甲醇、1-丙醇、2-丙醇、丙三醇、1, 2-丙二醇或者上述非水性提取剂与水的混合物进行提取。在该情况下, 如果用于根据本发明的口服剂型的根据本发明的提取物已从最后一个提取步骤的初级提取物中获得, 则是优选的。

[0088] 根据步骤 a) 出现的提取物和 / 或可在步骤 b) 之后获得的提取物可任选地还被进

一步消化,所述消化例如,通过酶处理(例如,用于细胞消化的纤维素酶),通过酸处理(例如在压力条件下),通过用合适的碱性溶液处理(例如,钠、钾、钙、镁和锌的氢氧化物、碳酸盐或碳酸氢盐的碱性溶液),用酸离子交换剂或蒸汽处理而进行,优选地,所述消化在压强为 0.01mbar 至 100mbar,优选地,1mbar 至 20mbar 的条件下进行。

[0089] 任选地,如果需要的话,可通过蒸馏或其它蒸发的或渗透蒸发的方法在步骤 b) 中浓缩来自步骤 a) 的提取物,如果需要的话,直到只有固体或几乎不挥发或非挥发性的液体存在。

[0090] 优选地,在各步骤中,步骤 b) 之后的 *Mycetia balansae* 的浓缩的或者,更准确地,干燥的初级提取物含有占浓缩初级提取物的干质量的 0.001wt% 至 80wt%,优选地,0.005wt% 至 50wt%,尤其优选地,0.01wt% 至 25wt% 的式(I) 的南岭茵(balansin)。

[0091] 任选地,如果需要的话,浓缩的初级提取物可通过用吸附剂或通过吸附剂(硅胶、改良硅胶(例如 RP 相)、活性炭、泡沸石、膨润土、硅藻土、氧化铝、碱性或酸性或中性[大孔]离子交换剂)以分批式或柱式法,如果需要的话,还可在其它提取剂(优选地,一种或多种提取剂)的辅助下处理而在步骤 c) 中纯化,以获得二级提取物,所述提取剂选自水、正己烷、二氯甲烷、甲酸、甲醇、乙醇和 1,2-丙二醇。

[0092] 根据步骤 c) 得到的 *Mycetia balansae* 的二级提取物还可被 1wt% 至 99wt%(基于干燥的二级提取物计)的适于食用的辅助物质或载体物质(例如麦芽糖糊精、淀粉、天然或合成多糖和/或诸如改良淀粉或阿拉伯胶之类的植物胶)代替,从而优化根据步骤 d) 的干燥二级提取物的生产。

[0093] 步骤 d) 中优选的辅助物质或载体物质为麦芽糖糊精、淀粉、天然或合成多糖和/或诸如改良淀粉或阿拉伯胶之类的植物胶,由此,如果需要的话,还可使用另外的一种或一种以上其它适于食用的物质,优选地,所述适于食用的物质选自:

[0094] (i) 稀释剂,例如乙醇、1,2-丙二醇、丙三醇、甘油二乙酸酯、三乙酸甘油酯和/或植物油甘油三脂,

[0095] (ii) 着色剂,例如批准的食用色素和着色植物提取物,

[0096] (iii) 稳定剂、防腐剂、抗氧化剂和粘度控制物质。

[0097] 优选地,步骤 d) 之后的浓缩的和/或干燥的 *Mycetia balansae* 二级提取物含有的式(I) 的化合物的总量为 0.001wt% 至 99wt%,优选地,1wt% 至 99wt%,更优选地,5wt% 至 95wt%,尤其优选地,10wt% 至 90wt% (在各种情况中基于浓缩的二级提取物的总质量计)。

[0098] 优选地,根据本发明的植物提取物在步骤 e) 中与稀释剂或稀释剂混合物混合,并生成溶液,由此,可通过温和加热便于或加速 balansin 的化合物的完全溶解,优选地,所述稀释剂或稀释剂混合物选自水、丙二醇、丙三醇和乙醇及其混合物。

[0099] 优选地,这种溶液中的根据本发明的植物提取物的总量为 1wt% 至 20wt%,优选地,2wt% 至 10wt%,尤其优选地,4wt% 至 6wt%。

[0100] 优选地,这样的溶液通过上述稀释剂的稀释剂混合物生成,优选地,所述稀释剂混合物选自水-丙二醇、水-丙三醇、水-乙醇、丙三醇-乙醇、丙三醇-丙二醇和丙二醇-乙醇。

[0101] 优选地,根据本发明的提取方法的步骤 e) 中使用的稀释剂或稀释剂混合物适于食用,因为,在这种情况下,根据步骤 e) 得到的根据本发明的提取物,尤其是作为溶液得到

的提取物,特别适合直接用于口服制剂,所述口服制剂优选为选自以下的口服制剂:营养制剂、膳食补充制剂、刺激性制剂、口服药物制剂、口腔护理产品(口腔卫生用品)以及调味料组合物。

[0102] 本发明还涉及口服制剂,所述口服制剂包含感官活性量的如上所述的根据本发明的化合物和/或上述化合物的根据本发明的生理上可接受的盐,如上所述的根据本发明的混合物,和/或如上所述的根据本发明的提取物,口服制剂,优选地,所述口服制剂选自营养制剂、膳食补充制剂、刺激性制剂、口服药物制剂、口腔护理产品、调味料组合物和美容制剂。

[0103] 为了确定与水性蔗糖溶液相比的根据本发明的提取物的甜味印象或式(I)的根据本发明的化合物的甜味印象,以与根据研究存在于口服制剂中的浓度相同浓度生成一种或多种式(I)的化合物的水性溶液。随后,通过一组至少5人针对溶于水的不同蔗糖浓度的参照系列,比较该水性溶液的味道并分级。这样确定蔗糖等同值(以蔗糖等同量表示),换言之,确定甜味印象与某一浓度的式(I)的化合物的甜味印象相等的蔗糖溶液的浓度。

[0104] 蔗糖参照溶液的优选浓度是在水中为0;0.25wt%;0.5wt%;0.75wt%;1wt%;1.5wt%;2wt%;3wt%;4wt%和5wt%的蔗糖。如果需要的话,其它浓度,尤其是较高的浓度,也可用于参照系列。所确定的蔗糖等同量获自小组个体成员的个体分级的平均值。优选地,小组成员为不同年级和性别以及来自不同背景环境的人,所述小组成员有品味领域的经验。

[0105] 出乎意料地,本发明发现式(I)的根据本发明的化合物和/或根据本发明的提取物(优选地, *Mycetia balansae* 的根据本发明的提取物)甚至在非常低的浓度也可显著增强根据本发明的口服制剂(优选地,营养制剂、口腔护理制剂或刺激性制剂或用于头部的美容制剂)中的甜味物质的甜味以及甜味质量。

[0106] 即使在根据本发明的提取物的量少于或等于1wt%(即, $\leq 1\text{wt}\%$),优选地 $\leq 0.5\text{wt}\%$,尤其优选地 $\leq 0.1\text{wt}\%$ (在各种情况中基于根据本发明的口服制剂的总重量计)时,也可观察到根据本发明的提取物(优选地, *Mycetia balansae* 的根据本发明的提取物)的甜味增强效果。

[0107] 优选地,即使在式(I)的根据本发明的化合物的总量少于0.01wt%(等于100ppm)(ppm=百万分之一),优选地,少于0.0050wt%(等于50ppm)(在各种情况中基于根据本发明的口服制剂的总重量计)时,也可观察到作为根据本发明的提取物(优选地, *Mycetia balansae* 的根据本发明的提取物)的成分的式(I)的根据本发明的化合物的甜味增强效果。

[0108] 如上所述,根据本发明的混合物,根据本发明的植物提取物以及根据本发明的口服制剂优选为包含一种或多种上述优选的和/或尤其优选的式(I)、(II)和/或(III)的化合物或其盐的混合物、植物提取物和口服制剂。尤其优选的是包含 Balansin A 和/或 Balansin B 的根据本发明的混合物,根据本发明的植物提取物和根据本发明的口服制剂。

[0109] 优选地,在一种优选实施方式中,本发明还涉及通过下列步骤(a)赋予和/或增强一种、两种或多种甜味物质的甜味印象和/或(b)生成根据本发明的口服制剂:

[0110] a) 提供根据本发明的化合物(优选地,在一种优选实施方式中提供)和/或根据本发明的化合物的生理上可接受的盐(优选地,在一种优选实施方式中提供),根据本发明的混合物(优选地,在一种优选实施方式中提供)和/或根据本发明的提取物(优选地,在一种优选实施方式中提供),

[0111] b) 提供口服制剂, 优选地, 所述口服制剂包含一种、两种或多种其它甜味物质,

[0112] c) 使步骤 a) 和 b) 中提供的成分接触或混合。

[0113] 根据本发明的优选方法包括以下步骤:

[0114] a-i) 通过提取植物材料(优选地, 来自 *Mycetia balansae* 的植物材料)生产根据本发明的提取物(优选地, 以一种优选实施方式生成), 所述提取物包含根据本发明的化合物(优选地, 在一种优选实施方式中包含)和 / 或根据本发明的化合物的生理上可接受的盐(优选地, 在一种优选实施方式中包含), 或根据本发明的混合物(优选地, 在一种优选实施方式中包含);

[0115] a-ii) 任选地将步骤(a-i) 中生产的提取物进一步加工成含有根据本发明的化合物、根据本发明的化合物的生理上可接受的盐, 或根据本发明的混合物的进一步加工的产品,

[0116] b) 提供口服制剂, 优选地, 所述口服制剂包含一种、两种或多种其它甜味物质,

[0117] c) 使来自步骤 b) 的口服制剂与步骤 a-i) 中生成的提取物和 / 或步骤 a-ii) 中生成的进一步加工的产品接触或混合, 优选地, 所述口服制剂包含一种、两种或多种其它甜味物质。

[0118] 优选的是根据本发明的待口服的制剂, 所述制剂含有一种或多种式(I)、(II) 或(III) 的化合物和 / 或一种或多种式(I)、(II) 或(III) 的根据本发明的化合物的生理上可接受的盐, 其总量足以在待口服的制剂中产生甜味感觉, 所述感觉至少等于由 2wt% 蔗糖水溶液组成的参照制剂的感觉。

[0119] 本发明的另一方面涉及含有一种或多种式(I) 的化合物和 / 或其药学上可接受的盐和 / 或其混合物并结合有至少其它甜味物质的待口服的制剂(口服制剂)。

[0120] 优选的是根据本发明的待口服的制剂, 所述制剂包含一种或多种式(I)、(II) 或(III) 的化合物和 / 或一种或多种式(I)、(II) 或(III) 的根据本发明的化合物的生理上可接受的盐, 以及至少其它甜味物质, 其浓度足以在待口服的制剂中产生甜味感觉, 所述感觉至少等于由 2wt% 蔗糖水溶液组成的参照制剂的感觉。

[0121] 在该情况下, 优选地, 所述甜味印象协同增加。

[0122] 本发明的目标还涉及增强通过品尝口服制剂产生的甜味印象的方法, 所述方法包括以下步骤:

[0123] a) 提供口服制剂, 所述口服制剂包含一种或多种其它甜味物质, 所述甜味物质共同赋予与含有浓度为 2wt% 的蔗糖的蔗糖水溶液的甜味印象等同的或比这种蔗糖水溶液的甜味印象更强的甜味印象,

[0124] b) 提供一种或多种式(I) 的根据本发明的化合物, 或者

[0125] 提供根据本发明的提取物(优选地, *Mycetia balansae* 的根据本发明的提取物), 所述提取物包含一种或多种式(I) 的化合物, 其中, 优选地, 所述化合物的含量为提取物的干质量的 0.00001wt% 至 99wt%, 优选地, 0.0001wt% 至 95wt%, 尤其优选地, 0.0005wt% 至 80wt%, 最优选地, 0.001wt% 至 30wt%,

[0126] c) 将步骤 a) 和 b) 中提供的成分混合。

[0127] 在本发明意指范围内的其它甜味物质可为天然生成的植物提取物的甜味物质, 但也可为合成的甜味物质。

[0128] 例如,天然生成的甜味物质(包括植物提取物)可为甜味的糖类(例如蔗糖、海藻糖、乳糖、麦芽糖、松三糖、蜜二糖、棉籽糖、帕拉金糖、乳果糖、D-果糖、D-葡萄糖、D-半乳糖、L-鼠李糖、D-山梨糖、D-甘露糖、D-塔格糖、D-阿拉伯糖、L-阿拉伯糖、D-核糖、D-甘油醛、麦芽糊精)、糖醇(例如赤藓糖醇、苏糖醇、阿糖醇、核糖醇、木糖醇、山梨醇、甘露醇、麦芽糖醇、异麦芽糖醇、半乳糖醇、乳糖醇)、蛋白质(例如神秘果素、皮泰亭(pentaidin)、莫内林、奇异果甜蛋白、仙茅甜蛋白、布拉齐因、马宾灵(mabinlin))、D-氨基酸(例如D-苯基丙氨酸、D-色氨酸)或获自含有这些氨基酸和/或蛋白质的天然资源的提取物或片段、新橙皮苷二氢查尔酮、柚苷二氢查尔酮、甜菊糖苷、甜菊苷、甜菊双糖苷、莱鲍迪苷、莱鲍迪苷A、莱鲍迪苷B、莱鲍迪苷C、莱鲍迪苷D、莱鲍迪苷E、莱鲍迪苷F、莱鲍迪苷G、莱鲍迪苷H、杜尔可苷、甜叶悬钩子苷、甜茶苷A、甜茶苷B、甜茶苷G、甜茶苷H、甜茶苷I、甜茶苷J、白元参苷1、白元参苷2、糙苏苷1、糙苏苷2、糙苏苷3和糙苏苷4、相思子三萜甙A、相思子三萜甙B、相思子三萜甙C、相思子三萜甙D、环卡司A(cyclocaryoside A)和环卡司I(cyclocaryoside I)、奥斯雷丁、聚波朵苷A、丝甜奇1(strogin1)、丝甜奇2(strogin2)、丝甜奇4(strogin4)、赛桂因A(selligueain A)、二氢槲皮素-3-醋酸盐、紫苏萜、特洛莫思 A_{15} (telosmoside A_{15})、巴西甘草甜素I-V、蝶卡苷(pterocaryoside)、环卡司(cyclocaryosides)、木库罗苷(mukurozioside)、反式茴香脑、反式肉桂醛、布赖斯(bryosides)、布赖诺斯(bryonosides)、布赖诺卡斯(bryonodulcosides)、肉质雪胆皂苷、司地诺斯(scandenosides)、绞股蓝皂苷、三叶苷、根皮苷、二氢黄烷醇、苏木精、青色素、绿原酸、合欢皂素、特洛莫思(telosmosides)、甘查奥思(gaudichaudioside)、罗汉果苷、罗汉果苷V、荷兰度辛(hernandulcin)、莽那亭(monatin)、甘草次酸及其衍生物,尤其是甘草甜素(优选地,作为铵盐),以及叶甜素,由此,在天然产生的甜味剂的情况下,也可使用提取物或这些提取物的富集片段,例如奇异果提取物(卡特莫夫灌木)、甜叶菊种(*Stevia* ssp.) (尤其是 *Stevia rebaudiana*) 的提取物、swingle 提取物(苦瓜属 *Momordica* 或 *Siratia grosvenorii*, 罗汉果)、*Glycerrhizia* ssp. (尤其是 *Glycerrhizia glabra*) 的提取物、悬钩子属(*Rubus* ssp., 尤其是 *Rubus suavissimus*) 的提取物、柑橘提取物、*Lippia dulcis* 的提取物。

[0129] 根据本发明,优选的是口服制剂,所述口服制剂另外包含一种、两种、三种、四种、五种、六种、七种、八种、九种、十种或多种其它物质,所述物质选自下列(a1)至(a5)组:

[0130] (a1) 调味料,优选地,一种、两种、三种、四种、五种或多种选自以下物质的调味料:香草醛、乙基香草醛、2-羟基-4-甲氧基苯甲醛、异丁酸乙基香兰酯(=3-乙氧基-4-异丁酰氧苯甲醛)、**furaneol**[®] (2,5-二甲基-4-羟基-3(2H)-呋喃酮)及衍生物(例如酱油酮、2-乙基-4-羟基-5-甲基-3(2H)-呋喃酮)、环高呋喃酮(homofurono1) (2-乙基-5-甲基-4-羟基-3(2H)-呋喃酮和5-乙基-2-甲基-4-羟基-3(2H)-呋喃酮)、麦芽酚及其衍生物(例如乙基麦芽酚)、香豆素及其衍生物、 γ -内酯(例如 γ -十一碳内酯、 γ -壬内酯)、 δ -内酯(例如4-甲基 δ -内酯、芳香薄荷内酯、 δ -癸内酯、结节内酯(tuberolactone))、山梨酸甲酯、双香草醛,4-羟基-2(或5)-乙基-5(或2)-甲基-3(2H)呋喃酮、2-羟基-3-甲基-2-环戊烯酮、3-羟基-4,5-二甲基-2(5H)-呋喃酮、果实酯类和果实内酯(例如乙酸正丁酯、乙酸异戊酯、丙酸乙酯、丁酸乙酯、丁酸正丁酯、丁酸异戊酯、3-甲基-丁酸乙酯、正己酸乙酯、正己酸烯丙酯、正己酸正丁酯、正辛酸乙酯、乙基-3-甲基-3-苯基环氧丙酸酯、乙

基-2-反式-4-顺式-癸二烯酸酯)、4-(p-羟苯基)-2-丁酮、1,1-二甲氧基-2,2,5-三甲基-4-己烷,2,6-二甲基-5-庚烯-1-醛和苯乙醛;

[0131] (a2)选自下列物质的糖类:蔗糖、海藻糖、乳糖、麦芽糖、松三糖、蜜二糖、棉子糖、帕拉金糖、乳果糖、D-果糖、D-葡萄糖、D-半乳糖、L-鼠李糖、D-山梨糖、D-甘露糖、D-塔格糖、D-阿拉伯糖、L-阿拉伯糖、D-核糖、D-甘油醛、麦芽糊精和含有一种或多种上述糖类的植物制剂,优选地,所述糖类的比例为至少5wt%,优选地,至少15wt%,其中,所述糖类还可作为天然生成的或合成的混合物提供,在该情况下,尤其可作为蜂蜜、转化糖浆或来自玉米淀粉的高富集的果糖浆以及这些糖类的生理上可接受的盐,尤其是钠、钾、钙或铵盐提供;

[0132] (a3)糖醇,优选地为选自以下物质的天然生成的糖醇:丙三醇、赤藓糖醇、苏糖醇、阿糖醇、核糖醇、木糖醇、山梨醇、甘露醇、麦芽糖醇、异麦芽糖醇、半乳糖醇、乳糖醇以及这些糖醇的生理上可接受的盐,尤其是钠、钾、钙或铵盐;

[0133] (a4)天然生成的甜味剂,优选地,所述甜味剂选自:

[0134] (a4-1)神秘果素、莫内林、马宾灵、奇异果甜蛋白、仙茅甜蛋白、布拉齐因、皮泰亭(pentaidin)、D-苯丙氨酸、D-色氨酸以及获自含有这些氨基酸和/或蛋白质的自然资源中得到的提取物或片段以及这些氨基酸和/或蛋白质的生理上可接受的盐,尤其是钠、钾、钙或铵盐;

[0135] (a4-2)新橙皮苷二氢查尔酮、柚苷二氢查尔酮、甜菊苷、甜菊双糖苷、莱鲍迪苷,尤其是莱鲍迪苷A、莱鲍迪苷B、莱鲍迪苷C、莱鲍迪苷D、莱鲍迪苷E、莱鲍迪苷F、莱鲍迪苷G、莱鲍迪苷H,杜尔可苷和甜叶悬钩子苷、甜茶苷A、甜茶苷B、甜茶苷G、甜茶苷H、甜茶苷I、甜茶苷J、白元参苷1、白元参苷2、糙苏苷1、糙苏苷2、糙苏苷3和糙苏苷4、相思子三萜甙A、相思子三萜甙B、相思子三萜甙C、相思子三萜甙D、cyclocaryoside A和cyclocaryoside I、奥斯雷丁、聚波朵苷A、strogen1、strogen2、strogen4、selliguenin A、二氢槲皮素-3-醋酸酯、紫苏萜、telosmoside A₁₅、巴西甘草甜素I-V、蝶卡苷(pterocaryoside)、cyclocaryosides、木库罗苷(mukurozioside)、反式茴香脑、反式肉桂醛、bryosides、bryonosides、bryonodulcosides、肉质雪胆皂苷、scandenosides、绞股蓝皂苷、三叶苷、根皮苷、二氢黄烷醇、苏木精、青色素、绿原酸、合欢皂素、telosmosides、gaudichaudioside、罗汉果苷、罗汉果苷V、荷兰度辛、莽那亭(monatin)、叶甜素、甘草次酸及甘草次酸的衍生物,尤其是甘草次酸的苷类(例如甘草甜素)以及这些化合物的生理上可接受的盐,尤其是钠、钾、钙或铵盐;

[0136] (a4-3)提取物或提取物的富集片段,选自:奇异果提取物(卡特莫夫灌木)、甜叶菊种(*Stevia* ssp.) (尤其是*Stevia rebaudiana*)的提取物、swingle提取物(苦瓜属*Momordica*或*Siratia grosvenorii*,罗汉果)、*Glycyrrhiza* ssp. (尤其是*Glycyrrhiza glabra*)的提取物、悬钩子属(*Rubus* ssp.,尤其是*Rubus suavissimus*)的提取物、柑橘提取物以及*Lippia dulcis*的提取物;

[0137] (a5)合成的甜味物质,优选地,选自下列物质:唛甘浦(magap)、环拉酸钠或环拉酸的其它生理上可接受的盐、安赛蜜K或其它生理上可接受的盐、新橙皮苷二氢查尔酮、柚苷二氢查尔酮、沙卡林(saccharin)、沙卡林-钠盐、阿斯巴甜、超级阿斯巴甜、纽甜、阿力甜、糖精(advantame)、紫苏萜、三氯蔗糖、胍乙酸、卡瑞来(carrelame)、苏洛内特(sucrononate)和苏洛奥内特(sucrooctate)。

- [0138] 上述(a1)组的调味料产生或加强甜的气味和/或味道印象,可用作味道调节剂。
- [0139] 此外,我们的研究显示上述甜味物质的甜味印象可通过 *Mycetia balansae* 的根据本发明的待用提取剂特别有效地加强。
- [0140] 在优选的实施方式中,式(I)的化合物的总量以及上述(a4)和(a5)组的甜味物质的总量的范围为直接口服的口服制剂的总质量的 0.001wt% 至 1wt%, 优选地, 0.001wt% 至 0.5wt%, 更优选地, 0.003wt% 至 0.1wt%。
- [0141] 除了根据本发明的化合物及其生理上可接受的盐和/或其混合物,根据本发明的优选口服制剂还含有一种或多种增强甜味印象的其它物质。
- [0142] 优选地,增强甜味印象的其它物质(不限于本发明)选自羟基去氧安息香,例如,2-(4-羟基-3-甲氧基苯基)-1-(2,4,6-三羟基苯基)乙酮、1-(2,4-二羟基苯基)-2-(4-羟基-3-甲氧基苯基)乙酮、1-(2-羟基-4-甲氧基苯基)-2-(4-羟基-3-甲氧基苯基)乙酮(尤其例如 W02006/106023 中描述的,与本文公开的相应的化合物有关的 W02006/106023 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分);羟苯基 alkanedion, 例如异毛茛辣二酮(isogingerdion-[2]) (尤其例如 W02007/003527 中描述的,与本文公开的相应的化合物有关的 W02007/003527 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分);二乙酰三聚物(尤其例如 W02006/058893 中描述的,与本文公开的相应的化合物有关的 W02006/058893 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分);双香草醛(尤其例如 W02004/078302 中描述的,与本文公开的相应的化合物有关的 W02004/078302 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分);W02007/014879 中公开的橙皮素,与本文公开的相应的化合物有关的 W02007/014879 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分,4-羟基二氢查尔酮,因此,尤其地,EP1998636B1 中公开的根皮素(与这些化合物有关的 EP1998636B1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分),或者如 EP1955601A1 中描述的丙烯基苯基苷类(姜叶酚苷类)(与这些化合物有关的 EP1955601A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、如 EP2253226A1 中公开的羟基黄烷(与这些化合物有关的 EP2253226A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、如 EP2298084A1 中公开的 *Hydrangea macrophylla* 的一些提取物(与这些化合物有关的 EP2298084A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、如申请号为 10152331.4 (Symrise) 的欧洲专利申请中公开的 1-(2,4-二羟基苯基)-3-(3-羟基-4-甲氧基苯基)-丙-1-酮(与这些化合物有关的该专利申请以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)。
- [0143] 在这种情况下,优选的甜味增强物质尤其为橙皮素、根皮素、3',7-二羟基-4'-甲氧基黄烷和 (S)-3',7-二羟基-4'-甲氧基黄烷、一些绣球花提取物或叶甜素、以及 1-(2,4-二羟基苯基)-3-(3-羟基-4-甲氧基苯基)-丙-1-酮。
- [0144] 此外,涉及根据本发明的制剂的甜味印象的增强效果可通过最后提到的组中的物质实现。
- [0145] 此外,含有一种或多种其它芳香植物提取物、调味料、辅助物质或载体物质的根据本发明的制剂是优选的。
- [0146] 显然,根据本发明的优选的制剂还含有其它常规食品成分。
- [0147] 在根据本发明的优选的口服制剂中,式(I)的化合物的总量的范围为制剂的总质量的 0.01ppm 至 95wt%, 优选地, 0.1ppm 至 90wt%, 优选地, 1ppm 至 50wt%, 更优选地, 1ppm 至

20wt%，最优选地，1ppm 至 5wt%。

[0148] 尤其优选的是根据本发明的口服制剂，优势是适于直接食用的口服制剂，式(I)的化合物的总量的范围为制剂的总重量的 0.01ppm 至 1000ppm，优选地，0.1ppm 至 500ppm，尤其优选地，1ppm 至 100ppm。

[0149] 如上已说明的，即使在非常低的浓度条件下，也可使用式(I)的化合物的甜味增强功能，上文也说明了所述增强是协同作用的。

[0150] 根据本发明的口服制剂是优选的，所述制剂选自：药物制剂、口腔护理制剂、营养型或刺激型液体或固体食品制剂以及可能与口腔接触的用于头部的美容制剂。

[0151] 根据本发明的制剂还可以半成品的形式提供，所述半成品一般不被直接口服，但用于生产直接食用的根据本发明的口服制剂。

[0152] 在这种情况下，基于得到的口服制剂的总质量，优选地，根据本发明的半成品在 0.0001wt% 至 90wt%，优选地，0.001wt% 至 50wt%，尤其优选地，0.01wt% 至 20wt% 的浓度范围条件下使用。例如，这种半成品可作为调味料组合物提供。

[0153] 除了一种或多种式(I)、(II)和/或(III)的化合物和/或一种或多种这些化合物的生理上可接受的盐，本发明意指范围内的调味料组合物含有至少(i)一种、两种、三种、四种、五种、六种、七种、八种、九种、十种或多种(其它)调味料和/或(ii)一种、两种、三种、四种、五种、六种、七种或多种(其它)有味道的物质。

[0154] 如已经提到的，新鲜的或干燥的植物 *Mycetia balansae* 本身不是本发明的目的。相比之下，除了一种或多种干燥的 *Mycetia balansae* 的植物部分(优选干燥粉末形式的植物部分)，根据本发明的口服制剂还可包含一种或多种其它适于食用的成分，优选地，所述其它适于食用的成分不能从 *Mycetia balansae* 中提取，且优选地，不能在 *Mycetia balansae* 中得到。

[0155] 在这种情况下，根据本发明的尤其优选的口服制剂为除了一种或多种干燥的 *Mycetia balansae* 的植物部分，还含有一种、两种、三种、四种、五种或多种(其它)调味料的制剂，优选地，所述调味料选自上述(a1)组和/或下述(A)组。

[0156] 如上所述，本发明的一方面涉及式(I)的根据本发明的化合物、根据本发明的混合物或者半成品形式的根据本发明的口服制剂的实现甜味印象、增强甜味印象和/或作为味道调节剂的用途。

[0157] 因此，本发明还涉及根据本发明的化合物(优选地，在一种优选实施方式中)和/或根据本发明的化合物的生理上可接受的盐(优选地，在一种优选实施方式中)、根据本发明的混合物(优选地，在一种优选实施方式中)或者根据本发明的提取物(优选地，在一种优选实施方式中)的在口服制剂中产生甜味印象或增强口服制剂的甜味印象的用途，所述口服制剂包含至少其它(优选天然生成的)甜味物质。

[0158] 由此，口服制剂可优选为甜味制剂、营养型制剂、膳食补充制剂、口腔护理制剂或刺激型制剂、美容制剂(优选用于头部)，或者口服药物制剂(即用于口服的药物制剂)。

[0159] 除了根据本发明的待用的 *Mycetia balansae* 的提取物，本发明意指范围内的调味料组合物可包含一种或多种不同的天然或非天然调味料和/或芳香食品、反应香精、香味制剂、有味道的物质、其它调节味道的物质、前体、其它调味料、添加剂、甜味剂、着色剂和酸化剂、稳定剂以及溶剂、辅助物质和载体物质。

[0160] 优选地,在本发明的范围内,优选使用的(一种或多种)调味料选自下列(A)组:乙酰苯、己酸丙烯酯、 α -紫罗酮、 β -紫罗酮、茴香醛、茴香醇乙酸酯、甲酸茴香酯、苯甲醛、苯并噻唑、乙酸苜蓿酯、苜蓿醇、苯甲酸苜蓿酯、 β -紫罗酮、丁酸丁酯、己酸丁酯、丁烯基酞内酯、香芹酮、茨烯、石竹烯、桉树脑、乙酸肉桂酯、柠檬醛、香茅醇、香茅醛、乙酸香茅酯、乙酸环己酯、伞花烃、大马酮(damascone)、癸内酯、二氢香豆素、邻胺苯甲酸二甲酯、邻氨基苯钾酸酯、十二内酯、乙酸乙氧乙酯、乙基丁酸、丁酸乙酯、癸酸乙酯、己酸乙酯、巴豆酸乙酯、乙基呋喃酮、乙基愈创木酚、异丁酸乙酯、异戊酸乙酯、乳酸乙酯、乙基丁酸甲酯、丙酸乙酯、桉油精、丁子香酚、庚酸乙酯、4-(*p*-羟苯甲基)-2-丁酮、 γ -癸内酯、香叶醇、乙酸香叶酯、乙酸香叶酯、葡萄柚醛、二氢茉莉酮酸甲酯(例如 **Hedion®**)、胡椒醛、2-庚酮、3-庚酮、4-庚酮、反式-2-庚烯醛、顺式-4-庚烯醛、反式-2-己烯醛、顺式-3-己烯醇、反式-2-己酸、反式-3-己酸、顺式-2-乙酸叶醇酯、顺式-3-乙酸叶醇酯、顺式-3-己酸己烯酯(hexenyl capronate)、反式-2-己酸己烯酯、顺式-3-甲酸己烯酯、顺式-2-乙酸己酯、顺式-3-乙酸己酯、反式-2-乙酸己酯、顺式-3-甲酸己酯、对-羟基苜蓿基丙酮、异戊醇、异戊酸异戊酯、丁酸异丁酯、异丁醛、异丁香基甲基醚、异丙基甲基噻唑、月桂酸、leavulinic acid、芳樟醇、氧化芳樟醇、乙酸芳樟酯、薄荷醇、薄荷呋喃、邻氨基苯甲酸甲酯、甲基丁醇、甲基丁酸、2-甲基丁基乙酸酯、己酸甲酯、肉桂酸甲酯、5-甲基糠醛、3,2,2-甲基环戊烯醇酮、6,5,2-甲基庚烯酮、二氢茉莉酮酸甲酯、茉莉酮酸甲酯、2-甲基甲基丁酯、2-甲基-2-戊烯酸、硫代丁酸甲酯、3,1-甲硫基己醇、3-甲硫基乙酸己酯、橙花醇、橙花醇乙酸酯、反式,反式-2,4-壬二烯醛、2,4-壬二烯醇、2,6-壬二烯醇、2,4-壬二烯醇、圆柚酮、 δ -辛内酯、 γ -辛内酯、2-辛醇、3-辛醇、1,3-辛烯醇、1-乙酸辛酯、3-乙酸辛酯、棕榈酸、三聚乙醛、水芹烯、乙酰基丙酮、乙酸苯乙酯、苯乙醇、苯乙醇、苯乙基异戊酸酯、胡椒醛、丙醛、丁酸丙酯、长叶薄荷酮、长叶薄荷醇、甜橙醛、硫噻唑(sulfurool)、萜品烯、萜品醇、萜品油烯、8,3-硫代孟烷酮(thiomenthanone)、4,4,2-硫代甲基戊酮、百里香酚、 δ -十一内酯、 γ -十一内酯、朱栾倍半萜、戊酸、香草醛、乙偶姻、乙基香草醛、异丁酸乙基香兰酯(=3-乙氧基-4-异丁酰氧苯甲醛)、2,5-二甲基-4-羟基-3(2H)-呋喃酮及其衍生物(在此优选酱油酮(homofuraneol)(=2-乙基-4-羟基-5-甲基-3(2H)-呋喃酮)、homofuronol(=2-乙基-5-甲基-4-羟基-3(2H)-呋喃酮和5-乙基-2-甲基-4-羟基-3(2H)-呋喃酮)、麦芽酚和麦芽酚衍生物(在此优选乙基麦芽酚)、香豆素和香豆素衍生物、 γ -内酯(在此优选 γ -十一内酯、 γ -壬内酯、 γ -癸内酯)、 δ -内酯(在此优选4-甲基 δ -癸内酯、芳香薄荷内酯、 δ -癸内酯、结节内酯(tuberolactone))、山梨酸甲酯、双香兰素、4-羟基-2(或5)-乙基-5(或2)-甲基-3(2H)呋喃酮、2-羟基-3-甲基-2-环戊烯酮、3-羟基-4,5-二甲基-2(5H)-呋喃酮、乙酸异戊基酯、丁酸乙酯、丁酸正丁酯、丁酸异戊基酯、3-甲基-丁酸乙酯、*n*-己酸乙酯、*n*-己酸烯丙酯、*n*-己酸*n*-丁酯、*n*-辛酸乙酯、乙基-3-甲基-3-苯基环氧丙酸酯、乙基-2-反式-4-顺式-癸二烯酸酯、4-(*p*-羟苯基)-2-丁酮、1,1-二甲氧基-2,2,5-三甲基-4-己烷、2,6-二甲基-5-庚-1-醛、苯基乙醛、2-甲基-3-(甲硫基)呋喃、2-甲基-3-呋喃硫醇、二(2-甲基-3-呋喃基)二硫化物、糠基硫醇、甲硫基丙醛、2-乙酰基-2-噻唑啉、3-巯基-2-戊酮、2,5-二甲基-3-呋喃硫醇、2,4,5-三甲基噻唑、2-乙酰基噻唑、2,4-二甲基-5-乙基噻唑、2-乙酰基-1-吡咯啉、2-甲基-3-乙基吡嗪、2-乙基-3,5-二甲基吡嗪、2-乙基-3,6-二甲基吡嗪、2,3-二乙基-5-甲基吡嗪、3-异丙基-2-甲氧基吡嗪、3-异丁

基-2-甲氧基吡嗪、2-乙酰基吡嗪、2-戊基吡啶、(E,E)-2,4-癸二烯醛、(E,E)-2,4-壬二烯醛、(E)-2-辛烯醛、(E)-2-壬烯醛、2-十一烯醛、12-甲基十三醛、1-戊烯-3-酮、4-羟基-2,5-二甲基-3(2H)-咪喃酮、愈创木酚、3-羟基-4,5-二甲基-2(5H)-咪喃酮、3-羟基-4-甲基-5-乙基-2(5H)-咪喃酮、肉桂醛、肉桂醇、水杨酸甲酯、异蒲勒醇(isopulegol)和(文中未具体列出的)这些物质的立体异构体、对映体、位置异构体、非对映体、顺式/反式异构体和差向异构体。

[0161] 在优选的实施方式中,根据本发明的调味料组合物的总量范围为直接用于食用的口服制剂的总质量的0.01wt%至1wt%,优选地,0.01wt%至0.5wt%,更优选地,0.01wt%至0.1wt%,优选地,所述调味料组合物含有一种、两种、三种、四种、五种或多种来自上述(a1)组和/或(A)组的调味料。

[0162] 例如,本发明意指范围内的液体和固体营养型或刺激型食品制剂为焙烤食品(例如面包、饼干、蛋糕、其它焙烤食品)、狭义上的糕点糖果(例如巧克力、酒吧巧克力食品、其它酒吧食品、果味橡皮糖、硬的或软的糖果、口香糖)、酒精饮料或非酒精性饮料(例如咖啡、茶、酒、含酒饮料、啤酒、含啤酒的饮料、利口酒、烈性酒、白兰地、含水果的柠檬水、等张饮料、软饮料、花蜜、水果和蔬菜汁、水果汁或蔬菜汁制剂)、速溶饮料(例如速溶可可饮料、速溶茶饮料、速溶咖啡饮料)、肉制品(例如火腿、冷切肠或熏制的香肠制剂、含香料的或卤泡的生肉或腌肉制品)、蛋类或蛋制品(蛋粉、蛋白、蛋黄)、谷物制品(例如早餐燕麦片、燕麦坚果棒、预煮的即食米制品)、奶制品(例如牛奶饮料、牛奶冰淇淋、酸奶、克菲尔、白软干酪、软干酪、硬质奶酪、奶粉、乳清、黄油、酪乳、含有部分或全部水解的乳蛋白的制品)、来自大豆蛋白或其它大豆部分的制品(例如豆奶及用其制备的食品、含大豆磷脂的制剂、发酵食品,所述发酵食品例如豆腐或豆豉或用其制备的食品(例如酱油))、水果制剂(例如果酱、果汁冰糕、果实沙司、水果馅)、蔬菜制剂(例如番茄酱、调味酱、干菜、冷冻蔬菜、预煮蔬菜、醋泡蔬菜、瓶装蔬菜)、零食(例如焙烤的或油炸的土豆片或土豆面团、面包团、基于玉米或花生的挤出物)、基于油脂的食品或其乳剂(例如美乃滋、蛋黄酱、敷料剂、香料制剂)、其它做好的饭菜和汤(例如汤粉、速溶汤、预煮的汤)、香味料、调味品混合物,尤其是例如可用于快餐行业的调味品。

[0163] 本发明意指范围内的制剂也可以作为膳食补充剂提供,所述膳食补充剂可为如下形式:胶囊、药片(无包衣片剂和包衣片剂,例如耐胃酸的包衣)、糖包衣药丸、颗粒、小球、固体混合物、液体相中的分散体、作为乳剂、作为粉末、作为溶液、作为糊剂或其它可吞食或咀嚼的剂型。

[0164] 本发明意指范围内的口腔护理制剂(口腔卫生产品)尤其为口腔和/或牙齿卫生产品,例如牙膏、牙凝胶、牙粉、漱口水、口香糖和其它口腔护理产品。

[0165] 本发明意指范围内的口服药物制剂为以如下形式提供的制剂:例如胶囊、药片(无包衣片剂和包衣片剂,例如耐胃酸的包衣)、糖包衣药丸、颗粒、小球、固体混合物、液体相中的分散体、作为乳剂、作为粉末、作为溶液、作为糊剂或其它可吞食或咀嚼的剂型,并且所述口服药物制剂用作仅凭处方可购买的药品、不需处方可购买的药品或其它药品或膳食补充剂。

[0166] 用于头部的美容制剂尤其为那些即使正确用于皮肤,也可与口腔接触的制剂,例如,如已经提及的,用于头部的美容制剂,例如肥皂、其它用于面部的清洁产品或护理产品、

面霜、面部乳液或面部药膏、防晒产品、胡须清洁或护理产品、剃须泡沫、剃须皂或剃须膏、唇膏或其它唇部化妆品或唇部护理产品。

[0167] 可含有含量高达制剂总重量的 99.999999wt%，优选地，10wt% 至 80wt% 的根据本发明的用于口服制剂的其它常规的活性的、母体的、辅助物质和添加剂物质。在这种情况下，优选地，根据本发明的口服制剂可含有含量高达制剂总重量的 99.999999wt%，优选地，1wt% 至 95wt%，优选地，5wt% 至 80wt% 的水。

[0168] 根据本发明的含有 *Mycetia balansae* 的提取物的制剂根据优选实施方式生成，在所述优选实施方式中，优选地，将 *Mycetia balansae* 的提取物作为调味料组合物以与固体或液体载体物质的混合物的形式并入口服基础制剂中。优选地，作为溶液提供的根据本发明的制剂还可通过喷雾干燥转化为固体剂型。

[0169] 根据另一优选实施方式，对于生产根据本发明的口服制剂而言，*Mycetia balansae* 的提取物或含有这些物质的调味料组合物也预先并入乳剂、脂质体(例如开始于卵磷脂)、微球体、纳米球体中或也并入胶囊、颗粒或适于食品和刺激剂的基质的挤出物中，所述基质例如淀粉、淀粉衍生物、纤维素或纤维素衍生物(例如羟丙基纤维素)、其它多糖(例如藻酸盐)、天然脂肪、天然蜡(例如蜂蜡、巴西棕榈蜡)或者蛋白质(例如胶质)。

[0170] 在另一优选的生产方法中，*Mycetia balansae* 的提取物或含有这些物质的调味料组合物预先与一种或多种合适的螯合剂复合并以这种复合形式使用，例如，所述提取物或组合物与环糊精或环糊精衍生物(优选地， α -环糊精或 β -环糊精)复合。

[0171] 尤其优选的根据本发明的口服制剂中，选择基质以使 *Mycetia balansae* 的提取物，或者更准确地，式(I)的 balansin 从基质中缓慢释放，从而获得持久效果。

[0172] 用于食品或刺激剂的常规的母体物质、辅助物质和添加剂物质可用作根据本发明的口服制剂的其它成分，例如水、新鲜的或加工的植物或动物母体物质或起始原料(例如未加工的、烘烤的、干燥的、发酵的、熏制的和 / 或煮熟的肉、骨头、软骨、鱼、蔬菜、水果、草药、坚果、蔬菜或水果的汁或糊状物或其混合物)的混合物、易消化的或难消化的、不甜糖类(例如糊精、直链淀粉、支链淀粉、菊粉、木聚糖、纤维素)、天然脂肪或硬化脂肪(例如牛脂、猪油、棕榈油、椰子油、硬化植物油)、油类(例如向日葵油、花生油、玉米油、橄榄油、鱼油、豆油、芝麻油)、脂肪酸或其盐(例如硬脂酸钾)、蛋白胺基酸(proteinogenic)的氨基酸或非蛋白氨基酸的氨基酸及相关化合物(例如 γ -氨基丁酸、牛磺酸)、肽(例如谷胱甘肽)、天然或加工的蛋白(例如明胶)、酶(例如肽酶)、核酸、核苷酸、其它用于不好的味道印象的调味剂、用于其它非一般不好的味道印象的味道调节剂、其它味道调节物质(例如肌醇磷酸盐、诸如单磷酸鸟苷、单磷酸腺苷之类的核苷酸或者其它物质，例如谷氨酸钠或 2-苯氧基丙酸)、乳化剂(例如卵磷脂、甘油二酯、阿拉伯胶)、稳定剂(例如卡拉胶、藻酸盐)、防腐剂(例如苯甲酸、山梨酸)、抗氧化剂(例如生育酚、抗坏血酸)、螯合剂(例如柠檬酸)、有机或无机酸化剂(例如苹果酸、醋酸、柠檬酸、酒石酸、磷酸)、其它苦味素(例如奎宁、咖啡因、柠檬烯、苦杏仁苷、humolone、lupolone、儿茶酚、单宁)、矿物盐(例如氯化钠、氯化钾、氯化镁、磷酸钠)、预防酶促褐变的物质(例如亚硫酸盐、抗坏血酸)、香精油、植物提取物、天然或合成的着色剂或颜料(例如类胡萝卜素、黄酮类、花青素、叶绿素及其衍生物)、香味料、三叉神经活性物质或含有这种三叉神经活性物质的植物提取物、合成的、天然的或与天然味道相同的香料或气味和味道调节剂。

[0173] 口腔卫生产品(作为口腔护理制剂的基础)一般含有研磨体系(碾磨剂或磨光剂),例如硅酸、碳酸钙、磷酸钙、氧化铝和 / 或羟基磷灰石、表面活性剂物质(例如月桂烷硫酸钠、月桂肌氨酸钠和 / 或椰油酰胺丙基甜菜碱)、湿润剂(例如丙三醇和 / 或山梨醇)、增稠剂(例如羧甲基纤维素、聚乙二醇、卡拉胶和 / 或Laponite[®])、用于不好的味道印象的味道调节剂、用于其它一般与不好的味道不同的味道印象的味道调节剂、味道调节物质(例如磷酸肌醇、诸如单磷酸鸟苷、单磷酸腺苷之类的核苷酸或者其它物质,例如谷氨酸钠或 2- 苯氧基丙酸)、冷却剂(例如薄荷醇、薄荷醇衍生物(例如 L- 薄荷醇、L- 乳酸薄荷酯、L- 碳酸薄荷基烷基酯、薄荷酮缩醇、薄荷烷羧酸酰胺)、2, 2, 2- 三烷基乙酰胺(例如 2, 2- 二异丙基丙酸甲基酰胺)、缩水甘油衍生物、稳定剂和活性物质(例如氟化钠、一氟磷酸钠、氟化锡(II)、季铵氟化物、柠檬酸锌、硫酸锌、焦磷酸锡、氯化锡(II)、不同焦磷酸钠盐的混合物、三氯生、氯化十六烷基吡啶、乳酸铝、柠檬酸钾、硝酸钾、氯化钾、氯化锶、过氧化氢)、香味料和 / 或碳酸钠或味道调节剂。

[0174] 口香糖(作为口腔护理制剂的另一实例)一般包含口香糖基质(即咀嚼时变成塑胶的咀嚼块)、其它用于不好的味道印象的味道调节剂、用于其它一般与不好的味道不同的味道印象的味道调节剂、味道调节物质(例如肌醇磷酸盐、诸如单磷酸鸟苷、单磷酸腺苷之类的核苷酸或诸如谷氨酸钠或 2- 苯氧基丙酸之类的其它物质)、湿润剂、增稠剂、乳化剂、其它香味剂和稳定剂或气味调节剂。

[0175] 用于口服药物制剂的所有传统的其它活性物质、母体物质、辅助物质和添加剂物质可用作根据本发明的口服药物制剂的成分。具体而言,即使味道不好的口服的活性药物也可用作活性物质。活性物质、母体物质、辅助物质和添加剂物质可以其本身已知的方式转化成口服形式。这通过使用惰性的、无毒的、药学上适合的辅助物质定期发生。在其它物质中,它们包含载体物质(例如微晶纤维素)、溶剂(例如液体聚乙二醇)乳化剂(例如十二烷基硫酸钠)、分散剂(例如聚乙烯比咯烷酮)、合成的和天然的生物聚合物(例如白蛋白)、稳定剂(例如诸如抗坏血酸之类的抗氧化剂)、着色剂(例如诸如氧化铁之类的无机颜料)和气味调节剂以及不涉及苦味的味道调节剂。

[0176] 优选地,根据本发明的口服制剂还可含有其它香味组合物以使制剂的味道和 / 或气味更加完美并使制剂的味道和 / 或气味更纯。合适的有香味的组合物包括,例如具有合成的、天然的或与天然香味相同的香味、气味和 / 或味道的物质以及合适的辅助物质和载体物质。本发明认为尤其优选的是,由根据本发明的制剂中包含的具有香味、气味和 / 或味道的物质发出的可能存在的苦味或金属味印象可被降低或抑制,从而改善整体香味特征或味道特征。

[0177] 根据本发明的半成品可以用于加强可以用于加强口服成品的(即用于直接消费的制剂的)甜味印象,该口服成品使用根据本发明的半成品生产。

[0178] 优选地,根据本发明的半成品含有式(I)的化合物或根据本发明的植物提取物(优选为 *Mycetia balansae* 的根据本发明的植物提取物),总含量范围为半成品的总重量的 0.001wt% 至 99wt%, 优选地, 1wt% 至 95wt%, 更优选地, 5wt% 至 95wt%, 尤其优选地, 10wt% 至 95wt%。

[0179] 作为半成品提供的根据本发明的待使用的制剂可用于实现和 / 或加强使用半成品制剂生成的成品制剂的甜味印象。

[0180] 在本发明尤其优选的实施方式中,除了式(I)的根据本发明的化合物之外,根据本发明的制剂还包含式(I)的化合物的生理上可接受的盐、根据本发明的混合物或根据本发明的提取物、一种或多种味道调节剂(即一种或多种不与式(I)对应的其它物质),所述味道调节剂适于:

[0181] 改变或掩盖(本文中的掩盖是指降低或完全抑制)一种或一种以上有不好味道的物质的令人不好的味道印象,或者

[0182] 增强令人愉悦的味道印象,优选地,所述味道印象为除了甜味印象之外的其它味道印象,或者

[0183] 增强具有令人愉悦的味道物质,优选地,除了甜味印象之外,还提供其它令人愉悦的味道印象的具有令人愉悦的味道物质。

[0184] 本发明意指范围内的不好的味道印象为:

[0185] 苦、涩、非常辣、辛辣、粘、白垩味、尘味、干、粉、腐臭、极酸和/或金属味以及

[0186] 相应(如果合适的话,消失非常慢的)余味。

[0187] 本发明意指范围内的令人愉悦的(除了甜味印象之外还有的)味道印象为:

[0188] 油滑、甘、香辣、轻微温暖、凉爽、奶油、鲜(kokumi)。

[0189] 优选地,其它味道调节剂可选自:核苷酸(例如腺苷-5'-单磷酸酯、胞苷-5'-单磷酸酯)或其药学上可接受的盐、lactisole、钠盐(例如氯化钠、乳酸钠、柠檬酸钠、醋酸钠、葡糖酸钠),羟基黄烷酮(例如圣草酚、sterubin(圣草酚-7-甲基醚)、高圣草素)及其钠盐、钾盐、钙盐、镁盐或锌盐(尤其是EP1258200A2中描述的那些,与其中公开的相应化合物有关的EP1258200A2以交叉引用的方式成为本申请的一部分),羟基苯甲酸酰胺(例如2,4-二羟基苯甲酸香草基酰胺、2,4-二羟基苯甲酸-N-(4-羟基-3-甲氧基苄基)酰胺,2,4,6-三羟基苯甲酸-N-(4-羟基-3-甲氧基苄基)酰胺,2-羟基-苯甲酸-N-(4-羟基-3-甲氧基苄基)酰胺,4-羟基苯甲酸-N-(4-羟基-3-甲氧基苄基)酰胺,2,4-二羟基苯甲酸-N-(4-羟基-3-甲氧基苄基)酰胺-单钠盐,2,4-二羟基苯甲酸-N-2-(4-羟基-3-甲氧基苄基)乙基酰胺,2,4-二羟基苯甲酸-N-(4-羟基-3-乙氧基苄基)酰胺,2,4-二羟基苯甲酸-N-(3,4-二羟基苄基)酰胺和2-羟基-5-甲氧基-N-[2-(4-羟基-3-甲氧基苄基)乙基]酰胺;4-羟基苯甲酸香草基酰胺(尤其是W02006/024587中描述的那些,与其中公开的相应化合物有关的W02006/024587以交叉引用的方式成为本申请的一部分);羟基脱氧安息香,例如2-(4-羟基-3-甲氧基苄基)-1-(2,4,6-三羟基苄基)乙酮、1-(2,4-二羟基苄基)-2-(4-羟基-3-甲氧基苄基)乙酮、1-(2-羟基-4-甲氧基苄基)-2-(4-羟基-3-甲氧基苄基)乙酮(尤其是W02006/106023中描述的那些,与其中公开的相应化合物有关的W02006/106023以交叉引用的方式成为本申请的一部分);羟基苯基链烷二酮,例如姜二酮-[2](gingerdion-[2])、姜二酮-[3]、姜二酮-[4]、二氢姜二酮-[2]、二氢姜二酮-[3]、二氢姜二酮-[4],(尤其是W02007/003527中描述的那些物质,与其中公开的相应化合物有关的W02007/003527以交叉引用的方式成为本申请的组成部分);双乙酰三聚体类(尤其是W02006/058893中描述的那些物质,与其中公开的相应化合物有关的W02006/058893以交叉引用的方式成为本申请的组成部分); γ -氨基丁酸类(尤其是W02005/096841中描述的那些物质,与其中公开的相应化合物有关的W02005/096841以交叉引用的方式成为本申请的组成部分);双香兰素(尤其是W02004/078302中描述的那些物质,与其中公开的

相应化合物有关的 W02004/078302 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分) 以及 4- 羟基二羟基查尔酮(优选地如 US2008/227867A1 描述的那样,与其中公开的相应化合物有关的 US2008/227867A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分,本文中,尤其是根皮素和 davidigenin)、氨基酸或者乳清蛋白与卵磷脂的混合物、如 W02007/014879 中公开的橙皮素(与这些化合物有关的 W02007/014879 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、4- 羟基二氢查尔酮(如 W02007/107596 公开的那样,与这些化合物有关的 W02007/107596 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分) 或者 EP1955601A1 中描述的丙烯基苯基苷类(姜叶酚苷类)(与这些化合物有关的 EP1955601A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、墙草碱(尤其是反式墙草碱)及其衍生的香味组合物(如 EP2008530A1 中描述的,与这些化合物和香味组合物有关的 EP2008530A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、如美国临时申请 61/333,435 (Symrise) 及其母案申请(例如申请号为 11165566.8 的欧洲专利申请(Symrise))中描述的来自 *Rubus suavissimus* 的一些提取物(与这些提取物有关的这些专利文件以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、如 W02008/046895A1 和 EP1989944A1 中描述的鲜味化合物(与这些化合物有关的这些专利文件每一篇以交叉引用的方式成为本申请的组成部分),以及如 EP2064959A1 和 EP2135516A1 中描述的鲜味化合物(与其中公开的相应化合物有关的 EP2064959A1 和 EP2135516A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、叶甜素或 *Hydrangea macrophylla* var. *thunbergii* makino 的提取物及其衍生的香味组合物(如 EP2298084A1 和 US2011/0076239A1 中描述的那样,与这些提取物(或更准确地,叶甜素)有关的 EP2298084A1 和 US2011/0076239A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)、羟基黄烷衍生物及其衍生的香味组合物(如 US2010/0292175A1 中描述的,与这些化合物及其衍生的香味化合物有关的 US2010/0292175A1 以交叉引用的方式成为本申请的组成部分)。

[0190] 例如,如果根据本发明的制剂含有较高浓度的式(I)的根据本发明的化合物、式(I)的化合物的生理上可接受的盐、根据本发明的混合物或根据本发明的提取物,则除了产生所描述的期望的感觉效应之外,还产生不期望的甚至不好的味道印象,例如苦味。这些不期望的和 / 或不好的味道印象可被味道调节剂至少部分地降低或者甚至完全抑制。

[0191] 因此,在优选的实施方式中,本发明还涉及根据本发明的制剂,所述制剂含有:

[0192] (a) 式(I)的根据本发明的混合物、式(I)的化合物的生理上可接受的盐、根据本发明的混合物或根据本发明的提取物,以及

[0193] (b) 一种或多种用于掩盖不好的味道印象(尤其是苦味、极酸或涩味印象)的(其它)物质。

[0194] 优选地,在这种情况下,成分(b)中的一种或多种物质选自钠盐(本发明优选氯化钠、乳酸钠、柠檬酸钠、醋酸钠、葡糖酸钠)、高圣草素及其钠盐、圣草酚、反式-墙草碱和悬钩子提取物(优选如申请号为 11165566.8(Symrise)的欧洲专利申请中描述的悬钩子提取物)。

实施例

[0195] 实施例只用于说明本发明而不对其构成任何限定。除非另有说明,所有数据涉及重量。

实施例 1:通过连续提取得到 Mycetia balansae 提取物

[0196] 在室温下,各搅拌 1h 的条件下,以增加极性的方式用 1L 庚烷、二氯甲烷、甲基叔丁基醚、乙酸乙酯和乙醇 / 水(4:1)(按体积计 ;v/v)连续提取 Mycetia balansae 的干燥并研磨的植物地上部分(100g)两次。在这种情况下,连续是指以所述顺序用各提取剂处理植物材料,将各提取剂排出,然后用下一提取剂对已提取的植物材料进行下一步提取。在真空下除去提取剂,品尝并从感官上评价剂量为 500ppm 的糖溶液(5%)形式的所得到的干提取物。

提取剂	产率(基于叶片总重量的 wt%)	Balansin A 和 Balansin B 的含量(wt%)*	味道描述
庚烷	0.3	未检出	香草味、苦
二氯甲烷	0.25	未检出	土的、发霉的、苦、烟熏的味
甲基叔丁基醚	0.2	未检出	苦、涩、烟熏的、肉质的味
乙酸乙酯	0.12	Balansin A 3.8 %	甜味剂、苦、粘、香草味
乙醇/水(4:1) (v/v)	4.7	Balansin A 4.6 % Balansin B 4.5 %	甜味剂、甜、花香、淡果味、弱苦味

[0197] * 通过对照内标的 LC/MS 定量

[0198] 由于乙醇 / 水提取物具有令人愉悦的味道、用较少极性的提取剂通过前述提取除去不好的味道以及具有显著较高的产率,因此选择乙醇 / 水提取物用于进一步测试。

实施例 2:富集的 Mycetia balansae 提取物

[0199] 以 250mg/ml 的浓度将实施例 1 中描述的乙醇 - 水性提取物溶于乙醇 / 水(1:2) (v/v) 中以通过高温液相色谱(HTLC)分离。将 100 μ l 该溶液上样并在 120 $^{\circ}$ C (等温)下通过聚合物柱(PS-DVB, Hamilton PRP-1 ;250x10mm)分馏。使用下述梯度:

t[μ min]	水 [%]	乙醇 [%]

0.0	100	0
25.0	75	25
40.0	0	100
50.0	0	100

[0200] 将洗脱物分成 12 部分(每四分钟为一部分)并通过 LC-MS 分析。除去洗脱液,分别将各个部分收集至 2ml 水中,通过经训练的专家组进行感官评价。

[0201] 部分 9 (除了含有其它物质之外,还含有根据本发明的两种化合物 Balansin A 和 B) 被该专家组的测试人员描述为很甜,如同甜味剂和甘草。

[0202] 图 1 表示含有 Balansin A 和 Balansin B 的部分 9 的 LC-MS 色谱图。在图 1 中,上方的图 [a] 显示负模式质谱,中间的图 [b] 显示正模式质谱,底部的图 [c] 显示 UV 谱。

实施例 3:生产水性 / 乙醇的 Mycetia balansae 提取物

[0203] 在室温下(约 23°C)1 小时内,用 2 升乙醇 / 水混合物(4:1) (v/v) 将 200g 干燥 Mycetia balansae 叶片中的每一片完全提取 4 次。过滤之后,在真空下除去提取剂。随后通过对内标的 LC/MS 进行定量确定干提取物的产率为 18.23g;Balansin A 的含量为 5.8%, Balansin B 的含量为 5.7%。

实施例 4:从 Mycetia balansae 提取物中分离 Balansin A 和 Balansin B

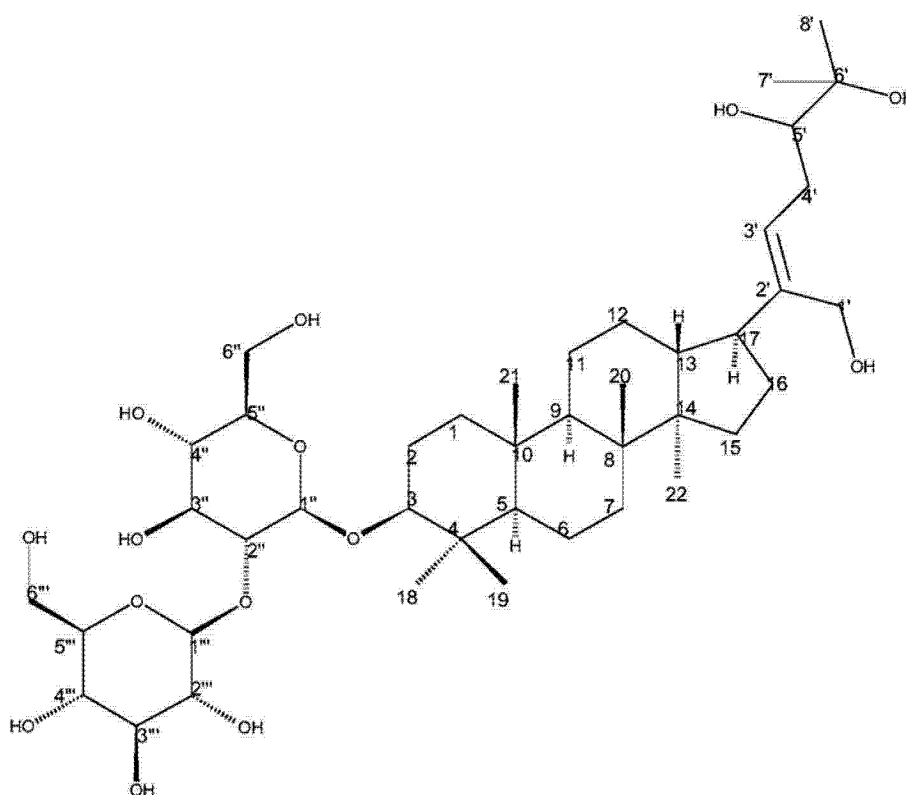
[0204] 通过制备高效液相色谱(pHPLC)分离化合物 Balansin A 和 Balansin B。为此,以 150mg/ml 的浓度将乙醇 - 水性提取物溶于水 / 乙腈混合物(1:1) (v/v) 中。通过 Grom Saphir110C-18 柱(5 μm, 150x20mm; 前置柱 10x20mm; 进样体积 1000 μl)进行分离。通过流速为 25ml/min 的水 / 乙腈混合物(7:3) (v/v)进行恒溶(isocratically)洗脱,并在 210nm 处检测。

[0205] 在 10.5min 至 13.0min (Balansin B)以及 19.5min 至 23.0min (Balansin A)的范围内收集来自 50 个循环的部分,并在 40°C,0.1mbar 的条件下,在旋转蒸发仪中蒸发溶剂。Balansin A 的产率为 180mg, Balansin B 的产率为 230mg。

物质	实验式	质量	m/z	UV 最大值
Balansin A	C ₄₂ H ₇₁ O ₁₄	799.4824	711.4, 637.4, 549.4, 221.1, 179.1, 161.0, 143.0, 113.0, 101.0	200 nm
Balansin B	C ₄₈ H ₈₁ O ₁₉	961.5421	799.5, 711.4, 637.4, 549.4, 221.1, 179.1, 161.0, 143.0, 113.0, 101.0	200nm

实施例 5:通过核磁共振波谱法表征 Balansin A

[0206] 进行不同的一维和二维 ¹H- 和 ¹³C- 核磁共振波谱法对实施例 4 的分离的化合物 Balansin A 进行结构解析。由此得到的数据在下文列出。



[0207] ¹H-NMR; CD₃OD, TMS; 600MHz

C	δ (ppm)	多重性	H 数	J (Hz)

1a	1.71	m	1	
1b	1.00	m	1	
2a	1.96	m	1	
2b	1.71	m	1	
3	3.24	m	1	
5	0.78	d	1	11.5
6a	1.56	m	1	
6b	1.48	m	1	
7a	1.62	m	1	
7b	1.30	m	1	
9	1.36	m	1	
11a	1.54	m	1	
11b	1.25	m	1	
12a	1.64	m	1	
12b	1.07	m	1	
13	1.77	d, d, d	1	3.3, 12.2, 12.2
15a	1.64	m	1	
15b	1.12	m	1	
16a	1.90	m	1	
16b	1.41	m	1	
17	2.30	d, d, d	1	6.8, 11.0, 11.0
18	1.07	s	3	
19	0.85	s	3	
20	1.02	s	3	

21	0.89	s	3	
22	0.91	s	3	
1' a	4.13	d	1	11.7
1' b	3.90	d	1	11.7
3'	5.44	d, d	1	6.98.7
4' a	2.39	d, d, d	1	2.4, 6.5, 14.4
4' b	2.20	d, d, d	1	8.9, 10.3, 14.4
5'	3.24	m	1	
7'	1.18	s	3	
8'	1.16	s	3	
1''	4.43	d	1	7.5
2''	3.57	m	1	
3''	3.35	d, d	1	8.6, 9.3
4''	3.15-3.29	m	1	
5''	3.15-3.29	m	1	
6'' a	3.85	d, d	1	2.0, 12.0
6'' b	3.65,	d, d	1	5.5, 12.0
1'''	4.67	d	1	7.7
2'''	3.15-3.29	m	1	
3'''	3.56	m	1	
4'''	3.15-3.29	m	1	
5'''	3.15-3.29	m	1	
6''' a	3.82	d, d	1	2.3, 11.9
6''' b	3.61	d, d	1	6.4, 11.9

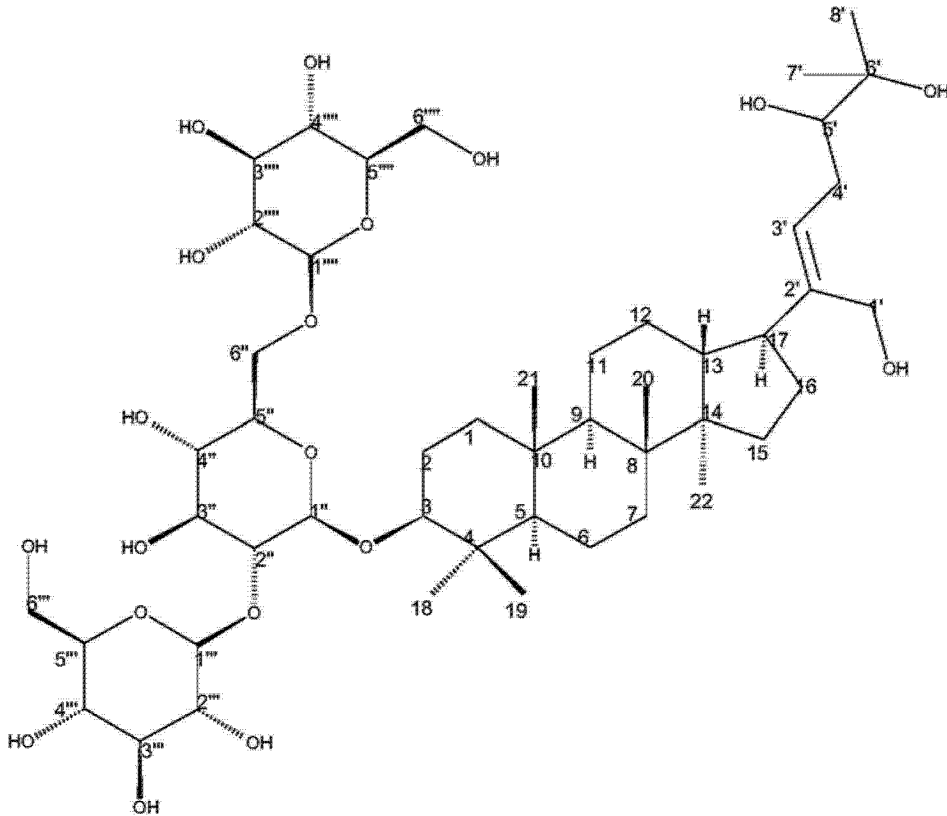
[0208] ^{13}C -位移值 125MHz, CD_3OD

C	δ (ppm)	多重性
1	40.49	T
2	27.36	T
3	91.50	D
4	40.69	S
5	57.72	D
6	19.31	T
7	36.72	T
8	41.79	S
9	52.45	D
10	38.15	S
11	22.57	T
12	26.05	T
13	46.83	D
14	50.37	S
15	32.67	T
16	29.56	T
17	49.60	D
18	28.43	Q
19	16.79	Q
20	16.24	Q
21	16.88	Q
22	16.35	Q

1'	58.94	T
2'	144.38	S
3'	127.82	D
4'	30.94	T
5'	78.70	D
6'	73.87	S
7'	a26.02	Q
8'	a24.78	Q
1''	105.45	D
2''	81.08	D
3''	b78.57	D
4''	c71.98	D
5''	b78.41	D
6''	62.90	T
1'''	104.54	D
2'''	76.35	D
3'''	b77.94	D
4'''	c71.65	D
5'''	b77.74	D
6'''	63.18	T

实施例 6 :通过核磁共振波谱法表征 Balansin B

[0209] 进行不同的一维和二维 ^1H - 和 ^{13}C - 核磁共振波谱法对实施例 4 的分离的化合物 Balansin A 进行结构解析。由此得到的数据在下文列出。



[0210] $^1\text{H-NMR}$; CD_3OD , TMS; 600MHz

C	δ (ppm)	多重性	H 数	J (Hz)
1a	1.72	m	1	
1b	1.02	m	1	
2a	1.95	m	1	
2b	1.71	m	1	
3	3.23	m	1	
5	0.79	d,d	1	1.7, 11.6
6a	1.56	m	1	
6b	1.49	d,d,d	1	2.4, 12.6, 12.6
7a	1.62	m	1	
7b	1.31	m	1	
9	1.37	d,d	1	2.7, 12.8
11a	1.56	m	1	
11b	1.24	m	1	
12a	1.63	m	1	
12b	1.07	m	1	
13	1.77	d,d,d	1	3.5, 12.0, 12.0
15a	1.65	m	1	
15b	1.13	m	1	
16a	1.90	d,d,d,d	1	8.8, 8.8, 10.1, 13.4
16b	1.41	m	1	
17	2.30	d,d,d	1	6.9, 10.6, 10.6
18	1.07	s	3	
19	0.85	s	3	

20	1.02	s	3	
21	0.89	s	3	
22	0.91	s	3	
1'a	4.13	d	1	11.5
1'b	3.91	d	1	11.5
3'	5.44	d,d	1	6.8, 8.6
4'a	2.39	d,d,d	1	2.1, 6.7, 14.3,
4'b	2.20	d,d,d	1	8.9, 10.0, 14.3
5'	3.23	m	1	
7'	1.18	s	3	
8'	1.16	s	3	
1''	4.45	d	1	7.5
2''	3.58	m	1	
3''	3.55	d,d	1	8.8, 8.8
4''	3.35	m	1	
5''	3.46	d,d,d	1	2.0, 5.9, 9.9
6''a	4.12	d,d	1	1.9, 11.8
6''b	3.78	d,d	1	5.9, 11.8
1'''	4.67	d	1	7.7
2'''	3.17 – 3.29	m	1	
3'''	3.17 – 3.29	m	1	
4'''	3.17 – 3.29	m	1	
5'''	3.17 – 3.29	m	1	
6'''a	3.82	d,d	1	2.4, 11.8
6'''b	3.61	d,d	1	6.1, 11.8
1''''	4.39	d	1	7.9
2''''	3.17 – 3.29	m	1	
3''''	3.17 – 3.29	m	1	
4''''	3.17 – 3.29	m	1	

5''''	3.17 – 3.29	m	1	
6''''a	3.86	d,d	1	2.1, 11.9
6''''b	3.66	d,d	1	5.4, 11.9

[0211] ^{13}C -NMR, 125MHz, CD_3OD

C	δ (ppm)	多重性
1	40.48	T
2	27.44	T
3	91.45	D
4	40.71	S
5	57.68	D
6	19.33	T
7	36.71	T
8	41.79	S
9	52.38	D
10	38.18	S
11	22.56	T
12	26.06	T
13	46.84	D
14	50.40	S
15	32.67	T
16	29.59	T
17	49.61	D
18	28.42	Q
19	16.81	Q

20	16.24	Q
21	16.90	Q
22	16.38	Q
1'	58.97	T
2'	144.39	S
3'	127.78	D
4'	30.95	T
5'	78.72	D
6'	73.87	S
7'	a26.02	Q
8'	a24.78	Q
1''	105.35	D
2''	80.91	D
3''	b78.38	D
4''	71.52	D
5''	76.95	D
6''	70.11	T
1'''	104.51	D
2'''	76.35	D
3'''	b78.39	D
4'''	72.00	D
5'''	b78.12	D
6'''	63.19	T
1''''	104.93	D

2''''	75.25	D
3''''	b78.08	D
4''''	71.74	D
5''''	b77.94	D
6''''	62.87	T

应用实施例 1:对 Balansin A 和 Balansin B 的感官评价

[0212] 一组专家品尝并从感官上评价了两种来自实施例 4 的分离化合物 Balansin A 和 Balansin B (每一种化合物的浓度为在水中 50ppm) 以及 5wt% 的蔗糖水溶液。

[0213] 水溶液中的 Balansin A 被描述为非常甜,略苦并显示出甜味剂型特征。

[0214] Balansin B 被描述为略苦、轻微甜味剂和弱乙醇性,但没有另外显示出明显的固有味道。

应用实施例 2:Balansin A 的固有甜味

[0215] 为了评价甜味化合物 Balansin A 的固有甜味,针对蔗糖对照组(10 个递增的不同浓度)品尝不同的浓度的 Balansin A。该对照组由下列浓度的样品构成:0wt%、0.25wt%、0.5wt%、0.75wt%、1wt%、1.5wt%、2wt%、3wt%、4wt% 和 5wt% 的蔗糖水溶液。

[0216] 图 2 说明与蔗糖对照组相比,浓度为 5ppm、10ppm、25ppm 和 50ppm (绘制在横坐标上)的 Balansin A 的固有甜味。横坐标以 ppm 表示 Balansin A 的浓度,纵坐标表示蔗糖等同量。

[0217] 图 3 说明与蔗糖对照组相比,浓度为 5ppm、10ppm、25ppm 和 50ppm (绘制在横坐标上)的 Balansin B 的固有甜味。横坐标以 ppm 表示 Balansin A 的浓度,纵坐标表示蔗糖等同量。

[0218] 从图 2 和图 3 可以看出, Balansin A 和 Balansin B 均具有一定的固有甜味。在浓度为 50ppm 的条件下, Balansin A 的固有甜味与 2% 蔗糖的甜味相同, Balansin B 的甜味与 1% 蔗糖的甜味相同。

应用实施例 3:加强糖溶液的甜味印象

[0219] 为了对甜味印象的加强进行量化,由一组专家确定含有 5wt% 蔗糖的溶液的甜味与含有 5wt% 蔗糖和一定量的测试物质或测试提取物的样品的甜味(1 级 [不甜] 至 10 级 [极甜])。通过计算对蔗糖溶液评价的平均值和对含有蔗糖和化合物 2 的溶液的评价的平均值的甜味印象的降低(%)进行分析(根据配对的、双尾检验 Student's 统计检验将 p 确定为显著性测量值)。

物质/提取物	甜味印象(1-10)		% 甜味印象的加强
	无	有	
Balansin A, 25 ppm	4.9 ± 1.5	7.2 ± 1.4	48 % (p < 0.00005)
Balansin B, 50 ppm	5.1 ± 1.1	6.7 ± 1.1	31 % (p < 0.0005)
<i>Mycetia balansae</i> 提取物, 550 ppm (等同于 25 ppm Balansin A)	4.8 ± 1.2	7.1 ± 2.4	46.6 % (p < 0.001)

应用实施例 4: 低糖软饮料, 柠檬型

[0220] 制剂 A: 含有 10wt% 的糖的比较制剂

[0221] 制剂 B: 含有 8wt% 的糖的比较制剂

[0222] 制剂 C-I: 含有 8wt% 的糖的根据本发明的低糖制剂

成分	用量 wt%								
	A	B	C	D	E	F	G	H	I
制剂									
糖 (蔗糖)	10	8	8	8	8	8	8	7	0
柠檬酸	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15	0.15
柑橘香精	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
Balansin A	-	-	0.005	-	0.0025	-	0.001	0.001	0.010
Balansin B	-	-	-	-	-	0.002	-	-	0.050
根据实施例 3 的 <i>Mycetia balansae</i> 提取物	-	-	-	0.1	-	-	-	-	-
根皮素	-	-	-	-	-	-	0.001	-	-

橙皮素	-	-	-	-	0.010	-	-	-	-
根据 EP 2 253 226 的 3',7-二羟基-4'-甲氧基黄 烷	-	-	-	-	-	-	-	0.0025	-
<i>Rubus suavissimu s</i> 提取 物,含有占提取物总重量 的 5 wt% 的甜茶苷	-	-	-	-	-	0.010	-	-	-
<i>Hydrangea dulcis</i> 提取 物,含有占提取物总重量 的 8 % 的叶甜素	-	-	-	-	-	-	-	0.010	-
水	加至 100								

[0223] 以所指明的顺序混合各成分并用水加至 100%。将混合物装在玻璃瓶中并进行碳化。

[0224] 由专家对制剂进行感官评价。通过减少糖(基于蔗糖量的 20wt%),观察到甜味降低约 36% (制剂 B 比 A)。在制剂 C 至 I 中,甜味不能与整体糖制剂 A 区别开。

应用实施例 5:含有天然甜味剂的半成品(香味组合物)

成分	制剂(用量 wt%)							
	A	B	C	D	E	F	G	H
“液体糖”,含 80 % 蔗糖	99.9	-	-	-	-	-	99.85	-
莱鲍迪苷 A 98 %	-	85	-	-	-	25	0.01	73.5
蛇菊苷 95 %	-	-	73	-	-	-	-	-

Balansin A	0.05	10		-	80	10	0.02	10
Balansin B	-	5	20	-	-	10	-	10
根据实施例 3 的 <i>Mycetia balansae</i> 提取物	-	-	-	30				
<i>Rubus suavissimus</i> 提取物,含有占提 取物的总重量的 5 wt%的甜茶苷 (例如来自 PlantExtrakt)	-	-	-	25	-	25	0.07	-
<i>Hydrangea dulcis</i> 提取物,含有占提 取物的总重量的 8%的叶甜素	-	-	-	25	-	25	-	-
根皮素	0.02	-	4	5	3.2	3.5	0.02	5
橙皮素	0.02	-	1	5	0.8	1	0.02	1
根据 EP 2 253 226 的 3',7-二羟基-4'- 甲氧基黄酮	0.01	-	2	8	-	-	0.01	-
新橙皮苷二氢查尔 酮	-	-	-	-	-	0.5	-	-
高圣草素钠盐	-	-	-	-	16	-	-	-
香草醛(天然的)	-	-	-	2	-	-	-	-
来自蔗糖的糖蒸馏 物(例如 Treatt)	-	-	-	-	-	-	-	0.5

[0225] 以上述比例混合各成分并随后可(进一步地)将其以该形式使用。成品中的制剂 A 和 G 的一般剂量为成品的总重量的 7wt% 至 15wt%。应用实施例 5 中的剩余制剂的一般剂量

范围为成品的总重量的 0.01wt% 至 0.1wt%，优选地，0.03wt% 至 0.06wt%。

应用实施例 6：根据本发明的混合物和半成品

成分	制剂(用量 wt%)							
	A	B	C	D	E	F	G	H
Balansin A	80	20	50	50	20	40	20	20
Balansin B	20	80						20
莱鲍迪苷 A 98 %			50	25				20
蛇菊苷 95 %				25				
Saccharin [®] 钠盐						20		
Cyclamate [®]					75			
Acesulfame [®] K						20		
Aspartame [®]						20		
Neotame [®]					5			
Thaumatococin								20
Sucralose [®]							80	
甘草甜素铵盐								20

[0226] 以上述比例混合各成分并将其用于使口服制剂具有甜味。成品中的混合物 A 至 H 的一般剂量范围为成品的总重量的 0.001wt% 至 0.5wt%，优选地，0.003wt% 至 0.1wt%。

应用实施例 7：半成品(含有无热量的糖和 / 或糖醇)

成分	制剂 (用量 wt%)							
	A	B	C	D	E	F	G	H
来自应用实施例 6 的混合物 A		0.05			0.05			0.05
来自应用实施例 6 的混合物 C			0.05			0.05		
来自应用实施例 6 的混合物 H				0.05			0.05	
Balansin A	0.05							
Maltite	50	10						
甘露醇		10						
山梨醇	20	20						
赤藓糖醇	29.95	59.95	99.95	99.95		50	50	99.95
木糖醇							49.95	
帕拉金糖					50			
塔格糖					49.95	49.95		

[0227] 以上述比例混合各物质并将其用于使口服制剂具有甜味。成品中的半成品 A 至 H 的一般剂量范围为 0.01wt% 至 80wt%，优选地，0.1wt% 至 50wt%，尤其优选地，0.1wt% 至 10wt%（在每种情况下基于成品的总重量）。半成品 A 至 H 可用作甜味剂，例如也直接用于咖啡或茶中。

应用实施例 8：作为给成品加味的半成品的喷雾干燥制剂

成分	用量 wt%				
	A	B	C	D	E
制剂					
饮用水	60.8	60.8	60.8	60.8	60.8
小麦中的麦芽糖糊精	24.3	24.3	24.3	24.3	24.3
阿拉伯树胶	6.1	6.1	6.1	6.1	6.1
Balansin A	8.8	3.3	4.0	-	-
Balansin B	-	3.3	1.5	3.3	4.4
橙皮素	-	2.2	-	-	1.1
高圣草素钠盐	-	-	-	5.5	3.3
根皮素	-	-	3.3	-	-

[0228] 将饮用水装入容器中,将麦芽糖糊精和阿拉伯树胶溶于其中。然后,使用 Turrax 在载体溶液中乳化调味料。喷雾溶液的温度应当不超过 30°C。随后将混合物喷雾干燥(入口指定温度:185-195°C,出口指定温度:70-75°C)。

应用实施例 9:半成品的溶液

[0229] 还可用水、丙二醇、丙三醇或乙醇,或者优选地,用这些溶剂的混合物(例如水-丙二醇、水-丙三醇、水-乙醇、丙三醇-乙醇、丙三醇-丙二醇、丙二醇-乙醇)将来自上述应用实施例 5、6 和 7 的混合物和半成品收集成,例如 1% 至 20% 的溶液,优选地,2% 至 10%,尤其优选地,5% 的溶液,并通过温和加热完全溶解。

应用实施例 10:“可乐”型软饮料

成分	制剂(用量 wt%)						
	A	B	C	D	E	F	G
蔗糖	0	8	7	7	-	7	-
来自玉米的葡萄糖/果糖糖浆, 含 55 wt% 果糖	-	-	-	-	8	-	7
来自应用实施例 5 的调味料组合物 A	10	-	-	-	-	-	-
来自应用实施例 5 的调味料组合物 B	-	0.05	-	-	-	-	-
来自应用实施例 5 的调味料组合物 C	-	-	0.05	-	-	-	-
来自应用实施例 5 的调味料组合物 D	-	-	-	0.05	-	-	-
来自应用实施例 5 的调味料组合物 E	-	-	-	-	0.05	-	-
来自应用实施例 5 的调味料组合物 F	-	-	-	-	-	0.05	-
来自应用实施例 5 的调味料组合物 H	-	-	-	-	-	-	0.05
磷酸	0.07	0.07	0.07	0.07	0.07	0.07	0.07
柠檬酸	0.06	0.06	0.06	0.06	0.06	0.06	0.06
焦糖色素	0.14	0.14	0.14	0.14	0.14	0.14	0.14
咖啡因	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01
“可乐”型 饮用乳液	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05
水	加至 100 %						

[0230] 以所指明的顺序混合各成分、装瓶并碳化。

应用实施例 11:低糖“可乐”型软饮料

[0231] 制剂 A:含有 10wt% 的糖的比较制剂

[0232] 制剂 B:含有 8wt% 的糖的比较制剂

[0233] 制剂 C-I:含有 8wt% 的糖的根据本发明的低糖制剂

成分	制剂 (用量 wt%)						
	A	B	C	D	E	F	G
蔗糖	0	8	8	8	-	-	-
来自玉米的葡萄糖/果糖 糖浆, 含 55 wt% 果糖	-	-	-	-	8	8	8
Balansin A	0.005	-	0.003	0.0025	-	0.003	0.0025
Balansin B	-	0.005	-	0.0025	0.005	-	0.0025
磷酸	0.07	0.07	0.07	0.07	0.07	0.07	0.07
柠檬酸	0.06	0.06	0.06	0.06	0.06	0.06	0.06
焦糖色素	0.14	0.14	0.14	0.14	0.14	0.14	0.14
咖啡因	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01
“可乐”型 饮用乳液	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05
水	加至 100 %						

[0234] 以所指明的顺序混合各成分并用水加至 100%。将混合物装在玻璃瓶中并碳化。

应用实施例 12:口香糖

部分	成分	用量 wt%
A	口香糖基质, “Jagum T” 公司	30.95
B	山梨醇, 磨碎的	39.00
	Isomalt [®] (Palatinit GmbH)	9.50
	山梨醇	2.00
	甘露醇	3.00
	Aspartame [®]	0.10
		0.10
	Acesulfame [®] K	
		0.30
	Emulgum [®] (Colloides Naturels, Inc.)	
C	山梨醇, 70 %	14.00
		1.00
	丙三醇	
D		0.05
	Balansin A	

[0235] 混合 A 至 D 部分并充分揉合。可对原材料进行加工, 例如以薄带状加工成口香糖成品。

应用实施例 13: 牙膏

部分	成分	用量 wt%
A	脱矿质水	23.08

	山梨醇 (70 %)	45.00
	Solbrol® M, 钠盐 (Bayer AG, p-羟基苯甲酸烷基酯)	0.15
	磷酸三钠	0.10
	Balansin A	0.02
	一氟磷酸钠	1.12
	聚乙二醇 1500	5.00
B	Sident 9 (粗糙的二氧化硅)	10.00
	Sident 22 S (增稠二氧化硅)	8.00
	羧甲基纤维素钠	0.90
	二氧化钛	0.50
C	脱矿质水	4.53
	月桂醇硫酸钠	1.50
D	薄荷调味料	0.1

[0236] 分别单独预混合 A 和 B 部分的成品,并在真空下在 25-30 °C 下一起充分搅拌 30min。预先混合 C 部分并将其加至 A 和 B 中;添加 D,在真空下在 25-30 °C 下完全搅拌混合物 30min。松弛之后,得到牙膏且可将其移出。

应用实施例 14:无糖硬熟(hard-boiled)糖果

成分	含量(wt%)			
	A	B	C	D
直辉中基性岩, M 型	75.00	74.00	75.50	75.00
柠檬酸	-	1.0	0.5	-
水	24.88	24.842	23.87	24.8815
黄色色素	-	0.01	-	-
红色色素	-	-	0.01	-
蓝色色素	0.01	-	-	0.01
薄荷调味料	0.1	-	-	0.1
柑橘调味料	-	0.1	-	-
红色水果 调味料	-	-	0.1	-
莱鲍迪苷 A 98 %	-	0.040	-	-
Balansin A	0.010	0.005	0.020	0.005
橙皮素	-	0.001	-	0.001
根皮素	-	0.002	-	-
根据 EP 2 253 226 的 3',7-二羟基-4'-甲氧 基黄烷	-	-	-	0.0025

[0237] 如果需要的话,在添加柠檬酸之后,将直辉中基性岩与水混合,在 165°C 下使混合物熔化,随后冷却至 115°C。添加调味料和其它成分,在充分搅拌后,倒入模具中,硬化后从模具中移出,然后单独包装。

应用实施例 15:低糖牛奶冻型布丁

[0238] 制剂 A 和 B 为具有全糖含量(制剂 A)和低糖含量(制剂 B)的比较制剂

成分	制剂 (wt%)					
	A	B	C	D	E	F
蔗糖	7.8 %	5.4 %	5.4 %	5.4 %	5.4 %	5.4 %
淀粉	3.0 %	3.0 %	3.0 %	3.0 %	3.0 %	3.0 %
脱脂奶粉	1.5 %	1.5 %	1.5 %	1.5 %	1.5 %	1.5 %
Aubygel MR50	0.5 %	0.5 %	0.5 %	0.5 %	0.5 %	0.5 %
Balansin A	-	-	0.01 %	0.005 %	0.005 %	0.005 %
来自 <i>Rubus suavis</i> 的提取物(例如来自 PlantExtrakt), 含占提取物总重量的 5 wt% 的甜茶苷	-	-	-	-	0.010 %	0.005 %
橙皮素	-	-	-	0.001 %	-	0.001 %
根皮素	-	-	-	0.002 %	-	0.001 %
根据 EP 2 253 226 的 3',7-二羟基-4'-甲氧基黄烷	-	-	-	-	-	0.001 %
香草豆荚提取物, 喷雾干燥的, Symrise (德之馨)	0.1 %	0.1 %	0.1 %	0.1 %	0.1 %	0.1 %
牛奶, 含 1.5 % 脂肪	加至 100 %					

[0239] 提供固体物质并与牛奶一起搅拌。将混合物加热至 95°C 持续 2min, 同时充分搅拌, 倾倒并冷却至 5-8°C。

应用实施例 16: 低脂酸奶

[0240] 含糖的制剂 A 为比较制剂。

[0241] 含有甜味剂混合物和来自实施例 2 的提取物的根据本发明的制剂 (B-D)

成分	制剂 (wt%)			
	A	B	C	D
蔗糖	10	8	6	-
草莓制剂	10	10	10	10
莱鲍迪苷 A 98 %	-	-	-	0.050
Balansin A	-	0.010	0.005	0.010
来自 <i>Rubus suavissimus</i> 的提取物 (例如来自 PlantExtrakt), 含占提取物总重量的 5 wt% 的甜茶苷	-	-	0.010	-
橙皮素	-	0.001	0.001	0.001
根皮素	-	-	0.002	-
高圣草酚钠盐	-	-	-	0.005
天然草莓调味料	0.1 %	0.1 %	0.1 %	0.1 %
酸奶, 0.1 % 脂肪	加至 100 %			

[0242] 混合各成分, 在 5 摄氏度下冷却。

应用实施例 17: 牛奶混合饮料

[0243] 制剂 A 为含糖的比较制剂

[0244] 制剂 B 至 D 为根据本发明的制剂

成分	制剂 (data in wt%)			
	A	B	C	D
蔗糖	10	8	7	-

果糖	-	-	0.5	
莱鲍迪苷 A 98 %	-	-	-	0.040
Balansin A	-	0.010	0.005	0.010
来自 Rubus suavissimus 的提取 物 (例如来自 PlantExtrakt), 含占 提取物总重量的 5 wt% 甜茶苷	-	-	0.010	-
橙皮素	-	0.003	0.002	0.005
根皮素	-	-	0.002	-
高圣草酚 钠盐	-	-	-	0.002
香草调味料	0.1	0.1	0.1	0.1
保久奶, 1.5 % 脂肪	加至 100 %			

[0245] 混合各成分,用牛奶加满,充分搅拌,装瓶并于 5℃下冷藏。

应用实施例 18:低糖番茄酱

[0246] 含糖比较制剂(A)

[0247] 具有低糖含量的比较制剂(B)

[0248] 根据本发明的制剂(C-I)

成分	制剂 (wt%)							
	A	B	C	E	F	G	H	I
食盐	2	2	2	2	2	2	2	2
淀粉, Farinex WM 55	1	1	1	1	1	1	1	1
蔗糖	12	9.6	9.2	8.4	9.6	9.6	8.4	4.2
双倍浓缩的番茄酱	40	40	40	40	30	30	30	30
葡萄糖糖浆 80 Brix	18	18	18	18	18	18	18	18
酒精醋 10 %	7	7	7	7	3	3	3	3
莱鲍迪苷 A 98 %	-	-	-	-	-	-	-	0.05
Balansin A	-	-	0.01	0.005	0.005	0.01	0.005	0.01
来自 Rubus suavissimus 的提取物 (例如来自 PlantExtrakt), 含占提取物总重量的 5 wt% 的甜茶苷	-	-	-	-	-	-	0.01	-
1,2-丙二醇中 2.5 % 的橙皮素	-	-	-	-	0.1	-	0.1	-
1,2-丙二醇中 2.5 % 的根皮素	-	-	-	0.2	0.2	-	-	0.3
水	加至 100 %							

[0249] 以给定的顺序将各物质混合, 在混合器的辅助下使得到的番茄酱均质化, 装瓶并杀菌。

应用实施例 19: 低糖冰淇淋

[0250] 含糖比较制剂(A)

[0251] 具有低糖含量的比较制剂(B)

[0252] 根据本发明的制剂(C-F)

成分	制剂 (含量 wt%)					
	A	B	C	D	E	F
植物油, 熔点范围 35 - 40 °C	20.00	20.00	20.00	20.00	20.00	20.00
糖 (蔗糖)	12.00	8.00	8.00	8.00	8.00	8.00
脱脂奶粉	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00
葡萄糖糖浆 72 % 干物质	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00	5.00
乳化剂 SE 30 (Grindstedt Products, Denmark)	0.65	0.65	0.65	0.65	0.65	0.65
调味料含 0.1 % 二乙酰和 1 % 香草醛	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20	0.20
Balansin A	-	-	0.01	0.005	0.01	0.005
Rubus suavissimus 的提取物 (例如来自 PlantExtrakt), 含有占提取物总重量的 5 wt% 的甜茶苷	-	-	-	-	-	0.010
1,2-丙二醇中 2.5 % 的橙皮素	-	-	-	0.10	-	0.10
1,2-丙二醇中 2.5 % 的根皮素	-	-	-	-	0.05	0.05
脱脂牛奶	加至 100 %					

[0253] 将植物油加热至 58°C。将脱脂奶和葡萄糖浆加热至 55°C, 添加糖、脱脂奶粉、乳化剂和调味料, 将混合物加至植物油中。在直流高压拌匀器 (180/50bar) 的辅助下使混合物均质化。在 78°C 下调和得到的团块持续 1min, 然后冷却至 2-4°C, 在该温度下孵育 10h 直至成熟。然后, 将成熟团块倒出并存于 -18°C 的冰箱。

应用实施例 20 : 适合糖尿病人的冰淇淋

[0254] 适合糖尿病人的冰淇淋由下列成分生产并将其分装至桶中, 每桶 95ml, 所述成分为:

[0255] 浓缩的脱脂牛奶、果糖浆、草莓片和草莓泥 (15wt%)、植物油、糖尿病人适合的巧克力片 (3.5wt%, 具有乳化剂大豆磷脂)、乳清制品、甜菜根汁、槐豆胶、瓜尔豆胶、角叉菜、乳化剂 (E471)、明胶、酸化剂、柠檬酸、0.1wt% 草莓调味料 (含有占草莓调味料总重量的 1wt% 的 Balansin A)、着色剂胡萝卜素。

[0256] 热值 (每 95mL):

[0257] 蛋白质 1.8g、糖类 13.3g (其中果糖 9.5g)、脂肪 4.2g。

应用实施例 21:基于 maltite 的糖尿病人适合的巧克力

[0258] 适合糖尿病人的巧克力由下列成分生产并倒入矩形棒中：

[0259] maltite、榛子块、可可油、脱脂奶粉、可可块、菊粉、液体黄油、乳化剂大豆磷脂、0.1wt% 香草香精(含香草豆荚提取物、香草醛和占香草香精的总重量的 5wt% 的 Balansin A)。

[0260] 热值(每 100g)：

[0261] 蛋白质 8g、糖类 43g (其中 maltite 34g)、脂肪 34g。

应用实施例 22:基于果糖的糖尿病人适合的巧克力

[0262] 适合糖尿病人的巧克力由下列成分生产并倒入矩形棒中：

[0263] 可可块、果糖、脱脂奶粉、可可油、菊粉、液体黄油、乳化剂大豆磷脂、walnut、食盐、0.1wt% 香草香精(含香草醛和占香草香精的总重量的 1wt% 的来自实施例 2 的 Balansin A)。

[0264] 热值(每 100g)：

[0265] 蛋白质 8.8g、糖类 34g (其中果糖 23g、乳糖 7.5g、蔗糖 1.4g)、脂肪 36g；膳食纤维 18.5g (其中 12.2g 菊粉)；钠：0.10g。可可含量最少为 50wt%。

应用实施例 23:低糖什锦麦片混合物

编号		A (wt%)	B (wt%)
1	燕麦片	17.00	18.90
2	酥脆燕麦片簇	10.00	12.00
3	大米片	16.90	17.80
4	玉米片	16.50	17.50
5	小葡萄干	3.50	3.50
6	榛子, 切碎的	2.50	2.50
7	来自小麦的葡萄糖糖浆, DE 30	9.50	9.50
8	蔗糖	20.00	14.00
9	水	4.00	4.00
10	柠檬酸粉, 脱水的	0.10	0.10
11	来自应用实施例 5 的调味 料组合物 D	-	0.20

[0266] 在转鼓中混合 1 至 6 号各成分(混合 1)。加热 7 至 9 号各成分并添加 10 号成分(在制剂 B 中还添加 11 号成分)(混合 2)。每次将混合 2 加至混合 1 中并充分混合。最终, 将得到的什锦混合物放至烤盘上并在 130°C 的烤炉中干燥 8 分钟。

应用实施例 24:低糖果味橡皮糖

	A (wt%)	B (wt%)
水	23.70	25.70
蔗糖	34.50	8.20
葡萄糖糖浆, DE 40	31.89	30.09
Iso Syrup C* Tru Sweet 01750 (Cerestar GmbH)	1.50	2.10
明胶 240 Bloom	8.20	9.40
聚葡萄糖 (Litesse [®] Ultra, Danisco Cultor GmbH)	-	24.40
黄色和红色色素	0.01	0.01
柠檬酸	0.20	
樱桃调味料, 含占樱桃调味料的 1 wt% 的 Balansin A 和 0.3 wt% 的根 皮素	-	0.10

[0267] 聚葡萄糖为自身味道不甜的具有低热值的多聚糖。

应用实施例 25: 巧克力-卡布奇诺冰淇淋

	A (wt%)	B (wt%)
葡萄糖-果糖糖浆	14.30	14.30
蔗糖	10.00	7.50
脱脂奶粉	5.00	5.00
奶油(36 % 脂肪)	24.00	24.00
乳化剂和稳定剂 Cremodan [®] 709VEG (Danisco)	0.50	0.50
可可粉	5.975	5.975
卡拉胶	0.025	0.025
水	40.20	42.50
卡布奇诺调味料, 含占调味料 1 wt% 的 Balansin B 和 1 wt% 高圣草酚钠盐	-	0.20

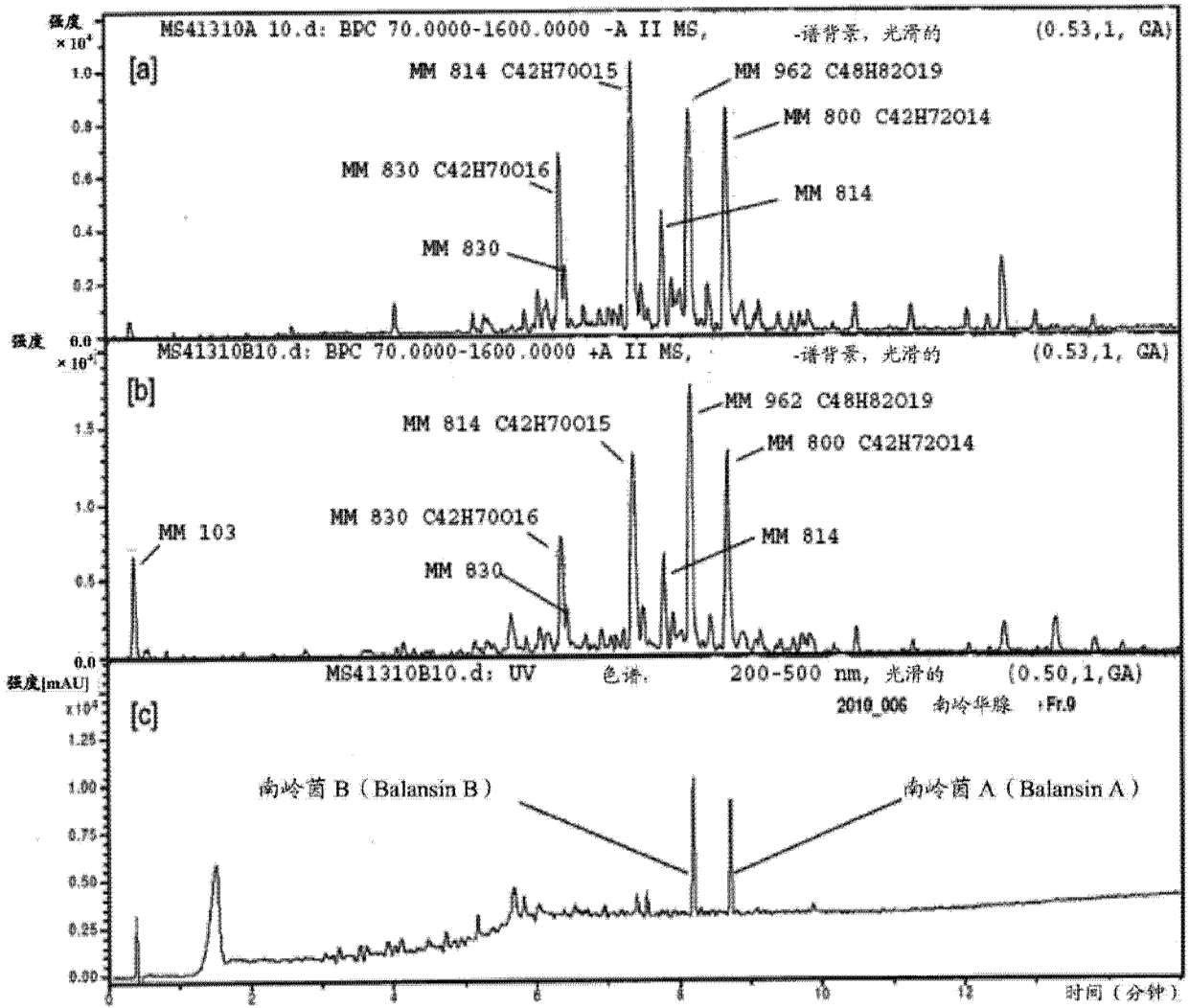


图 1

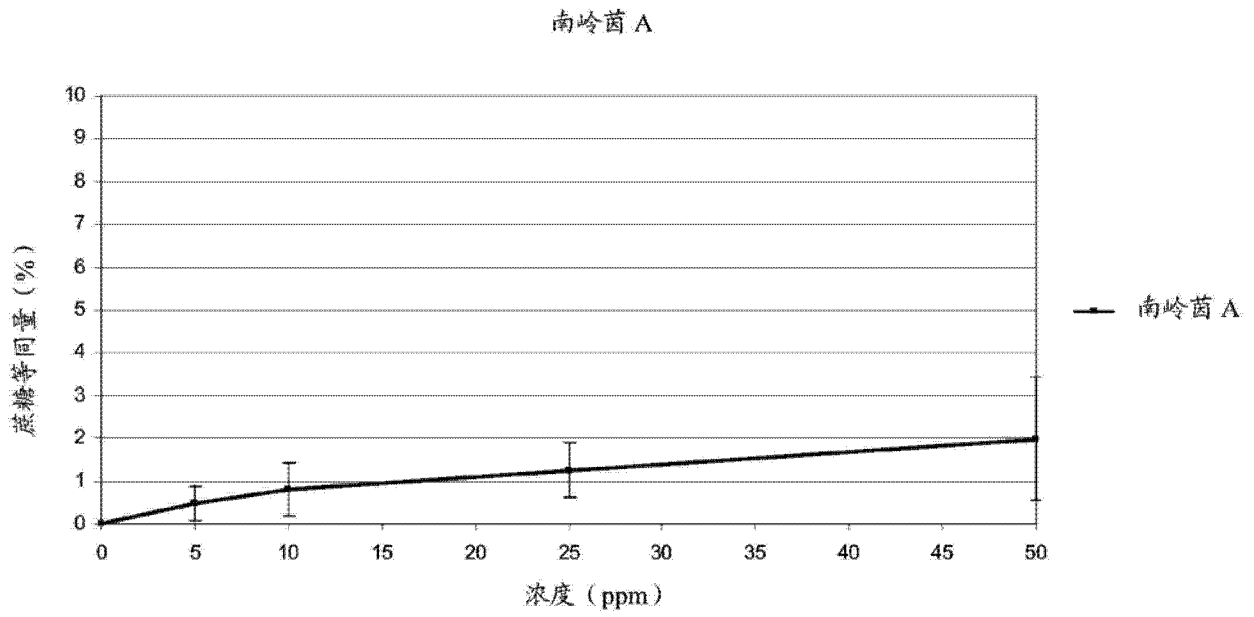


图 2

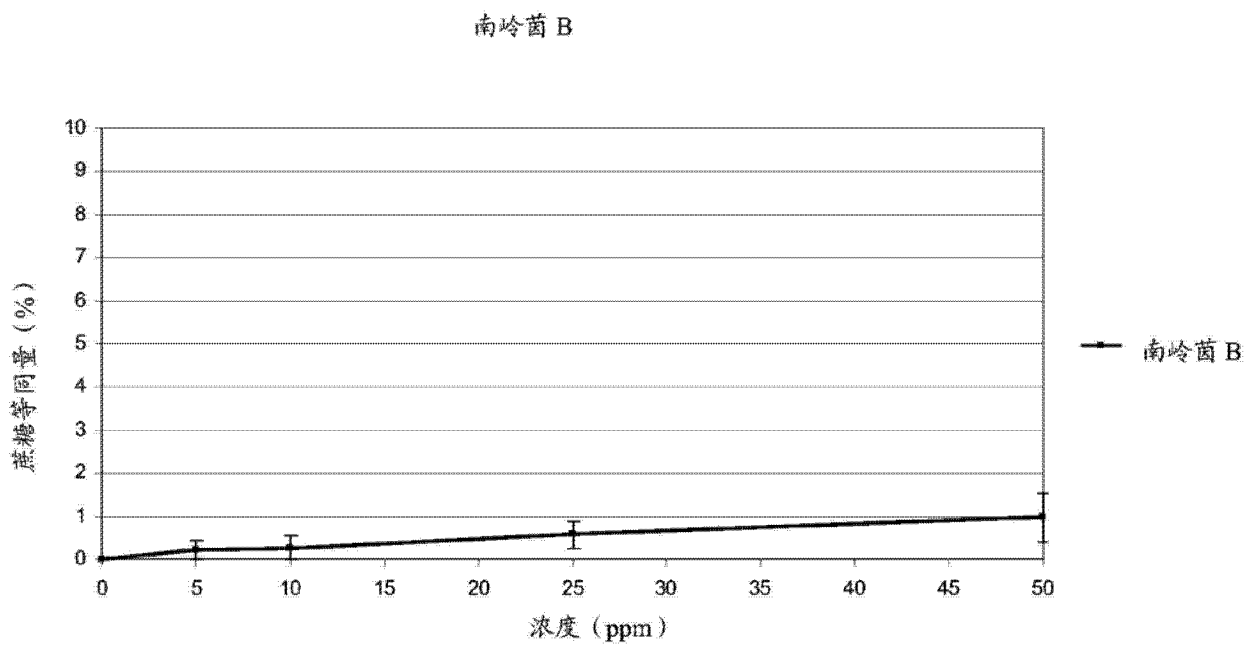


图 3