

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
12. Dezember 2024 (12.12.2024)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2024/252015 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation:

A61K 9/20 (2006.01) A61P 3/00 (2006.01)  
A61K 9/28 (2006.01)

RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,  
GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2024/065870

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz  
3)

(22) Internationales Anmeldedatum:  
10. Juni 2024 (10.06.2024)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
10 2023 002 336.1  
09. Juni 2023 (09.06.2023) DE

(71) Anmelder: EUVORIO GMBH [DE/DE]; Grüner Weg 42,  
50825 Köln (DE).

(72) Erfinder: GRENNIGLOH, Julius; Grüner Weg 42, 50825  
Köln (DE).

(74) Anwalt: GULDE & PARTNER PATENT- UND RECH-  
TSANWALTSKANZLEI MBB; Wallstr. 58/59, 10179  
Berlin (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW,  
BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CV, CZ, DE, DJ,  
DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH,  
GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO,  
JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR,  
LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, MW, MX, MY,  
MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT,  
QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST,  
SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD,  
SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH,  
CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS,  
IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO,

(54) Title: USE OF CARBOHYDRATE-CONTAINING COMPOSITIONS IN TABLET FORM FOR TREATMENT OF HYPO-  
GLYCEMIC STATES

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG KOHLENHYDRATHALTIGER ZUSAMMENSETZUNGEN IN TABLETTENFORM ZUR  
BEHANDLUNG VON HYPOGLYKÄMIEZUSTÄNDEN

(57) Abstract: The invention relates to the use of specific carbohydrate-containing compositions, in particular in tablet form, for  
production of agents for treatment of hypoglycemia, in particular nocturnal hypoglycemia. The compositions are easy to dose and do  
not leave a sweet taste in the mouth, but do release the carbohydrates present rapidly in the stomach and are therefore particularly  
suitable for treatment of in particular nocturnal hypoglycemia.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft die Verwendung spezieller kohlenhydrathaltiger Zusammensetzungen, insbesondere  
in Tablettenform, zur Herstellung von Mitteln zur Behandlung der Hypoglykämie, insbesondere der nächtlichen Hypoglykämie. Die  
Zusammensetzungen sind leicht dosierbar und hinterlassen keinen süßen Geschmack im Mund, setzen aber die enthaltenen Kohlenhy-  
drate im Magen rasch frei und sind daher zur Behandlung insbesondere der nocturnalen Hypoglykämie besonders geeignet.



WO 2024/252015 A1

## Verwendung kohlenhydrathaltiger Zusammensetzungen in Tablettenform zur Behandlung von Hypoglykämiezuständen

Die Erfindung betrifft die Verwendung spezieller kohlenhydrathaltiger Zusammen-  
setzungen, insbesondere in Tablettenform, zur Herstellung von Mitteln zur  
5 Behandlung von Formen der Hypoglykämie, insbesondere der der nächtlichen  
Hypoglykämie.

Diabetes mellitus ist eine Stoffwechselstörung, die die Verwertung von Kohlen-  
hydraten betrifft. Sie beruht insbesondere auf einem Mangel an Insulin und kann zu  
einer chronischen Überzuckerung (Hyperglykämie) führen mit zahlreichen  
10 Folgeschäden.

Im Verdauungssystem des Körpers werden die mit der Nahrung aufgenommenen  
Kohlenhydrate zu Glucose abgebaut, welche durch die Darmwand in das Blut  
überführt und im Körper verteilt werden. Das körpereigene Hormon Insulin führt  
dazu, dass die im Blut enthaltene Glucose in das Innere von Zellen gelangt, wo sie  
15 zu Energiegewinnung verbraucht wird. Das hierzu notwendige Insulin wird über-  
wiegend in der Bauchspeicheldrüse produziert. Wenn der Körper kein oder nicht  
genügend Insulin produziert, kann Glucose nicht in die Körperzellen überführt  
werden und verbleibt daher im Blut. Zur Vermeidung der Folgen des zu hohen  
Blutzuckerspiegels wird Diabetes mellitus in der Regel mit Insulin behandelt. Dabei  
20 ergibt sich das Problem, die Insulinmenge richtig zu dosieren, das heißt an die  
Kohlenhydratmenge anzupassen. Wird zu wenig Insulin gegeben, dann bleibt zu viel  
Glucose im Blut. Im Falle einer zu hohen Insulindosierung kann es zu einer  
Unterzuckerung (Hypoglykämie) kommen. Eine derartige Hypoglykämie ist eine ernst  
zu nehmende Störung, die im schlimmsten Fall tödlich enden kann.

25 Personen, die an Diabetes leiden, führen daher häufig kohlenhydrathaltige  
Nahrungsmittel mit sich, um im Fall einer Unterzuckerung schnell eine Kohlen-  
hydratzufuhr bewirken zu können. Häufige verwendete Mittel sind Traubenzucker-  
tabletten, Fruchtsäfte oder Brot.

Hypoglykämien können auch nachts auftreten. Im Fall einer Unterzuckerung wachen Personen, die an Diabetes leiden, nachts beispielsweise mit Schweißausbrüchen auf oder werden durch Warngeräte geweckt. Dieser Fall kann z. B. eintreten, wenn die betreffende Person abends oder nachts eine Mahlzeit aufgenommen hat, deren  
5 genauer Kohlenhydratanteil nicht bekannt ist. Die Person ist dann darauf angewiesen, eine Schätzung des Kohlenhydratanteils vorzunehmen, um dann die entsprechende Menge Insulin zuzuführen. Wird die Kohlenhydratmenge überschätzt, kann es dann zu der erwähnten Unterzuckerung nach Insulingabe kommen.

Betroffenen Personen ist es insbesondere nachts häufig unangenehm Traubenzucker, (süße) Fruchtsäfte bzw. Brot zu essen, um die Unterzuckerung auszugleichen. Um den süßen Geschmack im Mund kompensieren, müssten sie nachts aufstehen und beispielsweise sich nochmals die Zähne putzen. Es stellt sich daher die Aufgabe, eine Zusammensetzung bereitzustellen, die in der Lage ist, den  
10 Blutzuckerspiegel im Fall einer Unterzuckerung gezielt anzuheben, einfach dosierbar zu sein, gleichzeitig aber keinen unangenehmen süßen Geschmack im Mund zu hinterlassen, so dass die betroffenen Personen weiterschlafen können. Diese Aufgabe wird durch die Verwendung der nachfolgend beschriebenen Zusammensetzungen gelöst.

Aus dem Stand der Technik sind folgende Druckschriften bekannt:

20 Das Dokument US2014/0180224 A1 beschreibt Zusammensetzungen zur Behandlung der nächtlichen Hypoglykämie. Es handelt sich hierbei aber um Zusammensetzungen, die als "delayed and sustained release compositions" beschrieben sind. Die Zusammensetzungen sollen vor dem Zubettgehen eingenommen werden und während der Nacht eine gleichmäßige Kohlenhydratversorgung gewährleisten. Eine Behandlung einer akuten nocturnalen  
25 Hypoglykämie ist durch die verzögerte Freisetzung nicht möglich.

Das Dokument CN 115226896 beschreibt weitere "Sustained release"-Zusammensetzungen verschiedener Kohlehydrate, die ebenfalls nicht zur Behandlung einer akuten nocturnalen Hypoglykämie geeignet sind.

30 Das Dokument DE 2246013 A beschreibt ein Verfahren zur Herstellung von porösen, kohlehydrathaltigen Tabletten, die verschiedene Herstellungsprobleme von

Tablettenformulierungen lösen sollen. Eine nächtliche Hypoglykämiebehandlung wird hier nicht erwähnt.

Das Dokument WO20157148742 A1 beschreibt Zusammensetzungen zur Herstellung von Zellkulturen. Diese Zusammensetzungen sollen Kohlehydrate  
5 enthalten und sind als "Sustained release" Zusammensetzungen beschrieben. Eine Verwendung zur nächtlichen Hypoglykämiebehandlung wird hier nicht erwähnt

Das Dokument CN 105963266 A beschreibt Glukosetabletten, die auch für die Behandlung der Hypoglykämie geeignet sein sollen. Aufgrund ihrer Zusammensetzung lösen sich die Tabletten bereits im Mund auf und erzeugen einen  
10 süßen Geschmack.

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung kohlenhydrathaltige Zusammensetzungen, insbesondere in Tablettenform, die die enthaltenen Kohlenhydrate erst im Magen-Darmtrakt freisetzen, zur Behandlung von Hypoglykämien, insbesondere der nocturnalen Hypoglykämie.

15 Diese Zusammensetzungen enthalten als Kohlenhydrate zunächst ein oder mehrere Saccharide, wie z. B. Dextrose, Lactose, Maltose, Trehalose, Saccharose oder Mischungen hiervon. Eine bekannte Kohlenhydratmischung ist beispielsweise Maltodextrin. Die Kohlenhydrate kommen teilweise in verschiedenen Hydratformen vor, d.h. sie enthalten unterschiedlich viel Kristallwasser. Dextrose ist beispielsweise  
20 als Monohydrat, aber auch als wasserfreies Anhydrat erhältlich. Typischerweise können alle verfügbaren stabilen Hydratformen zur Herstellung der erfindungsgemäßen Zubereitungen herangezogen werden.

Der Vorteil der Dextrose ist, dass diese schnell wirkt, während andere Kohlenhydrate einen verzögerten Wirkungseintritt aufweisen, dafür aber unter Umständen einen  
25 über längere Zeit anhaltenden Effekt bewirken. Mischungen verschiedener Kohlenhydrate können eine rasche initiale Wirkung erzeugen, die durch Beimischung komplexerer Kohlenhydrate länger anhält.

Für den eingangs genannten Zweck besteht die Zusammensetzung überwiegend, das heißt zu mehr als 70 %, aus dem Saccharid bzw. der Saccharid-Mischung. Dazu  
30 kommen lediglich fachübliche Mittel zur Verbesserung der Verarbeitbarkeit bzw. der Auflösungseigenschaften, wie beispielsweise Stearate oder Zellulose. Der Saccharidanteil beträgt bis zu 95%, typischerweise ca. 80%. Das erfindungsgemäß

am meisten bevorzugte Saccharid ist Dextrose, insbesondere als Dextrose-Monohydrat.

Die Zusammensetzung wird zunächst zu pelletförmigen Tablettenkernen gepresst. Die einzelnen Tablettenkerne haben Durchmesser zwischen 4 und 10 mm, bevorzugt  
5 zwischen 6 und 8 mm, und können die für derartige Zusammensetzungen üblichen Formen aufweisen, wie z. B. kugelförmig, biconvex, fascettiert oder gewölbt. Es versteht sich von selbst, dass sie zum Zweck der Einnahme keine scharfen Kanten aufweisen sollten, ansonsten ist die Formgestaltung praktisch beliebig.

Die vorgefertigten Tablettenkerne werden erfindungsgemäß mit einem Coating  
10 überzogen, das geschmacksneutral ist und dafür sorgt, dass sich die Tabletten nicht im Mund auflösen, sondern dass die enthaltenen Saccharide erst im Magen freigesetzt werden. Ferner verbessert sich durch das Coating die Schluckbarkeit der Tabletten. Derartige Coatings sind prinzipiell bekannt. Diese sind in der Regel auf Basis von Stärke und modifizierter Zellulose zusammengesetzt. Entscheidend für  
15 das Coating ist, dass es sich noch nicht im Mund auflöst, sondern erst im Magen den Tablettenkern rasch freisetzen. Vorzugsweise werden folgende Substanzklassen für das erfindungsgemäße Coating verwendet:

- Cellulose und Cellulosederivate, insbesondere Carboxymethylcellulose  
Hydroxypropylmethylcellulosephthalat, Methylcellulose,  
20 Hydroxypropylmethylcellulose (Hypromellose) und/oder Hydroxypropylcellulose
- Methacrylsäurecopolymere und Methacrylsäureester
- Polyvinylpyrrolidon (PVP) und Derivate
- Polyvidonacetat
- 25 • Polyvinylacetatphthalat

Das am meisten bevorzugte Coatingmittel ist Hydroxypropylmethylcellulose (Hypromellose). Die Coatings können auch Farbstoffe enthalten. Bevorzugt werden hierzu Lebensmittelfarbstoffe verwendet, wie z.B. Carotinoide (E 160a), Beerenfarbstoffe (Anthocyane, E 163), Beten-Farbstoffe (Betanin, E 162), Karmin (E 120),  
30 Paprikaextrakt (E 160c) und Curcumin (E 100). Besonders bevorzugt sind stark

färbende Pflanzen- oder Fruchtextakte, wie z. B. Rote Beete, Spinat- oder Holundersaft und Gewürze wie Safran und Gelbwurzel.

Aus praktischen Gründen werden die Tablettenkerne bevorzugt in einem einzigen Vorgang mit dem Coating überzogen, so dass sich modifizierte Filmtabletten (5 (Filmdragees) ergeben. Alternativ möglich ist natürlich auch die klassische Dragierung mit mehreren Schichten.

Die durch das Coating aus den Tablettenkernen entstandenen Tabletten haben typischerweise einen Durchmesser zwischen 4 und 10 mm und eine Masse zwischen 50 und 500 mg. Bevorzugt haben sie die einzelnen Tabletten einen Durchmesser (10 von 7 bis 8 mm und eine Masse von 210 bis 270 mg.

Eine Person, die von einer Unterzuckerung betroffen ist, kann die erfindungsgemäße Zusammensetzung in Tablettenform mit einfachen Dosiervorrichtungen dosieren, beispielsweise mit einem Dosierlöffel. Der Löffel kann so ausgestaltet sein, dass jeweils eine Gesamtmenge Tabletten aufgenommen wird, die einer bestimmten (15 Menge Kohlenhydrate entspricht, beispielsweise einer Kohlenhydrateinheit, der typischen Rechengröße von Diabetikern. Je nach Bedarf können dann ein oder mehrere Kohlenhydrateinheiten aus einem Vorratsbehältnis entnommen und oral aufgenommen werden. Ein Schluck Wasser kann hilfreich sein, um die Tabletten komplett zu schlucken. Wie weiter oben bereits geschildert setzen die Tabletten (20 innerhalb von ca. 15 Sekunden im Mund keine Kohlenhydrate frei, so dass deren süßer Geschmack im Mund vermieden wird. Die Tabletten lösen sich erst im Magen auf und setzen dort rasch die enthaltenen Saccharide frei, die dann durch Hebung des Blutzuckerspiegels die Unterzuckerung bekämpfen. Innerhalb einer Minute nach dem Schlucken werden im leeren Magen mehr als 80% des Kohlenhydratanteils der (25 Tabletten freigesetzt. Dabei wird der ansonsten übliche süße Geschmack kohlenhydrathaltiger Zusammensetzungen vermieden. Gleichzeitig entfällt die Notwendigkeit des anschließenden Zähneputzens zum Zweck der Kariesprophylaxe. Im Fall einer nächtlichen Unterzuckerung kann die betroffene Person dann unmittelbar weiterschlafen.

(30 Die Eigenschaften der beschriebenen Tabletten erlaubt auch eine Anwendung bei Hypoglykämiezuständen, die nicht diabetesbedingt sind, z.B. im Ausdauersport. So kann beispielsweise bei Marathonläufern der sogenannte „Hungerast“ auftreten, der

wiederum eine Form der Hypoglykämie darstellt, die nicht diabetesbedingt ist. Eine andere Form der nicht diabetesbedingten Hypoglykämie kann auftreten, wenn Menschen lange nichts oder nur extrem kohlehydratarm gegessen haben („fastin Hypoglycemia“). Eine dosierte Einnahme der beschriebenen Tabletten kann auch  
5 derartige Hypoglykämiezustände überwinden.

Ein besonderer Vorteil der beschriebenen Tabletten ist, dass bei beschreibungsgemäßer Einnahme ein Hypoglykämiezustand behandelt werden kann, ohne dass die Gefahr des Auslösens einer Zuckersucht (sugar addiction) besteht. Eine solche Zuckersucht wird von Fachleuten durch den Zusammenhang von süßem Geschmack  
10 mit dem unmittelbar folgenden Blutzuckeranstieg gefördert, so wie es beim Verzehr üblicher Süßigkeiten (z.B. Schokoriegel, Gummibärchen) auftritt. Durch das Fehlen des süßen Geschmacks im Mund, wird offenbar der Belohnungssystem im Gehirn nicht aktiviert, so dass keine Suchteffekte auftreten.

## Beispiele

Die nachfolgenden Beispiele erläutern die Erfindung weiter, ohne einschränkend wirken zu wollen. Der Fachmann auf dem Gebiet kann basierend auf den Beispielen weitere Ausführungsformen der Erfindung entwickeln, ohne erfinderisch tätig werden zu müssen.

5

### Beispiel 1

#### Tablettenkern:

Rohstoff	Gehalt%
Dextrose- Monohydrat	76,0
Na.Croscarmellose	8,2
Mikrokristalline Cellulose	15,8

Zur Herstellung der Tablettenkerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Tablettenkernen gepresst. Anschließend erfolgt das Coating mit der nachfolgend angegebenen Zusammensetzung.

10

**Coating:** Bioground AquaPolish F pink 040.344 oder AquaPolish F pink 044.419

Rohstoff	Quality
Hydroxypropylmethylcellulose	E464
Rote-Bete Pulver (optional)	Lebensmittelzutat
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Echtes Karmin	E120

Nach dem Trocknen können die Tabletten verpackt werden.

#### Produktbeschreibung:

Tablettengröße: 7 oder 8 mm Tablettenkerne (gewölbt)  
 Tablettenkernmasse: 238 mg  
 Tablettenmasse (mit Coating) 247 mg

15

## Beispiel 2

### Tablettenkern:

Rohstoff	Gehalt%
Trehalose-Dihydrat	85,2
Na.Croscarmellose	5,2
Mikrokristalline Cellulose	9,6

Zur Herstellung der Tablettenkerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Tablettenkernen gepresst. Anschließend erfolgt das Coating mit der nachfolgend angegebenen Zusammensetzung.

5

**Coating:** Bioground AquaPolish F pink 040.344 oder AquaPolish F pink 044.419

Rohstoff	Quality
Hydroxypropylmethylcellulose	E464
Rote-Bete Pulver (optional)	Lebensmittelzutat
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Echtes Karmin	E120

Nach dem Trocknen können die Tabletten verpackt werden.

### Produktbeschreibung:

Tablettengröße: 7 oder 8 mm Tablettenkerne (gewölbt)  
 Tablettenkernmasse: 238 mg  
 Tablettenmasse (mit Coating) 247 mg

10

**Beispiel 3a****Tablettenkern:**

Rohstoff	Gehalt%
Dextrose- Monohydrat	81,8
Na.Croscarmellose	6,2
Mikrokristalline Cellulose	12,0

Zur Herstellung der Tablettenkerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Tablettenkernen gepresst. Anschließend erfolgt das Coating mit der nachfolgend angegebenen Zusammensetzung.

5

**Coating:** Bioground AquaPolish F pink 040.344 oder AquaPolish F pink 044.419

Rohstoff	Quality
Hydroxypropylmethylcellulose	E464
Rote-Bete Pulver (optional)	Lebensmittelzutat
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Echtes Karmin	E120

Nach dem Trocknen können die Tabletten verpackt werden.

**Produktbeschreibung:**

Tablettengröße: 7 oder 8 mm Tablettenkerne (gewölbt)  
 Tablettenkernmasse: 238 mg  
 Tablettenmasse (mit Coating) 247 mg

10

**Beispiel 3b****Drageekern:**

Rohstoff	Gehalt%
Dextrose- Monohydrat	82,4
Na.Croscarmellose	6,2
Cellulose	11,4

Zur Herstellung der Drageekerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Drageekernen gepresst. Anschließend erfolgt das Coating mit der nachfolgend angegebenen Zusammensetzung.

5

**Coating:** Bioground Aquapolish F green 074.133 MS

Pantone 7425

Rohstoff	Quality
Hypromellose	E464
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Hydroxypropylcellulose	E463
mikrokristalline Zellulose	E460(i)
Cu-Chlorophyllin	E141(ii)

Nach dem Trocknen können die Dragees verpackt werden.

**Produktbeschreibung:**

Drageegröße: 7 oder 8 mm Drageekerne (gewölbt)  
 Drageekernmasse: 238 mg  
 Drageemasse (mit Coating) 247 mg

10

**Beispiel 3c****Drageekern:**

Rohstoff	Gehalt%
Dextrose- Monohydrat	81,2
Magnesiumstearat	1,2
Na.Croscarmellose	6,2
Cellulose	11,4

Zur Herstellung der Drageekerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Drageekernen gepresst. Anschließend erfolgt das Coating mit der nachfolgend angegebenen Zusammensetzung.

5

**Coating:** Bioground Aquapolish F green 074.133 MS oder AquaPolish F pink 044.419

Rohstoff	Quality
Hypromellose	E464
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Hydroxypropylcellulose	E463
mikrokristalline Zellulose	E460(i)
Cu-Chlorophyllin	E141(ii)

Nach dem Trocknen können die Dragees verpackt werden.

**Produktbeschreibung:**

Drageegröße: 7 oder 8 mm Drageekerne (gewölbt)  
 Drageekernmasse: 238 mg  
 Drageemasse (mit Coating) 247 mg

10

## Beispiel 4

### Tablettenkern:

Rohstoff	Gehalt%
Dextrose- Monohydrat	61,6
Trehalose-Dihydrat	21,8
Na.Croscarmellose	6,2
Mikrokristalline Cellulose	11,4

Zur Herstellung der Tablettenkerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Tablettenkernen gepresst. Anschließend erfolgt das Coating mit der nachfolgend angegebenen

5 Zusammensetzung.

**Coating:** Bioground AquaPolish F pink 040.344

Rohstoff	Quality
Hydroxypropylmethylcellulose	E464
Rote-Bete Pulver	Lebensmittelzutat
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Echtes Karmin	E120

Nach dem Trocknen können die Tabletten verpackt werden.

### Produktbeschreibung:

Tablettengröße: 7 oder 8 mm Tablettenkerne (gewölbt)  
 Tablettenkernmasse: 238 mg  
 Tablettenmasse (mit Coating) 247 mg

10

**Beispiel 5****Tablettenkern:**

Rohstoff	Gehalt%
Dextrose- Monohydrat	65,3
Maltose-Hydrat	16,5
Na.Croscarmellose	6,2
Mikrokristalline Cellulose	12,0

Zur Herstellung der Tablettenkerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Tablettenkernen gepresst. Anschließend erfolgt das Coating mit der nachfolgend angegebenen

5 Zusammensetzung.

**Coating:** Bioground AquaPolish F pink 040.344

Rohstoff	Quality
Hydroxypropylmethylcellulose	E464
Rote-Bete Pulver (optional)	Lebensmittelzutat
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Echtes Karmin	E120

Nach dem Trocknen können die Tabletten verpackt werden.

**Produktbeschreibung:**

Tablettengröße: 7 oder 8 mm Tablettenkerne (gewölbt)  
 Tablettenkernmasse: 238 mg  
 Tablettenmasse (mit Coating) 247 mg

10

**Beispiel 6a****Tablettenkern:**

Rohstoff	Gehalt%
Maltodextrin	82,6
Na.Croscarmellose	6,2
Mikrokristalline Cellulose	12,0

Zur Herstellung der Tablettenkerne werden die oben angegebenen Komponenten gemischt und zu Tablettenkernen mit 6 mm Durchmesser gepresst.

5 **Beispiel 6b**

Die gemäß Beispiel 6a hergestellten Tablettenkerne werden mit einem Coating überzogen werden, wobei das Coating die nachfolgend angegebene Zusammensetzung aufweist.

**Coating:** Bioground Aquapolish F green 074.133

Rohstoff	Quality
Hypromellose	E464
Macrogol	E1521
Reisstärke	Lebensmittelzutat
Saccharoseester von Fettsäuren	E473
Hydroxypropylcellulose	E463
mikrokristalline Zellulose	E460(i)
Cu-Chlorophyllin	E141(ii)

10 Nach dem Trocknen können die Tabletten verpackt werden.

**Produktbeschreibung:**

Tablettengröße:	Ca. 7 mm Tablettenkerne (gewölbt)
Tablettenkernmasse:	117 mg
Tablettenmasse (mit Coating)	124 mg

## **Beispiel 7: Sweet Presence Binary Test zur Bewertung der Süßfreiheit von Tabletten**

Die Frage, ob eine kohlenhydrathaltige Zusammensetzung bei erfindungsgemäßer Anwendung einen süßen Geschmack im Mund erzeugt, kann durch den nachfolgend beschriebenen Sweet Presence Binary Test geprüft werden.

**Ziel:** Feststellung, ob eine Tablette unmittelbar nach dem Verweilen im Mund über 15 Sekunden süß schmeckt.

**Anwendbarkeit:** Dieses Protokoll ist für alle Arten von Tabletten anwendbar, die zur oralen Einnahme bestimmt sind und nicht gelutscht, sondern direkt geschluckt werden sollen.

### **Materialien:**

- Testtableten (zu prüfendes Produkt)
- Wasser zum Spülen des Mundes zwischen den Tests

### **Probanden:**

- Mindestens 20 Testpersonen (nicht sensorisch geschult), vorzugsweise ca. 100 Personen
- Alter zwischen 18 und 65 Jahren
- Keine bekannten Geschmacksbeeinträchtigungen

### **Methode:**

#### **a. Vorbereitung:**

- Die Testpersonen werden über das Ziel des Tests informiert und geben ihr Einverständnis zur Teilnahme.
- Jede Testperson erhält Anweisungen, vor dem Test keine stark gewürzten oder süßen Speisen zu sich zu nehmen.

#### **b. Durchführung:**

- Jede Testperson erhält eine bestimmte Anzahl von Testtableten, entsprechend der üblichen Dosierung für das getestete Produkt.

- Die Testpersonen behalten die Tabletten für 15 Sekunden im Mund, bevor sie diese schlucken.
- Unmittelbar nach dem Schlucken geben die Testpersonen an, ob sie während der Zeit im Mund eine Süße wahrgenommen haben oder nicht.

#### 5 **c. Dokumentation:**

- Die Antworten werden in einem standardisierten Formular festgehalten, das Folgendes umfasst:
  - Testperson-ID
  - Antwort auf die Frage ob Testtablett, während der Zeit im Mund, zu süßem Geschmack führen, (Ja/Nein)

10

#### **d. Auswertung:**

- Die Daten werden statistisch ausgewertet, um festzustellen, ob eine signifikante Anzahl von Testern Süße in den Testtabletten während der Zeit im Mund wahrgenommen hat.

#### 15 **e. Berichterstattung:**

- Die Ergebnisse werden in einem Abschlussbericht zusammengefasst, der folgende Informationen enthält:
  - Anzahl der Testpersonen, die Süße in den Testtabletten während der Zeit im Mund wahrgenommen haben
  - Statistische Analyse der Ergebnisse
  - Schlussfolgerungen hinsichtlich der Süßfreiheit der getesteten Tabletten

20

#### **f. Sicherheit und ethische Überlegungen:**

- Alle Testpersonen werden über mögliche Risiken aufgeklärt und geben ihr schriftliches Einverständnis.
- Der Test wird unter Aufsicht durchgeführt, um die Einhaltung der Protokolle zu gewährleisten und bei Bedarf Unterstützung zu bieten.

25

**g. Ergebnisse**

Bei Durchführung des Sweet Presence Binary Test für die Zusammensetzungen der Beispiele 1-6 geben mehr als 90% der Testpersonen, im Fall der Beispiele 2 (n=100) und 3 (n=50) sogar mehr als 95 % der Testpersonen an, keinen süßen Geschmack  
5 wahrgenommen zu haben.

**Ansprüche:**

1. Zusammensetzung in Tablettenform, bestehend aus  
Tablettenkernen enthaltend 70-95% Dextrose, Lactose, Maltose, Trehalose,  
Saccharose, Maltodextrin oder Mischungen hiervon zusammen mit  
5 fachüblichen Mitteln zur Verbesserung der Verarbeitbarkeit bzw. der  
Auflösungseigenschaften,  
sowie einem  
Tablettencoating ausgewählt aus den folgenden Substanzklassen
  - 10 a) Cellulose und Cellulosederivate, insbesondere Carboxymethylcellulose  
Hydroxypropylmethylcellulosephthalat, Methylcellulose,  
Hydroxypropylmethylcellulose (Hypromellose) und/oder  
Hydroxypropylcellulose,
  - 15 b) Methacrylsäurecopolymeren und Methacrylsäureestern
  - c) Polyvinylpyrrolidon (PVP) und Derivate
  - d) Polyvidonacetat
  - 20 e) Polyvinylacetatphthalatwobei die durch das Coating aus den Tablettenkernen entstandenen Tabletten  
einen Durchmesser zwischen 4 und 10 mm und eine Masse zwischen 50 und  
25 500 mg aufweisen,  
dadurch gekennzeichnet, dass  
die Tabletten innerhalb von 15 Sekunden im Mund keine Kohlenhydrate  
freisetzen und dass  
die Tabletten nach dem Schlucken im Magen mehr als 80% der enthaltenen  
30 Kohlenhydrate innerhalb von einer Minute freisetzen.
2. Zusammensetzung in Tablettenform gemäß Anspruch 1, wobei die einzelnen  
Tabletten einen Durchmesser von 7 bis 8 mm und eine Masse von 210 bis  
270 mg aufweisen.

3. Zusammensetzung in Tablettenform gemäß Anspruch 1 oder 2, wobei die Tablettenkerne ca. 80 % Dextrose, Lactose, Maltose, Trehalose, Saccharose, Maltodextrin oder Mischungen hiervon enthalten.
4. Zusammensetzung in Tablettenform gemäß Anspruch 1 oder 2, wobei die Tablettenkerne Maltodextrin enthalten.
5. Zusammensetzung in Tablettenform gemäß mindestens einem der Ansprüche 1 bis 4, wobei das Tablettencoating im Wesentlichen Hydroxypropylmethylcellulose enthält.
6. Verwendung einer Zusammensetzung in Tablettenform zur Herstellung eines Mittels zur Behandlung hypoglykämischer Zustände, die Zusammensetzung bestehend aus Tablettenkernen enthaltend 70-95% Dextrose, Lactose, Maltose, Trehalose, Saccharose, Maltodextrin oder Mischungen hiervon zusammen mit fachüblichen Mitteln zur Verbesserung der Verarbeitbarkeit bzw. der Auflösungs-eigenschaften, sowie einem Tablettencoating ausgewählt aus den folgenden Substanzklassen
  - a) Cellulose und Cellulosederivate, insbesondere Carboxymethylcellulose Hydroxypropylmethylcellulosephthalat, Methylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose (Hypromellose) und/oder Hydroxypropylcellulose,
  - b) Methacrylsäurecopolymere und Methacrylsäureester
  - c) Polyvinylpyrrolidon (PVP) und Derivate
  - d) Polyvidonacetat
  - e) Polyvinylacetatphthalat

wobei die durch das Coating aus den Tablettenkernen entstandenen Tabletten einen Durchmesser zwischen 4 und 10 mm und eine Masse zwischen 50 und

500 mg aufweisen und

wobei die Tabletten innerhalb von 15 Sekunden im Mund keine Kohlenhydrate freisetzen und

wobei die Tabletten nach dem Schlucken im Magen mehr als 80% der

5 enthaltenen Kohlenhydrate innerhalb von einer Minute freisetzen.

7. Verwendung einer Zusammensetzung in Tablettenform gemäß Anspruch 6, wobei die einzelnen Tabletten einen Durchmesser von 7 bis 8 mm und eine Masse von 210 bis 270 mg aufweisen.

10 8. Verwendung einer Zusammensetzung in Tablettenform gemäß Anspruch 6 oder 7, wobei die Tablettenkerne ca. 80 % Dextrose, Lactose, Maltose, Trehalose, Saccharose, Maltodextrin oder Mischungen hiervon enthalten.

9. Verwendung einer Zusammensetzung in Tablettenform gemäß Anspruch 6 oder 7, wobei die Tablettenkerne Maltodextrin enthalten.

15 10. Verwendung einer Zusammensetzung zur Behandlung von Hypoglykämie in Tablettenform gemäß mindestens einem der Ansprüche 6 bis 9, wobei die Tablettenkerne ca. 80 % Dextrose enthalten.

11. Verwendung einer Zusammensetzung zur Behandlung von Hypoglykämie in Tablettenform gemäß mindestens einem der Ansprüche 6 bis 10, wobei das Tablettencoating im Wesentlichen Hydroxypropylmethylcellulose enthält.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

**PCT/EP2024/065870**

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
A61K 9/20(2006.01)i; A61K 9/28(2006.01)i; A61P 3/00(2006.01)i		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A61K; A61P		
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) EPO-Internal		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	CN 115226896 A (ZHANG JING) 25 October 2022 (2022-10-25) the whole document	1-11
A	WO 2020254940 A1 (IYENGAR SHRINIVASAN SHESHA [IN]; BOTHRA CHANDANMAL PUKHRAJ [IN] ET AL.) 24 December 2020 (2020-12-24) pages 16-18; claims 1-12	1-11
Y	US 2016081941 A1 (NEUMANN DAVID [CZ] ET AL) 24 March 2016 (2016-03-24) column 0019 - column 0021; claims 1-9	1-11
Y	WO 2014001267 A2 (HENNIG ARZNEIMITTEL GMBH & CO [DE]) 03 January 2014 (2014-01-03) page 12 - page 14	1-11
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
<p>* Special categories of cited documents:</p> <p>“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date</p> <p>“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)</p> <p>“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“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</p> <p>“&amp;” document member of the same patent family</p>		
Date of the actual completion of the international search <b>13 August 2024</b>		Date of mailing of the international search report <b>10 September 2024</b>
Name and mailing address of the ISA/EP <b>European Patent Office p.b. 5818, Patentlaan 2, 2280 HV Rijswijk Netherlands (Kingdom of the)</b> Telephone No. (+31-70)340-2040 Facsimile No. (+31-70)340-3016		Authorized officer <b>Erdmann, Mona</b> Telephone No.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**  
**Information on patent family members**

International application No.

**PCT/EP2024/065870**

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
CN	115226896	A	25 October 2022	NONE			
WO	2020254940	A1	24 December 2020	NONE			
US	2016081941	A1	24 March 2016	EP	2994111	A1	16 March 2016
				US	2016081941	A1	24 March 2016
				WO	2014180453	A1	13 November 2014
WO	2014001267	A2	03 January 2014	AU	2013283473	A1	29 January 2015
				BR	112014032578	A2	27 June 2017
				CA	2877190	A1	03 January 2014
				CO	7250447	A2	30 April 2015
				DE	102012105528	A1	02 January 2014
				DK	2679216	T3	31 August 2015
				EA	201500044	A1	29 May 2015
				EP	2679216	A1	01 January 2014
				EP	2863896	A2	29 April 2015
				ES	2546172	T3	21 September 2015
				ES	2607447	T3	31 March 2017
				HU	E025739	T2	28 April 2016
				HU	E031246	T2	28 June 2017
				MX	367284	B	13 August 2019
				MY	168531	A	12 November 2018
				PH	12014502836	A1	02 February 2015
				PL	2679216	T3	31 December 2015
				PL	2863896	T3	28 April 2017
				PT	2679216	E	09 October 2015
				PT	2863896	T	21 December 2016
				UA	118836	C2	25 March 2019
				WO	2014001267	A2	03 January 2014
				ZA	201409506	B	31 August 2016

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2024/065870

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. A61K9/20 A61K9/28 A61P3/00  
ADD.

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
A61K A61P

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	CN 115 226 896 A (ZHANG JING) 25. Oktober 2022 (2022-10-25) das ganze Dokument -----	1 - 11
A	WO 2020/254940 A1 (IYENGAR SHRINIVASAN SHESHA [IN]; BOTHRA CHANDANMAL PUKHRAJ [IN] ET AL.) 24. Dezember 2020 (2020-12-24) Seiten 16-18; Ansprüche 1-12 -----	1 - 11
Y	US 2016/081941 A1 (NEUMANN DAVID [CZ] ET AL) 24. März 2016 (2016-03-24) Spalte 0019 - Spalte 0021; Ansprüche 1-9 -----	1 - 11
Y	WO 2014/001267 A2 (HENNIG ARZNEIMITTEL GMBH & CO [DE]) 3. Januar 2014 (2014-01-03) Seite 12 - Seite 14 -----	1 - 11

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen  Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

13. August 2024

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

10/09/2024

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Erdmann, Mona

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2024/065870

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
CN 115226896	A	25-10-2022	KEINE
WO 2020254940	A1	24-12-2020	KEINE
US 2016081941	A1	24-03-2016	EP 2994111 A1 16-03-2016 US 2016081941 A1 24-03-2016 WO 2014180453 A1 13-11-2014
WO 2014001267	A2	03-01-2014	AU 2013283473 A1 29-01-2015 BR 112014032578 A2 27-06-2017 CA 2877190 A1 03-01-2014 CO 7250447 A2 30-04-2015 DE 102012105528 A1 02-01-2014 DK 2679216 T3 31-08-2015 EA 201500044 A1 29-05-2015 EP 2679216 A1 01-01-2014 EP 2863896 A2 29-04-2015 ES 2546172 T3 21-09-2015 ES 2607447 T3 31-03-2017 HU E025739 T2 28-04-2016 HU E031246 T2 28-06-2017 MX 367284 B 13-08-2019 MY 168531 A 12-11-2018 PH 12014502836 A1 02-02-2015 PL 2679216 T3 31-12-2015 PL 2863896 T3 28-04-2017 PT 2679216 E 09-10-2015 PT 2863896 T 21-12-2016 UA 118836 C2 25-03-2019 WO 2014001267 A2 03-01-2014 ZA 201409506 B 31-08-2016