



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **113612** (13) **C2**
(51) МПК
A61K 31/5377 (2006.01)

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2012 12840	(72) Винахідник(и):	Шекдар Камбіз (US), Лавері Деніел (US), Ганнет Джозеф (US), Лангер Джессіка (US), Ліланд Джейн В. (US), Хаяші Девід (US), Браун Пітер Х. (US), Слейд Луїс (US), Джонс Вільям П. (US)
(22) Дата подання заявки:	15.04.2011	(73) Власник(и):	ХРОМОСЕЛЛ КОРПОРЕЙШН, 685 U.S. Highway One, North Brunswick, New Jersey 08902, United States of America (US), КРАФТ ФУДС ГЛОБАЛ БРЕНДС ЛЛСІ, Three Lakes Drive, Northfield, Illinois 60093, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	27.02.2017	(74) Представник:	Кістерський Арсеній Леонідович, реєстр. №177
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	61/324,362, 61/324,359, 61/324,351, 61/324,346, 61/324,345	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	US 2006/0257543 A1, 16.11.2006 US 2005/0084506 A1, 21.04.2005 US 2009/0069301 A1, 12.03.2009 US 5925527 A, 20.07.1999 US 2008/293824 A1, 27.11.2008 US 3 983 164 A, 28.09.1976 DE 10 2004 041496 A1, 02.03.2006 US 2008/249189 A1, 09.10.2008 US 2009/143455 A1, 04.06.2009 US 2003/229050 A1, 11.12.2003 JP H02129171 A, 17.05.1990
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	15.04.2010, 15.04.2010, 15.04.2010, 15.04.2010, 15.04.2010		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US, US, US, US, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	25.04.2013, Бюл.№ 8		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	27.02.2017, Бюл.№ 4		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2011/032782, 15.04.2011		

(54) СПОЛУКИ, КОМПОЗИЦІЇ ТА СПОСОБИ ДЛЯ ЗНИЖЕННЯ АБО УСУНЕННЯ ГІРКОГО СМАКУ

(57) Реферат:

Даний винахід забезпечує їстівні композиції, які містять сполуку згідно з даним винаходом, харчові продукти, що містять такі їстівні композиції, і способи приготування таких харчових продуктів. Даний винахід також забезпечує способи зниження кількості NaCl у харчовому продукті, способи зниження споживання натрію в раціоні та способи зменшення гіркого смаку харчових продуктів.

UA 113612 C2

Область техніки винаходу

[0001] Даний винахід відноситься до смаку їстівних композицій.

Рівень техніки

[0002] Відчуття смаку, наприклад, у людини, забезпечує розпізнавання чотирьох

традиційних смаків: солодкий, кислий, солоний, гіркий та уамі (гострий). Багато поживних речовин, включаючи овочі, їжу, інгредієнти їжі та поживні сполуки, містять речовини, які мають гіркий смак, і/або мають гіркий смак. Крім того, багато фармацевтичних речовин, важливих для збереження або підтримки здоров'я, містять речовини, які мають гіркий смак, і/або мають гіркий смак. Хоча для деяких харчових і споживчих продуктів, включаючи каву, пиво та темний шоколад, гіркий смак є бажаною властивістю, у багатьох випадках споживачам не подобається гіркий смак. Наприклад, багатьом споживачам не подобається відчуття деяких речовин, які мають гіркий смак, і/або гіркого смаку, і вони уникають їжі або фармацевтичних продуктів, які містять небажані речовини, що мають гіркий смак, або які мають гіркий смак, надаючи перевагу їжі або фармацевтичним продуктам зі зниженим рівнем небажаних речовин, що мають гіркий смак, або в яких знижений чи повністю відсутній гіркий смак. Ця антипатія до продуктів, які містять небажані речовини, що мають гіркий смак, і/або мають гіркий смак, опосередковується рецепторами гіркого смаку в ротовій порожнині і/або шлунково-кишковому тракті. У багатьох випадках споживачам не подобається гіркий смак і/або гіркий смак перешкоджає або утруднює покращення поживних властивостей і безпеки їжі внаслідок неможливості використовувати необхідні кількості харчових речовин і/або консервантів, які містять речовини, що мають гіркий смак, і/або мають гіркий смак. Також ворожість або відраза до речовин, що мають гіркий смак, або гіркого смаку деяких фармацевтичних агентів негативно позначається на дотриманні запропонованих режимів їх використання.

[0003] Наприклад, деякі добавки, консерванти, емульгатори та харчові продукти, які використовуються у виробництві продуктів харчування, містять речовини, що мають гіркий смак, і/або мають гіркий смак. У той час як ці добавки, консерванти, емульгатори та харчові продукти можуть негативно впливати на смак продукту харчування, вони також можуть бути важливими для покращення строку придатності, поживних властивостей або текстури продукту харчування. Наприклад, зростаючу схильність до гіпертензії та серцево-судинних захворювань пов'язують частково з високим споживанням натрію в раціоні західного типу. Відповідно, існує потреба в заміні хлориду натрію на іншу сполуку, що має солоний смак. Найпоширенішим замінником хлориду натрію є хлорид калію, який, окрім солоного смаку, у частини популяції викликає відчуття гіркого смаку. Гіркий смак хлориду калію обмежує ступінь, у якому його можна застосовувати для заміни хлориду натрію в харчових продуктах, не викликаючи відчуття гіркого смаку у чутливої до нього частини популяції.

[0004] Інша поширена харчова добавка, лактат натрію, має широку протимікробну дію, ефективно придушує псування та ріст патогенних бактерій і часто використовується в продуктах харчування (наприклад, у продуктах із м'яса та птиці) для збільшення строку придатності та підвищення безпеки продуктів. Однак, через вміст у ньому натрію, може бути небажаним використовувати лактат натрію як консервант. Лактат калію, який має аналогічні антимікробні властивості, використовується як замінник лактату натрію. Однак, лактат калію також пов'язаний із гірким смаком, що обмежує ступінь, у якому його можна використовувати для заміни лактату натрію в продуктах харчування, не викликаючи небажаного гіркого смаку.

[0005] Крім того, ріст захворюваності ожирінням і діабетом пов'язують частково з високим споживанням цукру в багатьох типах дієт. Відповідно, існує потреба в заміні цукру на іншу сполуку, яка має солодкий смак. Штучні та природні замінники цукру, які можна застосовувати для зниження кількості цукру в їжі, часто пов'язані з гірким смаком, що обмежує ступінь, у якому їх можна застосовувати для заміни цукру в продуктах харчування, не викликаючи небажаного гіркого смаку. Наприклад, поширеним замінником цукру є Ацесульфам К, який також окрім солодкого має гіркий смак.

[0006] Без прив'язки до якої-небудь теорії, речовини, які мають гіркий, солодкий смак або смак уамі, зазвичай викликають смакову реакцію через рецептори, спряжені з G-білком, а речовини, які мають солоний і кислий смак, як вважається, викликають смакову відповідь через йонні канали. Рецептори гіркого смаку належать до сімейства T2R (яке також називають TAS2R) рецепторів, спряжених із G-білками, які викликають зміни внутрішньоклітинних концентрацій кальцію у відповідь на речовину, яка має гіркий смак. Рецептори T2R діють через густидин, смак-специфічний G-білок. Існує щонайменше двадцять п'ять різних членів сімейства T2R, що вказує на те, що сприйняття гіркого смаку являє собою комплекс, у якому задіяно кілька взаємодій смакова речовина-рецептор. Сполуки, здатні модулювати активацію і/або сигналінг рецепторів гіркого смаку в ротовій порожнині і/або шлунково-кишковому тракті, можуть

забезпечити можливість використання необхідних рівнів речовин, що мають гіркий смак, або речовин гіркої смаку, у харчових і фармацевтичних продуктах, не викликаючи в покупців відторгнення таких продуктів внаслідок сприйняття підвищених рівнів речовин, що мають гіркий смак, або гіркої смаку. У деяких випадках блокатори або модулятори рецепторів гіркої смаку

5 можливо знижують сприйняття речовини, що має гіркий смак, і/або гіркої смаку через рецептори гіркої смаку і/або механізм передачі смакового сигналу, який існує в ротовій порожнині і/або шлунково-кишковому тракті.

[0007] Традиційно в харчових продуктах і фармацевтичних продуктах гіркий смак маскують, використовуючи підсолоджувачі та інші смакові сполуки, включаючи солі. Однак, у деяких

10 випадках таке маскування може бути небажаним або недостатнім, оскільки воно може змінити, замаскувати або порушити інші смаки/аромати/враження (наприклад, негірких смаків або бажаних гірких смаків) у продукті харчування. Крім того, цей підхід рідко дозволяє повністю замаскувати гіркий смак такого продукту харчування або фармацевтичного продукту. Відповідно, переважними є сполуки, які зменшують гіркий смак замість або на додаток до

15 маскуючих агентів.

[0008] Відповідно, існує потреба в сполуках, які можна додавати до продуктів харчування, споживчих продуктів і фармацевтичних засобів, які містять речовини, що мають гіркий смак, або які мають гіркий смак, для усунення, модуляції або зниження сприйняття речовини, що має гіркий смак, або гіркої смаку в ротовій порожнині і/або в шлунково-кишковому тракті.

20 Аналогічно, існує потреба в продуктах харчування, харчових продуктах і фармацевтичних композиціях, що містять такі сполуки. Також існує необхідність у зниженні споживання натрію з використанням таких сполук для усунення, модуляції або зниження сприйняття гіркої смаку, пов'язаного із заміниками солі. Далі, існує необхідність у зниженні споживання цукру суб'єктом з використанням таких сполук для усунення, модуляції або зниження сприйняття гіркої смаку,

25 пов'язаного із заміниками цукру.

Сутність винаходу

[0009] Даний винахід забезпечує сполуки, які модулюють гіркий смак, їстівні композиції, які містять такі сполуки, та способи приготування таких їстівних композицій. Даний винахід також забезпечує способи зниження кількості натрію або цукру в їстівній композиції та способи

30 зменшення гіркої смаку харчового продукту. Далі даний винахід забезпечує способи зниження, модуляції або усунення сприйняття гіркої смаку їжі, споживчого або фармацевтичного продукту у суб'єкта. Даний винахід також відноситься до способу модулювання і, зокрема, зниження активації рецептора гіркої смаку.

Їстівні композиції

[0010] Один аспект даного винаходу відноситься до їстівних композицій для зниження гіркої смаку речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція містить дифеніл-вмісну сполуку. У деяких варіантах реалізації, зазначена дифеніл-вмісна сполука являє собою сполуку, яка має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У

35 деяких варіантах реалізації, зазначена дифеніл-вмісна сполука являє собою сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb') або Формули (IIIb'') або Сполуку 1-22, або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

[0011] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція містить піразол-вмісну сполуку. У деяких варіантах реалізації, зазначена піразол-вмісна сполука являє собою сполуку, яка має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах

45 реалізації, піразол-вмісна сполука являє собою сполуку Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa) або Формули (VIIb), або Сполуку 23-36, або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

[0012] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція містить гідрохінолінову сполуку. У деяких варіантах реалізації, гідрохінолінова сполука являє собою сполуку, яка має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, гідрохінолінова сполука являє собою сполуку Формули (VIII), Формули (IX) або Формули (X), або

50 Сполуку 37-43, або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки.

[0013] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція містить сполуку хіноліну. У деяких варіантах реалізації, сполука хіноліну являє собою сполуку, яка має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, сполука хіноліну являє собою сполуку Формули (XI), Формули (XIa), Формули (XIb), Формули (XIIa) або Формули

60 (XIIb), або сполуку 44-48, або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або

похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

[0014] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція містить N-фенілалкіламідну сполуку. У деяких варіантах реалізації, N-фенілалкіламідна сполука являє собою сполуку, яка має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, N-фенілалкіламідна сполука являє собою сполуку Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або Сполуку 49-58, або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

[0015] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція містить (a) сполуку згідно з даним винаходом; і (b) речовину, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє собою сполуку, яка має молекулярну масу меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє собою сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук.

[0016] У іншому варіанті реалізації, їстівна композиція містить (a) будь-яку зі сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук; і (b) речовину, що має гіркий смак.

[0017] Відповідно до даного винаходу речовина, що має гіркий смак, може бути присутньою в, наприклад, харчовому продукті (такому як кава або шоколад) або може бути компонентом їстівної композиції (наприклад, консервант, що має гіркий смак). У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівній композиції, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівній композиції, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівних композиціях, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівній композиції, являє собою лактат калію.

[0018] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить сіль натрію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить NaCl. У інших варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить лактат натрію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить цукор.

[0019] Згідно з іншим аспектом даного винаходу, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, який містить щонайменше одну сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє собою сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук. У інших варіантах реалізації, фармацевтична композиція містить фармацевтично активний інгредієнт, що має гіркий смак, і будь-яку зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0020] У іншому аспекті даного винаходу, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію, яка містить фармацевтично активний інгредієнт, що має гіркий смак, і сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук. У інших варіантах реалізації, фармацевтична композиція містить фармацевтично активний інгредієнт, що має гіркий смак, і будь-яку зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0021] У інших варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію, яка містить фармацевтично активний інгредієнт, речовину, що має гіркий смак, і сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук. У інших варіантах реалізації, фармацевтична композиція містить фармацевтично активний інгредієнт, речовину,

що має гіркий смак, і будь-яку зі Сполук 1-58 згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0022] У іншому аспекті даного винаходу, їстівна композиція являє собою споживчий продукт, який містить речовину, що має гіркий смак, і сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (Vlb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук. У інших варіантах реалізації, споживчий продукт містить інгредієнт, що має гіркий смак, і будь-яку зі сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0023] У ще одному варіанті реалізації, даний винахід забезпечує споживчий продукт для зниження гіркого смаку речовини, що має гіркий смак, причому зазначений споживчий продукт містить сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (Vlb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук. У інших варіантах реалізації, споживчий продукт для зменшення гіркого смаку речовини, що має гіркий смак, містить будь-яку зі сполук 1-58 згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0024] У іншому аспекті, даний винахід забезпечує спосіб приготування їстівної композиції, який включає:

(а) готування придатного для вживання в їжу носія; і

(b) додавання до зазначеного прийнятного для вживання в їжу носія (а) сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (Vlb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0025] У іншому варіанті реалізації, спосіб приготування їстівної композиції включає:

(а) готування придатного для вживання в їжу носія; і

(b) додавання до зазначеного прийнятного для вживання в їжу носія (а) будь-якої зі сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0026] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, придатний для вживання в їжу носій являє собою харчовий продукт, продукт харчування або фармацевтично прийнятний носій.

[0027] У деяких варіантах реалізації, придатний для вживання в їжу носій в (а) за своєю природою має гіркий смак. У таких варіантах реалізації, придатний для вживання в їжу носій можливо містить речовину, що має гіркий смак, як невід'ємний інгредієнт (тобто, придатний для вживання в їжу носій є гірким без додавання речовини, що має гіркий смак). У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, придатний до їжі гіркий носій, що має за своєю природою гіркий смак, містить сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, придатний до їжі гіркий носій, що має за своєю природою гіркий смак, містить сіль калію, таку як KCl.

[0028] У інших варіантах реалізації, спосіб приготування їстівної композиції додатково включає: (с) додавання речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка використовується в способі приготування їстівної композиції, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка використовується в способі приготування їстівної композиції, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка використовується в способі приготування їстівної композиції, являє собою сіль калію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка використовується в способі приготування їстівної композиції, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка використовується в способі приготування їстівної композиції, являє собою лактат калію.

[0029] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить сіль натрію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить NaCl. У деяких варіантах

реалізації, їстівна композиція додатково містить лактат натрію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить цукор.

[0030] Даний винахід також відноситься до способу зниження кількості натрію в їстівній композиції. У деяких варіантах реалізації такі способи включають:

5 (a) заміну деякої кількості однієї або більше солей натрію, яка використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість однієї або більше солей калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII),
10 Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0031] У іншому варіанті реалізації, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції включає:

15 (a) заміну деякої кількості однієї або більше солей натрію, яка використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість однієї або більше солей калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0032] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію.

[0033] У деяких варіантах реалізації даного винаходу, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції включає додавання сполуки на етапі (b) в кількості, достатній для забезпечення заміни до 25 % натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб
25 забезпечити заміну до 50 % натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. У інших варіантах реалізації кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 75 % натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. У інших варіантах реалізації кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 100 % натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. У деяких
30 варіантах реалізації їстівна композиція зберігає солоний смак.

[0034] Даний винахід також відноситься до способу зниження кількості NaCl у їстівній композиції. У деяких варіантах реалізації такі способи включають:

(a) заміну деякої кількості NaCl, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість KCl; і

35 (b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом
40 або комбінації зазначених сполук.

[0035] У іншому варіанті реалізації, спосіб зниження кількості NaCl у їстівній композиції включає:

(a) заміну деякої кількості NaCl, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість KCl; і

45 (b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0036] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію.

[0037] У деяких варіантах реалізації даного винаходу, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції включає додавання сполуки на етапі (b) в кількості, достатній для того, щоб замінити до 25 % NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 50 % NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. У інших варіантах реалізації кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 75 %
50 NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. У інших варіантах реалізації кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 100 % NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. У деяких варіантах реалізації їстівна композиція зберігає солоний смак.

[0038] У іншому варіанті реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції, який включає:

(a) заміну деякої кількості лактату натрію, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0039] У іншому варіанті реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції, який включає:

(a) заміну деякої кількості лактату натрію, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0040] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію.

[0041] У деяких варіантах реалізації даного винаходу, спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції включає додавання сполуки на етапі (b) в кількості, достатній для забезпечення заміни до 25 % лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію.

У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 50 % лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 75 % лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 100 % лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція має такий же строк придатності, що і їстівна композиція, яка містить лактат натрію.

[0042] У іншому варіанті реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції, який включає:

(a) заміну деякої кількості цукру, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість Ацесульфаму К; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0043] У іншому варіанті реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції, який включає:

(a) заміну деякої кількості цукру, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість Ацесульфаму К; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0044] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію.

[0045] У деяких варіантах реалізації даного винаходу, спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції включає додавання сполуки на етапі (b) в кількості, достатній для забезпечення заміни до 25 % цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 50 % цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 75 % цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для того, щоб забезпечити заміну до 100 % цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція зберігає солодкий смак.

[0046] Даний винахід також відноситься до способу зниження споживання натрію суб'єктом. Такий спосіб включає:

(a) заміну деякої кількості NaCl, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість KCl; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I),

Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук, що забезпечує зниження споживання натрію суб'єктом.

[0047] У іншому варіанті реалізації, спосіб зниження споживання натрію суб'єктом включає:

(а) заміну деякої кількості NaCl, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість KCl; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук, що забезпечує зниження споживання натрію суб'єктом.

[0048] У іншому варіанті реалізації, спосіб зниження споживання натрію суб'єктом включає:

(а) заміну деякої кількості лактату натрію, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук, що забезпечує зниження споживання натрію суб'єктом.

[0049] У іншому варіанті реалізації, спосіб зниження споживання натрію суб'єктом включає:

(а) заміну деякої кількості лактату натрію, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук, що забезпечує зниження споживання натрію суб'єктом.

[0050] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію.

[0051] У деяких варіантах реалізації даного винаходу, способи зниження споживання натрію суб'єктом додатково включають (с) ідентифікацію суб'єкта, що потребує застосування даного способу. У деяких варіантах реалізації, способи зниження споживання натрію суб'єктом включають додавання на етапі (b) кількості сполуки, достатньої для зниження споживання натрію на величину до 25 % з використанням калієвої заміни. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання натрію на величину до 50 % з використанням калієвої заміни. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання натрію на величину до 75 % з використанням калієвої заміни. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання натрію на величину до 100 % з використанням калієвої заміни.

[0052] Даний винахід також відноситься до способу зниження споживання цукру суб'єктом, який включає:

(а) заміну деякої кількості цукру, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість Ацесульфаму К; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук зі зниженням споживання цукру суб'єктом.

[0053] У іншому варіанті реалізації, спосіб зниження споживання цукру суб'єктом включає:

(а) заміну деякої кількості цукру, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість Ацесульфаму К; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук зі зниженням споживання цукру в раціоні або їжі суб'єктом.

[0054] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію.

[0055] У деяких варіантах реалізації даного винаходу, способи зниження споживання цукру суб'єктом додатково включають (с) ідентифікацію суб'єкта, що потребує застосування даного способу. У деяких варіантах реалізації, способи зниження споживання цукру суб'єктом включають додавання на етапі (b) кількості сполуки, достатньої для зниження споживання цукру на величину до 25 % з використанням Ацесульфаму К як заміни. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання цукру на

величину до 50 % з використанням Ацесульфаму К як заміни. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання цукру на величину до 75 % з використанням Ацесульфаму К як заміни. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання цукру на величину до 100 % з використанням Ацесульфаму К як заміни.

[0056] Даний винахід також відноситься до способу зменшення гіркого смаку, пов'язаного з речовиною, що має гіркий смак, у їстівній композиції, який включає додавання ефективної кількості сполуки, що відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук до їстівної композиції, що забезпечує зниження будь-якого гіркого смаку, викликаного речовиною, яка має гіркий смак. У інших варіантах реалізації, сполука, яка додається до їстівної композиції, являє собою будь-яку зі сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0057] Далі даний винахід забезпечує спосіб зменшення гіркого смаку, пов'язаного з речовиною, що має гіркий смак, у їстівній композиції, який включає приймання внутрішньої ефективної кількості сполуки, що відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук перед, одночасно з або після їстівної композиції, що забезпечує зниження будь-якого гіркого смаку, викликаного речовиною, яка має гіркий смак. У інших варіантах реалізації, сполука, яку приймають внутрішньо з їстівною композицією, являє собою будь-яку зі сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0058] У деяких варіантах реалізації, спосіб забезпечує зниження гіркого смаку, викликаного речовиною, що має гіркий смак, на величину до 25 %. У деяких варіантах реалізації, спосіб забезпечує зниження гіркого смаку, викликаного речовиною, що має гіркий смак, на величину до 50 %. У інших варіантах реалізації, гіркий смак, викликаний речовиною, що має гіркий смак, знижується на величину до 75 %. У інших варіантах реалізації, гіркий смак, викликаний речовиною, що має гіркий смак, знижується на величину до 100 %. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівній композиції, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівній композиції, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівних композиціях, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в їстівній композиції, являє собою лактат калію.

[0059] У іншому аспекті даний винахід забезпечує спосіб консервації їстівної композиції, який включає:

(a) готування їстівної композиції; і

(b) додавання до їстівної композиції з етапу (a) лактату калію та ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0060] У іншому варіанті реалізації, спосіб консервації або збільшення строку придатності їстівної композиції включає:

(a) готування їстівної композиції; і

(b) додавання до їстівної композиції (a) лактату калію та ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0061] Даний винахід також відноситься до способу зниження кількості натрію в їстівній композиції та одночасно до консервації зазначеної їстівної композиції. У деяких варіантах реалізації, такий спосіб включає:

(a) заміну деякої кількості лактату натрію, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII),

Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIla), Формулі (XIlb), Формулі (XIlla), Формулі (XIllb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук.

[0062] Даний винахід також відноситься до способу зниження кількості натрію в їстівній композиції та одночасно до консервації зазначеної їстівної композиції. У деяких варіантах реалізації, такий спосіб включає:

(а) заміну деякої кількості лактату натрію, що використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(b) введення до їстівної композиції ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0063] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію.

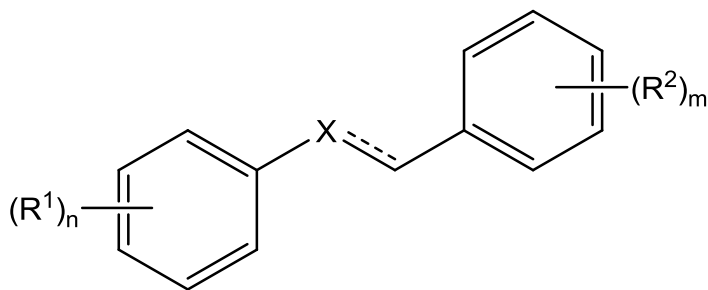
[0064] Даний винахід також відноситься до способу зниження або усунення сприйняття гіркого смаку у суб'єкта із застосуванням їстівної композиції, яка містить сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (Vlb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIla), Формули (XIlb), Формули (XIlla), Формули (XIllb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук. У інших варіантах реалізації, композиція, яка забезпечує зниження або усунення сприйняття гіркого смаку у суб'єкта, містить будь-яку зі сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0065] У деяких варіантах реалізації, гіркий смак є невід'ємною властивістю. У деяких варіантах реалізації, гіркий смак обумовлений сіллю, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, гіркий смак обумовлений сіллю калію, сіллю магнію або сіллю кальцію. У деяких варіантах реалізації, гіркий смак обумовлений KCl. У інших варіантах реалізації, гіркий смак обумовлений лактатом калію.

[0066] Даний винахід також відноситься до способу придушення або зниження активації і/або передачі сигналу рецептора гіркого смаку, причому зазначений спосіб включає реалізації контакту рецептора гіркого смаку зі сполукою Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (Vlb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIla), Формули (XIlb), Формули (XIlla), Формули (XIllb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук. У інших варіантах реалізації, спосіб включає реалізації контакту рецептора гіркого смаку з будь-якою зі сполук 1-58 або комбінацій зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку знаходиться в роті. У інших варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку знаходиться в шлунково-кишковому тракті, наприклад, у шлунку. У інших варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку знаходиться в in vitro тест-системі.

[0067] Нижче наведені деякі варіанти реалізації даного винаходу у вигляді пронумерованих параграфів:

1. Композиція, яка містить сполуку, що відповідає Формулі (I):



Формула (I);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, C_{6-10} арилокси, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} етероарилокси, C_{1-10}

5 гетероарил-С₁₋₆алкілокси, С₃₋₁₀алкенілокси, С₃₋₁₀алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, диС₁₋₁₀алкіламіно, моноС₁₋₁₀алкіламіно, С₁₋₁₃амідо, С₁₋₁₀іміно, С₁₋₁₀карбамат, С₁₋₁₀сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, С₁₋₁₀алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфоаміол, сульфонамідо, сульфоніл, С₃₋₇карбоцикліл, С₃₋₇карбоцикліл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₆гетероцикліл, С₁₋₆гетероцикліл-С₁₋₆алкіл, фенол, фенол-С₁₋₆алкіл, С₁₋₅гетероарил і С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обраних із N, O і S;

10 R^2 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: С₁₋₁₀алкіл, С₁₋₁₀галоалкіл, С₂₋₁₀алкеніл, С₂₋₁₀алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, С₁₋₁₀алкоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкенілоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкінілоксикарбоніл, С₁₋₁₀ацил, С₁₋₁₀ациламіно, С₁₋₁₀ацилокси, С₁₋₁₀карбонат, С₁₋₁₀алкокси, С₆₋₁₀арилокси, С₆₋₁₀арил-С₁₋₆алкілокси, С₁₋₅гетероарилокси, С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкілокси, С₃₋₁₀алкенілокси, С₃₋₁₀алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, диС₁₋₁₀алкіламіно, моноС₁₋₁₀алкіламіно, С₁₋₁₃амідо, С₁₋₁₀іміно, С₁₋₁₀карбамат, С₁₋₁₀сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, С₁₋₁₀алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфоаміол, сульфонамідо, сульфоніл, С₃₋₇карбоцикліл, С₃₋₇карбоцикліл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₆гетероцикліл, С₁₋₆гетероцикліл-С₁₋₆алкіл, фенол, фенол-С₁₋₆алкіл, С₁₋₅гетероарил і С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обраних із N, O і S;

20 X являє собою O або NR^a, де R^a відсутній або обраний із групи, яка складається з наступного: водень, С₁₋₁₀алкіл, С₁₋₁₀галоалкіл, С₂₋₁₀алкеніл, С₂₋₁₀алкініл, карбоксил, С₁₋₁₀алкоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкенілоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкінілоксикарбоніл, С₁₋₁₀ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфоаміол, сульфоніл, С₃₋₇карбоцикліл, С₃₋₇карбоцикліл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₆гетероцикліл, С₁₋₆гетероцикліл-С₁₋₆алкіл, фенол, фенол-С₁₋₆алкіл, С₁₋₅гетероарил і С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

25 причому будь-який із R¹, R² та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: С₁₋₁₀алкіл, С₁₋₁₀галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, С₁₋₁₀алкоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкенілоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкінілоксикарбоніл, С₁₋₁₀ацил, С₁₋₁₀ациламіно, С₁₋₁₀ацилокси, С₁₋₁₀карбонат, С₁₋₁₀алкокси, фенолокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, диС₁₋₁₀алкіламіно, моноС₁₋₁₀алкіламіно, С₁₋₁₃амідо, С₁₋₁₀іміно, С₁₋₁₀карбамат, С₁₋₁₀сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, С₁₋₁₀алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфоаміол, сульфонамідо, сульфоніл, С₃₋₇карбоцикліл, С₃₋₇карбоцикліл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₆гетероцикліл, С₁₋₆гетероцикліл-С₁₋₆алкіл, фенол, фенол-С₁₋₆алкіл, С₁₋₅гетероарил і С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

м являє собою 1-3; і

п являє собою 0-3;

40 причому зазначена композиція їстівна або здатна зменшувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак.

2. Композиція згідно з параграфом 1, причому за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

45 R¹, незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген; гідроксил; С₁₋₆алкіл; С₁₋₆галоалкіл, С₁₋₆гідроксилалкіл або С₁₋₆ацилокси-С₁₋₆алкіл; С₂₋₆алкеніл; С₂₋₆алкініл; С₁₋₆алкокси; С₁₋₆алкілтію; і С₆₋₁₀арил-С₁₋₆алкілокси, які можливо містять як замісники галоген, гідроксил, С₁₋₆алкіл, С₁₋₆алкокси або С₁₋₆ацилокси;

50 R², незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген; гідроксил; С₁₋₆алкіл; С₁₋₆галоалкіл, С₁₋₆гідроксилалкіл і С₁₋₆ацилокси-С₁₋₆алкіл; С₂₋₆алкеніл; С₂₋₆алкініл; С₁₋₆алкокси; С₁₋₆алкілтію; і С₆₋₁₀арил-С₁₋₆алкілокси, які можливо містять як замісники галоген, гідроксил, С₁₋₆алкіл, С₁₋₆алкокси або С₁₋₆ацилокси;

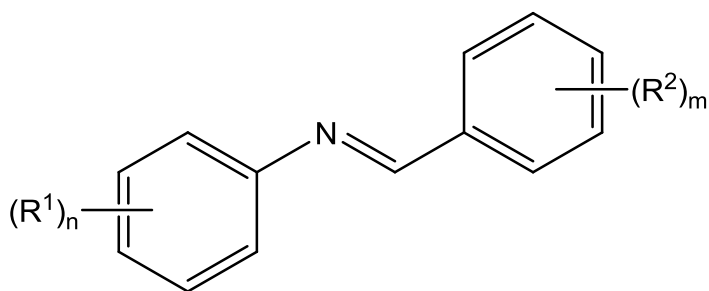
X являє собою O або NR^a, причому R^a відсутній або обраний із групи, яка складається з водню та С₁₋₆алкілу;

причому будь-який із R¹, R² і R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо додатково містить замісники, визначені в параграфі 1;

м являє собою 1-3; і

п являє собою 0-3.

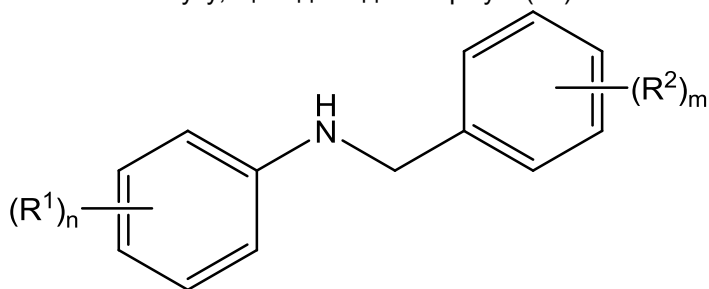
3. Композиція згідно з параграфом 1, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (I), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (IIa):



Формула (IIa);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , m і n мають значення, визначені в параграфі 1.

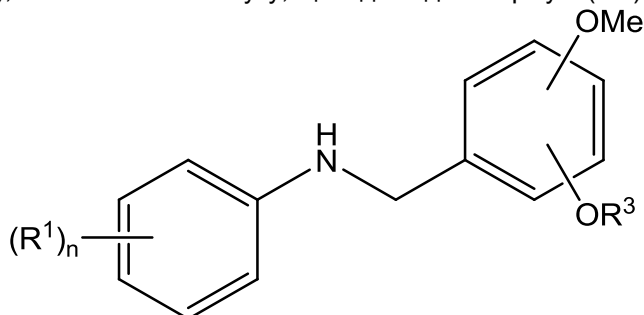
4. Композиція згідно з параграфом 1, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (I), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (IIb):



Формули (IIb);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , m і n мають значення, визначені в параграфі 1.

5. Композиція згідно з параграфом 4, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (IIb), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (IIIb):



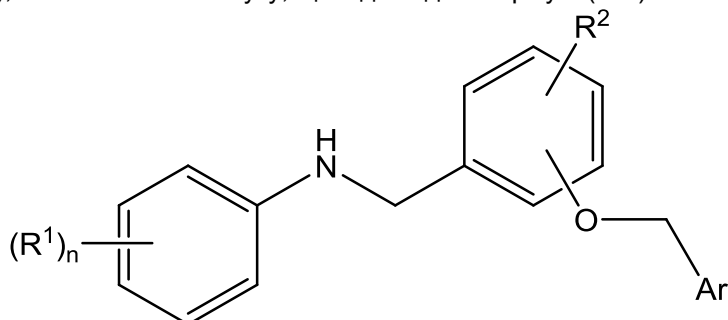
Формули (IIIb);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 і n мають значення, визначені в параграфі 1; і

R^3 обраний із групи, яка складається з метилу та етилу.

6. Композиція згідно з параграфом 4, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (IIb), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (IIIb'):



Формула (IIIb');
 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної

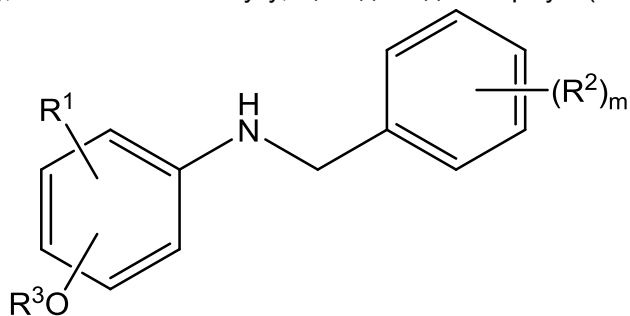
сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

5 R^1 , R^2 і n мають значення, визначені в параграфі 1; і

Ag являє собою C_{6-10} арил, який можливо містить як замісники галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкокси або C_{1-6} ацилокси.

7. Композиція згідно з параграфом 4, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (IIb), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (IIIb''):



10 Формула (IIIb'');
 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної

сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

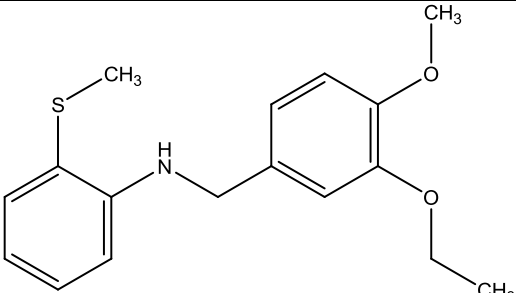
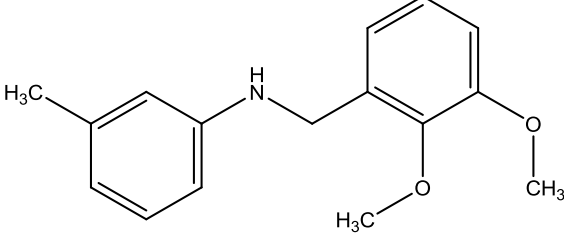
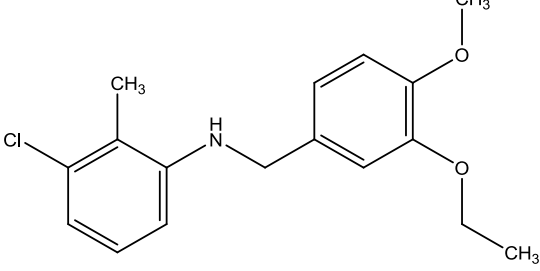
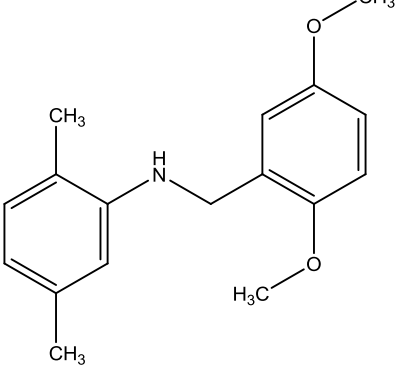
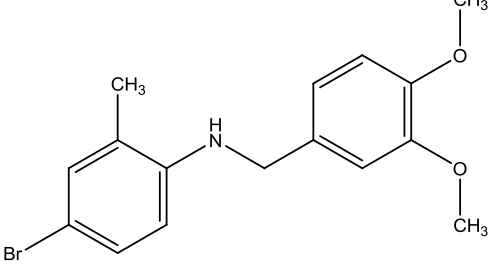
де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

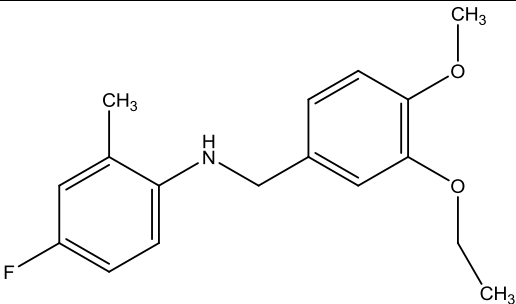
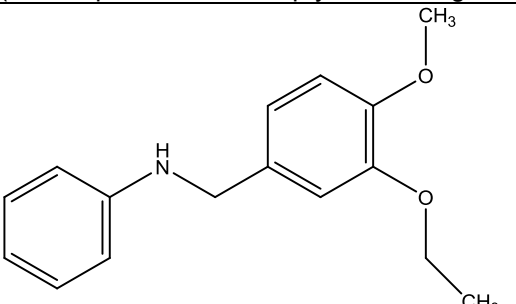
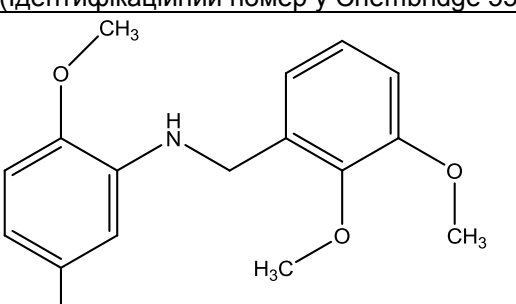
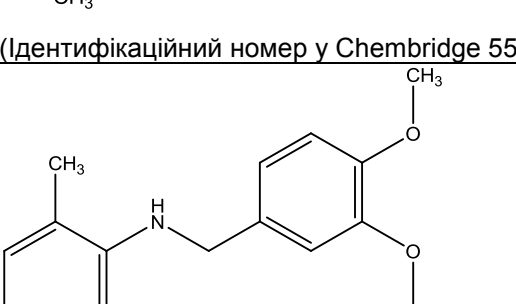
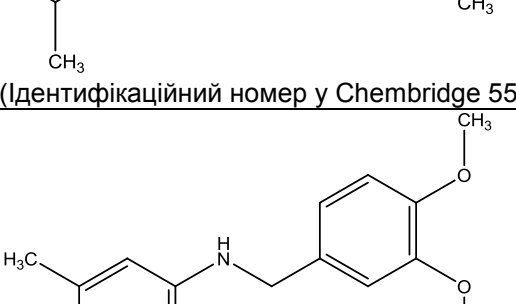
15 R^1 , R^2 і m мають значення, визначені в параграфі 1; і

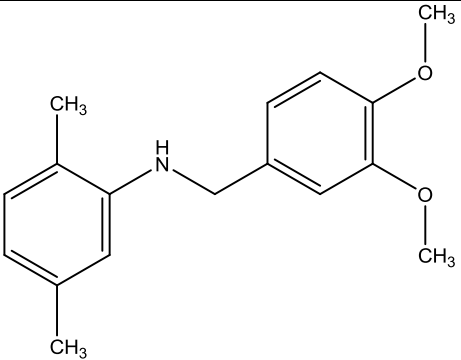
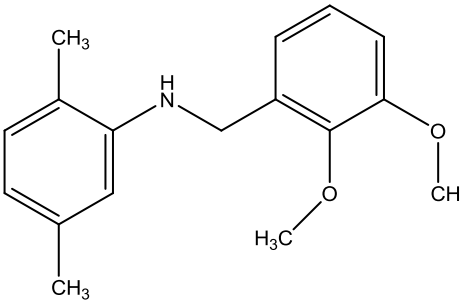
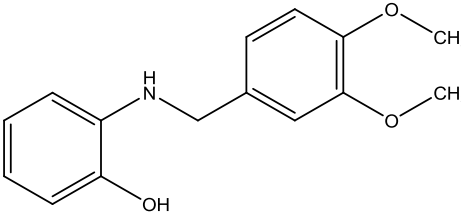
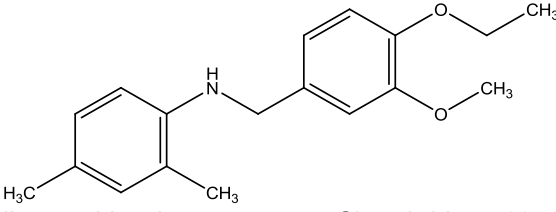
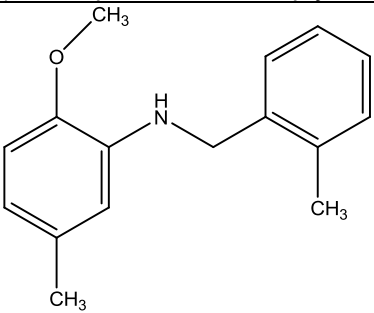
R^3 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил.

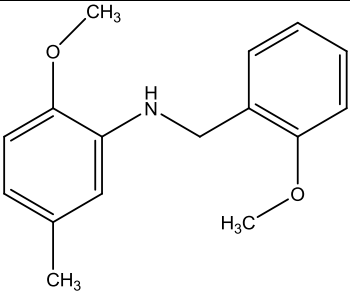
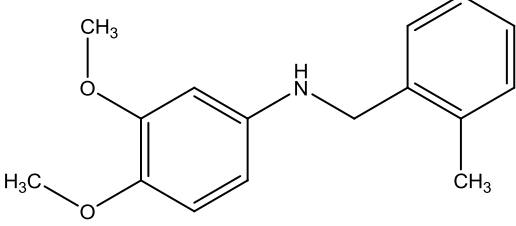
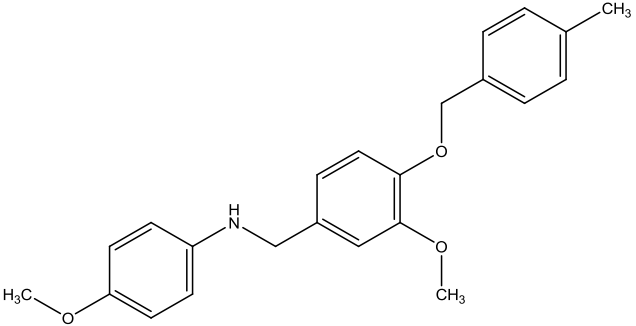
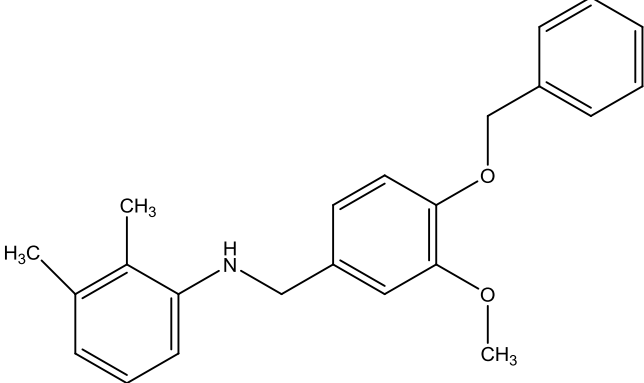
8. Композиція згідно з параграфом 1, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (I), обрана з групи, що складається з наступного:

Сполука 1	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7993700),</p>
Сполука 2	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5466932),</p>
Сполука 3	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7577371),</p>

<p>Сполука 4</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5455001),</p>
<p>Сполука 5</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5456409),</p>
<p>Сполука 6</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5464866),</p>
<p>Сполука 7</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5531378),</p>
<p>Сполука 8</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5537313),</p>

Сполука 9	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5538324),</p>
Сполука 10	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5539449),</p>
Сполука 11	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5549065),</p>
Сполука 12	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5562743),</p>
Сполука 13	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5567336),</p>

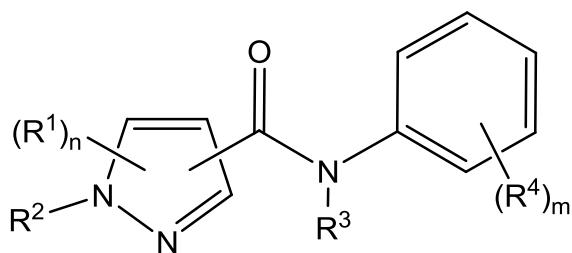
<p>Сполука 14</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5572799),</p>
<p>Сполука 15</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5575970),</p>
<p>Сполука 16</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7675788),</p>
<p>Сполука 17</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7684680),</p>
<p>Сполука 18</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5556341),</p>

Сполука 19	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 5531571),
Сполука 20	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 5453910),
Сполука 21	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7575033),
Сполука 22	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7678665),

придатна для вживання в їжу чи біологічно придатна похідна зазначеної сполуки або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

9. Композиція, яка містить сполуку, що відповідає Формулі (IV):

5



Формула (IV);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної

сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфамойл, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфамойл, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^4 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфамойл, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 та R^4 незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містять 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

n являє собою 0-2; і

m являє собою 0-3;

причому зазначена композиція їстівна або здатна зменшувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак.

10. Композиція згідно з параграфом 9, у якій:

R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} ацил;

R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^4 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген,

C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси, $-C(O)-O-R^5$ і $-C(O)-N(R^5)_2$;

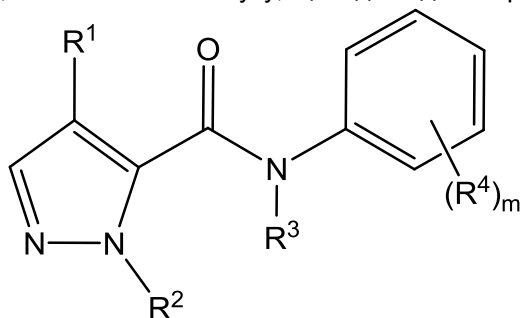
R^5 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

причому будь-який із R^3 та R^4 незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить замісники, визначені в параграфі 9;

n являє собою 0-2; і

m являє собою 0-3.

11. Композиція згідно з параграфом 9, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (IV), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (Va):

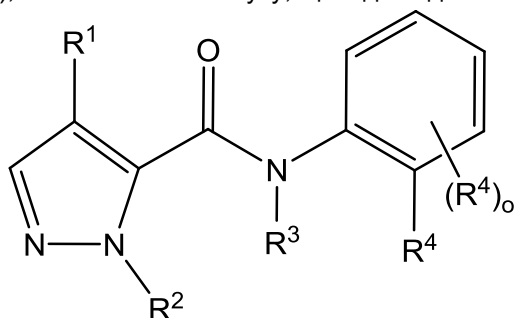


Формула (Va);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 і m мають значення, визначені в параграфі 9.

12. Композиція згідно з параграфом 11, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (Va), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (VIa):



Формула (VIa);

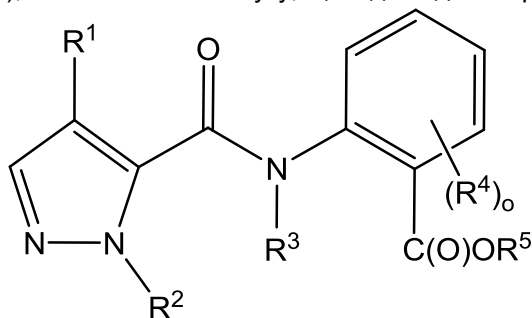
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , R^3 та R^4 мають значення, визначені в параграфі 11; і

o являє собою 0-2.

13. Композиція згідно з параграфом 12, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (VIa), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (VIIa):

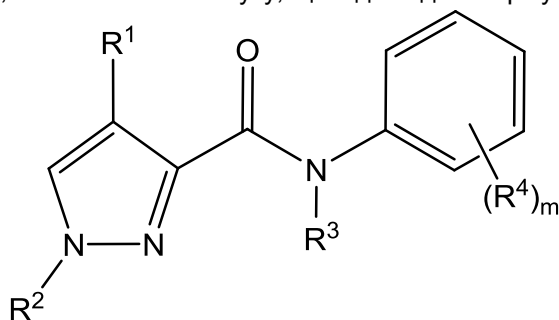


Формула (VIIa);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль, або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 і o мають значення, визначені в параграфі 12.

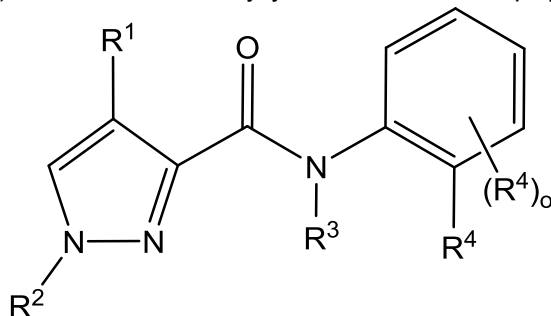
14. Композиція згідно з параграфом 9, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (IV), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (Vb):



Формула (Vb);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 і m мають значення, визначені в параграфі 9.

15. Композиція згідно з параграфом 14, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (Vb), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (VIb):



Формула (VIb);

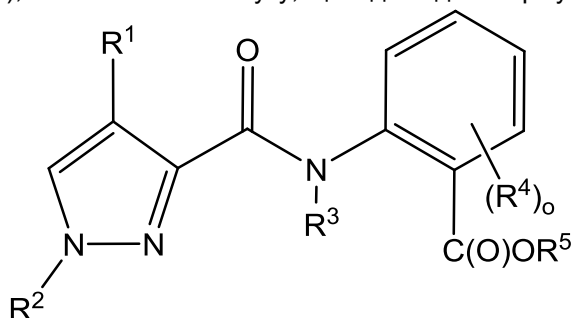
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 мають значення, визначені в параграфі 14; і

о являє собою 0-2.

16. Композиція згідно з параграфом 15, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (VIb), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (VIIb):

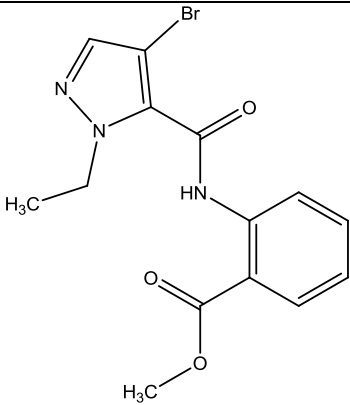
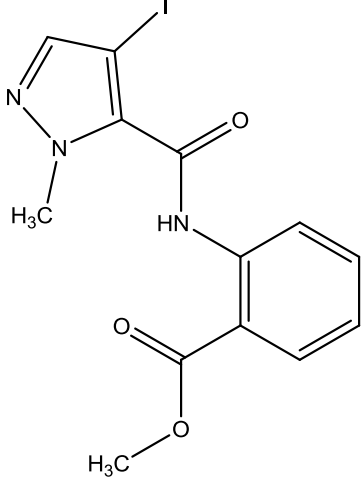
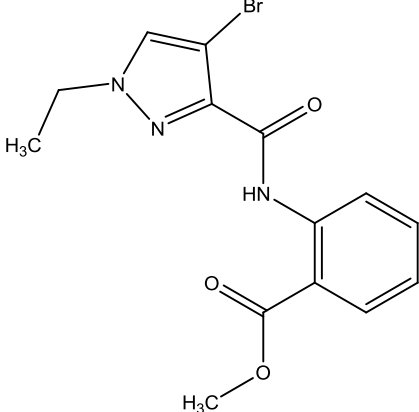


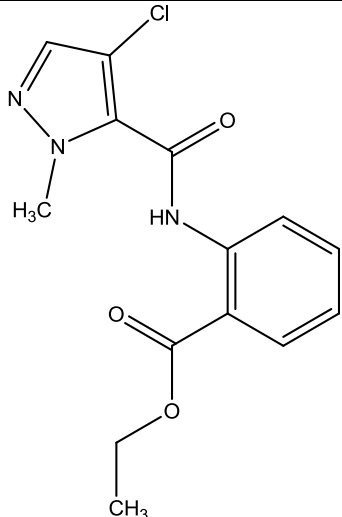
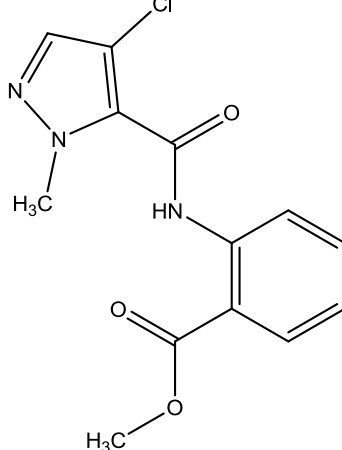
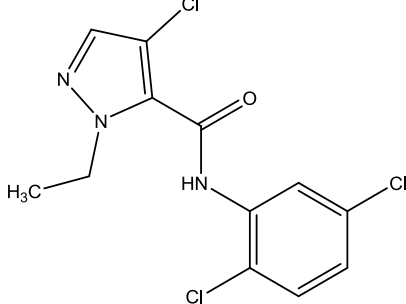
Формула (VIIb);

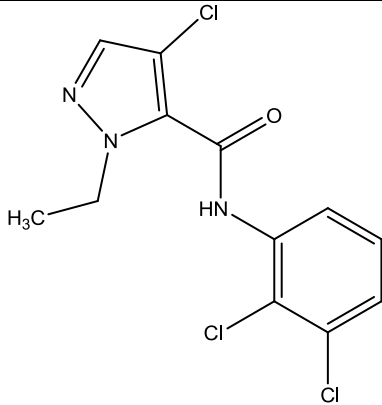
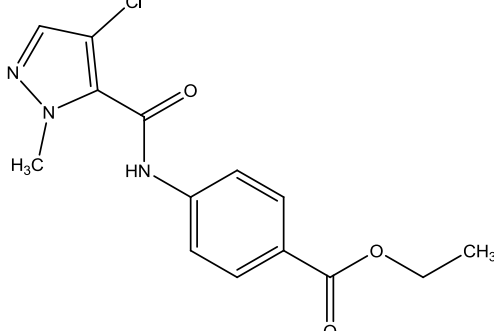
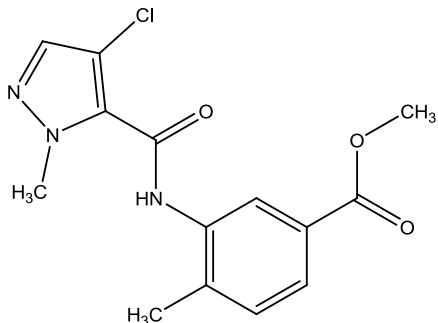
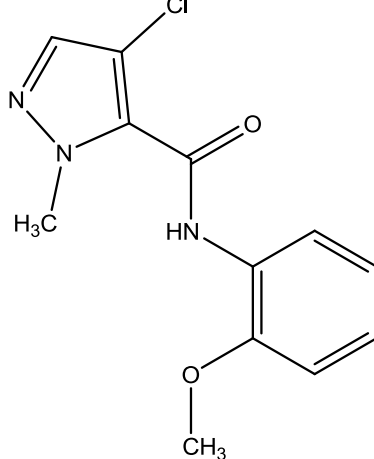
і придатну для споживання в їжу чи біологічно придатну похідну зазначеної сполуки або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

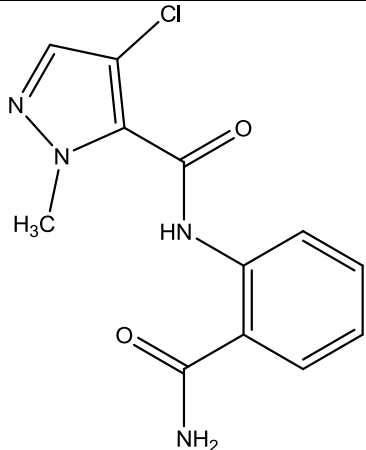
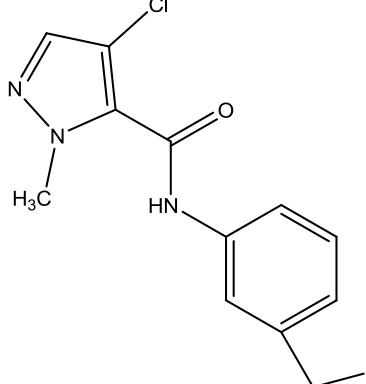
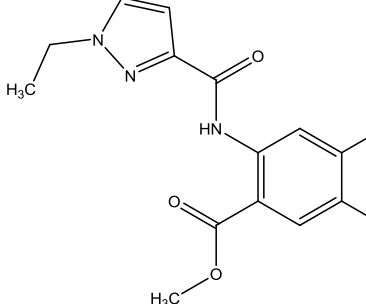
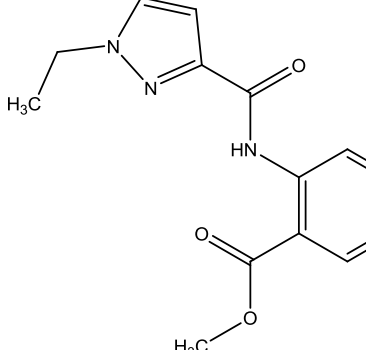
де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 і o мають значення, визначені в параграфі 9.

17. Композиція згідно з параграфом 9, причому зазначена сполука, що відповідає Формулі (IV), обрана з групи, яка складається з наступного:

<p>Сполука 23</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7533235)</p>
<p>Сполука 24</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6741054)</p>
<p>Сполука 25</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7529691)</p>

<p>Сполука 26</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9048753)</p>
<p>Сполука 27</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9052639)</p>
<p>Сполука 28</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7500589)</p>

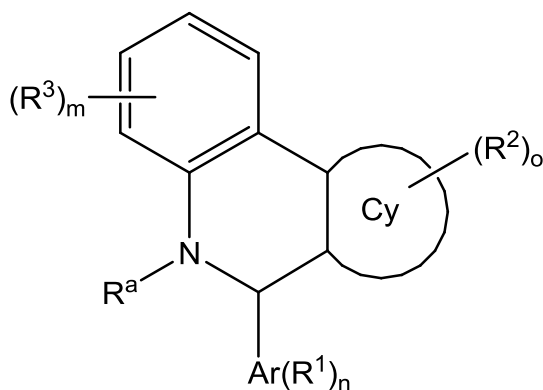
<p>Сполука 29</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7530695)</p>
<p>Сполука 30</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7903488)</p>
<p>Сполука 31</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9052883)</p>
<p>Сполука 32</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9052868)</p>

Сполука 33	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9053364)</p>
Сполука 34	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9054710)</p>
Сполука 35	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9048483)</p>
Сполука 36	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9053578), і</p>

придатна для споживання в їжу чи біологічно придатна похідна зазначеної сполуки або

енантиомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

18. Композиція, яка містить сполуку, що відповідає Формулі (VIII):



5 Формула (VIII);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

10 R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, ази́до, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

20 R^2 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, ази́до, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

30 R^3 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, ази́до, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

45 R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфат, сульфамойл, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

Ar обраний із групи, яка складається з C_{6-10} ари́лу та C_{3-9} гетероари́лу;

Су являє собою 5-7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, причому кожне гетероциклічне кільце містить 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди C_{1-10} алкіламіно, моно C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

m являє собою 1-3;

n являє собою 0-3; i

o являє собою 0-3;

причому зазначена композиція їстівна або здатна зменшувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак.

19. Композиція згідно з параграфом 18, у якій:

R^1 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси та C_{1-6} ацилокси;

R^2 незалежно в кожному випадку являє собою C_{1-6} алкіл;

R^3 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, $C(O)-O-R^4$ і $C(O)-N(R^4)_2$;

R^4 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

Ar обраний із групи, яка складається з C_{6-10} арилу та C_{3-9} гетероарилу;

Су являє собою 5-7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке можливо містить один або два подвійні зв'язки вуглець-вуглець або вуглець-азот усередині кільця;

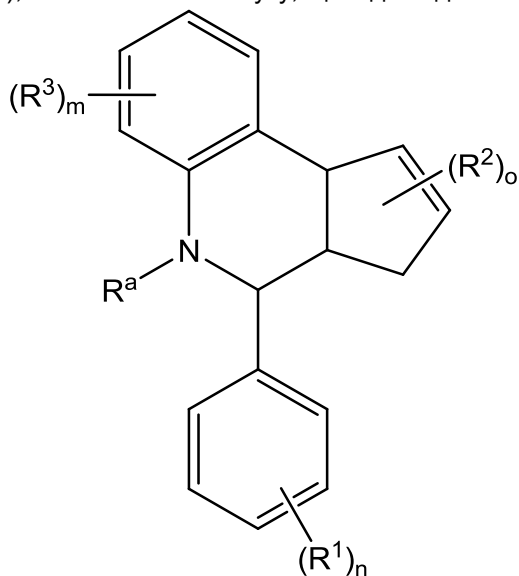
причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить замісники, як описано в параграфі 18;

m являє собою 1-3;

n являє собою 0-3; i

o являє собою 0-3.

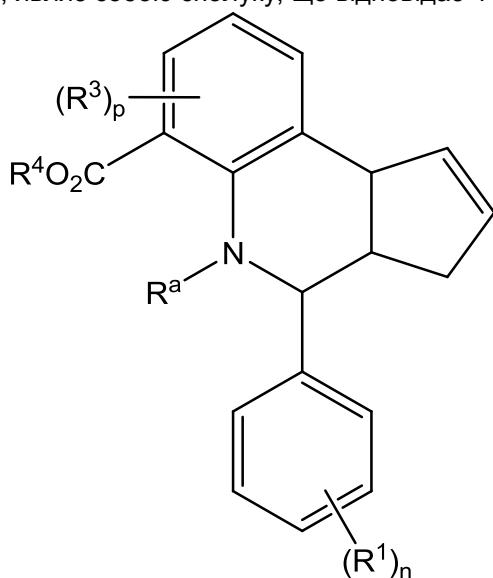
20. Композиція згідно з параграфом 18, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (VIII), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (IX):



Формула (IX);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль, або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^a , m, n і o мають значення, визначені в параграфі 18.

21. Композиція згідно з параграфом 20, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (IX), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (X):



Формула (X);

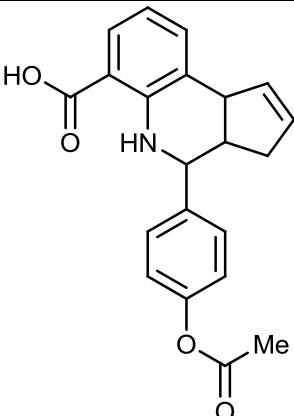
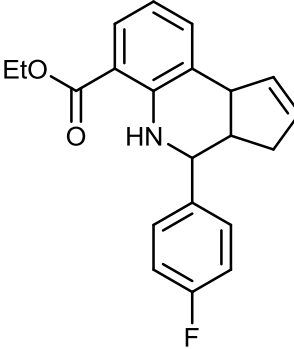
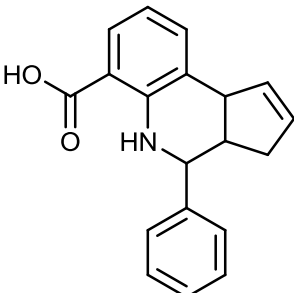
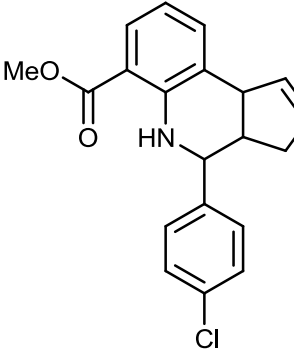
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^3 , R^4 , R^a і n мають значення, визначені в параграфі 20; і

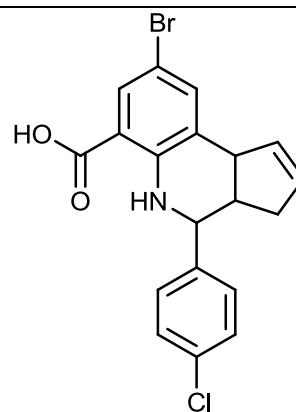
p являє собою 0-2.

22. Композиція згідно з параграфом 18, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (VIII), обрана з групи, що складається з наступного:

Сполука 37	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5846684),</p>
Сполука 38	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6831241),</p>

<p>Сполука 39</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6527982),</p>
<p>Сполука 40</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер Asinex BAS02001668),</p>
<p>Сполука 41</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5580105),</p>
<p>Сполука 42</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6973933),</p>

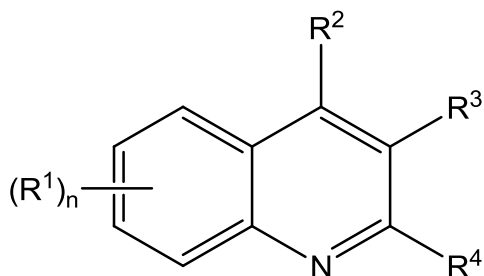
Сполука 43



(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7975872), і

придатні для вживання в їжу чи біологічно придатні похідні зазначеної сполуки.

23. Композиція, яка містить сполуку, що відповідає Формулі (XI):



5

Формула (XI);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

10 R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, C_{1-10} карбама-
 15 C_{1-10} аміно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, ази-
 20 C_{1-10} азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамоіл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

20 R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, Het- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, C_{1-10} карбама-
 25 C_{1-10} аміно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, ази-
 30 C_{1-10} азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамоіл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

35 R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, Het- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, C_{1-10} карбама-
 40 C_{1-10} аміно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, ази-
 45 C_{1-10} азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамоіл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміоїл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно

5 обрані з N, O і S;

R^4 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, Het- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміоїл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно

15 обрані з N, O і S;

або R^3 і R^4 разом із атомами, до яких вони приєднані, утворюють 5-6-членне арильне або гетероарильне кільце, яке можливо містить як замісники від 1 до 4 груп, обраних із групи, що складається з: Het, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміоїл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

Het являє собою C_{1-9} гетероцикліл, який містить 1-4 гетероатоми в кільці, обрані з кисню, сірки й азоту;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та Het незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміоїл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{6-10} арил, C_{1-6} алкіл- C_{6-10} арил, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S; і

n являє собою 0-4;

причому зазначена композиція їстівна або здатна зменшувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак.

24. Композиція згідно з параграфом 23, причому за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, Het- C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, Het- C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

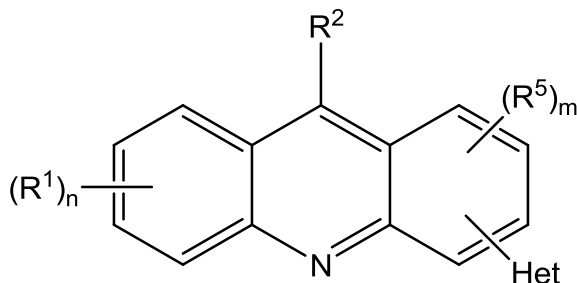
R^4 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, Het- C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

або R^3 і R^4 разом із атомами, до яких вони приєднані, утворюють 5-6-членне арильне кільце, яке можливо містить як замісники від 1 до 4 груп, обраних із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси та Het;

Het являє собою C_{2-6} гетероцикліл, який містить 1-3 гетероатоми в кільці, обрані з кисню, сірки й азоту, і який можливо містить як замісник одну або більше груп, обраних із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6}

алкокси та C_{6-10} арил, який можливо містить як замісник C_{1-6} алкіл;
причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та Het незалежно і незалежно в кожному випадку
можливо додатково містить замісники, визначені в параграфі 23; і
n являє собою 0-4.

25. Композиція згідно з параграфом 23, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі
(XI), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (XIIa):



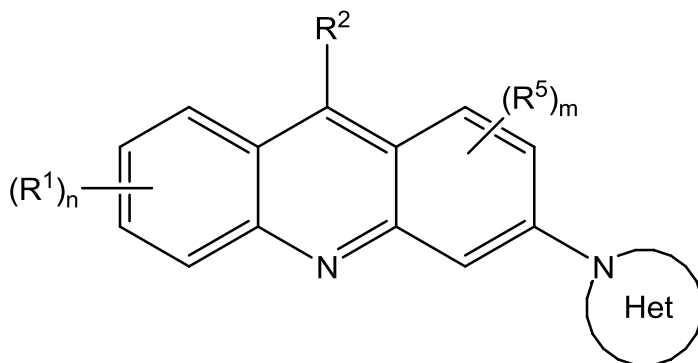
Формула (XIIa);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної
сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,
де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , Het і n мають значення, визначені в параграфі 23;

R^5 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген,
гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси; і
m являє собою 0-3.

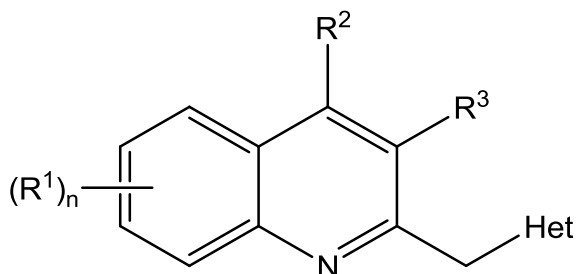
26. Композиція згідно з параграфом 25, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі
(XIIa), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (XIIIa):



Формула (XIIIa);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної
сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають
вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^5 , Het, n і m мають значення, визначені в параграфі
25.

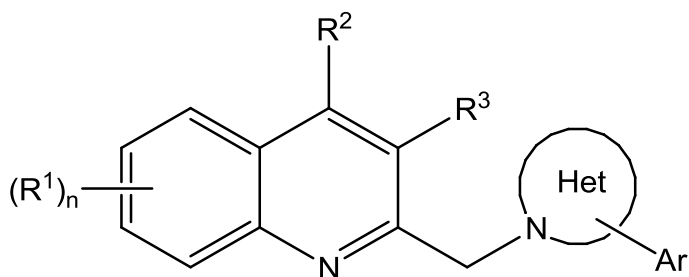
27. Композиція згідно з параграфом 23, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі
(XI), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (XIIb):



Формула (XIIb);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної
сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають
вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , Het і n мають значення, визначені в параграфі 23.

28. Композиція згідно з параграфом 27, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі
(XIIb), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (XIIIb):



Формула (XIIIb);

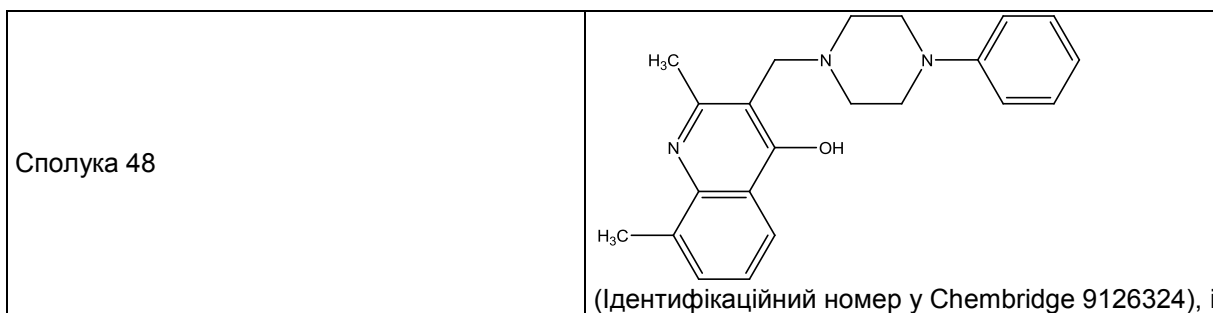
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , R^3 , Het і n мають значення, визначені в параграфі 27; і Ar являє собою C_{6-10} арил, такий як феніл або нафтил, який можливо містить як замісник C_{1-6} алкіл.

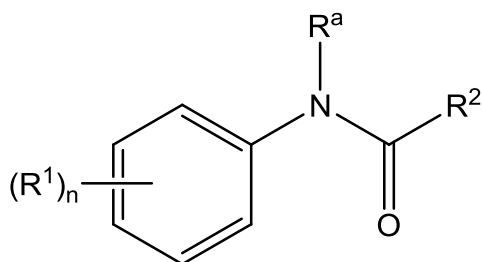
29. Композиція згідно з параграфом 23, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (XI), обрана з групи, що складається з:

Сполука 44	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7728336),</p>
Сполука 45	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7733323),</p>
Сполука 46	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7726077),</p>
Сполука 47	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9149274),</p>



придатні для вживання в їжу чи біологічно придатні похідні зазначеної сполуки.

30. Композиція, яка містить сполуку, що відповідає Формулі (XIV):



5

Формула (XIV);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

10

R^1 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміно, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

20

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, гідроксил, C_{1-10} алкокси, C_{6-10} арилокси, C_{6-10} арилокси- C_{1-10} алкіл, C_{6-10} ариламіно- C_{1-10} алкіл, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкілокси, C_{1-9} гетероарилокси, C_{1-9} гетероарилокси- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероариламіно- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, C_{3-10} карбоцикліл, C_{3-10} карбоциклілокси, C_{3-10} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{3-10} карбоциклілокси- C_{1-6} алкіл, C_{3-10} карбоцикліламіно- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероцикліл, C_{1-9} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероциклілокси- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероцикліламіно- C_{1-6} алкіл, C_{6-10} арил, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероарил і C_{1-9} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

30

R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфоаміно, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

35

причому будь-який із R^1 , R^2 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, C_{6-10} арилокси, C_{6-10} ариламіно, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо,

40

сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміол, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S; і

n являє собою 0-3;

причому зазначена композиція їстівна або здатна зменшувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак.

31. Композиція згідно з параграфом 30, причому за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси та C_{1-6} ацилокси;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкокси-заміщений C_{1-6} алкіл, C_{6-10} арилокси-заміщений C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкіл і $-(CH_2)_mX)_p-Ar$, причому арильні групи в R^2 можливо містять як замісники один або більше з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{1-6} алкокси та C_{1-6} ацилокси;

R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

X обраний із групи, яка складається з наступного: O, NH і CH_2 ;

Ar обраний із групи, яка складається з наступного: C_{6-10} арил, C_{4-9} гетероарил, C_{5-10} карбоцикліл і C_{4-9} гетероцикліл, включаючи сполучені біциклічні групи, причому Ar можливо містить як замісники один або більше з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{1-6} алкокси і C_{1-6} ацилокси;

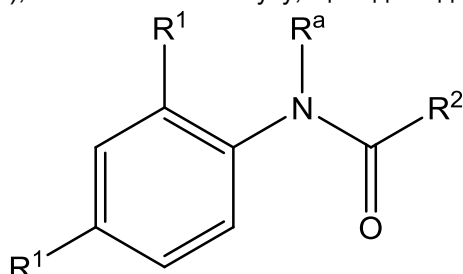
причому будь-який із R^1 , R^2 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо додатково містить замісники, визначені в параграфі 30;

m являє собою 1-3;

n являє собою 0-3; і

p являє собою 0 або 1.

32. Композиція згідно з параграфом 30, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (XIV), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (XVa):



Формула (XVa);

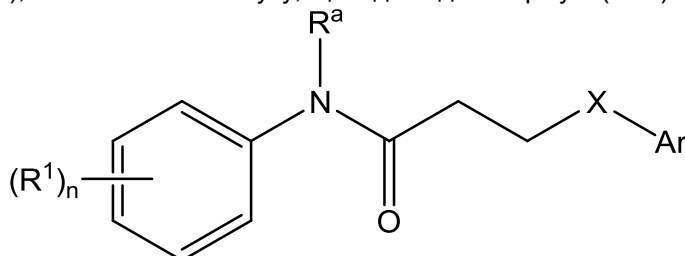
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 і R^a мають значення, визначені в параграфі 30; і

R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил.

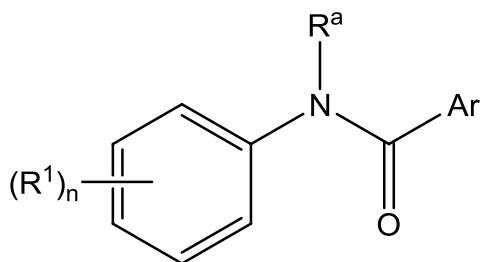
33. Композиція згідно з параграфом 30, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (XIV), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (XVb):



Формула (XVb);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^a , X, Ar і n мають значення, визначені в параграфі 30.

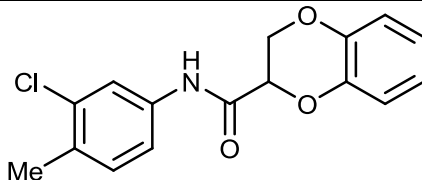
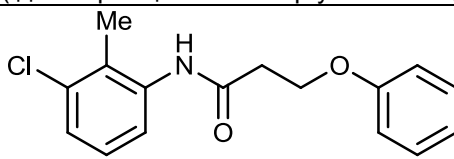
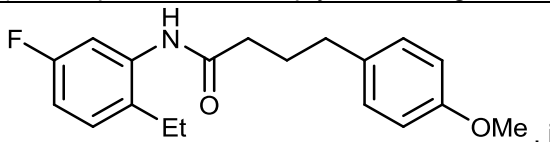
34. Композиція згідно з параграфом 30, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (XIV), являє собою сполуку, що відповідає Формулі (XVc):



5 Формула (XVc); або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^a , Ar і n мають значення, визначені в параграфі 30.

35. Композиція згідно з параграфом 30, причому зазначена сполука, яка відповідає Формулі (XIV), обрана з групи, що складається з наступного:

Сполука 49	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 5838356),
Сполука 50	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6637745),
Сполука 51	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 5837150),
Сполука 52	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7395241),
Сполука 53	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7446463),
Сполука 54	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6048404),
Сполука 55	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6872430),

Сполука 56	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6424175),
Сполука 57	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6050479),
Сполука 58	 OMe, i

придатні для вживання в їжу чи біологічно придатні похідні зазначеної сполуки.

36. Композиція, яка містить:

- 5 (а) сполуку, що відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), описаним у даному тексті, або їхні комбінації, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних у даному тексті, або їхні комбінації; і (b) речовину, що має гіркий смак,

10 причому зазначена композиція є їстівною.

37. Композиція згідно з параграфом 36, причому зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою харчовий продукт.

38. Композиція згідно з параграфом 36, причому зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак.

15 39. Композиція згідно з параграфом 38, причому сіль, що має гіркий смак, являє собою сіль магнію, сіль кальцію або сіль калію.

40. Композиція згідно з параграфом 40, причому калій-вмісна сіль являє собою KCl або лактат калію.

20 41. Композиція згідно з будь-яким із параграфів 1-40, причому зазначена їстівна композиція додатково містить один або більше компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: NaCl, лактат натрію та цукор.

42. Харчовий продукт, який містить композиції за будь-яким із параграфів 1-41.

43. Спосіб приготування їстівної композиції, який включає:

(а) готування придатного для вживання в їжу носія; і

25 (b) додавання до зазначеного прийнятного для вживання в їжу носія (а) сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc) згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук.

30 44. Спосіб згідно з параграфом 43, в якому зазначеному придатному для вживання в їжу носію властивий гіркий смак.

35 45. Спосіб згідно з параграфом 44, в якому зазначений придатний для вживання в їжу носій являє собою сіль, що має гіркий смак.

46. Спосіб згідно з параграфом 45, у якому сіль, що має гіркий смак, являє собою сіль магнію, сіль кальцію або сіль калію.

47. Спосіб згідно з параграфом 46, у якому сіль калію являє собою KCl або лактат калію.

40 48. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 43-47, причому зазначена їстівна композиція додатково містить один або більше компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: NaCl, лактат натрію та цукор.

49. Спосіб згідно з параграфом 43, причому зазначений спосіб додатково включає:

(с) додавання речовини, що має гіркий смак.

50. Спосіб згідно з параграфом 49, причому зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак.

51. Спосіб згідно з параграфом 50, причому сіль, що має гіркий смак, являє собою сіль магнію, сіль кальцію або сіль калію.

52. Спосіб згідно з параграфом 51, у якому сіль калію являє собою KCl або лактат калію.

53. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 49-52, причому зазначена їстівна композиція додатково містить один або більше компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: NaCl, лактат натрію та цукор.

54. Спосіб зниження кількості NaCl у їстівній композиції, який включає:

(а) заміну деякої кількості NaCl, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість KCl; і

(б) додавання до їстівної композиції, отриманої на етапі (а), ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук.

55. Спосіб згідно з параграфом 54, в якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості NaCl, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 25 %.

56. Спосіб згідно з параграфом 54, в якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості NaCl, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 50 %.

57. Спосіб згідно з параграфом 54, в якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості NaCl, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 75 %.

58. Спосіб згідно з параграфом 54, в якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості NaCl, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 100 %.

59. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 54-58, причому їстівна композиція зберігає солоний смак.

60. Спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції, який включає:

(а) заміну деякої кількості лактату натрію, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(б) додавання до їстівної композиції, отриманої на етапі (а), ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук.

61. Спосіб згідно з параграфом 60, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 25 %.

62. Спосіб згідно з параграфом 60, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 50 %.

63. Спосіб згідно з параграфом 60, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 75 %.

64. Спосіб згідно з параграфом 60, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (б), є достатньою для заміни кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 100 %.

65. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 60-64, причому їстівна композиція має такий же строк придатності, що і їстівна композиція, яка містить лактат натрію.

66. Спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції, який включає: (а) заміну деякої кількості цукру, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість Ацесульфаму К; і

(б) додавання до їстівної композиції, отриманої на етапі (а), ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі

(IIIb"), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (Vla), Формулі (Vlb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або

5 комбінацій зазначених сполук.
67. Спосіб згідно з параграфом 66, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для заміни кількості цукру, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 25 %.

68. Спосіб згідно з параграфом 66, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для заміни кількості цукру, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 10 50 %.

69. Спосіб згідно з параграфом 66, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для заміни кількості цукру, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 75 %.

15 70. Спосіб згідно з параграфом 66, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для заміни кількості цукру, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 100 %.

71. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 66-70, причому їстівна композиція зберігає солодкий смак.

20 72. Спосіб зниження споживання натрію суб'єктом, причому зазначений спосіб включає: (a) заміну деякої кількості солі натрію, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість солі калію; i

(b) додавання до їстівної композиції, отриманої на етапі (a), ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb"), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (Vla), Формулі (Vlb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук.

30 73. Спосіб згідно з параграфом 72, причому сіль натрію являє собою NaCl, а сіль калію являє собою KCl.

74. Спосіб згідно з параграфом 72, причому сіль натрію являє собою лактат натрію, а сіль калію являє собою лактат калію.

35 75. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 72-74, причому зазначений спосіб додатково включає (c) ідентифікацію суб'єкта, що потребує застосування даного способу.

76. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 72-75, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання натрію на величину до 25 % шляхом заміни на калій.

40 77. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 72-75, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання натрію на величину до 50 % шляхом заміни на калій.

78. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 72-75, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання натрію на величину до 75 % шляхом заміни на калій.

45 79. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 72-75, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання натрію на величину до 100 % шляхом заміни на калій.

80. Спосіб зниження споживання цукру суб'єктом, причому зазначений спосіб включає: (a) заміну деякої кількості цукру, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість Ацесульфаму К; i

(b) додавання до їстівної композиції, отриманої на етапі (a), ефективної кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb"), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (Vla), Формулі (Vlb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук.

81. Спосіб згідно з параграфом 80, причому зазначений спосіб додатково включає (c) ідентифікацію суб'єкта, що потребує застосування даного способу.

60 82. Спосіб згідно з параграфом 80 або 81, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі

(b), є достатньою для зниження споживання цукру на величину до 25 % шляхом заміни на Ацесульфам К.

83. Спосіб згідно з параграфом 80 або 81, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання цукру на величину до 50 % шляхом заміни на Ацесульфам К.

84. Спосіб згідно з параграфом 80 або 81, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання цукру на величину до 75 % шляхом заміни на Ацесульфам К.

85. Спосіб згідно з параграфом 80 або 81, у якому кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для зниження споживання цукру на величину до 100 % шляхом заміни на Ацесульфам К.

86. Спосіб зменшення гіркого смаку, пов'язаного з речовиною, що має гіркий смак, у їстівній композиції, який включає:

(а) додавання ефективною кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (Vlb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук до їстівної композиції, що забезпечує зниження будь-якого гіркого смаку, викликаного речовиною, що має гіркий смак.

87. Спосіб зменшення гіркого смаку, пов'язаного з речовиною, що має гіркий смак, у їстівній композиції, який включає:

(а) приймання внутрішньо ефективною кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (Vlb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук разом із їстівною композицією, що забезпечує зниження будь-якого гіркого смаку, викликаного речовиною, що має гіркий смак.

88. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 43-87 або 89-98, причому їстівна композиція являє собою харчовий продукт, споживчий продукт або фармацевтичну композицію.

89. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 86-88, який відрізняється тим, що гіркий смак знижується на величину до 25 %.

90. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 86-88, який відрізняється тим, що гіркий смак знижується на величину до 50 %.

91. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 86-88, який відрізняється тим, що гіркий смак знижується на величину до 75 %.

92. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 86-88, який відрізняється тим, що гіркий смак знижується на величину до 100 %.

93. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 86-92, причому зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак.

94. Спосіб згідно з параграфом 93, причому сіль, що має гіркий смак, являє собою сіль магнію, сіль кальцію або сіль калію.

95. Спосіб згідно з параграфом 94, який відрізняється тим, що сіль калію являє собою KCl або лактат калію.

96. Спосіб згідно з будь-яким із параграфів 86-95, причому зазначена їстівна композиція додатково містить NaCl, сульфат натрію або цукор.

97. Спосіб консервації їстівної композиції, який включає:

(а) готування їстівної композиції; і

(b) змішування з їстівною композицією, отриманою на етапі (а), лактату калію та сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (Vlb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук.

98. Спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції й одночасно консервації зазначеної їстівної композиції, причому зазначений спосіб включає:

(a) заміну деякої кількості лактату натрію, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість лактату калію; і

(b) додавання до їстівної композиції, отриманої на етапі (a), ефективною кількості сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук.

99. Спосіб придушення, зниження або усунення гіркої смаку у суб'єкта, який включає:

(a) поміщення сполуки, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінацій таких сполук, або будь-якої зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінацій зазначених сполук до порожнини рота суб'єкта.

100. Спосіб згідно з параграфом 99, який відрізняється тим, що гіркий смак обумовлений сіллю, що має гіркий смак.

101. Спосіб згідно з параграфом 100, який відрізняється тим, що гіркий смак обумовлений сіллю магнію, сіллю кальцію або сіллю калію.

102. Спосіб згідно з параграфом 101, який відрізняється тим, що гіркий смак обумовлений KCl або лактатом калію.

103. Фармацевтична композиція, яка містить:

(a) активний фармацевтичний інгредієнт, що має гіркий смак; і

(b) сполуку, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінації таких сполук, або будь-яку зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук.

104. Фармацевтична композиція, яка містить:

(a) активний фармацевтичний інгредієнт;

(b) речовину, що має гіркий смак; і

(c) сполуку, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінації таких сполук, або будь-яку зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук.

105. Споживчий продукт, який містить:

(a) інгредієнт, що має гіркий смак; і

(b) сполуку, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінації таких сполук, або будь-яку зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук.

106. Споживчий продукт для зниження гіркої смаку речовини, яка має гіркий смак, причому зазначений споживчий продукт містить:

(a) сполуку, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінації таких сполук, або будь-яку зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук.

107. Спосіб інгібування рецептора гіркої смаку, який включає:

(a) здійснення контакту рецептора гіркої смаку зі сполукою, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінації таких сполук, або будь-яку зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінації зазначених сполук.

(XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінаціями таких сполук, або будь-якою зі сполук 1-58 згідно з даним описом, або комбінаціями зазначених сполук.

108. Спосіб згідно з параграфом 107, який відрізняється тим, що рецептор гіркого смаку знаходиться в ротовій порожнині суб'єкта.

109. Спосіб згідно з параграфом 107, який відрізняється тим, що рецептор гіркого смаку знаходиться в шлунково-кишковому тракті суб'єкта.

110. Спосіб згідно з параграфом 107, який відрізняється тим, що рецептор гіркого смаку знаходиться в тест-системі для аналізу *in vitro*.

10 Короткий опис графічних матеріалів

[0068] На Фігурах 1A-L представлені приклади даних для експериментів за смаком розчину та харчового продукту для композицій, які містять сполуки Формули (I) згідно з даним винаходом.

15 [0069] На Фігурах 2A-H представлені приклади даних для експериментів за смаком розчину та харчового продукту для композицій, які містять сполуки Формули (IV) згідно з даним винаходом.

[0070] На Фігурах 3A-D представлені приклади даних для експериментів за смаком розчину та харчового продукту для композицій, які містять сполуки Формули (VIII) згідно з даним винаходом.

20 [0071] На Фігурах 4A-C представлені приклади даних для експериментів за смаком розчину та харчового продукту для композицій, які містять сполуки Формули (XI) згідно з даним винаходом.

[0072] На Фігурах 5A-E представлені приклади даних для експериментів за смаком розчину та харчового продукту для композицій, які містять сполуки Формули (XIV) згідно з даним винаходом.

25 Докладний опис винаходу

[0073] Для забезпечення повного розуміння розкритого в даній заявці винаходу нижче наведений докладний опис винаходу.

30 [0074] Якщо не визначено інакше, технічні та наукові терміни, які використовуються в даній заявці, мають такі значення, як їх зазвичай розуміють середні фахівці в даній області. Хоча для реалізації винаходу або здійснення досліджень можна використовувати матеріали та методи, аналогічні або еквівалентні описаним, підходящі матеріали та методи описані нижче. Усі публікації, патенти та інші документи, що згадуються в даному тексті, включені до нього повністю за допомогою посилання.

35 [0075] У даному описі термін "містити" (включати) або такі варіанти, як "містить" або "який містить", мають на увазі включення зазначеного цілого об'єкта або групи об'єктів, але не припускає виключення інших об'єктів або груп об'єктів.

40 [0076] Термін "ацил" відноситься до замісників – алкілкарбонілу, алкенілкарбонілу, алкінілкарбонілу або арилкарбонілу, в яких зазначені алкіл, алкеніл, алкініл або арил можуть містити замісники. Приклади замісників-ацилів включають, але не обмежені перерахованими: ацетил, пропіоніл, бутирил і бензоїл.

45 [0077] Термін "ацилокси" відноситься до замісника виду -O-C(O)R, причому R являє собою алкіл, алкеніл, алкініл або арил, і при цьому зазначений алкіл, алкеніл, алкініл або арил може містити замісники. Приклади ацилокси-груп включають, але не обмежені перерахованими: пропаноїлокси, бутаноїлокси, пентаноїлокси та бензилокси.

50 [0078] Термін "аліфатичний" відноситься до прямого або розгалуженого ланцюга вуглеводнів, які повністю насичені або які містять одну чи більше одиниць ненасиченості. Наприклад, аліфатичні групи включають заміщену або незаміщену лінійну або розгалужену алкільну, алкенільну та алкінільну групи. Якщо не зазначено інше, термін "аліфатичний" включає як заміщені, так і незаміщені вуглеводні.

[0079] Терміни "алкіламід", "алкеніламід" і "алкініламід" відносяться до амідів структур алкіл-NR-C(=O)-алкеніл-NR-C(=O)- і алкініл-NR-C(=O)-, де R може бути визначений окремо або R також є алкілом, алкенілом або алкінілом.

55 [0080] Термін "алкокси" відноситься до O-алкіл замісника, в якому алкільна частина може бути заміщена. Приклади алкокси замісників включають, але не обмежуються наступними сполуками: метокси, етокси, n-пропокси, ізопропокси та n-бутокси. Також явно включені до об'єму терміну "алкокси" O-алкеніл або O-алкініл групи. У всіх випадках алкільні, алкенові та алкінові частини опціонально можуть бути заміщені.

60 [0081] Термін "алкіл" відноситься як до прямого, так і до розгалуженого насиченого ланцюга, який містить, наприклад, 1-3, 1-6, 1-9 або 1-12 атомів вуглецю. Алкільна група опціонально може

бути заміщена.

[0082] Термін "алкілтіо" відноситься до S-алкіл замісника, в якому алкільна частина може бути заміщена. Приклади алкілтіо замісників включають, але не обмежуються наступними сполуками: метилтіо, етилтіо та ізопропілтіо. Також явно включені до об'єму терміну "алкілтіо"

S-алкеніл або S-алкініл групи. У всіх випадках алкільні, алкенові та алкінові частини опціонально можуть бути заміщені.

[0083] Термін "алкеніл" відноситься до прямого або розгалуженого насиченого ланцюга, який містить, наприклад, 2-3, 2-6, 2-9 або 2-12 атомів вуглецю і принаймні один вуглець-вуглецевий подвійний зв'язок. Алкенільна група опціонально може бути заміщена.

[0084] Термін "алкініл" відноситься до прямого або розгалуженого насиченого ланцюга, який містить, наприклад, 2-3, 2-6, 2-9 або 2-12 атомів вуглецю і принаймні один вуглець-вуглецевий потрійний зв'язок. Алкінільна група опціонально може бути заміщена.

[0085] Термін "аралкіл" відноситься до алкіл групи, заміщеної арилом. Також алкеніл або алкініл групи, заміщені арилом, явно включені до об'єму терміну "аралкіл". Приклади аралкіл групи включають бензил і фенетил. Аралкільна група опціонально може бути заміщена.

[0086] Терміни "штучний підсолоджувач" і "замінник цукру" відносяться до харчової добавки, яка надає солодкий смак, але має менше калорій енергії, ніж цукор. У деяких випадках калорійність енергії "штучного підсолоджувача" або "замінника цукру" є незначною.

[0087] Термін "арил" відноситься до моноциклічних або поліциклічних ароматичних вуглецевих кільцевих систем із кількістю членів від п'яти до чотирнадцяти. Приклади арильних груп включають, але не обмежуються наступними сполуками: феніл (Ph), 1-нафтил, 2-нафтил, 1-антрацил і 2-антрацил. Арильна група опціонально може бути заміщена.

[0088] Термін "арилалкокси" відноситься до групи, яка має структуру -O-R-Ag, де R є алкілом і Ag являє собою ароматичний замісник. Також явно включені до об'єму терміну "арилалкокси" -

O-R-Ag групи, де R є алкенілом або алкінілом. У всіх випадках алкільні, алкенові, алкінові та арильні частини опціонально можуть бути заміщені.

[0089] Термін "гіркий" або "гіркий смак", який використовується тут, відноситься до сприйняття або смакових відчуттів у результаті виявлення гіркої смакової речовини. Наступні атрибути можуть супроводжувати гіркий смак: в'язкий, гірко-в'язкий, металевий, гірко-металевий, а також присмаки, післясмаки та небажані смаки, включаючи, але не обмежуючись морозно-пекучим і картонним смаком, і/або будь-якою їх комбінацією. Помічено, що в даній області термін "присмак" часто є синонімом "гіркого смаку". Не обмежуючись теорією, розмаїтість гірких смаків може відображати велика кількість рецепторів гіркого смаку й диференціальне виявлення гірких смакових речовин цими рецепторами. Гіркий смак у значенні, яке використовується тут, включає активацію рецепторів гіркого смаку гіркою смаковою речовиною. Гіркий смак у значенні, яке використовується тут, також включає активацію рецепторів гіркого смаку гіркою смаковою речовиною з наступною передачею спадного сигналу. Гіркий смак у значенні, яке використовується тут, також включає активацію сигнального шляху після стимуляції гіркою смаковою речовиною. Гіркий смак у значенні, яке використовується тут, додатково включає сприйняття в результаті сигналізації після виявлення гіркої смакової речовини рецептором гіркого смаку. Гіркий смак у значенні, яке використовується тут, додатково включає сприйняття в результаті сигналізації після контакту рецептора гіркого смаку з гіркою смаковою речовиною. Гіркий смак може бути сприйнятий мозком.

[0090] Термін "рецептор гіркого смаку" відноситься до рецептора, як правило, клітинного поверхневого рецептора, з яким може бути пов'язана гірка смакова речовина. Рецептори гіркого смаку можуть бути присутніми в порожнині рота і/або в усьому шлунково-кишковому тракті, включаючи шлунок, кишечник і товсту кишку. Рецептори гіркого смаку можуть також бути присутніми в пробірці, наприклад, в аналізі, включаючи, але не обмежуючись клітинним аналізом або аналізом зв'язування.

[0091] Термін "гірка смакова речовина", "гіркий ліганд" або "сполука, що має гіркий смак" відноситься до сполуки, яка активує або яка може бути виявлена рецептором гіркого смаку і/або дає суб'єктові сприйняття гіркого смаку. "Гірка смакова речовина" також відноситься до множини сполук, які поєднуються, щоб активувати або бути виявленими рецептором гіркого смаку, і/або дають суб'єктові сприйняття гіркого смаку. "Гірка смакова речовина" надалі відноситься до сполуки, яка ферментативно змінюється при прийманні внутрішньо суб'єктом, що забезпечує активацію або виявлення рецептором гіркого смаку і/або дає суб'єктові сприйняття гіркого смаку. Через те, що сприйняття гіркого смаку може варіюватися від людини до людини, деякі люди можуть описати "гірку смакову речовину" як сполуку, що надає іншого роду гіркий смак у порівнянні з гірким смаком, який сприймається іншими людьми від тої ж сполуки. Термін гірка смакова речовина також відноситься до сполуки, що дає гіркий смак. Фахівець у даній області

може легко визначити і зрозуміти, що мається на увазі під гіркою смаковою речовиною. Необмежуючі приклади гірких смакових речовин або речовин, у тому числі харчових продуктів, які містять речовину, що має гіркий смак, включають: гірку каву, несолодке какао, мармелад, гірку диню, пиво, гіркі настойки, шкірку цитрусових, зелень кульбаби, ескаріоль, хінін, солі магнію, солі кальцію, солі калію, хлорид калію, лактат калію, Ацесульфам К, брюссельську капусту, спаржу, гіркий гарбуз, дикий огірок, селеру, хміль, кольрабі, зелень редису, женьшень, гарбуз, зелень, капусту, спартеїн, кофеїн, атропін, нікотин, сечовину та стрихнін.

[0092] Інші приклади гірких смакових речовин включають лікарські засоби. Необмежуючі приклади лікарських засобів як гірких смакових речовин включають ацетамінофен, ампіцилін, азитроміцин, хлорфенірамін, циметидин, декстрометорфан, димедрол, еритроміцин, ібупрофен, пеніцилін, фенілбутазон, псевдоефідрин, ранітидин, спіронолактон і теофілін, усі з яких були пов'язані з гірким смаком.

[0093] Термін "карбоцикліл" або "карбоциклічний" відноситься до моноциклічних або поліциклічних неароматичних вуглецевих кільцевих систем, які можуть містити певне число атомів вуглецю, переважно від 3 до 12 атомів вуглецю, які повністю насичені або які містять одну або більше одиниць ненасиченості. Карбоциклічна кільцева система може бути моноциклічною, біциклічною або трициклічною. Карбоциклічне кільце може бути злите з іншим кільцем, таким як арильне кільце або інше карбоциклічне кільце. Приклади карбоциклічних кілець можуть включати циклогексил, циклопентил, циклобутил, циклопропіл, циклогексеніл, циклопентеніл, інданіл, тетрагідронафтил тощо. Термін "карбоциклічний" або "карбоцикліл", насичений або ненасичений, також відноситься до кілець, які опціонально заміщені, якщо не зазначено. Термін "карбоциклічний" або "карбоцикліл" також включає гібриди аліфатичних і карбоциклічних груп, такі як (циклоалкіл) алкіл, (циклоалкеніл) алкіл і (циклоалкіл) алкеніл.

[0094] Термін "їстівні або біологічно прийнятні солі" відноситься до будь-якої їстівної або біологічно прийнятної солі, ефіру або солі такого ефіру, сполуки даного винаходу, яка при прийманні внутрішньо здатна давати (прямо або непрямо) сполуку даного винаходу або метаболіт, залишок чи його частину, які характеризуються здатністю знижувати сприйняття гіркого смаку гіркої смакової речовини. Крім того, термін "їстівна або біологічно прийнятна похідна сполуки" відноситься до будь-якої їстівної або біологічно прийнятної похідної сполуки даного винаходу, яка при прийманні внутрішньо здатна давати (прямо або непрямо) сполуку даного винаходу або метаболіт, залишок чи його частину, які характеризуються здатністю знижувати сприйняття гіркого смаку гіркої смакової речовини. "Їстівний продукт" є продуктом, підходящим для перорального застосування, такого як їжа або пиття. Таким чином, їстівні сполуки являють собою придатні до їжі сполуки.

[0095] Термін "споживчий продукт" відноситься до продуктів для здоров'я та краси для особистого користування і/або споживання суб'єктом. Споживчі продукти можуть бути представлені в будь-якій формі, включаючи, але не обмежуючись наступними продуктами: рідини, тверді, напівтверді речовини, таблетки, капсули, пастилки, смужки, порошки, гелі, смоли, пасти, суспензії, сиропи, аерозолі та спреї. Необмежуючі приклади споживчих товарів включають нутрицевтики, харчові добавки, помади, бальзами для губ, мило, шампуні, жувальні гумки, клеї (наприклад, стоматологічні клеї), зубні пасти, оральні анальгетики, освіжувачі подиху, рідини для полоскання рота, зубні відбілювачі та інші засоби для чищення зубів.

[0096] Термін "дієта" колективно відноситься до харчової продукції і/або напоїв, які споживає суб'єкт. "Дієта" суб'єкта також включає будь-які споживчі продукти або фармацевтичні композиції, які суб'єкт споживає.

[0097] Термін "їстівна композиція" відноситься до композиції, придатної для споживання, як правило, через порожнину рота (хоча споживання може відбутися через неоральні засоби, такі як інгаляції). Їстівні композиції можуть бути представлені в будь-якій формі, включаючи, але не обмежуючись наступними формами: рідини, тверді, напівтверді речовини, таблетки, пастилки, порошки, гелі, смоли, пасти, суспензії, сиропи, аерозолі та спреї. Як використовується тут, їстівні композиції включають харчові продукти, фармацевтичні композиції, а також споживчі продукти. Термін їстівні композиції також відноситься, наприклад, до дієтичних і харчових добавок. Як використовується тут, їстівні композиції також включають композиції, які знаходяться в порожнині рота, але не ковтаються, в тому числі професійні стоматологічні продукти, такі як препарати для лікування зубів, заповнювачі, пакувальні матеріали, стоматологічні матриці та поліролі. Термін "придатний до їжі" посилається на аналогічні композиції й зазвичай використовується як синонім терміна "їстівний".

[0098] Термін "ефективна кількість" відноситься до кількості, достатньої для одержання необхідної властивості або результату. Наприклад, ефективна кількість сполуки даного винаходу являє собою кількість, здатну знизити сприйняття гіркого смаку, пов'язаного з гіркою

смаковою речовиною. Термін "ефективна кількість" сполуки згідно з даним винаходом також відноситься до кількості, яка при додаванні до харчової композиції знижує гіркий смак, наприклад, замітника NaCl, дозволяючи тим самим підтримувати сприйняття бажаного солоного смаку згаданої харчової композиції. Термін "ефективна кількість сполуки" також відноситься до

5 кількості, яка при додаванні до харчової композиції дозволяє досягти збереження харчових продуктів, знижуючи або усуваючи гіркий смак, пов'язаний із гіркою смаковою речовиною в консерванті. Термін "ефективна кількість" відноситься також до кількості сполуки даного винаходу, здатної зменшити або усунути сприйняття гіркого смаку та післясмаку, пов'язаного або з гіркою смаковою речовиною в харчовому продукті, або з первинно гірким продуктом харчування.

[0099] Термін "модифікатор смаку" відноситься до сполуки або суміші сполук, які при додаванні до харчової композиції, такої як харчовий продукт, модифікують (наприклад, маскують, усувають, знижують, зменшують або підсилюють сприйняття) смак (наприклад, солодкий, солоний, білковий, кислий або гіркий смак), присутній у харчовій композиції.

15 [0100] Термін "харчовий продукт" відноситься до будь-якої композиції, яка містить один або декілька оброблених продуктів харчування. Харчові продукти включають, але не обмежуються наступними продуктами: кондитерські вироби, хлібобулочні вироби (включаючи, але не обмежуючись наступними: тісто, хліб, тістечка, бісквіти, крекери, випічка, пироги, торти, пироги із заварним кремом і печиво), морозиво (включаючи, але не обмежуючись наступними: імпульс-

20 морозиво, морозиво для того, щоб їсти вдома, заморожений йогурт, морозиво, сорбет, щербет і морозиво на основі сої, вівса, бобових і рису), молочні продукти (включаючи, але не обмежуючись наступними: питне молоко, сир, йогурт і кисломолочні напої), сири (включаючи, але не обмежуючись наступними: натуральні сири та плавлені сири), вершкове масло, маргарин, солодкі та солоні закуски (включаючи, але не обмежуючись наступними: фруктові закуски, чіпси, кукурудзяні чіпси, попкорн, кренделі, цукерки та горіхи), гарячі та холодні напої (включаючи, але не обмежуючись наступними: напої, коктейлі, концентрати, соки, газовані напої, негазовані напої, алкогольні напої, безалкогольні напої, спортивні напої, ізотонічні напої, кава, чай, мінеральна вода та напої, приготовлені з рослинної сировини та рослинних екстрактів (у тому числі холодні напої, які готуються з рослинними або грибними екстрактами як

30 інгредієнтами, і напої, які готуються по-різному, наприклад, настої, відвари, або за допомогою інших засобів добування чи дистиляції з різних частин рослин, у тому числі, але не обмежуючись наступними частинами: листя, квіти, стебла, плоди, корені, кореневища, стебла, кора, ефірні олії або навіть вся рослина)), закуски (у тому числі, але не обмежуючись наступними: злакові плитки, батончики-мюслі, протеїнові батончики, плити для сніданку, енергетичні батончики та фруктові батончики), продукти-замінники страв, готові страви (включаючи, але не обмежуючись наступними: страви в банках, консервовані страви, заморожені страви, сухі страви, охолоджені страви, суміші для обіду, заморожена піца, охолоджена піца і готові салати), супи (включаючи, але не обмежуючись наступними: бульйоноподібні супи та крем-супи), бульйони, соуси, соєві соуси, м'ясо та риба (у тому числі сире, варене і сушене м'ясо), делікатесні продукти (включаючи, але не обмежуючись наступними: м'ясо та сири, підходящі для нарізання, або попередньо нарізані м'ясо та сири, наприклад, індичка, курка, шинка, ковбаси, салями, пивна ковбаса, капрікола, чорізо, солонина, голландський хліб, серрано, прошуто, сир у голівках, ліверна ковбаса, м'ясний рулет (у тому числі оливковий хлібець, перцевий хлібець, запашний хлібець і хлібець із шинкою та сиром),

45 мортадела, пастроми, пепероні, ростбіф, смажена свинина, сосисони, копчене м'ясо, сирокочена ковбаса, язик, американський сир, сир із пліснявою, сир чеддер, сир Колбі, сир Колбі-Джек, гауда, сир Монтері-Джек, мюнстерський сир моцарела, сир пармезан, сир Джек з перцем, проволоне, Романо сир, волокнистий сир, сирний спрей і швейцарський сир), овочі (включаючи, але не обмежуючись наступними: сирі, солоні, варені та сушені овочі, такі як картопля-фрі), фрукти (у тому числі сирі, варені та сухофрукти), зерна (включаючи, але не обмежуючись наступними: сушені, консервовані або банкові соуси і супи), закуски, макаронні вироби (включаючи, але не обмежуючись наступними: макаронні вироби, охолоджені макарони, заморожені макаронні вироби, сухі макарони), локшина (включаючи, але не обмежуючись наступними: яєчна локшина, локшина пшенична, рисова локшина, локшина бобова, картопляна локшина, локшина гречана, кукурудзяна локшина, кришталева локшина, чоу мейн, фетучіні, фузіллі, галушки, лазанья, лінгвіні вот мейн, макарони, манікотті, тайський Пад, пенне, рамен, рисова вермішель, ріжки, соба, спагетті, пера, удон і Циті), консерви, заморожені продукти, сушені продукти, охолоджені продукти, олії та жири, дитяче харчування, паштети, салати, зернові культури (включаючи, але не обмежуючись наступними: гарячі й холодні злаки), соуси

(включаючи, але не обмежуючись наступними: томатна паста, томатне пюре, бульйонні кубики, м'ясні кубики, столові соуси, соуси на основі сої, паста-соуси, соуси для готування, маринади, сухі соуси, порошкові суміші, кетчупи, майонези, заправки для салатів і вінегретів, гірчиці та підливи), желе, джеми, варення, мед, пудинги, готові суміші, сиропи, глазури, начинки, настояні продукти, сольові консерви, мариновані продукти і приправи (наприклад, кетчуп, гірчиця і стейк-соус). У деяких варіантах реалізації, харчовий продукт являє собою корм для тварин. Наприклад, харчовий продукт може бути харчовим продуктом для свійських тварин, тобто харчовим продуктом для споживання тваринами, які належать домашнім господарствам. У інших варіантах реалізації, харчовий продукт є продуктом для тваринництва, тобто харчовим продуктом для споживання сільськогосподарськими тваринами.

[0101] Термін "харчові продукти" відноситься до необробленого інгредієнта або основної поживної речовини, або смаковмісного елемента, який використовується для приготування харчового продукту. Необмежуючі приклади харчових продуктів включають: фрукти, овочі, м'ясо, рибу, зерно, молоко, яйця, бульби, цукор, підсолоджувачі, олії, трави, закуски, соуси, спеції та солі.

[0102] Термін "гало" або "галоген" відноситься до фторного, хлорного, бромного або йодного замісника.

[0103] Термін "гетероарил" відноситься до моноциклічних або поліциклічних ароматичних кільцевих систем, що мають від п'яти до чотирнадцяти членів і один або більше гетероатомів. Фахівцеві в даній області буде зрозуміло, що максимальна кількість гетероатомів у стабільному, хімічно можливому гетероарильному кільці залежить від розміру кільця і валентної зони. Термін "гетероаралкіл" відноситься до алкільної групи, заміщеної гетероарилом. Також алкеніл або алкініл групи, заміщені гетероарилом, явно включені до об'єму терміну "гетероаралкіл". У загальному випадку кільце гетероарилу може мати від одного до чотирьох гетероатомів. Гетероарил групи включають, без обмеження, 2-фураніл, 3-фураніл, N-імідазоліл, 2-імідазоліл, 4-імідазоліл, 5-імідазоліл, 3-ізоксазоліл, 4-ізоксазоліл, 5-ізоксазоліл, 2-оксадіазоліл, 5-оксадіазоліл, 2-оксазоліл, 4-оксазоліл, 5-оксазоліл, 2-піроліл, 3-піроліл, 2-піридил, 3-піридил, 4-піридил, 2-піримідил, 4-піримідил, 5-піримідил, 3-піридазиніл, 2-тіазоліл, 4-тіазоліл, 5-тіазоліл, 5-тетразоліл, 2-тріазоліл, 5-тріазоліл, 2-тієніл і 3-тієніл. Термін "гетероарильне кільце", "гетероарильна група" або "гетероаралкіл" також відноситься до кілець, які опціонально заміщені. Приклади злитих поліциклічних гетероарильних і арильних кільцевих систем, у яких карбоциклічне ароматичне кільце або гетероарильне кільце зливається з одним або декількома іншими кільцями, включають: тетрагідронафтил, бензімідазоліл, бензотієніл, бензофураніл, індоліл, хінолініл, бензотіазоліл, бензоксазоліл, бензімідазоліл, ізохінолініл, ізоіндоліл, акридиніл, бензоізоксазоліл тощо.

[0104] Термін "гетероциклічний" або "гетероцикліл" відноситься до неароматичних насичених або ненасичених моноциклічних або поліциклічних кільцевих систем, що містять один або більше гетероатомів, і з розміром кілець від трьох до чотирнадцяти. Фахівцеві в даній області буде зрозуміло, що максимальна кількість гетероатомів у стабільному, хімічно можливому гетероциклічному кільці визначається розміром кільця, ступенем ненасиченості й валентною зоною. У загальному випадку, гетероциклічне кільце може мати від одного до чотирьох гетероатомів доти, доки гетероциклічне кільце є хімічно можливим та стабільним і може бути злите з іншим кільцем, наприклад, карбоциклічним, арильним або гетероарильним кільцем, або з іншим гетероциклічним кільцем. Гетероциклічна кільцева система може бути моноциклічною, біциклічною або трициклічною. Також у рамках терміну "гетероциклічний" або "гетероцикліл", який використовується тут, існує група, в якій одне або більше карбоциклічних кілець злиті з гетероарилом. Приклади гетероциклічних кілець включають, але не обмежуються наступними сполуками: 3-1H-бензімідазол-2-он, 3-1H-алкіл-бензімідазол-2-он, 2-тетрагідрофураніл, 3-тетрагідрофураніл, 2-тетрагідротіофеніл, 3-тетрагідротіофеніл, 2-морфоліно, 3-морфоліно, 4-морфоліно, 2-тіоморфоліно, 3-тіоморфоліно, 4-тіоморфоліно, 1-піролідиніл, 2-піролідиніл, 3-піролідиніл, 1-піперазиніл, 2-піперазиніл, 1-піперидиніл, 2-піперидиніл, 3-піперидиніл, 4-піперидиніл, 4-тіазолідиніл, діазолоніл, N-заміщений діазолоніл, 1-фталімідиніл, бензоксан, бензотріазол-1-іл, бензопіролідин, бензопіперидин, бензоксолан, бензотіолан, бензотіан, азіраніл, оксираніл, азетидиніл, піролініл, діоксоланіл, імідазолініл, імідазолідиніл, піразолініл, піразолідиніл, піраніл, діоксаніл, дитіаніл, тритіаніл, хінуклідиніл, оксепаніл, сукцинімідил і тієпаніл.

[0105] Термін "ізопрен" (також відомий як "ізотерпен") відноситься до 2-метил-1,3-бутадієну і представлений формулою $\text{CH}_2=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$.

[0106] Термін "частин на мільйон" і "проміле" використовуються в харчовій промисловості для позначення низької концентрації розчину. Наприклад, один грам розчиненої речовини в

1000 мл розчинника має концентрацію 1000 частин на мільйон, а одна тисячна грама (0,001 г), розчиненого в 1000 мл розчинника, має концентрацію один проміле. Відповідно, концентрація один міліграм на літр (тобто 1 мг/л) дорівнює 1 проміле.

[0107] Термін "сприйняття гіркого смаку", "сприйняття солоності", "сприйняття смаку" і подібні терміни відносяться до усвідомлення суб'єктом певного смаку і аромату.

[0108] Термін "фармацевтично активний інгредієнт" відноситься до сполуки у фармацевтичній композиції, яка є біологічно активною.

[0109] Термін "солі калію" відноситься до солей, у яких катіон є калієм. Солі калію в контексті даного винаходу переважно є їстівними калійними солями, включаючи, але не обмежуючись наступними: ацесульфам К (Ace K), алюмосульфат калію, дикалію гуанілат, дикалію інозинат, монокалію глутамат, ацетат калію, кислий калію тартат, кислий калію тартрат, калію адипат, альгінат калію, алюмосилікат калію, калію аскорбат, калію аспартат, бензоат калію, калію бікарбонат, бісульфат калію, калію бісульфіт, бромат калію, карбонат калію, хлорид калію, цитрат калію, калію дигідроцитрат, калію дигідрофосфат, фероціанід калію, калію фумарат, калію гіберелат, калію глюконат, калію гідросульфат, йодид калію, лактат калію, калію малат, метабісульфіт калію, нітрат калію, нітрит калію, персульфат калію, фосфат калію (двоосновний), фосфат калію (одноосновний), фосфат калію (трьохосновний), калію поліметафосфат, калію поліфосфат, пірофосфат калію, пропіонат калію, калію сахарин, тартрат натрію калію (наприклад, калію, натрію L(+)-тартрат), сорбат калію, сульфат калію, сульфат калію та калію триполіфосфат.

[0110] Термін "оброблені харчові продукти" відноситься до харчового продукту, який піддають будь-якому процесу, що змінює початковий стан (за винятком, наприклад, збирання врожаю, забою та чищення). Приклади методів обробки продуктів включають, але не обмежуються наступними: видалення небажаних зовнішніх шарів, таких як видалення шкірочки картоплі або шкіри персиків, подрібнювання або нарізання, рубання або вимочування; скраплення, наприклад, для виробництва фруктового соку; ферментація (наприклад, пива); емульгування; приготування їжі, таке як кип'ятіння, підсмажування, смаження, нагрівання, приготування на парі або грилі, глибоке смаження, випікання, перемішування; додавання газу, наприклад, насичення повітрям для хліба або газифікація безалкогольних напоїв; розстойка; приправлення (наприклад, зеленню, спеціями, сіллю); сушіння розпиленням, пастеризація, упакування (наприклад, у консервні банки або коробки); екструзія; підняття тіста, змішування; і консервація (наприклад, шляхом додавання солі, цукру, лактату калію або інших консервантів).

[0111] Термін "замінити" або "заміна" відноситься до заміщення однієї сполуки іншою сполукою в, наприклад, їстівній композиції, такий як харчовий продукт, або при її приготуванні. Він включає повні й часткові заміни або заміщення.

[0112] Термін "солоний смак" відноситься до смаку, викликаного, наприклад, йонами солей лужних металів (наприклад, Na⁺ і Cl⁻ у хлориді натрію). Необмежуючі приклади композицій, що викликають солоний смак, включають поварену сіль (хлорид натрію), морську воду, морську сіль і хлорид калію. Кількість солоного смаку або солоність сполуки можуть бути визначені, наприклад, смаковим тестуванням.

[0113] Термін "натрій" або "натрієва сіль" відноситься до кількості натрію (тобто натрієвої солі), яку приймає внутрішньо або іншим способом споживає суб'єкт. У загальному випадку, "натрій" або "натрієва сіль" відноситься до солі або сполуки, в якій натрій є катіоном. Солі натрію в контексті даного винаходу, включають, але не обмежуються наступними сполуками: алюмосульфат натрію, кальцію динатрію ЕДТА, диоктилнатрійсульфосукцинат, динатрію 5'-рибонуклеотиди, динатрію етилендіамінтетраацетат, динатрію гуанілат, динатрію інозинат, ацетат натрію, мононатрію глутамат (МНГ), калію натрію тартрат, кислий пірофосфат натрію, натрій адипат, альгінат натрію, алюмосилікат натрію, алюмофосфат натрію (кислий), натрію алюмофосфат (основний), аскорбат натрію, бензоат натрію, бікарбонат натрію, бісульфат натрію, бісульфіт натрію, карбонат натрію, натрію карбоксиметилцелюлоза, казеїнат натрію, хлорид натрію, цитрат натрію, цикламат натрію, натрію дегідроацетат, натрію діацетат, дигідроцитрат натрію, фосфат натрію, дигідрофосфат натрію, DL-малат натрію, еріторбат натрію, натрію еріторбін, натрію етил пара-гідроксибензоат, натрію заліза пірофосфат, натрію фероціанід, форміат натрію, натрію фумарат, глюконат натрію, карбонат натрію, гідрокарбонат натрію, натрію гідро-DL-малат, натрію ацетат, натрію сульфат, натрію гідроксид, гіпофосфіт натрію, натрій тартрат (наприклад, натрію L(+)-тартрат), натрію лактат, натрію лаурилсульфат, натрію малат, натрію метабісульфіт, натрію метафосфат, натрію метил пара-гідроксибензоат, нітрат натрію, нітрит натрію, натрій О-фенілфенол, натрію фосфат (двоосновний), фосфат натрію (одноосновний), натрію фосфат (трьохосновний), поліфосфат натрію, тартрат натрію калію, натрію пропіонат, натрію пропіл пара-гідроксибензоат, пірофосфат натрію, натрію

сахарин, натрію сесквікарбонат, натрію стеароїллактилат, натрію стеарил фумарат, сукцинат натрію, сульфат натрію і октенілсукцинат крохмалю натрію.

[0114] Термін "споживання натрію" відноситься до кількості натрію, яка споживається внутрішньо або іншим способом споживається суб'єктом.

[0115] Термін "стабільність" або "стабільний" у контексті хімічної структури відноситься до хімічного стану, коли система у своєму нижчому енергетичному стані або в хімічній рівновазі з навколишнім середовищем. Таким чином, стабільна сполука (або, наприклад, сполуки, що містять деяке число стабільних атомів або заміщень) є не дуже реактивною в навколишньому середовищі або при нормальному використанні й зберігає свої корисні властивості протягом періоду її очікуваної корисності.

[0116] Термін "суб'єкт" відноситься до ссавців. У переважних варіантах реалізації, суб'єктом є людина. У деяких варіантах реалізації, суб'єктом є домашня або лабораторна тварина, включаючи, але не обмежуючись домашніми тваринами, такими як собаки, кішки, свині, кролики, пацюки, миші, піщанки, хом'яки, морські свинки і тхори. У деяких варіантах реалізації, суб'єктом є сільськогосподарська тварина. Необмежуючі приклади сільськогосподарських тварин включають: альпака, бізон, верблюд, велика рогата худоба, олені, свині, коні, ламы, мули, осли, вівці, кози, кролики, олені та яки.

[0117] Термін "цукор" відноситься до простих вуглеводів, таких як моносахарид або дисахарид, який забезпечує первинне смакове відчуття солодкості. Необмежуючі приклади цукру включають наступні сполуки: глюкоза, фруктоза, галактоза, сахароза, лактоза й мальтоза.

[0118] Термін "солодкий смак" відноситься до смаку, викликаного, наприклад, цукрами. Необмежуючі приклади композицій, які викликають солодкий смак, включають наступні сполуки: глюкоза, сахароза, фруктоза, сахарин, цикламат, аспартам, ацесульфам калію, сукралоза, алітам і неотам. Кількість солодкого смаку або солодкості сполуки може бути визначена, наприклад, смаковим тестуванням.

[0119] Термін "терпени" відноситься до сполук, що містять повторювані ланки ізопрену. Основна молекулярна формула терпену: $(C_5H_8)_n$, де через n позначене число зв'язаних між собою одиниць ізопрену.

[0120] Термін "терпеноїди" відноситься до сполук, що містять терпени і їхні похідні. Таким чином, у деяких варіантах реалізації, терпеноїди мають принаймні одну C_5H_8 вуглеводневу ланку з однією або більше точкою ненасиченості. У інших варіантах реалізації, терпеноїди включають насичені терпенові ланки та їхні похідні й не мають точок ненасиченості.

[0121] Арильна, аралкільна, гетероарильна або гетероаралкільна група може містити один або більше незалежно обраних замісників. Приклади підходящих замісників для ненасичених атомів вуглецю арильної або гетероарильної групи включають, але не обмежуються наступними сполуками: галоген, $-CF_3$, $-R'$, $-OR'$, $-OH$, $-SH$, $-SR'$, захищена OH група (така як ацилокси), $-NO_2$, $-CN$, $-NH_2$, $-NHR'$, $-N(R')_2$, $-NHCOR'$, $-NHCONH_2$, $-NHCONHR'$, $-NHCON(R')_2$, $-NRCOR'$, $-NHCO_2H$, $-NHCO_2R'$, $-CO_2R'$, $-CO_2H$, $-COR'$, $-CONH_2$, $-CONHR'$, $-CON(R')_2$, $-S(O)_2H$, $-S(O)_2R'$, $-S(O)_3H$, $-S(O)_3R'$, $-S(O)_2NH_2$, $-S(O)H$, $-S(O)R'$, $-S(O)_2NHR'$, $-S(O)_2N(R')_2$, $-NHS(O)_2H$ або $-NHS(O)_2R'$, де R' обрана з H , аліфатичної, карбоциклічної, гетероциклічної, арильної, аралкільної, гетероарильної або гетероаралкільної групи й кожна R' опціонально заміщена одним або більше галогеном, нітро, ціано, аміно, $-NH$ -(незаміщена аліфатична), $-N$ -(незаміщена аліфатична) $_2$, карбокси, карбаміл, гідрокси, $-O$ -(незаміщена аліфатична), $-SH$, $-S$ -(незаміщена аліфатична), CF_3 , $-S(O)_2NH_2$ незаміщена аліфатична, незаміщений карбоцикліл, незаміщений гетероцикліл, незаміщений арил, незаміщений аралкіл, незаміщений гетероарил або незаміщений гетероаралкіл.

[0122] Аліфатична група, карбоциклічне кільце або гетероциклічне кільце може містити один або більше замісників. Приклади підходящих замісників для насиченого або ненасиченого вуглецю аліфатичної групи, карбоциклічного кільця або гетероциклічного кільця включають, але не обмежуються перерахованими вище для ненасиченого вуглецю, а також наступними: $=O$, $=S$, $=NNHR'$, $=NN(R')_2$, $=N-OR'$, $=NNHCOR'$, $=NNHCO_2R'$, $=NNHSO_2R'$, $=N-CN$ або $=NR'$, де R' визначений так, як вище. Керуючись цією специфікацією, вибір підходящих замісників перебуває в межах знань фахівця в даній області.

[0123] Як визначено тут, сполуки винаходу включають всі стереохімічні форми сполуки, в тому числі геометричні ізомери (тобто E , Z) і оптичні ізомери (тобто R , S). Одиночні стереохімічні ізомери, а також енантімерні та діастереомерні суміші даних сполук перебувають у межах об'єму винаходу. Якщо не зазначено інше, формули, наведені тут, також призначені для включення сполук, які відрізняються тільки наявністю одного або більше ізотопно збагачених атомів. Наприклад, сполуки, що мають дану Формулу, за винятком заміни водню на дейтерій чи тритій або заміни вуглецю на ^{13}C - чи ^{14}C -збагачений вуглець, перебувають у межах

об'єму винаходу.

[0124] Даний винахід відноситься до їстівних композицій, що містять сполуки даного винаходу, в тому числі продуктів харчування, споживчих продуктів і фармацевтичних композицій, що містять зазначені сполуки, і способів одержання таких композицій. Даний винахід також пропонує способи зниження кількості натрію (наприклад, NaCl або лактату натрію) або цукру в харчовому продукті, спосіб зниження натрію або цукру в раціоні, спосіб зменшення гіркого смаку і спосіб зниження активності рецепторів гіркого смаку. Даний винахід включає також зменшення кількості натрію в харчовій композиції або дієті шляхом заміни натрій-вмісної сполуки або композиції калій-вмісною сполукою або композицією. Даний винахід також включає зниження кількості цукру в харчовій композиції або дієті шляхом заміни цукру калій-вмісним підсолоджувачем, таким як ацесульфам К.

Їстівні композиції

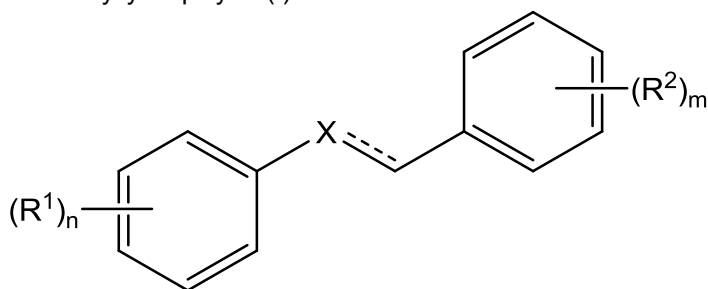
[0125] Згідно з одним аспектом, даний винахід забезпечує їстівну композицію, яка містить сполуку згідно з даним винаходом для зменшення гіркого смаку речовини, що має гіркий смак.

Їстівні композиції, що містять дифеніл-вмісні сполуки

[0126] Визначення замісників у цьому розділі (тобто R^1 , R^2 , R^a , X, m і n) відносяться до сполук Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb') і Формули (IIIb'').

[0127] Окремо передбачені всі стереохімічні форми сполук, розкритих у цьому розділі й у будь-якому розділі даної заявки, включаючи геометричні ізомери (тобто E, Z) і оптичні ізомери (тобто R, S). Також окремо передбачені окремі стереохімічні ізомери й енантіомерні та діастереомерні суміші сполук, розкритих у цьому й усіх інших розділах даної заявки.

[0128] У деяких варіантах реалізації, даний винахід забезпечує їстівну композицію для зменшення гіркого смаку речовини, що має гіркий смак, причому зазначена композиція містить дифеніл-вмісну сполуку. Зазначені дифеніл-вмісні сполуки згідно з даним винаходом здатні зменшувати або усувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, зазначена дифеніл-вмісна сполука має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, зазначена дифеніл-вмісна сполука являє собою сполуку Формули (I):



Формула (I);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, C_{6-10} арилокси, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфоаміно, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, фенол, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^2 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, C_{6-10} арилокси, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфоаміно, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, фенол, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

6гетероцикліл-С₁₋₆алкіл, феніл, феніл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₅гетероарил і С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

5 X являє собою O або NR^a, причому R^a відсутній або обраний із групи, яка складається з наступного: водень, С₁₋₁₀алкіл, С₁₋₁₀галоалкіл, С₂₋₁₀алкеніл, С₂₋₁₀алкініл, карбоксил, С₁₋₁₀алкоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкенілоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкінілоксикарбоніл, С₁₋₁₀ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфоаміол, сульфоніл, С₃₋₇карбоцикліл, С₃₋₇карбоцикліл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₆гетероцикліл, С₁₋₆гетероцикліл-С₁₋₆алкіл, феніл, феніл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₅гетероарил і С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

10 причому будь-який із R¹, R² та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: С₁₋₁₀алкіл, С₁₋₁₀галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, С₁₋₁₀алкоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкенілоксикарбоніл, С₂₋₁₀алкінілоксикарбоніл, С₁₋₁₀ацил, С₁₋₁₀ациламіно, С₁₋₁₀ацилокси, С₁₋₁₀карбонат, С₁₋₁₀алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, диС₁₋₁₀алкіламіно, моноС₁₋₁₀алкіламіно, С₁₋₁₃амідо, С₁₋₁₀іміно, С₁₋₁₀карбамат, С₁₋₁₀сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, С₁₋₁₀алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміол, сульфоамідо, сульфоніл, С₃₋₇карбоцикліл, С₃₋₇карбоцикліл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₆гетероцикліл, С₁₋₆гетероцикліл-С₁₋₆алкіл, феніл, феніл-С₁₋₆алкіл, С₁₋₅гетероарил і С₁₋₅гетероарил-С₁₋₆алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

m являє собою 1-3; і

n являє собою 0-3.

25 [0129] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули I, з урахуванням вимог валентності й стабільності:

R¹, незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген; гідроксил; С₁₋₆алкіл; С₁₋₆галоалкіл, С₁₋₆гідроксилалкіл або С₁₋₆ацилокси-С₁₋₆алкіл; С₂₋₆алкеніл; С₂₋₆алкініл; С₁₋₆алкокси; С₁₋₆алкілтіо; і С₆₋₁₀арил-С₁₋₆алкілокси, які можливо містять як замісники галоген, гідроксил, С₁₋₆алкіл, С₁₋₆алкокси або С₁₋₆ацилокси;

30 R², незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген; гідроксил; С₁₋₆алкіл; С₁₋₆галоалкіл, С₁₋₆гідроксилалкіл або С₁₋₆ацилокси-С₁₋₆алкіл; С₂₋₆алкеніл; С₂₋₆алкініл; С₁₋₆алкокси; С₁₋₆алкілтіо; і С₆₋₁₀арил-С₁₋₆алкілокси, які можливо містять як замісники галоген, гідроксил, С₁₋₆алкіл, С₁₋₆алкокси або С₁₋₆ацилокси;

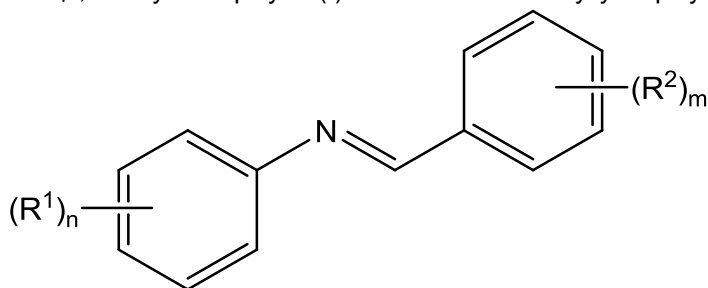
35 X являє собою O або NR^a, причому R^a відсутній або обраний із групи, яка складається з водню та С₁₋₆алкілу;

причому будь-який із R¹, R² та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо додатково заміщений, як описано вище;

m являє собою 1-3; і

n являє собою 0-3.

40 [0130] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули (I), X являє собою O. У інших варіантах реалізації, X являє собою NR^a, причому R^a відсутній. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (I) являє собою імін-вмісну сполуку. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (I) являє собою сполуку Формули (IIa):



45 Формула (IIa);

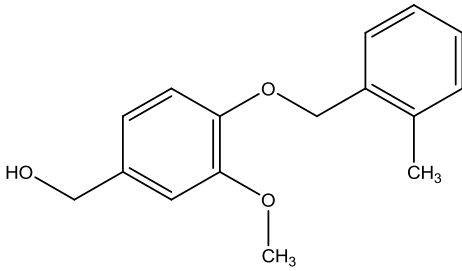
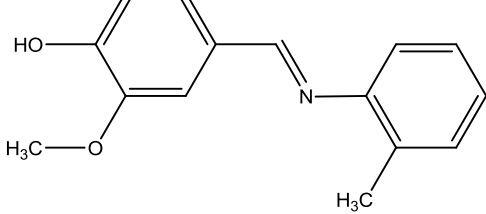
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R¹, R², m і n мають значення, визначені вище.

50 [0131] У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R¹ являє собою С₁₋₆алкіл, такий як метил, у одному або більше випадках R¹ являє собою С₁₋₆гідроксилалкіл, і/або в одному або більше випадках R¹ являє собою С₁₋₆алкокси, такий як метокси.

[0132] У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R² являє собою С₁₋

алкіл, такий як метил, в одному або більше випадках R^2 являє собою C_{1-6} гідроксилалкіл, і/або в одному або більше випадках R^2 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси.

[0133] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (I) або Формули (IIa) являє собою:

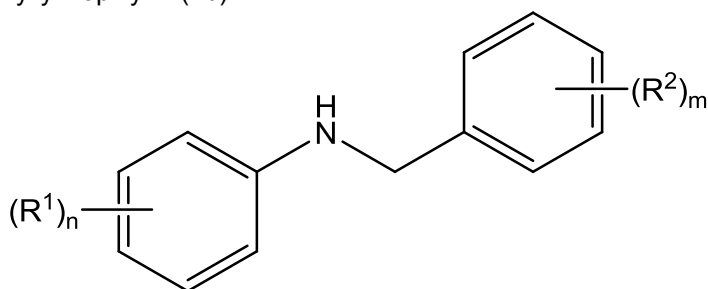
Сполука 1	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7993700),</p>
Сполука 2	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5466932),</p>

5

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

[0134] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули (I), X являє собою NR^a , причому R^a являє собою водень або C_{1-6} алкіл. У деяких варіантах реалізації, R^a являє собою водень. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (I) являє собою сполуку бензиламіну. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (I) являє собою сполуку Формули (IIb):

10



Формула (IIb);

15

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , m і n мають значення, визначені вище.

20

[0135] У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси або етокси, і/або в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкілтіо, такий як метилтіо.

[0136] У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^1 являє собою галоген, такий як фтор, хлор або бром.

25

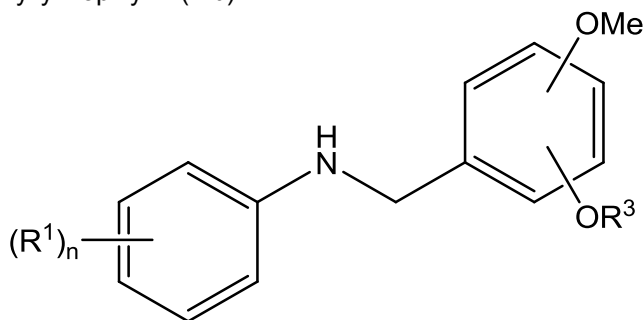
[0137] У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^1 являє собою гідроксил.

30

[0138] У деяких варіантах реалізації, n являє собою 0. У інших варіантах реалізації, n являє собою 1. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 1, а R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, або R^1 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси. У інших варіантах реалізації, n являє собою 2. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 2, і в одному або обох випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, і/або в одному або обох випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси. У деяких варіантах реалізації, n являє собою 2, і в одному випадку R^1 являє собою галоген, і в іншому випадку R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил.

[0139] У деяких варіантах реалізації, m являє собою 1. Наприклад, у деяких варіантах

- реалізації, m являє собою 1, а R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, або R^2 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси. У інших варіантах реалізації, m являє собою 2. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, m являє собою 2, і в одному або обох випадках R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, і/або в одному або обох випадках R^2 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси або етокси. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IIb) являє собою сполуку Формули (IIIb):



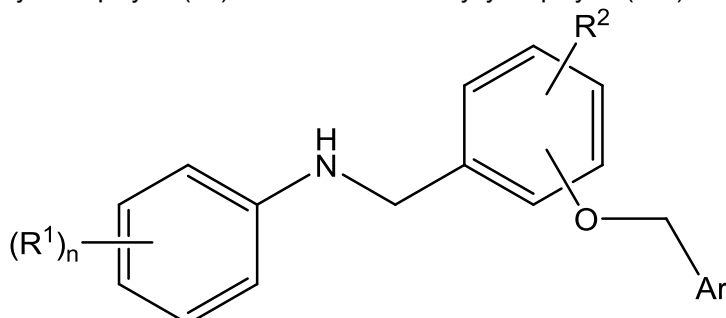
Формула (IIIb);

- або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 і n мають значення, визначені вище; і

R^3 обраний із групи, що складається з метилу та етилу.

- [0140] У деяких варіантах реалізації сполук Формули (IIb), m являє собою 2, і в одному або обох випадках R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил; в одному або обох випадках R^2 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси; і/або в одному або обох випадках R^2 являє собою C_{6-10} арил- C_{1-6} алкілокси, такий як феніл- C_{1-6} алкілокси, які можливо містять як замісники галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкокси або C_{1-6} ацилокси. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IIb) являє собою сполуку Формули (IIIb'):



Формула (IIIb');

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

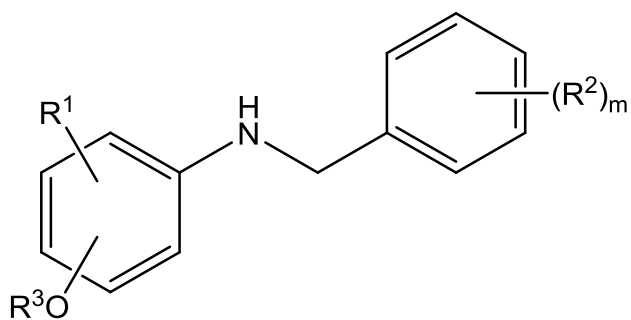
де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

- R^1 , R^2 і n мають значення, визначені вище; і

Ar являє собою C_{6-10} арил, який можливо містить як замісники галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкокси або C_{1-6} ацилокси.

- [0141] У деяких варіантах реалізації, Ar являє собою феніл, який можливо містить як замісники галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкокси або C_{1-6} ацилокси. У деяких варіантах реалізації, Ar містить як замісник C_{1-6} алкіл, такий як метил.

- [0142] У деяких варіантах реалізації сполук Формули (IIb), n являє собою 1, а R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, R^1 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси, або R^1 являє собою C_{1-6} алкілтіо, такий як метилтіо. У інших варіантах реалізації, n являє собою 2. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 2, і один або обидва R^1 являють собою галоген (наприклад, фтор, хлор або бром), один або обидва R^1 являють собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, і/або один або обидва R^1 являють собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IIb) являє собою сполуку Формули (IIIb''):



Формула (IIIb");

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

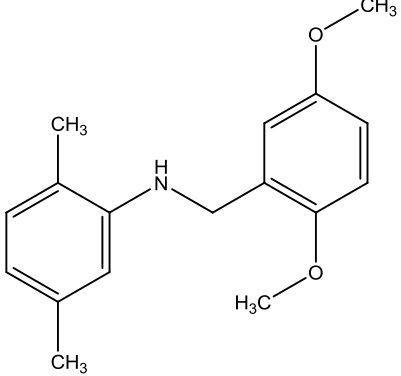
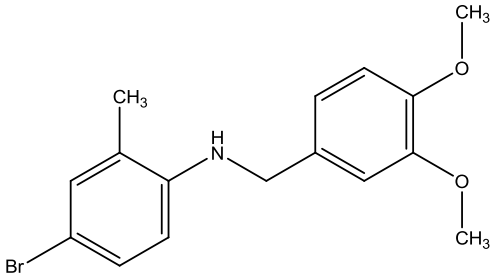
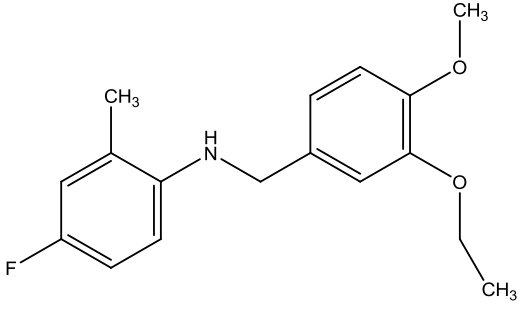
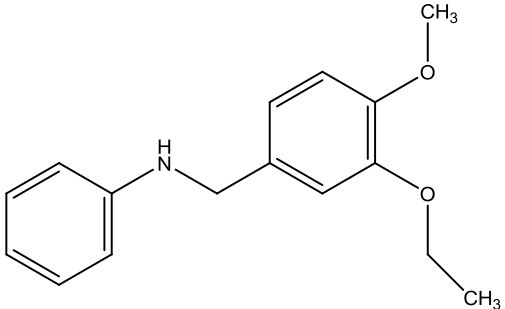
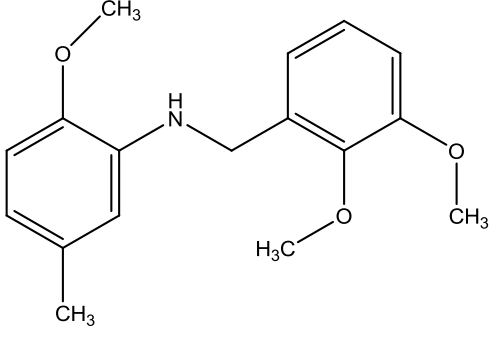
5 де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

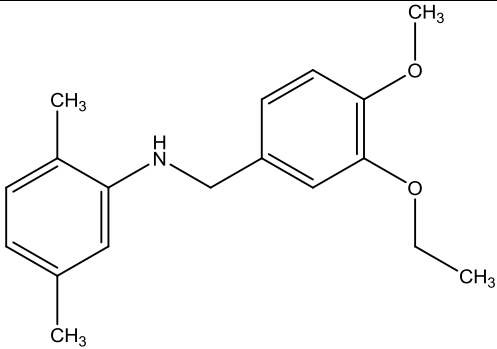
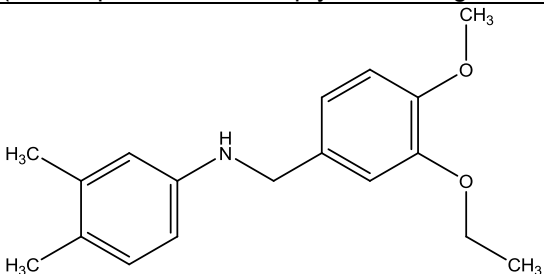
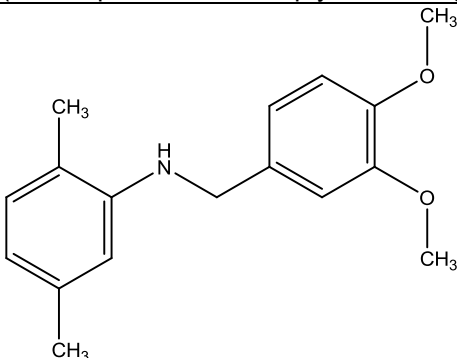
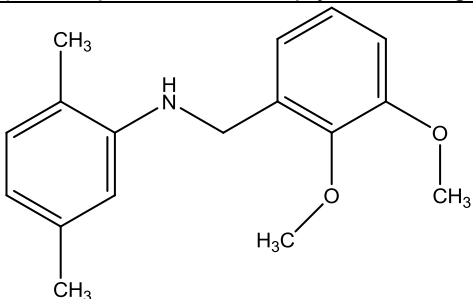
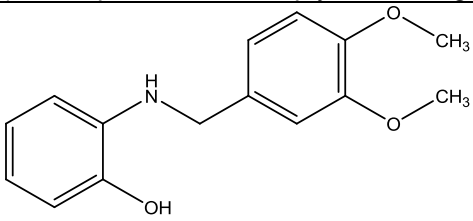
R^1 , R^2 та m мають значення, визначені вище; і

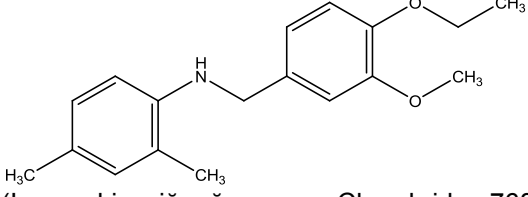
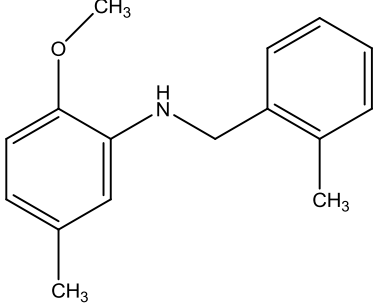
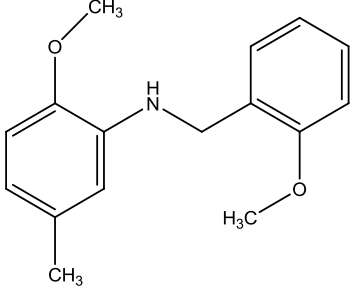
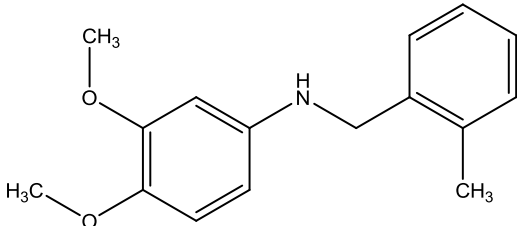
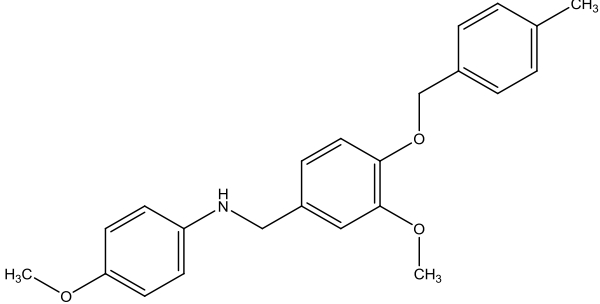
R^3 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил.

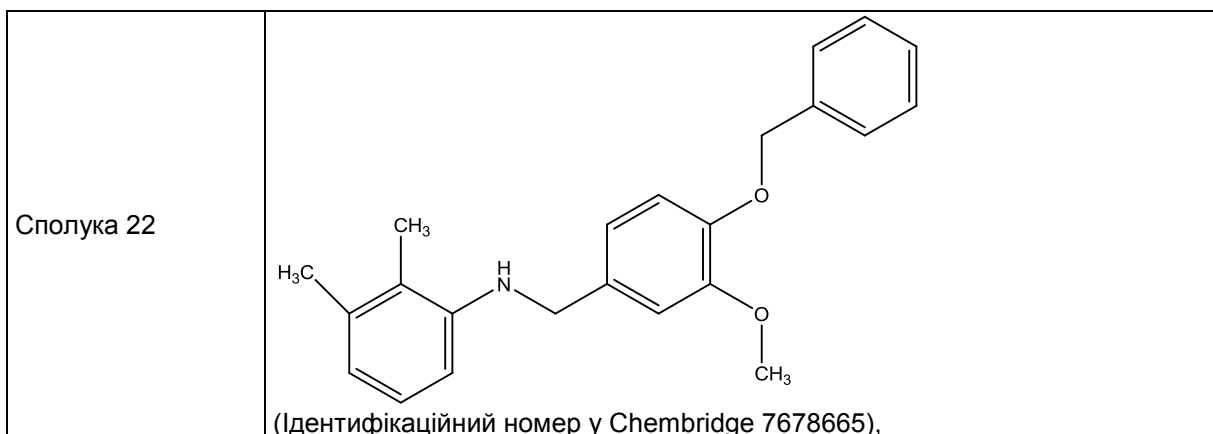
[0143] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (I) являє собою:

Сполука 3	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7577371),</p>
Сполука 4	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5455001),</p>
Сполука 5	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5456409),</p>
Сполука 6	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5464866),</p>

<p>Сполука 7</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5531378),</p>
<p>Сполука 8</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5537313),</p>
<p>Сполука 9</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5538324),</p>
<p>Сполука 10</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5539449),</p>
<p>Сполука 11</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5549065),</p>

Сполука 12	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5562743),</p>
Сполука 13	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5567336),</p>
Сполука 14	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5572799),</p>
Сполука 15	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5575970),</p>
Сполука 16	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7675788),</p>

Сполука 17	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7684680),</p>
Сполука 18	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5556341),</p>
Сполука 19	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5531571),</p>
Сполука 20	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5453910),</p>
Сполука 21	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7575033),</p>



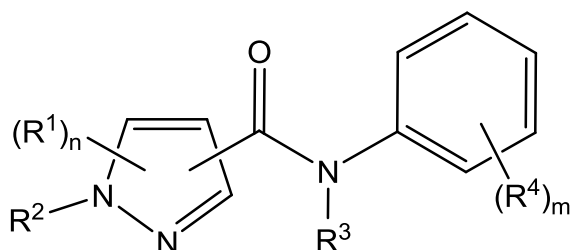
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

Істивні композиції, що містять піразол-вмісні сполуки

5 [0144] Визначення замісників у цьому розділі (тобто, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , m, n і o) відносяться до сполук Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa) і Формули (VIIb).

10 [0145] Окремо передбачені всі стереохімічні форми сполук, розкритих у цьому розділі й у будь-якому розділі даної заявки, включаючи геометричні ізомери (тобто E, Z) і оптичні ізомери (тобто R, S). Також окремо передбачені окремі стереохімічні ізомери і енантіомерні та діастереомерні суміші сполук, розкритих у цьому й усіх інших розділах даної заявки.

15 [0146] У деяких варіантах реалізації, даний винахід забезпечує композицію для зменшення гіркого смаку речовини, що має гіркий смак, причому зазначена композиція містить піразол-вмісну сполуку. Піразол-вмісні сполуки згідно з даним винаходом здатні зменшувати або усувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, композиція являє собою істивну композицію. У деяких варіантах реалізації, піразол-вмісна сполука являє собою істивну композицію, яка має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, піразол-вмісна сполука являє собою сполуку Формули (IV):



Формула (IV);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

25 R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, diC_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно

35 обрані з N, O і S;
 R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфамойл, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфоаміл, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^4 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 та R^4 незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

n являє собою 0-2; і

m являє собою 0-3.

[0147] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули IV, з урахуванням вимог валентності й стабільності:

R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} ацил;

R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^4 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси, $-C(O)-O-R^5$ і $-C(O)-N(R^5)_2$;

R^5 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 та R^4 незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить замісники, як описано вище;

n являє собою 0-2; і

m являє собою 0-3.

[0148] Згідно з деякими варіантами реалізації, n являє собою 0. Згідно з іншими варіантами реалізації, n являє собою 1 або 2, наприклад, 1. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^1 являє собою галоген, такий як фтор, хлор, бром або йод. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 1, а R^1 являє собою галоген, такий як фтор, хлор, бром або йод.

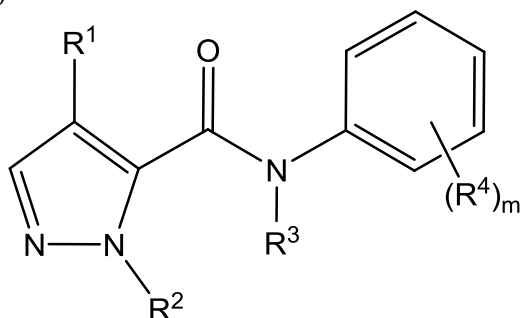
[0149] У деяких варіантах реалізації, R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил.

[0150] Згідно з деякими варіантами реалізації, в одному або більше випадках R^4 являє собою $-C(O)-O-R^5$ або $-C(O)-N(R^5)_2$. У деяких з таких варіантів реалізації, R^5 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, m являє собою 1, а R^4 являє собою $-C(O)-O-R^5$ або $-C(O)-N(R^5)_2$. У інших варіантах реалізації, m являє собою 2, і в одному випадку R^4 являє собою $-C(O)-O-R^5$, а іншому являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або

етил, або C_{1-6} алкокси, такий як метокси. У інших варіантах реалізації, m являє собою 3, і в одному випадку R^4 являє собою $-C(O)-O-R^5$, а у двох інших випадках, незалежно, C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил, C_{1-6} алкокси, такий як метокси, або їх комбінацію. У деяких варіантах реалізації, R^5 являє собою водень або C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил.

5 [0151] У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^4 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил. У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^4 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси. У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^4 являє собою галоген, такий як хлор. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, m являє собою 2, і обидва R^4 являють собою галоген, такий як хлор.

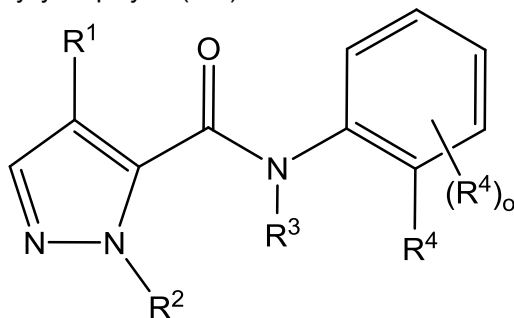
10 [0152] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IV) являє собою сполуку Формули (Va):



Формула (Va);

15 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та m мають значення, визначені вище.

[0153] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IV) або Формули (Va) являє собою сполуку Формули (Vla):



20 Формула (Vla);

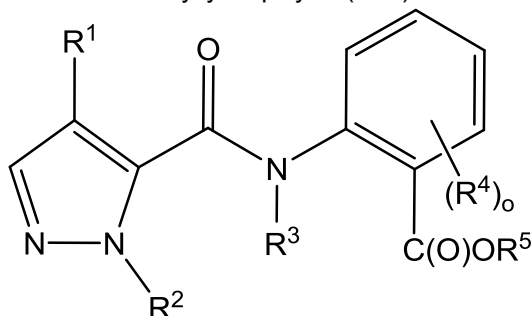
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 мають значення, визначені вище; і

25 о являє собою 0-2.

[0154] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IV), Формули (Va) або Формули (Vla) являє собою сполуку Формули (VIIa):

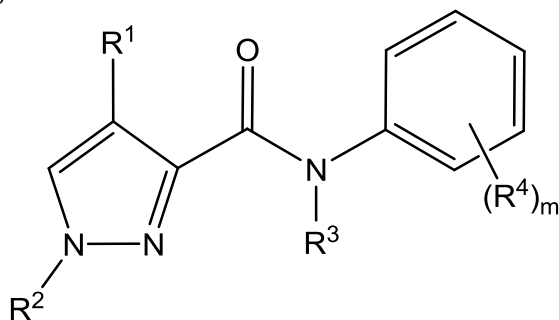


Формула (VIIa);

30 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають

вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 і o мають значення, визначені вище.

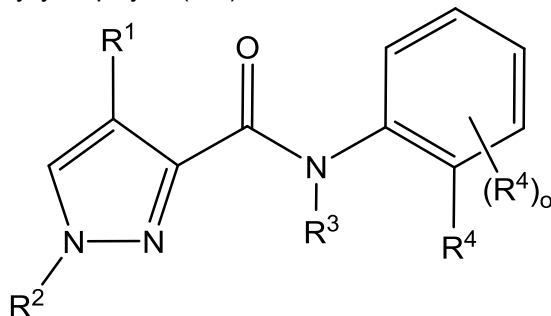
[0155] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IV) являє собою сполуку Формули (Vb):



5 Формула (Vb);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та m мають значення, визначені вище.

10 [0156] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IV) або Формули (Vb) являє собою сполуку Формули (VIb):



Формула (VIb);

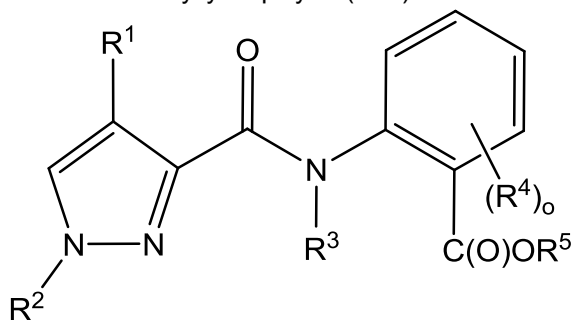
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

15 де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 мають значення, визначені вище; і

o являє собою 0-2.

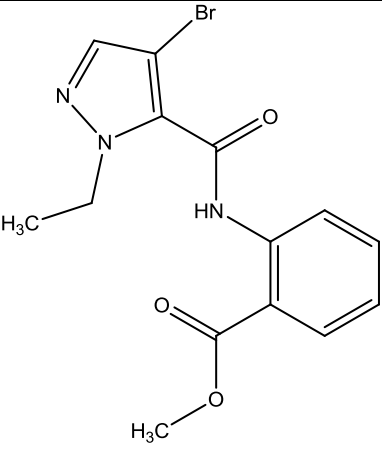
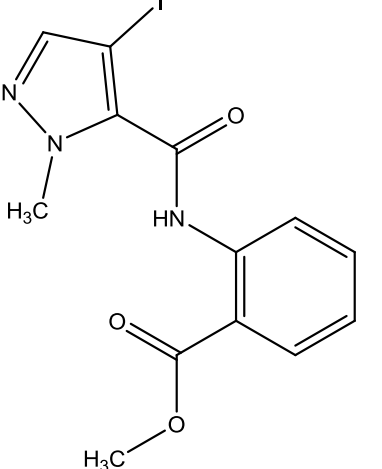
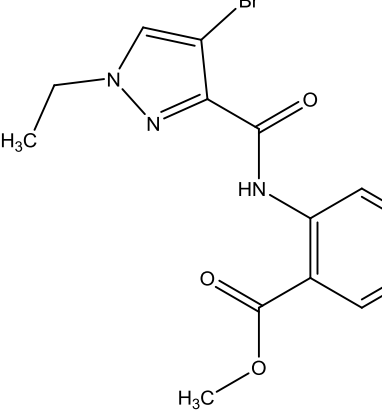
[0157] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IV), Формули (Vb) або Формули (VIb) являє собою сполуку Формули (VIIb):

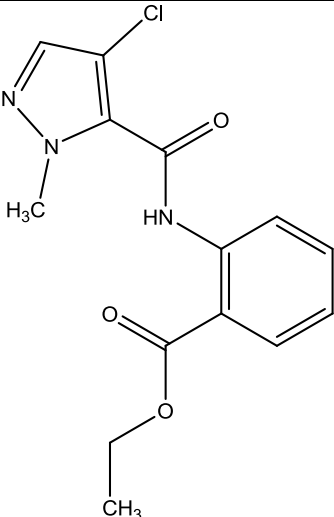
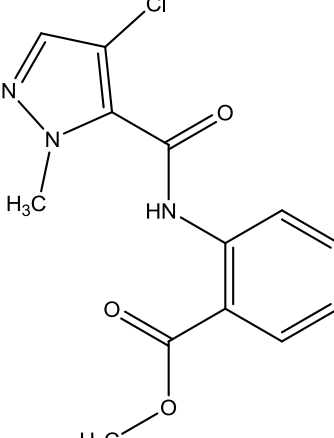
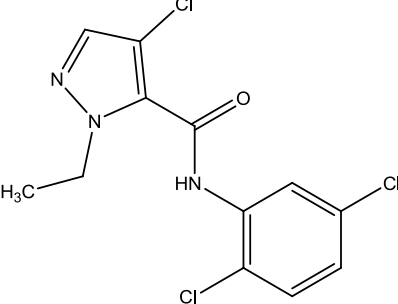


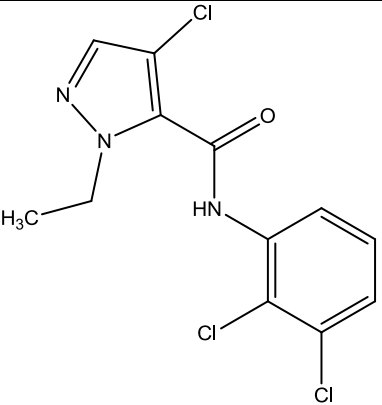
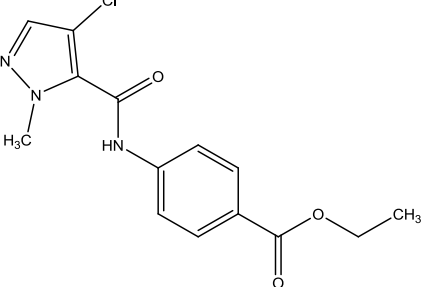
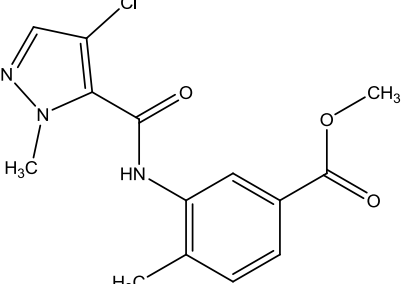
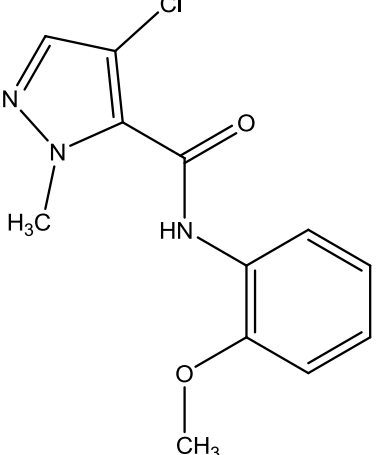
20 Формула (VIIb);

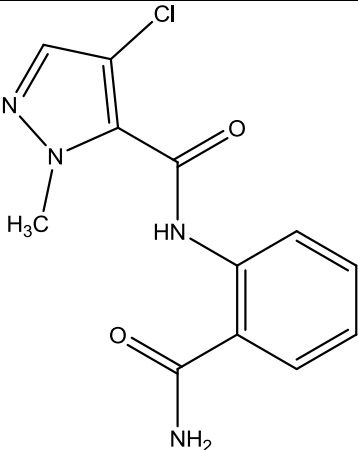
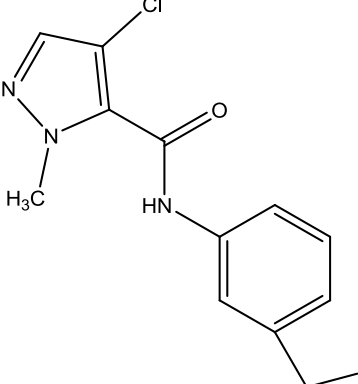
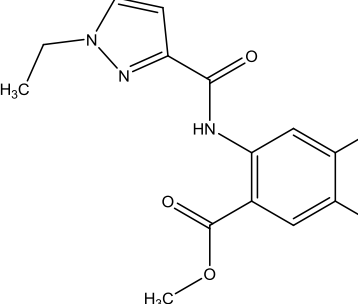
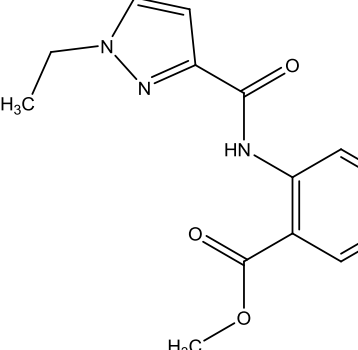
і придатну для споживання в їжу або біологічно придатну похідну зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 і o мають значення, визначені вище.

25 [0158] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (IV) являє собою:

<p>Сполука 23</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7533235)</p>
<p>Сполука 24</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6741054)</p>
<p>Сполука 25</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7529691)</p>

<p>Сполука 26</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9048753)</p>
<p>Сполука 27</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9052639)</p>
<p>Сполука 28</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7500589)</p>

<p>Сполука 29</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7530695)</p>
<p>Сполука 30</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7903488)</p>
<p>Сполука 31</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9052883)</p>
<p>Сполука 32</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9052868)</p>

<p>Сполука 33</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9053364)</p>
<p>Сполука 34</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9054710)</p>
<p>Сполука 35</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9048483)</p>
<p>Сполука 36</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9053578)</p>

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної

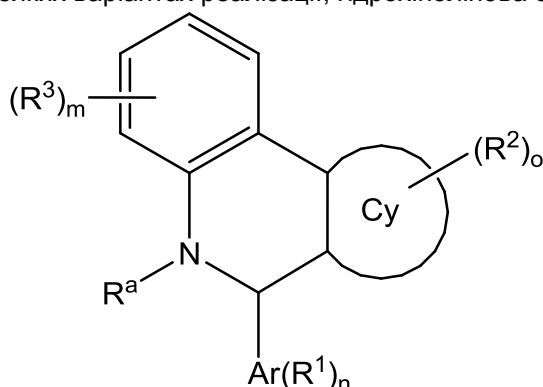
сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

Істивні композиції, що містять гідрохінолінові сполуки

[0159] Визначення замісників у цьому розділі (тобто, R^1 , R^2 , R^3 , R^a , Ar, Cy, m, n, o і p) відносяться до сполук Формули (VIII), Формули (IX) і Формули (X).

5 [0160] Окремо передбачені всі стереохімічні форми сполук, розкритих у цьому розділі й у будь-якому розділі даної заявки, включаючи геометричні ізомери (тобто E, Z) і оптичні ізомери (тобто R, S). Також окремо передбачені окремі стереохімічні ізомери і енантіомерні та діастереомерні суміші сполук, розкритих у цьому й усіх інших розділах даної заявки.

10 [0161] У деяких варіантах реалізації, даний винахід забезпечує істивну композицію для зменшення гіркої смаку речовини, що має гіркий смак, причому зазначена композиція містить гідрохінолінову сполуку. Гідрохінолінові сполуки згідно з даним винаходом здатні зменшувати або усувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, гідрохінолінова сполука має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, гідрохінолінова сполука являє собою сполуку Формули (VIII):



15

Формула (VIII);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

20 R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному
30 випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^2 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному
40 випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^3 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному
45 випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

C_6 гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

5 R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфоаміл, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

Ag обраний із групи, яка складається з C_{6-10} арилу і C_{3-9} гетероарилу;

Su являє собою 5-7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, причому кожне гетероциклічне кільце містить 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

15 причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміл, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

25 m являє собою 1-3;

n являє собою 0-3; i

o являє собою 0-3.

[0162] Згідно з деякими варіантами реалізації, сполуки Формули VIII,

з урахуванням вимог валентності й стабільності:

30 R^1 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси і C_{1-6} ацилокси;

R^2 незалежно в кожному випадку являє собою C_{1-6} алкіл;

R^3 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, $\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}^4$ і $\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^4)_2$;

35 R^4 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

Ag обраний із групи, яка складається з C_{6-10} арилу і C_{3-9} гетероарилу;

40 Su являє собою 5-7-членне карбоциклічне або гетероциклічне кільце, яке можливо містить один або два подвійні зв'язки вуглець-вуглець або вуглець-азот у кільці;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить замісники, як описано вище;

m являє собою 1-3;

45 n являє собою 0-3; i

o являє собою 0-3.

[0163] У деяких варіантах реалізації, n являє собою 0. У інших варіантах реалізації, n являє собою 1. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 1, а R^1 являє собою галоген (такий як фтор, хлор або бром) або C_{1-6} ацилокси (такий як ацетилокси). У інших варіантах реалізації, n являє собою 2. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 2, і в одному або обох випадках R^1 являє собою галоген, такий як хлор.

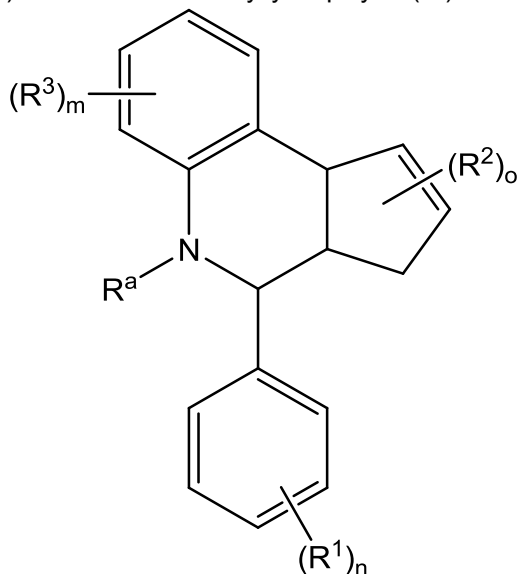
50 [0164] У деяких варіантах реалізації, m являє собою 1. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, m являє собою 1, а R^3 являє собою $\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}^4$, такий як $\text{C}(\text{O})-\text{OH}$, $\text{C}(\text{O})-\text{OMe}$ або $\text{C}(\text{O})-\text{OEt}$. У інших варіантах реалізації, m являє собою 2. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, m являє собою 2, і в одному випадку R^3 являє собою $\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}^4$, а в інших випадках являє собою галоген, такий як бром.

[0165] У деяких варіантах реалізації, o являє собою 0. У інших варіантах реалізації, o являє собою 1-3.

60 [0166] У деяких варіантах реалізації, R^a являє собою водень. У інших варіантах реалізації, R^a являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил.

[0167] У деяких варіантах реалізації, A_g являє собою C_{6-10} арил, такий як феніл. У інших варіантах реалізації, A_g являє собою C_{3-9} гетероарил.

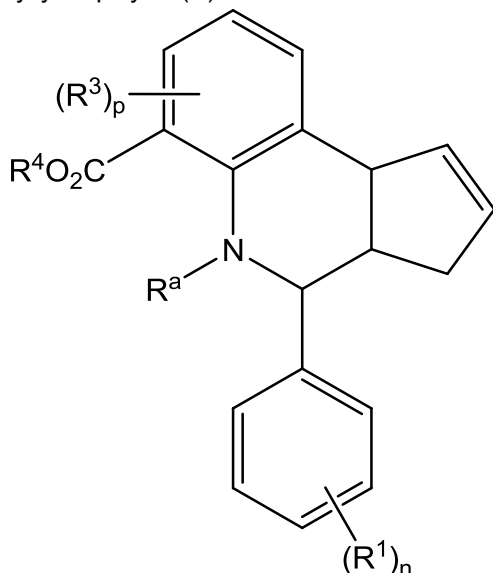
[0168] У деяких варіантах реалізації, S_u являє собою 5-7-членне карбоциклічне кільце, таке як 5-членне карбоциклічне кільце, таке як цикlopентильне або цикlopентенільне кільце. У деяких варіантах реалізації, S_u містить один подвійний зв'язок вуглець-вуглець у кільці, такому як цикlopентенільне кільце. Наприклад, згідно з одним варіантом реалізації, сполука Формули (VIII) являє собою сполуку Формули (IX):



Формула (IX);

10 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^a , m , n і o мають значення, визначені вище.

[0169] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (VIII) або Формули (IX) являє собою сполуку Формули (X):



15 Формула (X);

20 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

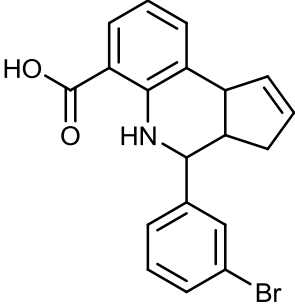
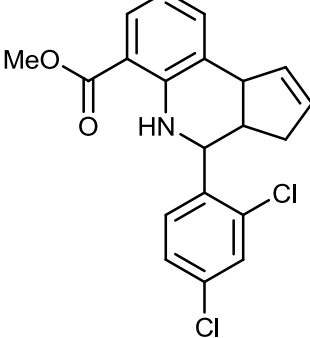
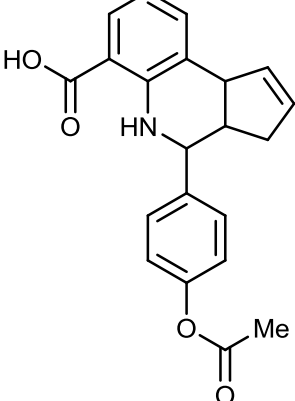
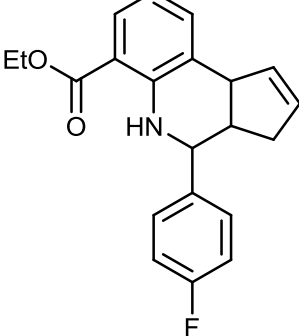
де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

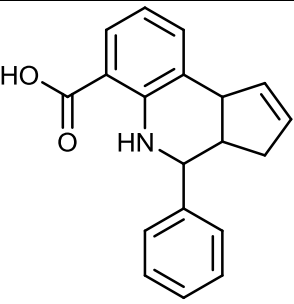
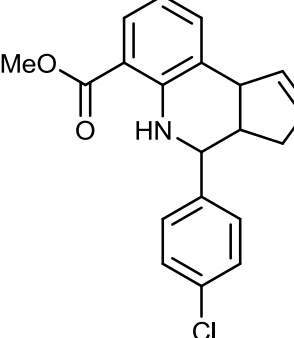
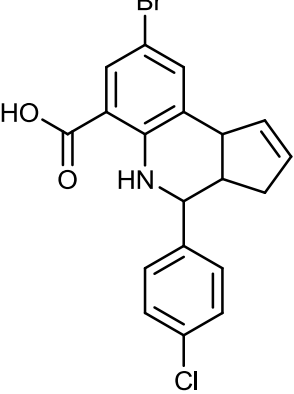
R^1 , R^3 , R^4 , R^a і n мають значення, визначені вище; і

p являє собою 0-2.

[0170] У деяких варіантах реалізації, p являє собою 0. У інших варіантах реалізації, p являє собою 1, а R^3 являє собою галоген, такий як бром.

[0171] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (VIII) являє собою:

<p>Сполука 37</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5846684),</p>
<p>Сполука 38</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6831241),</p>
<p>Сполука 39</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6527982),</p>
<p>Сполука 40</p>	 <p>(Ідентифікаційний номер Asinex BAS02001668),</p>

Сполука 41	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 5580105),</p>
Сполука 42	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 6973933),</p>
Сполука 43	 <p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 7975872),</p>

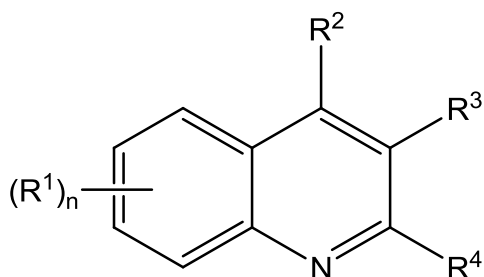
або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

Їстівні композиції, що містять хінолінові сполуки

5 [0172] Визначення замісників у цьому розділі (тобто, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, Het, Ar, m і n) відносяться до сполук Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa) і Формули (XIIIb).

10 [0173] Окремо передбачені всі стереохімічні форми сполук, розкритих у цьому розділі й у будь-якому розділі даної заявки, включаючи геометричні ізомери (тобто E, Z) і оптичні ізомери (тобто R, S). Також окремо передбачені окремі стереохімічні ізомери і енантіомерні та діастереомерні суміші сполук, розкритих у цьому й усіх інших розділах даної заявки.

15 [0174] У деяких варіантах реалізації, даний винахід забезпечує композицію для зменшення гіркого смаку речовини, що має гіркий смак, причому зазначена композиція містить сполуку хіноліну. Сполуки хіноліну згідно з даним винаходом здатні зменшувати або усувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, композиція являє собою їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, сполука хіноліну має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, сполука хіноліну являє собою сполуку Формули (XI):



Формула (XI);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, Het- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, Het- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^4 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, Het- C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтію, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

або R^3 і R^4 разом із атомами, до яких вони приєднані, утворюють 5-6-членний арил або гетероарил, який можливо містить як замісники від 1 до 4 груп, обраних із групи, що складається з: Het, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10}

$_{10}$ алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди C_{1-10} алкіламіно, моно C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

Het являє собою C_{1-9} гетероцикліл, який містить 1-4 гетероатоми в кільці, обрані з кисню, сірки й азоту;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та Het незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди C_{1-10} алкіламіно, моно C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфамойл, сульфонамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{6-10} арил, C_{1-6} алкіл- C_{6-10} арил, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S; і

n являє собою 0-4.

[0175] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули XI, з урахуванням вимог валентності й стабільності:

R^1 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, Het- C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

R^3 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, Het- C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

R^4 обраний із групи, яка складається з наступного: водень, галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, Het- C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси;

або R^3 і R^4 разом із атомами, до яких вони приєднані, утворюють 5-6-членне арильне кільце, яке можливо містить як замісники від 1 до 4 груп, обраних із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси і Het;

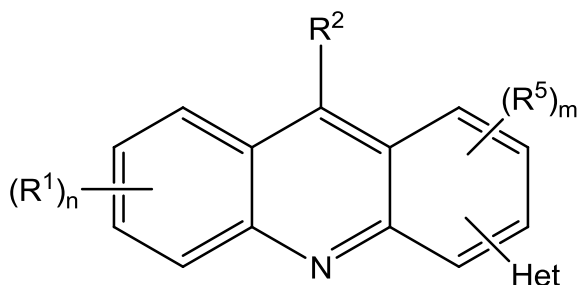
Het являє собою C_{2-6} гетероцикліл, який містить 1-3 гетероатоми в кільці, обрані з кисню, сірки й азоту, і можливо містить як замісник одну або більше груп, обраних із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси і C_{6-10} арил, який можливо містить як замісник C_{1-6} алкіл;

причому будь-який із R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та Het незалежно і незалежно в кожному випадку можливо додатково заміщений, як описано вище; і

n являє собою 0-4.

[0176] Згідно з деякими варіантами реалізації, один, два або кожний із R^2 , R^3 або R^4 не є воднем.

[0177] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули (XI), R^3 і R^4 разом із атомами, до яких вони приєднані, утворюють 5-6-членне арильне кільце, таке як бензольне кільце, яке можливо містить замісники, як описано вище. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XI) являє собою сполуку Формули (XIa):



Формула (XIa);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

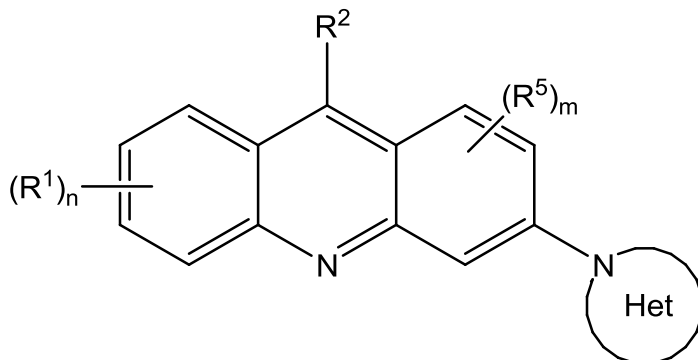
де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , Het і n мають значення, визначені вище;

R^5 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси; і

5 m являє собою 0-3.

[0178] Згідно з деякими варіантами реалізації, Het являє собою азот-вмісний гетероцикл, який можливо містить додаткові гетероатоми, обрані з кисню, сірки й азоту, і можливо містить замісники, як описано вище. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XIIa) являє собою сполуку Формули (XIIIa):



10

Формула (XIIIa);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^5 , Het, n і m мають значення, визначені вище.

15

[0179] У деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^5 являє собою галоген, такий як фтор. Наприклад, у деяких варіантах реалізації сполук Формули (XIIa) і Формули (XIIIa), m являє собою 3 і R^5 являє собою фтор у кожному випадку.

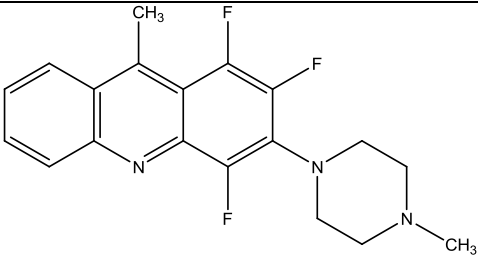
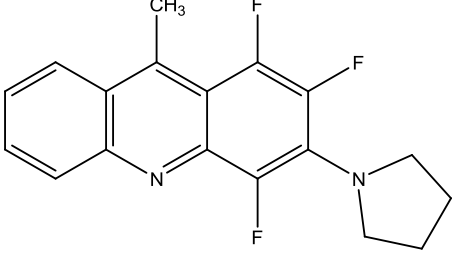
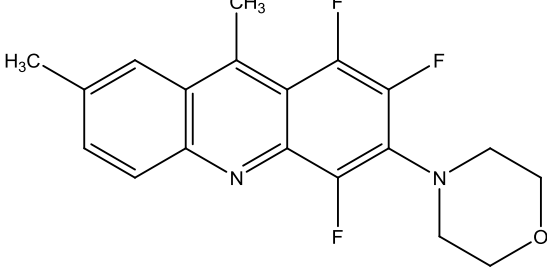
20

[0180] У деяких варіантах реалізації, Het являє собою азот-вмісний гетероцикл, такий як азиридин, азетидин, діазетидин, піролідін, піролін, імідазолідін, піразолідін, імідазолін, оксазолідін, ізоксазолідін, оксазолін, піперидин, піперазин, морфолін, оксазин, тіазин, азепан, азепін або діазепін, який можливо містить замісники, як описано вище. У деяких варіантах реалізації, Het являє собою піролідін, піперазин або морфолін, який можливо містить замісники, як описано вище. У деяких варіантах реалізації, Het містить як замісники один або більше C_{1-6} алкілів, таких як метил.

25

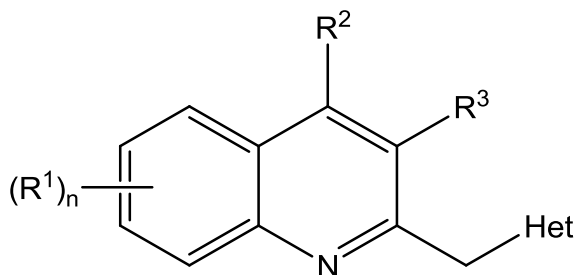
[0181] Згідно з деякими варіантами реалізації, n являє собою 0 або n являє собою 1, і R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил; R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил; m являє собою 3 і R^5 являє собою фтор у кожному випадку; і Het являє собою піролідін, піперазин або морфолін, який можливо містить як замісники один або більше C_{1-6} алкілів, таких як метил. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XI), Формули (XIIa) або Формули (XIIIa) являє собою:

30

Сполука 44	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7728336),
Сполука 45	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7733323),
Сполука 46	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7726077),

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

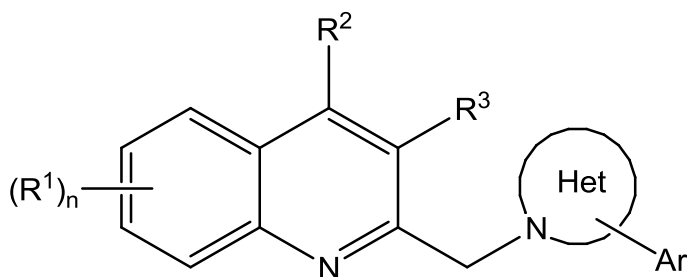
- 5 [0182] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули (XI), R^3 і R^4 незалежно обрані з групи, яка складається з наступного: водень, галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, Het- C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} алкокси. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, R^3 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил. У деяких варіантах реалізації, R^4 являє собою Het- C_{1-6} алкіл, такий як Het- CH_2 -. У інших варіантах реалізації, R^3 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, і R^4 являє собою Het- C_{1-6} алкіл, такий як Het- CH_2 -. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XI) являє собою сполуку Формули (XIb):



Формула (XIb);

- 15 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , Het і n мають значення, визначені вище.

- 20 [0183] Згідно з деякими варіантами реалізації, Het являє собою азот-вмісний гетероцикл, який можливо містить додаткові гетероатоми, обрані з кисню, сірки й азоту, і можливо містить замісники, як описано вище. У деяких варіантах реалізації, Het містить як замісники один або більше C_{6-10} арилів, таких як феніл або нафтил, які можливо містять як замісник C_{1-6} алкіл. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XIb) являє собою сполуку Формули (XIb):



Формула (XIIIb);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , R^2 , R^3 , Het і n мають значення, визначені вище; і

Ar являє собою C_{6-10} арил, такий як феніл або нафтил, який можливо містить як замісник C_{1-6} алкіл.

[0184] У деяких варіантах реалізації, Het являє собою азот-вмісний гетероцикл, такий як азиридин, азетидин, діазетидин, піролідін, піролін, імідазолідін, піразолідін, імідазолін, оксазолідін, ізоксазолідін, оксазолін, піперидин, піперазин, морфолін, оксазин, тіазин, азепан, азепін або діазепін, який можливо містить замісники, як описано вище. У деяких варіантах реалізації, Het являє собою піролідін, піперазин або морфолін, зокрема піперазин, який можливо містить замісники, як описано вище.

[0185] Згідно з деякими варіантами реалізації, в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил; R^2 являє собою гідроксил; R^3 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил; Het являє собою піперазин; і Ar являє собою феніл. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XI), Формули (XIIb) або Формули (XIIIb) являє собою:

Сполука 47	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9149274),</p>
Сполука 48	<p>(Ідентифікаційний номер у Chembridge 9126324),</p>

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

[0186] У деяких варіантах реалізації описаних вище сполук, n являє собою 0 і при цьому відсутній R^1 . У інших випадках n не дорівнює нулю. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 1 і R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, можливо в пара-положенні відносно атома азоту. У іншому варіанті реалізації, n являє собою 2 і R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, в обох випадках, причому положення R^1 можливо співвідносяться як 1,4.

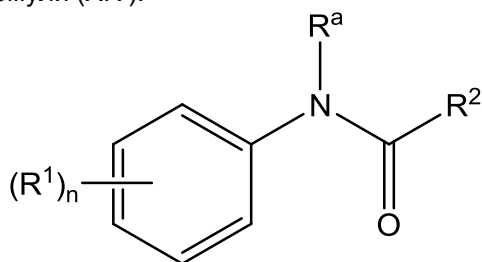
[0187] У деяких варіантах реалізації описаних вище сполук, R^2 являє собою водень. У інших варіантах реалізації, R^2 являє собою гідроксил. У інших варіантах реалізації, R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил.

Їстівні композиції, що містять N-фенілалкіламідні сполуки

[0188] Визначення замісників у цьому розділі (тобто, R^1 , R^2 , R^a , Ar, X, m, n і p) відносяться до сполук Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) і Формули (XVc).

[0189] Окремо передбачені всі стереохімічні форми сполук, розкритих у цьому розділі й у будь-якому розділі даної заявки, включаючи геометричні ізомери (тобто E, Z) і оптичні ізомери (тобто R, S). Також окремо передбачені окремі стереохімічні ізомери і енантіомерні та діастереомерні суміші сполук, розкритих у цьому й усіх інших розділах даної заявки.

[0190] У деяких варіантах реалізації, даний винахід забезпечує композицію для зменшення гіркої смаку речовини, що має гіркий смак, причому зазначена композиція містить N-фенілалкіламідну сполуку. N-фенілалкіламідні сполуки згідно з даним винаходом здатні зменшувати або усувати гіркий смак речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, композиція являє собою їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, N-фенілалкіламідна сполука має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, N-фенілалкіламідна сполука являє собою сполуку Формули (XIV):



Формула (XIV);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 , незалежно в кожному випадку, обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, феніл- C_{1-6} алкілокси, C_{1-5} гетероарилокси, C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміол, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, гідроксил, C_{1-10} алкокси, C_{6-10} арилокси, C_{6-10} арилокси- C_{1-10} алкіл, C_{6-10} ариламіно- C_{1-10} алкіл, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкілокси, C_{1-9} гетероарилокси, C_{1-9} гетероарилокси- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероариламіно- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероарил- C_{1-6} алкілокси, C_{3-10} алкенілокси, C_{3-10} алкінілокси, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, C_{3-10} карбоцикліл, C_{3-10} карбоциклілокси, C_{3-10} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{3-10} карбоциклілокси- C_{1-6} алкіл, C_{3-10} карбоцикліламіно- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероцикліл, C_{1-9} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероциклілокси- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероцикліламіно- C_{1-6} алкіл, C_{6-10} арил, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкіл, C_{1-9} гетероарил і C_{1-9} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, C_{2-10} алкеніл, C_{2-10} алкініл, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, фосфорил, фосфонат, фосфінат, ціано, сульфонат, сульфоаміол, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл, причому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S;

причому будь-який із R^1 , R^2 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо містить 1-3 замісники, обрані з групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, C_{6-10} арилокси, C_{6-10} ариламіно, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ди- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо,

сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоаміол, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, фенол, фенол- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця незалежно в кожному випадку містять 1-4 гетероатоми, незалежно обрані з N, O і S; і

n являє собою 0-3.

[0191] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули (XIV),

з урахуванням вимог валентності й стабільності:

R^1 незалежно в кожному випадку обраний із групи, яка складається з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси і C_{1-6} ацилокси;

R^2 обраний із групи, яка складається з наступного: C_{1-6} алкіл, C_{1-6} алкокси-заміщений C_{1-6} алкіл, C_{6-10} арилокси-заміщений C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{6-10} арил- C_{1-6} алкіл і $-(CH_2)_mX)_p-Ar$, причому арильні групи в R^2 можливо містять як замісники один або більше з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{1-6} алкокси або C_{1-6} ацилокси;

R^a обраний із групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

X обраний із групи, яка складається з наступного: O, NH і CH_2 ;

Ar обраний із групи, яка складається з наступного: C_{6-10} арил, C_{4-9} гетероарил, C_{5-10} карбоцикліл і C_{4-9} гетероцикліл, включаючи сполучені біциклічні групи, причому Ar можливо містить як замісники один або більше з наступного: галоген, гідроксил, C_{1-6} алкіл, C_{1-6} галоалкіл, C_{1-6} алкокси або C_{1-6} ацилокси;

причому будь-який із R^1 , R^2 та R^a незалежно і незалежно в кожному випадку можливо додатково заміщений, як описано вище;

m являє собою 1-3;

p являє собою 0-3; і

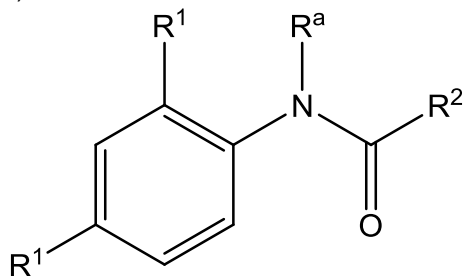
r являє собою 0 або 1.

[0192] У деяких варіантах реалізації, n являє собою 0. У інших варіантах реалізації, n являє собою 1-3. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, n являє собою 1-3, наприклад, 2, і в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси. У деяких варіантах реалізації, n являє собою 1-3, наприклад, 2, і в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкокси, такий як метокси, і в одному або більше випадках R^1 являє собою галоген, такий як хлор. У деяких варіантах реалізації, n являє собою 1-3, наприклад, 2, і в одному або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил, і в одному або більше випадках R^1 являє собою галоген, такий як хлор. У інших варіантах реалізації, n являє собою 2-3, наприклад, 2, і у двох або більше випадках R^1 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил.

[0193] У деяких варіантах реалізації, R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил, етил або пропіл. У деяких варіантах реалізації, R^2 являє собою C_{6-10} арилокси-заміщений C_{1-6} алкіл, такий як 2-арилоксиетил (наприклад, 2-фенілоксиетил), який можливо містить замісники, як описано вище. У деяких варіантах реалізації, R^2 являє собою C_{6-10} арил- C_{1-6} алкіл. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, R^2 являє собою фенол- C_{1-6} алкіл, такий як 2-арилетил (наприклад, дигідроцинаміл) або 3-арилпропіл (наприклад, 3-фенілпропіл), який можливо містить замісники, як описано вище.

[0194] Згідно з деякими варіантами реалізації, R^a являє собою водень. У інших варіантах реалізації, R^a являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил.

[0195] Як вказувалося вище, в деяких варіантах реалізації, R^2 являє собою C_{1-6} алкіл. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XIV) являє собою сполуку Формули (XVa):



Формули (XVa);

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки,

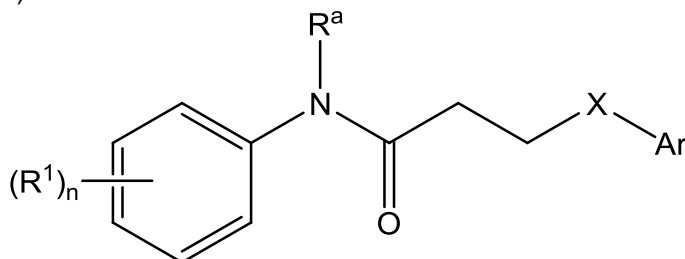
де, за умови, що це допускають вимоги валентності й стабільності:

R^1 і R^a мають значення, визначені вище; і

R^2 являє собою C_{1-6} алкіл, такий як метил або етил.

[0196] Згідно з деякими варіантами реалізації сполуки Формули (XIV), R^2 являє собою -
 ((CH₂)_mX)_p-Ar. У деяких варіантах реалізації, p являє собою 0. У інших варіантах реалізації, p
 5 являє собою 1. Наприклад, у деяких варіантах реалізації, p являє собою 1, а X являє собою O. У деяких варіантах
 реалізації, Ar являє собою C₆₋₁₀арил, такий як феніл, який можливо містить замісники, як
 описано вище. У інших варіантах реалізації, Ar являє собою C₄₋₉гетероцикліл (наприклад,
 діоксан), включаючи сполучені біциклічні групи, наприклад, бензо-конденсований гетероцикліл
 (наприклад, бензо-конденсований діоксан), який можливо містить замісники, як описано вище.

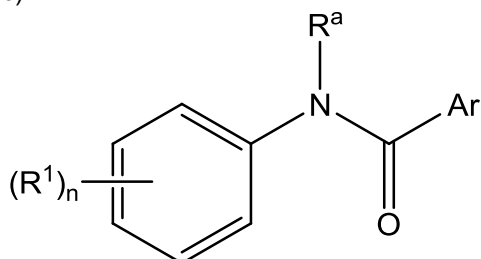
[0197] Як вказувалося вище, згідно з деякими варіантами реалізації, p являє собою 1.
 Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XIV) являє собою сполуку Формули
 (XVb):



Формула (XVb);

15 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної
 сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають
 вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^a , X, Ar і n мають значення, визначені вище.

[0198] Як вказувалося вище, згідно з деякими варіантами реалізації, p являє собою 0.
 Наприклад, у деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XIV) являє собою сполуку Формули
 20 (XVc):

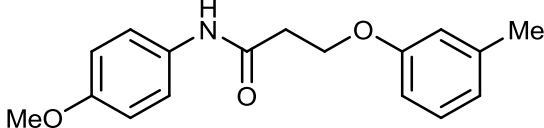
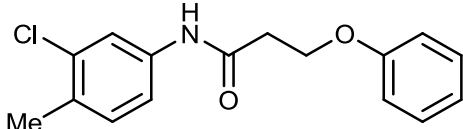
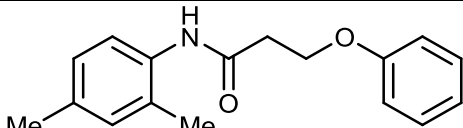
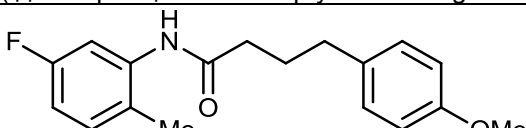
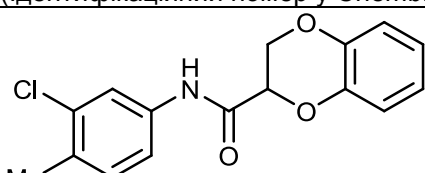
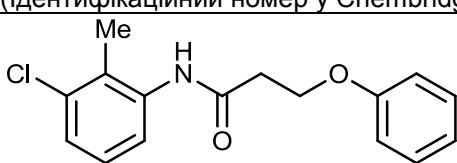
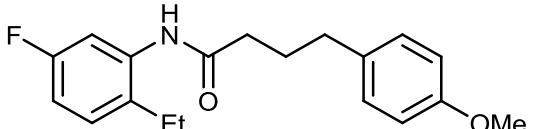


Формули (XVc);

25 або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної
 сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, де, за умови, що це допускають
 вимоги валентності й стабільності, R^1 , R^a , Ar і n мають значення, визначені вище.

[0199] У деяких варіантах реалізації, сполука Формули (XIV) являє собою:

Сполука 49	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 5838356),
Сполука 50	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6637745),
Сполука 51	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 5837150),

Сполука 52	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7395241),
Сполука 53	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 7446463),
Сполука 54	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6048404),
Сполука 55	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6872430),
Сполука 56	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6424175),
Сполука 57	 (Ідентифікаційний номер у Chembridge 6050479),
Сполука 58	

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки.

5 [0200] У деяких варіантах реалізації, істивні композиції згідно з даним винаходом містять дифеніл-вмісні сполуки, піразол-вмісні сполуки, гідрохінолінові сполуки, сполуки хіноліну або N-фенілалкіламідні сполуки, описані в даному тексті, або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль або похідну зазначеної сполуки, або енантіомер чи діастереомер зазначеної сполуки, або їх суміші.

10 [0201] У випадку використання придатної для вживання в їжу чи біологічно прийнятної солі сполуки згідно з даним винаходом, така сіль переважно утворена неорганічними або органічними кислотами та основами. Приклади таких кислот включають, але не обмежуються перерахованими: ацетат, адипат, альгінат, аспартат, бензоат, бензолсульфонат, бісульфат, бутират, цитрат, камфорат, камфорсульфонат, циклопентанпропіонат, диглюконат, додецилсульфат, етансульфонат формат, фумарат, глюкогептаноат, гліцерофосфат, гліколят, 15 гемісульфат, гептаноат, гексаноат, гідрохлорид, гідробромід, гідройодид, 2-гідроксietансульфонат, лактат, малеат, малонат, метансульфонат, 2-нафталінсульфонат, нікотинат, нітрат, оксалат, пальмоат, пектинат, персульфат, 3-фенілпропіонат, фосфат, пікрат, півалат, пропіонат, саліцилат, сукцинат, сульфат, тартрат, тіоціанат, тозилат і ундеканоат. Солі, утворені з придатних основ, включають солі лужних металів (наприклад, натрію і калію), 20 лужноземельних металів (наприклад, магнію), амонію і $n^+(C_{1-4} \text{ алкілу})_4$. Даний винахід також

передбачає кватернізацію будь-яких основних азот-вмісних груп, описаних у даному тексті. Завдяки такій кватернізації можуть бути отримані водорозчинні або диспергувальні продукти. У деяких варіантах реалізації, сполуки згідно з даним винаходом присутні в формі натрієвих, калієвих або цитратних солей.

5 [0202] Інший аспект даного винаходу відноситься до істивних композицій, які містять а) сполуку згідно з даним винаходом і b) речовину, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє собою сполуку, що має молекулярну масу, меншу за приблизно 1000, 500 або 300 Дальтон. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє собою сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb),
10 Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє
15 собою сполуку, обрану зі Сполук 1-58 або їхніх комбінацій.

[0203] У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в істивній композиції, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в істивній композиції, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є
20 присутньою в істивній композиції, являє собою сіль калію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в істивних композиціях, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, яка є присутньою в істивній композиції, являє собою лактат калію.

[0204] У іншому варіанті реалізації, істивні композиції містять: а) сполуку згідно з даним винаходом; і b) сіль калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє собою сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb),
25 Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом або комбінації зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом являє собою сполуку, обрану зі Сполук 1-58 або їхніх комбінацій.

[0205] У деяких варіантах реалізації, істивні композиції додатково містять сіль натрію. У деяких варіантах реалізації, істивні композиції додатково включають NaCl. У деяких варіантах реалізації, істивні композиції додатково містять лактат натрію. У деяких варіантах реалізації, істивні композиції додатково містять цукор.

[0206] У деяких варіантах реалізації, істивна композиція додатково містить один або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини, ароматизатори або додаткові модифікатори смаку, які можуть не мати власного
40 смаку.

[0207] У деяких варіантах реалізації, істивна композиція додатково містить один або більше емульгаторів. У харчовій промисловості зазвичай як емульгатори присутні емульгатори на основі калію та натрію. Емульгатори на основі натрію включають, наприклад, натрієві солі жирних кислот, альгінат натрію, алюмофосфат натрію, казеїнат натрію, метафосфат натрію, фосфат натрію (двоосновний), фосфат натрію (одноосновний), фосфат натрію (трьохосновний), поліфосфат натрію, пірофосфат натрію, натрій стеароїллактат. Емульгатори на основі калію включають, наприклад, калієві солі жирних кислот, альгінат калію, цитрат калію, фосфат калію (двоосновний), фосфат калію (одноосновний), фосфат калію (трьохосновний), калію поліфосфат, калію поліметафосфат і пірофосфат калію. Відповідно, деякі варіанти реалізації даної сполуки включають заміну емульгатора на основі натрію емульгатором на основі калію і
45 додавання сполуки згідно з даним винаходом.

[0208] У деяких варіантах реалізації, істивна композиція додатково містить поверхнево-активну речовину для підвищення або зниження ефективності сполуки згідно з даним винаходом. Підходящі поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються перерахованими: нейонні поверхнево-активні речовини (наприклад, моно- і дигліцериди, складні ефіри жирних кислот, складні ефіри сорбіту, ефіри пропіленгліколів і ефіри молочної кислоти), аніонні поверхнево-активні речовини (наприклад, сульфосукцинати й лецитин) і каніонні поверхнево-активні речовини (наприклад, четвертинні солі амонію).

60 [0209] У деяких варіантах реалізації, в яких істивні композиції додатково включають

консервант, зазначений консервант продовжує строк придатності їстівної композиції. Підходящі консерванти включають, але не обмежуються перерахованими: аскорбінова кислота, бензойна кислота, бутил-п-гідроксибензоат, бензоат кальцію, етилендіамінтетраацетат кальцію-натрію, гідросульфід гідрат кальцію, пропіонат кальцію, сорбат кальцію, хітозан, мідний купорос, 5 дегідрооцтова кислота, диетил пірокарбонат, диметил дикарбонат, динатрій ЕДТК, Е-полілізін гліцин, еріторбова кислота, етил р-гідроксибензоат, мурашина кислота, гваякова смола, гептилпарабен, хінокитіол, ізобутил параоксибензоат, екстракт японського бензойного бальзаму, метилпарабен, екстракт білка риби'ячої молоки, натаміцин, нізін, екстракт пептину, 2-фенілфенол, піраміцин, ацетат калію, бензоат калію, лактат калію, метабісульфіт калію, нітрат калію, нітрит калію, піросульфід калію, сорбат калію, сульфід калію, пропіонова кислота, пропіл р-гідроксибензоат, пропіл р-оксибензоат, пропілен оксид, пропілпарабен, бензоат натрію, бісульфіт натрію, дегідроацетат натрію, диацетат натрію, еріторбат натрію, гідросульфід гідрит натрію, гіпофосфіт натрію, гіпосульфід натрію, метабісульфіт натрію, нітрат натрію, нітрит натрію, о-фенілфенол натрію, пропіонат натрію, піросульфід натрію, сульфід натрію, тіоціанат 15 натрію, сорбінова кислота й сірки діоксид. У деяких варіантах реалізації, консервант має кислий присмак.

[0210] У деяких варіантах реалізації, композиція може додатково включати один або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступних речовин: агенти, що підвищують текучість, емульгатори, цукри, амінокислоти, інші нуклеотиди і органічні солі натрію 20 та калію, такі як цитрати і тертрати. Такі додаткові інгредієнти можуть додавати присмак або сприяти перемішуванню, переробці чи текучим властивостям їстівної композиції.

[0211] У деяких варіантах реалізації, швидкість вивільнення сполуки згідно з даним винаходом є регульованою. Швидкість вивільнення сполуки згідно з даним винаходом може змінюватися за допомогою, наприклад, зміни її розчинності у воді. Стрімкого вивільнення можна 25 досягти, поміщаючи сполуку згідно з даним винаходом у капсулу з матеріалом, який має високу розчинність у воді. Відкладеного вивільнення сполуки згідно з даним винаходом можна досягти, поміщаючи сполуку згідно з даним винаходом у капсулу з матеріалом, який має низьку розчинність у воді. Сполуку згідно з даним винаходом можна поміщати в капсулу з карбогідратами або маскуючими смаковими добавками, такими як підсолоджувачі. Швидкість вивільнення сполуки згідно з даним винаходом може також регулюватися ступенем капсулювання. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом є повністю інкапсульованою. У інших варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом є частково інкапсульованою. У деяких варіантах реалізації, швидкість вивільнення регулюється так, щоб вивільнення відбувалося з кислою смаковою добавкою.

[0212] Їстівні композиції згідно з даним винаходом готують згідно з технологією, добре відомою в даній області. У загальному випадку, їстівну композицію за даним винаходом готують, змішуючи компонент або інгредієнт їстівної композиції зі сполукою згідно з даним винаходом. У альтернативному варіанті, сполука згідно з даним винаходом може бути додана безпосередньо до їстівної композиції. У деяких варіантах реалізації, одночасно або послідовно зі сполукою за 40 даним винаходом додають кислоту смакову добавку. У випадку послідовного додавання, кислота смакова добавка може бути додана до або після сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0213] Кількість сполуки згідно з даним винаходом і кількість речовини, що має гіркий смак, які використовуються в їстівній композиції, залежать від різних факторів, включаючи бажане або прийнятне відчуття гіркоти, солоності або солодкості. Кількість може залежати від природи їстівної композиції, конкретної сполуки, що додається, речовини, що має гіркий смак, інших сполук, що є присутніми в композиції, способу приготування (включаючи ступінь нагрівання, 50 який використовується) і рН їстівної композиції. Зрозуміло, що фахівець у даній області знає, як визначити кількості, необхідні для одержання бажаного смаку (смаків).

[0214] Звичайна сполука згідно з даним винаходом може бути присутньою в їстівній композиції в концентрації в діапазоні між приблизно 0,001 ppm і 1000 ppm. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція містить приблизно від 0,005 до 500 ppm; від 0,01 до 100 ppm; від 55 0,05 до 50 ppm; від 0,1 до 5 ppm; від 0,1 до 10 ppm; від 1 до 10 ppm; від 1 до 30 ppm; від 1 до 50 ppm; від 10 до 30 ppm; від 10 до 50 ppm; або від 30 до 50 ppm сполуки згідно з даним винаходом. У інших варіантах реалізації, їстівна композиція містить приблизно від 0,1 до 30 ppm, від 1 до 30 ppm або від 1 до 50 ppm сполуки згідно з даним винаходом. У додаткових варіантах реалізації, їстівна композиція містить приблизно від 0,1 до 5 ppm; від 0,1 до 4 ppm; від 60 0,1 до 3 ppm; від 0,1 до 2 ppm; від 0,1 до 1 ppm; від 0,5 до 5 ppm; від 0,5 до 4 ppm; від 0,5 до 3

ppm; від 0,5 до 2 ppm; від 0,5 до 1,5 ppm; від 0,5 до 1 ppm; від 5 до 15 ppm; від 6 до 14 ppm; від 7 до 13 ppm; від 8 до 12 ppm; від 9 до 11 ppm; від 25 до 35 ppm; від 26 до 34 ppm; від 27 до 33 ppm; від 28 до 32 ppm; або від 29 до 31 ppm.

[0215] У інших варіантах реалізації, їстівна композиція містить приблизно 0,1 ppm, приблизно 0,5 ppm, приблизно 1 ppm, приблизно 2 ppm, приблизно 3 ppm, приблизно 4 ppm, приблизно 5 ppm, приблизно 6 ppm, приблизно 7 ppm, приблизно 8 ppm, приблизно 9 ppm або приблизно 10 ppm сполуки згідно з даним винаходом. У інших варіантах реалізації, їстівна композиція містить приблизно 11 ppm, приблизно 12 ppm, приблизно 13 ppm, приблизно 14 ppm, приблизно 15 ppm, приблизно 16 ppm, приблизно 17 ppm, приблизно 18 ppm, приблизно 19 ppm, приблизно 20 ppm, приблизно 21 ppm, приблизно 22 ppm, приблизно 23 ppm, приблизно 24 ppm, приблизно 25 ppm, приблизно 26 ppm, приблизно 27 ppm, приблизно 28 ppm, приблизно 29 ppm або приблизно 30 ppm сполуки згідно з даним винаходом.

[0216] У інших варіантах реалізації, їстівна композиція містить приблизно 31 ppm, приблизно 32 ppm, приблизно 33 ppm, приблизно 34 ppm, приблизно 35 ppm, приблизно 36 ppm, приблизно 37 ppm, приблизно 38 ppm, приблизно 39 ppm, приблизно 40 ppm, приблизно 41 ppm, приблизно 42 ppm, приблизно 43 ppm, приблизно 44 ppm, приблизно 45 ppm, приблизно 46 ppm, приблизно 47 ppm, приблизно 48 ppm, приблизно 49 ppm або приблизно 50 ppm сполуки згідно з даним винаходом.

[0217] У інших варіантах реалізації, їстівна композиція містить більше, ніж приблизно 0,5 ppm, 1 ppm, 5 ppm, 10 ppm, 15 ppm, 20 ppm, 25 ppm або 30 ppm сполуки згідно з даним винаходом, аж до, наприклад, приблизно 30 ppm або 50 ppm. У додаткових варіантах реалізації, їстівна композиція містить менше, ніж приблизно 50 ppm, 30 ppm, 25 ppm, 20 ppm, 15 ppm, 10 ppm, 5 ppm, 1 ppm або 0,5 ppm сполуки згідно з даним винаходом. У інших додаткових варіантах реалізації, їстівна композиція містить менше, ніж приблизно 30 ppm, 10 ppm або 1 ppm сполуки згідно з даним винаходом.

[0218] Якщо їстівна композиція містить KCl, кількість KCl варіює в залежності від природи їстівної композиції, бажаної інтенсивності сприйняття солоного смаку й присутності інших сполук у композиції. У деяких варіантах реалізації, KCl є присутнім у концентрації в діапазоні приблизно 0,001-5 % мас./мас.; 0,01-5 % мас./мас.; 0,1-5 % мас./мас.; 0,1-5 % мас./мас.; 0,5-4,8 % мас./мас.; 0,5-4 % мас./мас.; 0,5-3 % мас./мас.; 0,75-3 % мас./мас.; 1-2,5 % мас./мас.; або 1-2 % мас./мас. У деяких варіантах реалізації, KCl є присутнім у концентрації, яка дорівнює приблизно 0,5 % мас./мас., приблизно 1 % мас./мас., приблизно 1,5 % мас./мас., приблизно 2 % мас./мас., приблизно 2,5 % мас./мас., приблизно 3 % мас./мас., приблизно 3,5 % мас./мас., приблизно 4 % мас./мас., приблизно 4,5 % мас./мас. або приблизно 5 % мас./мас. У деяких варіантах реалізації, KCl є присутнім у концентрації до приблизно 0,5 % мас./мас., до приблизно 1 % мас./мас., до приблизно 1,5 % мас./мас., до приблизно 2 % мас./мас., до приблизно 2,5 % мас./мас., до приблизно 3 % мас./мас., до приблизно 3,5 % мас./мас., до приблизно 4 % мас./мас., до приблизно 4,5 % мас./мас. або до приблизно 5 % мас./мас. У деяких варіантах реалізації, KCl є присутнім у концентрації, яка дорівнює приблизно 2 % мас./мас.

[0219] У деяких варіантах реалізації, KCl додають до їстівної композиції в формі замітника – солі в кількості, достатній для заміни NaCl. Наприклад, кількість KCl у їстівній композиції може варіювати від приблизно 0,5 до приблизно 1,5 кількості NaCl, який замінюється, в залежності від застосування, наприклад, якщо замінюють приблизно 0,5 мг NaCl, додають приблизно від 0,25 до приблизно 0,75 мг KCl. Зазвичай KCl додають у тій же кількості за масою, що і NaCl, який замінюється.

[0220] Аналогічно, якщо їстівна композиція містить лактат калію, кількість лактату калію, яка додається, варіює в залежності від природи їстівної композиції, необхідного ступеня консервації та присутності інших сполук у композиції. Лактат калію може бути присутнім у концентрації в діапазоні приблизно 0,001-5 % мас./мас.; 0,01-5 % мас./мас.; 0,1-5 % мас./мас.; 0,5-4,8 % мас./мас.; 0,5-4 % мас./мас.; 0,5-3 % мас./мас.; 0,75-3 % мас./мас.; 1-2,5 % мас./мас.; або 1-2 % мас./мас.

[0221] У деяких варіантах реалізації, лактат калію додають до їстівної композиції в кількості, достатній для заміни лактату натрію. Наприклад, кількість лактату калію в їжі або напої після додавання лактату натрію може варіювати від приблизно 0,5 до приблизно 1,5 кількості лактату натрію, який замінюється, в залежності від застосування, наприклад, якщо замінюють приблизно 0,5 мг лактату натрію, додають від приблизно 0,25 до приблизно 0,75 мг лактату калію. Зазвичай лактат калію додають у тій же кількості за масою, що і лактат натрію, який замінюється.

[0222] Далі, якщо їстівна композиція містить штучний підсолоджувач, такий як Ацесульфам К, кількість підсолоджувача, який додається, варіює в залежності від природи їстівної

композиції, необхідного ступеня солодкості та присутності інших сполук у композиції. Ацесульфам К, наприклад, може бути присутнім у концентрації в діапазоні приблизно 1-200 ppm, 10-200 ppm, 50-150 ppm, 50-125 ppm, 75-125 ppm і 75-100 ppm, переважно в кількості приблизно 75 ppm.

5 [0223] У деяких варіантах реалізації, штучний підсолоджувач додають до їстівної композиції в кількості, достатній для заміни цукру. У деяких варіантах реалізації, зазначений штучний підсолоджувач має гіркий смак або післясмак. У деяких варіантах реалізації, зазначений штучний підсолоджувач являє собою Ацесульфам К. Наприклад, кількість Ацесульфаму К в їстівній композиції може варіювати від приблизно 0,001 до приблизно 0,01 кількості цукру, який заміняється, в залежності від застосування, наприклад, якщо заміняють приблизно 100 мг цукру, додають від приблизно 0,1 до приблизно 1 мг Ацесульфаму К. Зазвичай Ацесульфам К додають у кількості приблизно 0,005 кількості цукру, який заміняється.

10 [0224] У деяких варіантах реалізації, їстівні композиції упаковують. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція упакована без індивідуальної тари, у цьому випадку упаковка містить більше композиції, ніж зазвичай використовується для однієї страви або порції їжі чи напою. Такі масові упаковки можуть бути виконані в формі паперових, пластикових чи тканинних мішків або картонних коробок чи ємностей. Такі масові упаковки можуть бути оснащені пластиковими або металевими носиками, які полегшують розподіл їстівної композиції.

15 [0225] У деяких варіантах реалізації, упаковка містить композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом, яка має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, яка містить сполуку згідно з даним винаходом, і сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом, і сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом і сіль калію. У деяких варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом і KCl. У інших варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом і лактат калію. У деяких варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом, сіль калію та сіль натрію. У інших варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом KCl і NaCl. У інших варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом, лактат калію та лактат натрію. У інших варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом, Ацесульфам К і цукор. У інших варіантах реалізації, упаковка містить їстівну композицію, що містить сполуку згідно з даним винаходом, лактат калію, KCl і NaCl.

20 [0226] У деяких варіантах реалізації, їстівні композиції згідно з даним винаходом являють собою композиції, придатні для використання як приправи, інгредієнти продуктів харчування та добавок. У таких варіантах реалізації, їстівна композиція може містити або не містити речовину, що має гіркий смак. Наприклад, їстівна композиція придатна для застосування в, наприклад, приправі, що містить речовину, що має гіркий смак, таку як, наприклад, KCl. Такі приправи можна застосовувати замість столової солі (тобто NaCl) для надання смаку готовим продуктам харчування. У альтернативному варіанті, їстівна композиція придатна для застосування в, наприклад, приправі, яка не містить речовин, що мають гіркий смак. Такі приправи можна використовувати для надання смаку готовим продуктам харчування, які містять речовину, що має гіркий смак (або присутню спочатку, або додану в процесі приготування), для зниження гіркого смаку, пов'язаного з речовиною, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою приправу, що містить KCl і сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою приправу, що містить KCl, NaCl і сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, приправа додатково містить пряність або суміш прянощів.

25 [0227] У альтернативному варіанті, їстівні композиції можна застосовувати в медичних або гігієнічних цілях, наприклад, у милі, шампунях, полосканнях для рота, ліках, фармацевтичних продуктах, сиропах від кашлю, назальних спреях, зубних пастах, стоматологічних клеях, засобах для відбілювання зубів, клеях (наприклад, на марках або конвертах) і отруйних речовинах, які використовуються для боротьби з комахами і гризунами.

30 Продукт харчування

35 [0228] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. Згідно з такими варіантами реалізації, продукт харчування містить (a) харчовий продукт; і (b) сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa),

Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук.

5 [0229] У деяких варіантах реалізації, продукт харчування додатково містить речовину, що має гіркий смак, описану тут. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію, таку як KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl.

[0230] У деяких варіантах реалізації, продукт харчування додатково містить один або більше додаткових модифікаторів смаку.

10 [0231] У деяких варіантах реалізації, продукт харчування додатково містить один або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини, ароматизатори або додаткові модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Фармацевтична композиція

15 [0232] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. Згідно з такими варіантами реалізації, фармацевтична композиція містить (a) фармацевтично активний інгредієнт, що має гіркий смак; і (b) сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII),
20 Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук.

[0233] Згідно з деякими варіантами реалізації, фармацевтична композиція може містити
25 будь-який фармацевтично активний інгредієнт, що має гіркий смак. Необмежуючі приклади гірких фармацевтичних сполук включають: ацетамінофен, ампіцилін, азитроміцин, хлорфенірамін, циметидин, декстрометорфан, дифенгідрамін, еритроміцин, ібупрофен, пеніцилін, фенілбутазон, псевдоефедрин, ранітидин, статини спіронолактонового ряду (включаючи, але не обмежуючись перерахованими: аторвастатин, цеірвастатин, флювастатин,
30 лоувастатин, мевастатин, пітавастатин, правастатин, розувастатин та сімвастатин) і теофілін.

[0234] У інших варіантах реалізації, винахід забезпечує фармацевтичну композицію, яка містить (a) фармацевтично активний інгредієнт; (b) сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX),
35 Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук; і (c) речовину, що має гіркий смак. У таких варіантах реалізації, фармацевтичні композиції можуть містити будь-який фармацевтично активний інгредієнт.

40 [0235] У інших варіантах реалізації, винахід забезпечує фармацевтичну композицію, яка містить (a) фармацевтично активний інгредієнт; (b) сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX),
45 Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук; і (c) сіль калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl.

[0236] У деяких варіантах реалізації, фармацевтична композиція додатково містить один або
50 більше додаткових модифікаторів смаку.

[0237] У деяких варіантах реалізації, фармацевтична композиція додатково містить один або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини, ароматизатори або додаткові модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

55 Споживчий продукт

[0238] У деяких варіантах реалізації, їстівні композиції являють собою споживчий продукт. Згідно з такими варіантами реалізації, споживчий продукт містить (a) речовину, що має гіркий смак, і (b) сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'),
60 Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI),

Формули (XIa), Формули (XIb), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук.

[0239] Згідно з іншим варіантом реалізації, винахід забезпечує споживчий продукт, який містить (а) сіль калію; і (b) сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl.

[0240] У інших варіантах реалізації, винахід забезпечує споживчий продукт для зниження гіркого смаку речовини, що має гіркий смак, причому зазначений споживчий продукт містить сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою KCl.

[0241] У деяких варіантах реалізації, споживчий продукт додатково містить один або більше додаткових модифікаторів смаку.

[0242] У деяких варіантах реалізації, споживчий продукт додатково містить один або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини, ароматизатори або додаткові модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб приготування їстівної композиції

[0243] Згідно з іншим аспектом, даний винахід забезпечує спосіб приготування їстівної композиції. Спосіб включає: (а) готування придатного для вживання в їжу носія; і (b) додавання до зазначеного прийнятного для вживання в їжу носія (а) сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук, із придатним для вживання в їжу носієм. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом розчиняють перед етапом додавання (b).

[0244] У деяких варіантах реалізації, придатний для вживання в їжу носій у (а) за своєю природою має гіркий смак. У таких варіантах реалізації, придатний для вживання в їжу носій можливо містить речовину, що має гіркий смак, як невід'ємний інгредієнт. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль калію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою лактат калію.

[0245] У деяких варіантах реалізації, спосіб приготування їстівної композиції додатково включає: (с) додавання речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl. У деяких варіантах реалізації, речовину, що має гіркий смак, додають раніше, ніж сполуку згідно з даним винаходом. У інших варіантах реалізації, речовину, що має гіркий смак, додають пізніше, ніж сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, сполуки згідно з даним винаходом змішують зі сполукою, що має гіркий смак, і потім змішують із придатним для вживання в їжу носієм. У інших варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом змішують послідовно з придатним для вживання в їжу носієм і потім із речовиною, що має гіркий смак. У інших варіантах реалізації, сполуки згідно з даним винаходом змішують із сумішшю речовини, що має гіркий смак, і придатного для вживання в їжу носія.

[0246] У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом і речовину, що має гіркий смак, якщо вона присутня, змішують із придатним для вживання в їжу носієм. У інших варіантах реалізації, сполуку і речовину, що має гіркий смак, якщо вона присутня, напильють або наносять у вигляді покриття на придатний для вживання в їжу носій. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом нашаровують на вуглевод або сіль, інкапсулюють на солі або вуглеводі (сушіння розпиленням) або кристалізують разом із сіллю кальцію з одержанням "покриваючої" солі.

[0247] У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою лактат калію.

[0248] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить сіль натрію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить NaCl. У інших варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить лактат натрію. У інших варіантах реалізації, їстівна композиція додатково містить цукор.

[0249] У деяких варіантах реалізації, способи приготування їстівної композиції додатково включають додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку. У деяких варіантах реалізації, способи приготування їстівної композиції додатково включають додавання одного або більше додаткових модифікаторів смаку.

[0250] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

Спосіб приготування продукту харчування

[0251] Згідно з іншим аспектом, даний винахід забезпечує спосіб приготування їстівної композиції, причому їстівна композиція являє собою харчовий продукт. Спосіб включає: (a) готування харчового продукту; і (b) додавання до харчового продукту (a) сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb"), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінацій зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом додають у формі їстівної композиції, яка містить сполуку згідно з даним винаходом.

[0252] У деяких варіантах реалізації, харчовий продукт на етапі (a) за своєю природою має гіркий смак. У таких варіантах реалізації, харчовий продукт можливо містить речовину, що має гіркий смак, як невід'ємний інгредієнт. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль калію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою лактат калію.

[0253] У деяких варіантах реалізації, спосіб включає: (a) готування продукту харчування; і (b) додавання до продукту харчування зі стадії (a) їстівної композиції, яка містить сполуку Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb"), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом додають у формі їстівної композиції, яка містить сполуку згідно з даним винаходом.

[0254] У деяких варіантах реалізації, продукт харчування на етапі (a) містить речовину, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою лактат калію.

[0255] У деяких варіантах реалізації, спосіб приготування харчового продукту додатково

включає: (с) додавання речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію, таку як KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl. У деяких варіантах реалізації, речовину, що має гіркий смак, додають раніше, ніж сполуку згідно з даним винаходом. У інших варіантах реалізації, речовину, що має гіркий смак, додають пізніше, ніж сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом додають із речовиною, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом змішують із речовиною, що має гіркий смак, і потім змішують із харчовим продуктом або продуктом харчування. У інших варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом змішують послідовно з харчовим продуктом або продуктом харчування й потім із речовиною, що має гіркий смак. У інших варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом змішують із сумішшю речовини, що має гіркий смак, і харчового продукту або продукту харчування.

[0256] У деяких варіантах реалізації, сполуку і речовину, що має гіркий смак, якщо вона присутня, змішують із харчовим продуктом. У інших варіантах реалізації, сполуку і речовину, що має гіркий смак, якщо вона присутня, напилюють або наносять у вигляді покриття на харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом нашаровують на вуглевод або сіль, інкапсулюють на солі або вуглеводі (сушіння розпиленням) або кристалізують разом із сіллю кальцію з одержанням "покриваючої" солі.

[0257] У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою лактат калію.

[0258] У деяких варіантах реалізації, продукт харчування додатково містить сіль натрію. У деяких варіантах реалізації, продукт харчування додатково містить NaCl. У інших варіантах реалізації, продукт харчування додатково містить лактат натрію. У інших варіантах реалізації, продукт харчування додатково містить цукор.

[0259] У деяких варіантах реалізації, способи приготування продукту харчування додатково включають додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб приготування фармацевтичної композиції

[0260] Згідно з іншим аспектом, даний винахід забезпечує спосіб приготування їстівної композиції, причому їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. Спосіб включає: (а) готування фармацевтично активного інгредієнта; і (b) додавання до фармацевтично активного інгредієнта зі стадії (а) сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (Vlb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінацій зазначених сполук із фармацевтично активним інгредієнтом. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом додають у формі їстівної композиції, яка містить сполуку згідно з даним винаходом.

[0261] У деяких варіантах реалізації, фармацевтично активний інгредієнт на стадії (а) за своєю природою має гіркий смак. У таких варіантах реалізації, фармацевтично активний інгредієнт можливо містить речовину, що має гіркий смак, як невід'ємний інгредієнт. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак за своєю природою, являє собою сіль калію.

[0262] У деяких варіантах реалізації, спосіб приготування фармацевтичної композиції додатково включає: (с) додавання речовини, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl або лактат калію. У деяких варіантах реалізації, сіль калію являє собою KCl. У деяких варіантах реалізації, речовину, що має гіркий смак, додають раніше, ніж сполуку згідно з даним винаходом. У інших варіантах реалізації, речовину, що має гіркий смак, додають пізніше, ніж сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, речовину, що має гіркий смак, додають разом зі сполукою згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом змішують із речовиною, що має гіркий смак, і потім

змішують із фармацевтично активним інгредієнтом. У інших варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом змішують послідовно з фармацевтично активним інгредієнтом і потім із речовиною, що має гіркий смак. У інших варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом змішують із сумішшю речовини, що має гіркий смак, і фармацевтично активного інгредієнта.

5 [0263] У деяких варіантах реалізації, сполуку і речовину, що має гіркий смак, якщо вона присутня, змішують із фармацевтично активним інгредієнтом. У інших варіантах реалізації, сполуку і речовину, що має гіркий смак, якщо вона присутня, напильють або наносять у вигляді покриття на фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом інкапсують із фармацевтично активним інгредієнтом. У деяких варіантах реалізації, сполука згідно з даним винаходом має таку форму, що швидкість вивільнення прямо залежить від швидкості вивільнення речовини, що має гіркий смак.

10 [0264] У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою лактат калію.

20 [0265] У деяких варіантах реалізації, фармацевтична композиція додатково містить сіль натрію. У деяких варіантах реалізації, фармацевтична композиція додатково містить NaCl. У інших варіантах реалізації, фармацевтична композиція додатково містить лактат натрію. У інших варіантах реалізації, фармацевтична композиція додатково містить цукор.

25 [0266] У деяких варіантах реалізації, фармацевтична композиція додатково містить фармацевтично прийнятний носій. Фармацевтично прийнятні носії, які можна застосовувати в цих композиціях, включають, але не обмежуються перерахованими: іонообмінні сполуки, окис алюмінію, стеарат алюмінію, лецитин, сироваткові білки, такі як сироватковий альбумін людини, буферні речовини, такі як фосфати, гліцин, сорбінова кислота, сорбат калію, суміші неповних гліцеридів насичених жирних кислот рослинного походження, вода, солі або електроліти, такі як сульфат протаміну, гідрофосфат натрію, калію фосфат, хлорид натрію, солі цинку, колоїдний діоксид кремнію, магнію трисилікат, полівінілпіролідон, сполуки на основі целюлози, поліетиленгліколь, натрій карбоксиметилцелюлоза, поліакрилати, воски, блок-полімери поліетилен-поліоксипропілен, поліетиленгліколь і ланолін.

30 [0267] У деяких варіантах реалізації, способи приготування фармацевтичної композиції додатково включають додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

35 Спосіб зниження або усунення сприйняття гіркого смаку у суб'єкта

[0268] Згідно з іншим аспектом, даний винахід забезпечує спосіб зниження або усунення сприйняття гіркого смаку у суб'єкта. Спосіб включає застосування їстівної композиції, яка містить сполуку, що відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінації таких сполук, або будь-яку зі Сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук.

45 [0269] Спосіб можна застосовувати для зниження або усунення гіркого смаку в будь-якій їстівній композиції, включаючи харчові продукти, продукти харчування, фармацевтичні композиції та споживчі продукти. Їстівна композиція може бути представлена в будь-якій формі. У деяких варіантах реалізації, композиція представлена у формі, наприклад, жувальної гумки, таблетки, соусу, добавки, м'ясної м'якоті, м'ясної суспензії, пасти, суспензії, спреду, покриття, рідини, гелю, емульсії, гранул або приправи.

50 [0270] У деяких варіантах реалізації, їстівну композицію застосовують шляхом, наприклад, поміщення до ротової порожнини або проковтування. У деяких варіантах реалізації, їстівну композицію поміщають до ротової порожнини або проковтують раніше, ніж гіркий харчовий продукт, продукт харчування, фармацевтичну композицію або споживчий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівну композицію поміщають до ротової порожнини або проковтують одночасно з гірким харчовим продуктом, продуктом харчування, фармацевтичною композицією чи споживчим продуктом, або у вигляді окремої їстівної композиції, або шляхом введення до гіркого харчового продукту, фармацевтичної композиції або споживчого продукту. У деяких варіантах реалізації, їстівну композицію поміщають до ротової порожнини або проковтують пізніше, ніж гіркий харчовий продукт, продукт харчування, фармацевтичну композицію або

споживчий продукт. Наприклад, сполуку згідно з даним винаходом можна поєднувати з харчовим продуктом або їстівним продуктом для зниження гіркого смаку продукту харчування. У альтернативному варіанті, сполуку згідно з даним винаходом можна застосовувати, наприклад, у пастилках або жувальних гумках для застосування після контакту з гірким харчовим продуктом, продуктом харчування, фармацевтичною композицією або споживчим продуктом (наприклад, для зменшення або усунення гіркого післясмаку).

Спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції

[0271] Згідно з іншим варіантом реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції, такий як продукт харчування, фармацевтична композиція або споживчий продукт. У деяких варіантах реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості натрій-вмісної сполуки в їстівній композиції, такий як продукт харчування, фармацевтична композиція або споживчий продукт. У іншому варіанті реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості NaCl у їстівній композиції, такий як продукт харчування, фармацевтична композиція або споживчий продукт. У іншому варіанті реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції, такий як продукт харчування, фармацевтична композиція або споживчий продукт. У деяких варіантах реалізації, сіль натрію замінюють на ненатрієву сіль. У деяких варіантах реалізації, ненатрієва сіль являє собою сіль кальцію, сіль магнію або сіль калію. У деяких варіантах реалізації, ненатрієва сіль являє собою сіль калію.

[0272] У деяких варіантах реалізації, спосіб включає: (a) заміну деякої кількості солі натрію, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість солі калію; і (b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (Vlb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук. У деяких варіантах реалізації, сполуку згідно з даним винаходом додають у формі їстівної композиції, яка містить сполуку згідно з даним винаходом.

[0273] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції включає наступні етапи: (a) приймання внутрішньо першої їстівної композиції, в якій деяка кількість солі натрію замінена на деяку кількість солі калію; і (b) приймання внутрішньо другої їстівної композиції, яка містить сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо раніше, ніж другу їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо пізніше, ніж другу їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо одночасно з другою їстівною композицією.

[0274] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0275] У деяких варіантах реалізації, сіль калію додають до їстівної композиції перед додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, сіль калію додають до їстівної композиції після додавання ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, сіль калію додають до їстівної композиції одночасно з додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом.

[0276] У деяких варіантах реалізації, кількість натрію, який замінюється в їстівній композиції на етапі (a), являє собою кількість, достатню для підтримання або відновлення здоров'я суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість натрію, який замінюється в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для зниження гіпертензії у суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість натрію, який замінюється на калій у їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для зміни структури або температури замерзання їстівної композиції. У деяких варіантах реалізації, кількість натрію, який замінюється, становить до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу.

[0277] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), зменшує сприйняття гіркого смаку у суб'єкта. Гіркий смак зменшується повністю або частково. У деяких варіантах реалізації, сприйняття солоного смаку зберігається.

[0278] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %.

20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 % кількості натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 25 % кількості натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. У інших варіантах реалізації кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 50 % кількості натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. У інших варіантах реалізації кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 75 % кількості натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій. У інших варіантах реалізації кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 100 % кількості натрію, присутнього в їстівній композиції, на калій.

[0279] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

[0280] У деяких варіантах реалізації, спосіб включає: (a) заміну деякої кількості NaCl, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість KCl; і (b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук.

[0281] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції включає наступні етапи: (a) приймання внутрішньо першої їстівної композиції, в якій деяка кількість NaCl заміненена на деяку кількість KCl; і (b) приймання внутрішньо другої їстівної композиції, яка містить сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо раніше, ніж другу їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо пізніше, ніж другу їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо одночасно з другою їстівною композицією.

[0282] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0283] У деяких варіантах реалізації, KCl додають до їстівної композиції перед додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, KCl додають до їстівної композиції після додавання ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, KCl додають до їстівної композиції одночасно з додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом.

[0284] У деяких варіантах реалізації, кількість NaCl, який замінюється на KCl, у їстівній композиції на етапі (a), являє собою кількість, достатню для підтримування або відновлення здоров'я суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, NaCl, який замінюється на KCl у їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для зниження гіпертензії у суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, NaCl, який замінюється на KCl у їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для зміни структури або температури замерзання їстівної композиції. У деяких варіантах реалізації, кількість NaCl, який замінюється на KCl, становить до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу.

[0285] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), зменшує сприйняття гіркого смаку у суб'єкта. Гіркий смак зменшується повністю або частково. У деяких варіантах реалізації, сприйняття солоного смаку зберігається.

[0286] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 % кількості NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 25 % кількості NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою

для забезпечення заміни до 50 % кількості NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 75 % кількості NaCl, присутнього в їстівній композиції, на KCl. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для

[0287] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості NaCl у їстівній композиції або продукті харчування включає збереження солоного смаку.

[0288] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості NaCl у їстівній композиції додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

[0289] У інших варіантах реалізації, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції або продукті харчування включає: (a) заміну деякої кількості лактату натрію, присутньої в продукті харчування, на деяку кількість лактату калію; і (b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінацій зазначених сполук.

[0290] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції включає наступні етапи: (a) приймання внутрішньо першої їстівної композиції, в якій деяка кількість лактату натрію замінена на деяку кількість лактату калію; і (b) приймання внутрішньо другої їстівної композиції, яка містить сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо раніше, ніж другу їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо пізніше, ніж другу їстівну композицію. У деяких варіантах реалізації, першу їстівну композицію приймають внутрішньо одночасно з другою їстівною композицією.

[0291] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0292] У деяких варіантах реалізації, лактат калію додають до їстівної композиції перед додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, лактат калію додають до їстівної композиції після додавання ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, лактат калію додають до їстівної композиції одночасно з додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом.

[0293] У деяких варіантах реалізації, кількість лактату натрію, замінена на лактат калію в їстівній композиції на етапі (a), являє собою кількість, достатню для підтримування або відновлення здоров'я суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість лактату натрію, замінена на лактат калію в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для зниження гіпертензії у суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість лактату натрію, замінена на лактат калію в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для зміни структури або температури замерзання їстівної композиції. У деяких варіантах реалізації, кількість лактату натрію, заміненого на лактат калію, становить до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу.

[0294] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), зменшує сприйняття гіркого смаку у суб'єкта. Гіркий смак зменшується повністю або частково. У деяких варіантах реалізації, сприйняття солоного смаку зберігається.

[0295] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 % кількості лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 25 % кількості лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 50 % кількості

лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 75 % кількості лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 100 % кількості лактату натрію, присутнього в їстівній композиції, на лактат калію.

[0296] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції або продукт харчування включає консервацію продукту харчування.

[0297] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції

[0298] Згідно з іншим варіантом реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції. У деяких варіантах реалізації, спосіб включає: (a) заміну деякої кількості цукру, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість Ацесульфаму К; і (b) введення до їстівної композиції ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі Сполук 1-58, описаних вище, або комбінацій зазначених сполук.

[0299] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0300] У деяких варіантах реалізації, Ацесульфам К додають до їстівної композиції перед додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, Ацесульфам К додають до їстівної композиції після додавання ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, Ацесульфам К додають до їстівної композиції одночасно з додаванням ефективної кількості сполуки згідно з даним винаходом.

[0301] У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється в їстівній композиції на етапі (a), являє собою кількість, достатню для підтримування або відновлення здоров'я суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для забезпечення зниження ваги суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється на Ацесульфам К в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для полегшення ефектів або лікування захворювання, пов'язаного зі споживанням цукру або надлишковою вагою у суб'єкта (наприклад, діабет). У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється на Ацесульфам К, становить до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу.

[0302] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), знижує сприйняття гіркого смаку у суб'єкта. Гіркий смак зменшується повністю або частково. У деяких варіантах реалізації, сприйняття солодкого смаку зберігається.

[0303] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 % кількості цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 25 % кількості цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 50 % кількості цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 75 % кількості цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається на етапі (b), є достатньою для забезпечення заміни до 100 % кількості цукру, присутнього в їстівній композиції, на Ацесульфам К.

[0304] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції

включає збереження солодкого смаку.

[0305] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості цукру в їстівній композиції або продукті харчування додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб зниження споживання натрію суб'єктом

[0306] Згідно з іншим варіантом реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження споживання натрію суб'єктом. У деяких варіантах реалізації, спосіб включає етап надання їстівної композиції згідно з даним винаходом суб'єктові, причому всі натрієві солі або їх частина замінені на одну або більше ненатрієвих солей, і при цьому їстівна композиція містить сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, ненатрієва сіль являє собою сіль кальцію, сіль магнію або сіль калію. У деяких варіантах реалізації, зазначена ненатрієва сіль являє собою сіль калію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт. У деяких варіантах реалізації, сіль натрію являє собою NaCl, а сіль калію являє собою KCl. У деяких варіантах реалізації, сіль натрію являє собою лактат натрію, а сіль калію являє собою лактат калію.

[0307] У деяких варіантах реалізації, способи зниження споживання натрію суб'єктом додатково включають етап ідентифікації суб'єкта, що потребує застосування даного способу. Фахівець зможе ідентифікувати суб'єкта, що потребує зниження споживання натрію. Необмежуючі приклади таких суб'єктів включають суб'єктів, що страждають на одне або більше з наступних захворювань: гіпернатремія, гіпертензія, серцевосудинне захворювання, набряк, судоми, обумовлені набряком мозку, зневоднювання (викликане надлишковим потовиділенням, діареєю, захворюваннями сечовивідних шляхів або прийманням діуретиків), нецукровий діабет, синдром Конна та синдром Кушинга.

[0308] У деяких варіантах реалізації, кількість натрієвої солі, яка замінюється на калієву сіль у їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для підтримання або відновлення здоров'я суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість натрієвої солі, яка замінюється на калієву сіль у їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для зниження гіпертензії у суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість натрієвої солі, яка замінюється на калієву сіль у їстівній композиції, становить до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, щоденне споживання натрію суб'єктом менше 2500 мг/день, менше 2000 мг/день, менше 1500 мг/день, менше 1000 мг/день або менше 500 мг/день, за бажанням.

[0309] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки згідно з даним винаходом, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для зниження споживання натрію суб'єктом на величину до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання натрію суб'єктом на величину до 25 %. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання натрію суб'єктом на величину до 50 %. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання натрію суб'єктом на величину до 75 %. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання натрію суб'єктом на величину до 100 %.

[0310] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження споживання натрію суб'єктом додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб зниження споживання цукру суб'єктом

[0311] Згідно з іншим варіантом реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження споживання цукру суб'єктом. У деяких варіантах реалізації, спосіб включає етап надання їстівної композиції згідно з даним винаходом суб'єктові, причому весь цукор або частина цукру в їстівній композиції замінена на Ацесульфам К, і при цьому їстівна композиція містить сполуку згідно з даним винаходом. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий

продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0312] У деяких варіантах реалізації, способи зниження споживання цукру суб'єктом додатково включають етап ідентифікації суб'єкта, який потребує застосування даного способу. Фахівець зможе ідентифікувати суб'єкта, який потребує зниження споживання цукру. Необмежуючі приклади таких суб'єктів включають суб'єкти, що страждають на одне або більше з наступних захворювань: діабет, переддіабет, стійкість до інсуліну, ожиріння, надлишкова вага і гіперглікемія.

[0313] У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється на Ацесульфам К в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для підтримання або відновлення здоров'я суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється на Ацесульфам К в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для забезпечення зниження ваги суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється на Ацесульфам К в їстівній композиції, являє собою кількість, достатню для полегшення ефектів або лікування захворювання, пов'язаного зі споживанням цукру або надлишковою вагою у суб'єкта (наприклад, діабет). У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка замінюється на Ацесульфам К в їстівній композиції, становить до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, кількість цукру, яка щоденно споживається суб'єктом, є меншою за 250 г/день, меншою за 200 г/день, меншою за 175 г/день, меншою за 150 г/день, меншою за 125 г/день, меншою за 100 г/день, меншою за 75 г/день, меншою за 50 г/день або меншою за 25 г/день.

[0314] У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання суб'єктом цукру на величину до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання суб'єктом цукру на величину до 25 %. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання суб'єктом цукру на величину до 50 %. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання суб'єктом цукру на величину до 75 %. У інших варіантах реалізації, кількість сполуки, яка додається до їстівної композиції, є достатньою для забезпечення зниження споживання суб'єктом цукру на величину до 100 %.

[0315] У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження споживання цукру суб'єктом додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб зниження гіркого смаку їстівної композиції

[0316] Згідно з іншим варіантом реалізації, винахід забезпечує способи зниження гіркого смаку в їстівній композиції. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0317] У одному варіанті реалізації, спосіб включає: (а) додавання ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінацій зазначених сполук, до їстівної композиції, що забезпечує зменшення гіркого смаку.

[0318] У альтернативних варіантах реалізації, спосіб включає: (а) приймання внутрішньо ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-

58, описаних вище, або комбінацій зазначених сполук до, одночасно з або після їстівної композиції, що забезпечує зменшення гіркого смаку.

[0319] У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль калію, сіль магнію або сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль кальцію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою KCl. У інших варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, являє собою лактат калію. У деяких варіантах реалізації, речовина, що має гіркий смак, є невід'ємним компонентом у їстівній композиції, як, наприклад, у харчовому продукті, який має гіркий смак за своєю природою.

[0320] У деяких варіантах реалізації, гіркий смак зменшується на величину до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, гіркий смак зменшується на величину до 25 %. У інших варіантах реалізації, гіркий смак зменшується на величину до 50 %. У інших варіантах реалізації, гіркий смак зменшується на величину до 75 %. У інших варіантах реалізації, гіркий смак зменшується на величину до 100 %.

[0321] У деяких варіантах реалізації, спосіб зменшення гіркого смаку, пов'язаного з речовиною, що має гіркий смак, у їстівній композиції додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб консервації їстівної композиції

[0322] Згідно з іншим варіантом реалізації, даний винахід забезпечує спосіб консервації їстівної композиції або збільшення строку придатності їстівної композиції, який включає:

(a) готування їстівної композиції; і

(b) змішування з їстівною композицією, отриманою на етапі (a), консерванту та ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) згідно з даним описом чи комбінації зазначених сполук.

[0323] У іншому варіанті реалізації, спосіб консервації або збільшення строку придатності їстівної композиції включає:

(a) готування їстівної композиції; і

(b) змішування з їстівною композицією, отриманою на етапі (a), консерванту та ефективної кількості будь-якої зі Сполук 1-58 або комбінації зазначених сполук.

[0324] Згідно з даним винаходом, консервант може являти собою будь-який консервант, що має гіркий смак. У деяких варіантах реалізації, консервант на етапі (a) являє собою сіль калію. У деяких варіантах реалізації, консервант на етапі (a) являє собою лактат калію.

[0325] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0326] У деяких варіантах реалізації, спосіб консервації їстівної композиції додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку.

Спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції й одночасно консервації зазначеної їстівної композиції

[0327] Згідно з іншим варіантом реалізації, даний винахід забезпечує спосіб зниження кількості натрію в їстівній композиції й одночасно консервації зазначеної їстівної композиції. У деяких варіантах реалізації, спосіб включає заміну деякої кількості натрій-вмісного консерванту, присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість калій-вмісного консерванту і додавання ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV), Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінації зазначених сполук, або будь-якої зі Сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук.

[0328] У деяких варіантах реалізації, спосіб включає заміну деякої кількості лактату натрію,

присутньої в їстівній композиції, на деяку кількість лактату калію і додавання ефективної кількості сполуки Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb'), Формули (IIIb''), Формули (IV) Формули (Va), Формули (Vb), Формули (VIa), Формули (VIb), Формули (VIIa), Формули (VIIb), Формули (VIII), Формули (IX), Формули (X), Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb), Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), або комбінацій зазначених сполук, або будь-якої зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінацій зазначених сполук.

[0329] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0330] У деяких варіантах реалізації, ефективна кількість сполуки являє собою кількість, достатню для забезпечення зниження кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 1 %, 2 %, 3 %, 4 %, 5 %, 6 %, 7 %, 8 %, 9 %, 10 %, 15 %, 20 %, 25 %, 30 %, 35 %, 40 %, 45 %, 50 %, 55 %, 60 %, 65 %, 70 %, 75 %, 80 %, 85 %, 90 %, 95 % або 100 %. Дані кількості не є обмежувальними, і будь-які значення між зазначеними процентними значеннями також включені до об'єму винаходу. У деяких варіантах реалізації, ефективна кількість сполуки являє собою кількість, достатню для забезпечення зниження кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 25 %. У інших варіантах реалізації, ефективна кількість сполуки являє собою кількість, достатню для забезпечення зниження кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 50 %. У інших варіантах реалізації, ефективна кількість сполуки являє собою кількість, достатню для забезпечення зниження кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 75 %. У інших варіантах реалізації, ефективна кількість сполуки являє собою кількість, достатню для забезпечення зниження кількості лактату натрію, зазвичай присутньої в їстівній композиції, на величину до 100 %.

[0331] У деяких варіантах реалізації, спосіб зменшення гіркого смаку, пов'язаного з речовиною, що має гіркий смак, у їстівній композиції додатково включає додавання одного або більше додаткових компонентів, обраних із групи, яка складається з наступного: консерванти, поживні речовини або модифікатори смаку, які можуть не мати власного смаку. У деяких варіантах реалізації, спосіб зниження кількості лактату натрію в їстівній композиції з одночасною консервацією продукту харчування додатково включає додавання одного або більше додаткових модифікаторів смаку.

Спосіб інгібування рецептора гіркого смаку

[0332] Згідно з іншим варіантом реалізації, даний винахід забезпечує спосіб інгібування або зниження активації і/або сигналіну рецептора гіркого смаку. У деяких варіантах реалізації, спосіб включає здійснення контакту рецептора гіркого смаку зі сполукою, яка відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінаціями таких сполук, або будь-якою зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінаціями зазначених сполук.

[0333] У деяких варіантах реалізації, спосіб включає здійснення контакту рецептора гіркого смаку з композицією, яка містить сполуку, що відповідає Формулі (I), Формулі (IIa), Формулі (IIb), Формулі (IIIb), Формулі (IIIb'), Формулі (IIIb''), Формулі (IV), Формулі (Va), Формулі (Vb), Формулі (VIa), Формулі (VIb), Формулі (VIIa), Формулі (VIIb), Формулі (VIII), Формулі (IX), Формулі (X), Формулі (XI), Формулі (XIIa), Формулі (XIIb), Формулі (XIIIa), Формулі (XIIIb), Формулі (XIV), Формулі (XVa), Формулі (XVb) або Формулі (XVc), або комбінації таких сполук, або будь-яку зі сполук 1-58, описаних вище, або комбінації зазначених сполук.

[0334] У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою харчовий продукт. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою фармацевтичну композицію. У деяких варіантах реалізації, їстівна композиція являє собою споживчий продукт.

[0335] У деяких варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку являє собою *ex vivo* рецептор, який знаходиться, наприклад, у тест-системі. У деяких варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку являє собою *in vitro* рецептор, який знаходиться, наприклад, у тест-системі. У інших варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку являє собою *in vivo* рецептор, який знаходиться в організмі суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку знаходиться в ротовій порожнині або шлунково-кишковому тракті суб'єкта. У деяких варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку знаходиться в ротовій порожнині людини. У деяких варіантах реалізації, рецептор гіркого смаку знаходиться в ротовій порожнині тварини, що не є людиною. У деяких варіантах

реалізації, рецептор гіркої смаку знаходиться в ротовій порожнині модельної тварини.

Приготування сполук винаходу

[0336] У деяких варіантах реалізації, одна або більше сполук Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb') або Формули (IIIb''), як описано тут, є доступними для придбання, наприклад, із комерційних джерел, таких як ChemBridge Corporation of San Diego, California, USA; Sigma-Aldrich® of St. Louis, Missouri, USA; TCI America, Portland, Oregon, USA; i Acros Organics, Geel, Belgium; у числі інших.

[0337] У інших варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (I), Формули (IIa), Формули (IIb), Формули (IIIb), Формули (IIIb') або Формули (IIIb'') готують із доступних для придбання реагентів типовими способами синтетичної органічної хімії.

[0338] У одному з варіантів реалізації, одну або більше сполук Формули (I) або Формули (IIa), де X являє собою O, готують за допомогою нуклеофільного заміщення групи LG з A2, яка заміщується, феноксидним аніоном із A1, проведеного при основних умовах, для одержання ефірного продукту P1 (Схема I):

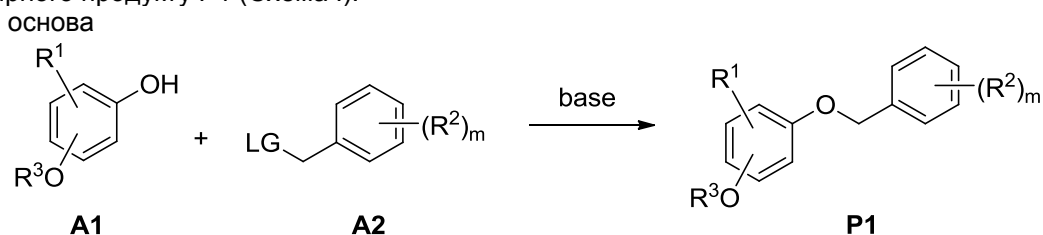


Схема I

[0339] Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області, такі як галогенід (наприклад, хлоро, бромо, йодо), трифлат, мезилат, тозилат тощо. Підходящі основи включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій і включають, але не обмежуються перерахованим нижче: гідроксиди лугів і лужноземельних металів (такі як NaOH, LiOH і т.д.), карбонати (такі як Na₂CO₃, K₂CO₃, CaCO₃ і т.д.) і бікарбонати (такі як NaHCO₃, KHCO₃ і т.д.). Інші підходящі основи включають амініні основи, такі як амоній, гідроксид амонію, триетиламін, піридин, піперидин, піролідин, 2,6-лутидин, 1,8-діазабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д.

утворення іміну

[0340] У іншому варіанті реалізації, одну або більше сполук Формули (I) або Формули (IIa), де X являє собою NR^a, а R^a відсутній, готують за допомогою реакції утворення іміну між феноламіном A3 і альдегідом A4 при умовах, відомих у даній області для одержання продукту P2, наприклад, при умовах використання зневоднюючих агентів, таких як молекулярні сита (Схема II):

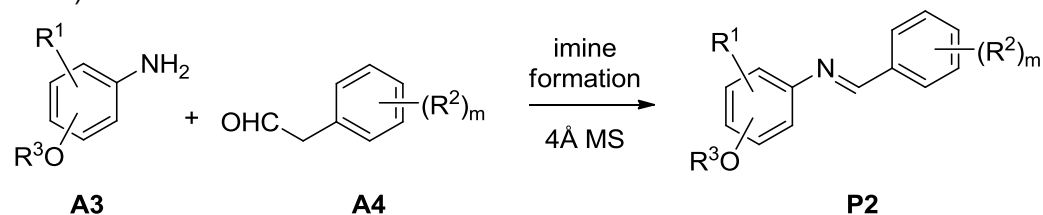


Схема II

[0341] У окремих варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (I) або Формули (IIb) готують за допомогою реакції відновлення іміну P2 для одержання аміну P3 (Схема III): відновл.

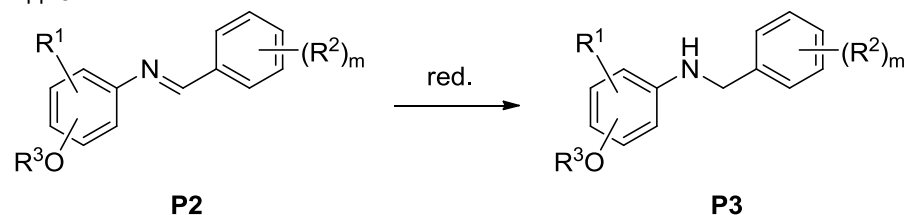
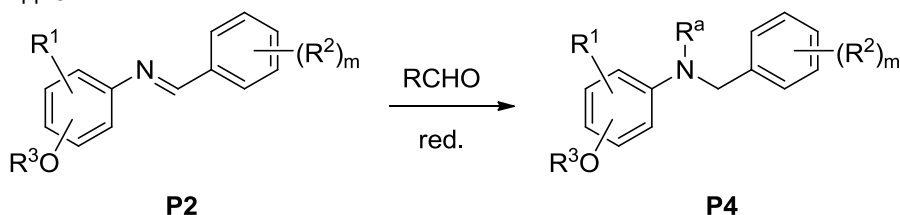


Схема III

[0342] Підходящі умови відновлення включають відомі в даній області умови для відновлення імінів та імінієвих йонів, такі як гідрогеноліз із воднем і паладієм, таким як паладій на вуглєці. Іншим підходящим джерелом водню є мурашина кислота.

[0343] У наступних варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (I), де X являє

собою NR^a , а R^a не відсутній, готують шляхом відновного алкілювання аміну P3 в присутності відповідного альдегіду $RCHO$ до форми продукту P4, де R^a є CH_2R (Схема IV):
відновл.



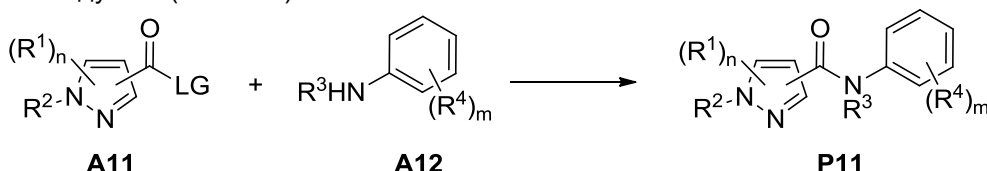
5 **Схема IV**

[0344] Підходящі умови відновного алкілювання включають відомі в даній області умови для відновлення імінів та імінієвих йонів, такі як гідрогеноліз із воднем і паладієм, таким як паладій на вуглеці. Іншим підходящим джерелом водню є мурашина кислота.

10 [0345] У деяких варіантах реалізації, одна або більше сполук Формули (IV), Формули (Va), Формули (Via), Формули (VIIa), Формули (Vb), Формули (VIb) або Формули (VIIb), як описано тут, є доступними для придбання, наприклад, із комерційних джерел, таких як ChemBridge Corporation of San Diego, California, USA; Sigma-Aldrich® of St. Louis, Missouri, USA; TCI America, Portland, Oregon, USA; і Acros Organics, Geel, Belgium; у числі інших.

15 [0346] У інших варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (IV) готують із доступних для придбання реагентів типовими способами синтетичної органічної хімії.

[0347] У одному з варіантів реалізації, одну або більше сполук Формули (IV) готують шляхом алкілювання аміну A12 ацильною сполукою A11, яка містить групу LG, що заміщається, для одержання аміду P11 (Схема V):



20 **Схема V**

[0348] Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області для реакцій алкілювання, такі як галогенід (наприклад, хлоро, бромо, йодо), алкокси, арилокси, активовані групи, що заміщаються, тощо. У деяких варіантах реалізації, умови алкілювання також використовують неорганічну або органічну основу. Підходящі основи включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій і включають, але не обмежуються перерахованим нижче: карбонати лугів і лужноземельних металів (такі як Na_2CO_3 , K_2CO_3 , $CaCO_3$ і т.д.) та бікарбонати (такі як $NaHCO_3$, $KHCO_3$ і т.д.). Інші підходящі основи включають апротонні амініні основи, такі як триетиламін, піридин, 2,6-лутидин, 1,8-дизабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д.

30 [0349] У одному визначеному варіанті реалізації, сполука A11 є галогенангідридом, таким як хлор- або бромангідрид, і реакція алкілювання протікає в присутності апротонної амініної основи, такої як триетиламін, піридин, 2,6-лутидин, 1,8-дизабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин.

35 [0350] Сполука A11 може бути приготована з відповідної карбоксильної кислоти з використанням звичайних способів, відомих у цій області.

40 [0351] У деяких варіантах реалізації, одна або більше сполук Формули (VIII), Формули (IX) або Формули (X), як описано тут, є доступними для придбання, наприклад, із комерційних джерел, таких як ChemBridge Corporation of San Diego, California, USA; Sigma-Aldrich® of St. Louis, Missouri, USA; TCI America, Portland, Oregon, USA; і Acros Organics, Geel, Belgium; у числі інших.

[0352] У інших варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (VIII), Формули (IX) або Формули (X) готують із доступних для придбання реагентів типовими способами синтетичної органічної хімії.

45 [0353] У одному з варіантів реалізації, одну або більше сполук Формули (VIII), Формули (IX) або Формули (X) готують за допомогою багатоетапної послідовності, яка починається з конденсування аміну A21 і арил- або гетероарил-альдегіду A22 для одержання іміну (коли як R^a позначений H у A21) або імінного йона (коли як R^a позначений не H у A21) P21, який потім піддається [4+2] циклоприєднанню з використанням циклічного алкену A23 з наступною реароматизацією для одержання конденсованої трициклічної системи P22 (Схема VI):

утворення іміну

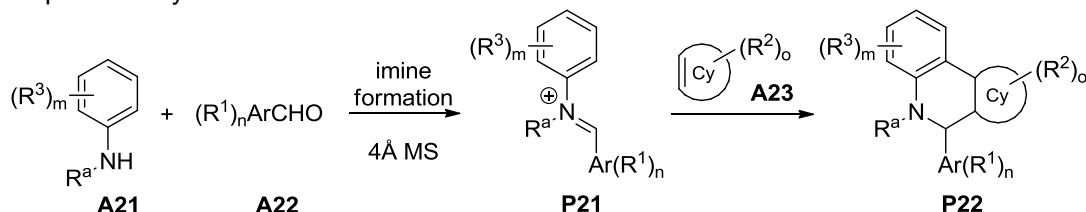


Схема VI

[0354] Підходящі умови для утворення іміну або імінного йона можуть використовувати зневоднюючі агенти, такі як молекулярні сита.

[0355] Підходящі умови циклоприєднання можуть включати нагрівання, наприклад, до як мінімум близько 50, 75, 100, 120, 150 °C або вище. У деяких варіантах реалізації, умови циклоприєднання включають використання кислот Льюїса, наприклад, борних сполук (наприклад, Bu_2BOTf або $BF_3 \cdot Et_2O$), сполук титану (наприклад, $TiCl_4$ або алкоксида титану), сполук алюмінію (наприклад, $AlCl_3$ або алкоксида алюмінію), сполук кремнію (наприклад, триалкілсиліл трифлати, такі як $TMS-OTf$, триалкілсиліл галогеніди і т.д.) тощо, особливо якщо кільце Cy є групою виведення електрона (наприклад, ефіри, кетони, альдегіди, ціано, нітро і т.д.) у спрєженні з олефіном Cy.

[0356] У певних випадках, реароматизація підтримується з використанням основи. Підходящі основи включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій і включають, але не обмежуються перерахованим нижче: гідроксиди лугів і лужноземельних металів (такі як $NaOH$, $LiOH$ і т.д.), карбонати (такі як Na_2CO_3 , K_2CO_3 , $CaCO_3$ і т.д.) і бікарбонати (такі як $NaHCO_3$, $KHCO_3$ і т.д.). Інші підходящі основи включають амінні основи, такі як амоній, гідроксид амонію, триетиламін, піридин, піперидин, піролідин, 2,6-лутидин, 1,8-діазабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д.

[0357] У одному визначеному варіанті реалізації, одну або більше сполук Формули (VIII), Формули (IX) або Формули (X) готують спочатку за допомогою утворення іміну або імінного йона P21, як зазначено вище, з наступним [4+2] циклоприєднанням циклопентадієну A24 і потім реароматизацією, як зазначено вище, для одержання конденсованої трициклічної системи P23 (Схема VII):

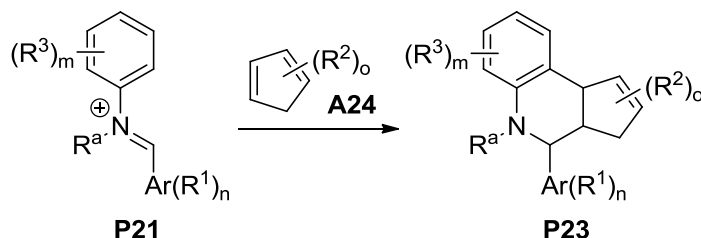


Схема VII

[0358] У деяких варіантах реалізації, одна або більше сполук Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa) або Формули (XIIIb), як описано тут, є доступними для придбання, наприклад, із комерційних джерел, таких як ChemBridge Corporation of San Diego, California, USA; Sigma-Aldrich® of St. Louis, Missouri, USA; TCI America, Portland, Oregon, USA; і Acros Organics, Geel, Belgium; у числі інших.

[0359] У інших варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (XI), Формули (XIIa), Формули (XIIb), Формули (XIIIa) або Формули (XIIIb) готують із доступних для придбання реагентів типовими способами синтетичної органічної хімії.

[0360] У одному з варіантів реалізації, одну або більше сполук Формули (XI), Формули (XIIa) або Формули (XIIIa) готують за допомогою заміщення групи LG, що заміщається, ариламіну A31 нуклеофільною групою гетероциклічної сполуки A32 для одержання продукту P31 (Схема VIII):

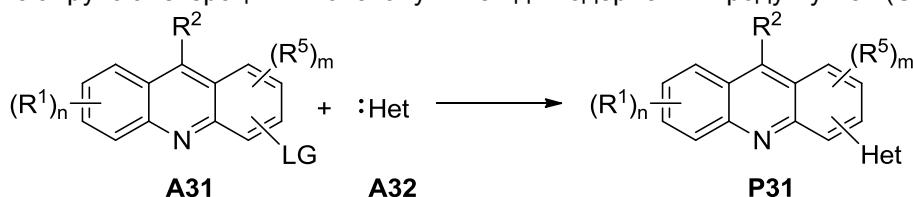


Схема VIII

[0361] Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій заміщення, такі як галогенід (наприклад, фторо, хлоро, бромо, йодо), алкокси, арилокси,

трифлат, мезилат, тозилат тощо. У деяких варіантах реалізації, умови заміщення також використовують неорганічну або органічну основу. Підходящі основи включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій і включають, але не обмежуються перерахованим нижче: гідроксиди лугів і лужноземельних металів (такі як NaOH, LiOH і т.д.), карбонати (такі як Na₂CO₃, K₂CO₃, CaCO₃ і т.д.) і бікарбонати (такі як NaHCO₃, KHCO₃ і т.д.). Інші підходящі основи включають аміні основи, такі як амоній, гідроксид амонію, триетиламін, піридин, піперидин, піролідін, 2,6-лутидин, 1,8-діазабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д. У деяких випадках, підходящі основи включають сильні основи такі як алкоксиди (такі як натрію або калію трет-бутоксид), літію діізопропіл амід (LDA), літію біс(триметилсиліл)амід (LiHMDS), натрію біс(триметилсиліл)амід (NaHMDS) тощо.

[0362] У одному визначеному варіанті реалізації, одну або більше сполук Формули (XI), Формули (XIIa) або Формули (XIIIa) готують за допомогою заміщення групи LG, що заміщається, ариламину A33 аміном гетероциклічної сполуки A34 при сильно основних умовах для одержання продукту P32 (Схема IX):

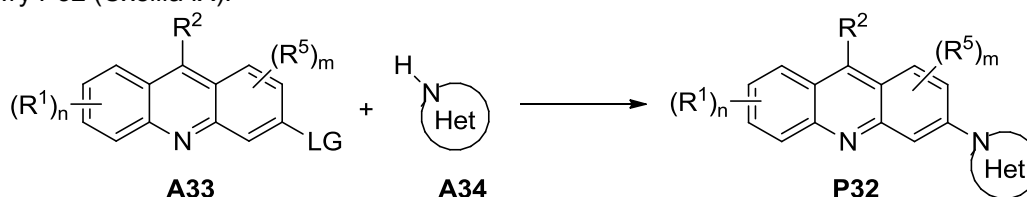


Схема IX

[0363] Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій заміщення, такі як галогенід (наприклад, фторо, хлоро, бромо, йодо), алкокси, арилокси, трифлат, мезилат, тозилат тощо. У деяких варіантах реалізації, підходящі основні умови використовують неорганічну або органічну основу. Підходящі сильні основи включають алкоксиди (такі як натрію або калію трет-бутоксид), літію діізопропіл амід (LDA), літію біс(триметилсиліл)амід (LiHMDS), натрію біс(триметилсиліл)амід (NaHMDS) тощо.

[0364] У іншому варіанті реалізації, одну або більше сполук Формули (XI), Формули (XIIb) або Формули (XIIIb) готують за допомогою заміщення групи LG, що заміщається, ариламину A35 нуклеофільною групою гетероциклічної сполуки A32 для одержання продукту P33 (Схема X):



Схема X

[0365] Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій заміщення, такі як галогенід (наприклад, хлоро, бромо, йодо), алкокси, арилокси, трифлат, мезилат, тозилат тощо. У деяких варіантах реалізації, умови заміщення також використовують неорганічну або органічну основу. Підходящі основи включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій і включають, але не обмежуються перерахованим нижче: гідроксиди лугів і лужноземельних металів (такі як NaOH, LiOH і т.д.), карбонати (такі як Na₂CO₃, K₂CO₃, CaCO₃ і т.д.) і бікарбонати (такі як NaHCO₃, KHCO₃ і т.д.). Інші підходящі основи включають аміні основи, такі як амоній, гідроксид амонію, триетиламін, піридин, піперидин, піролідін, 2,6-лутидин, 1,8-діазабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д. У деяких випадках, підходящі основи включають сильні основи, такі як алкоксиди (такі як натрію або калію трет-бутоксид), літію діізопропіл амід (LDA), літію біс(триметилсиліл)амід (LiHMDS), натрію біс(триметилсиліл)амід (NaHMDS) тощо.

[0366] У одному визначеному варіанті реалізації, одну або більше сполук Формули (XI), Формули (XIIb) або Формули (XIIIb) готують за допомогою заміщення групи LG, що заміщається, ариламину A35 аміном гетероциклічної сполуки A36 в основних умовах для одержання продукту P34 (Схема XI):

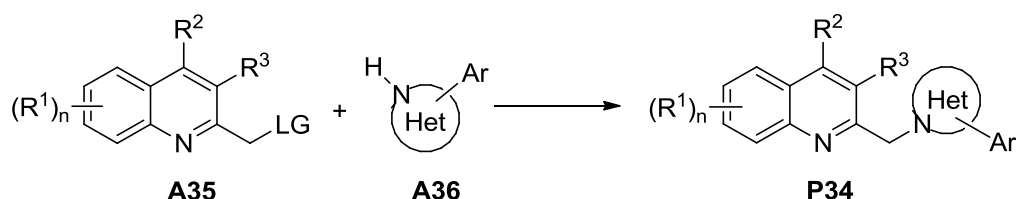


Схема XI

[0367] Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій заміщення, такі як галогенід (наприклад, хлоро, бромо, йодо), алкокси, арилокси, трифлат, мезилат, тозилат тощо. У деяких варіантах реалізації, підходящі основні умови використовують неорганічну або органічну основу. Підходящі основи включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій і включають, але не обмежуються перерахованим нижче: гідроксиди лугів і лужноземельних металів (такі як NaOH, LiOH і т.д.), карбонати (такі як Na₂CO₃, K₂CO₃, CaCO₃ і т.д.) і бікарбонати (такі як NaHCO₃, KHCO₃ і т.д.). Інші підходящі основи включають амініні основи, такі як амоній, гідроксид амонію, триетиламін, піридин, піперидин, піролідин, 2,6-лутидин, 1,8-дизабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д. У деяких випадках, підходящі основи включають сильні основи, такі як алкоксиди (такі як натрію або калію трет-бутоксид), літію діізопропіл амід (LDA), літію біс(триметилсиліл)амід (LiHMDS), натрію біс(триметилсиліл)амід (NaHMDS) тощо.

[0368] У деяких варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (XI), Формули (XIa), Формули (XIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb) або навіть сполуки A31, A33 або A35 готують за допомогою каталізованої перехідним металом реакції сполучення сполуки A37, яка містить групу LG, що заміщається, з метало- або боро-сполукою A38, де як М позначена металева або борна група, при підходящих умовах реакції сполучення, визнаних у даній області, для одержання продукту сполучення P35 (Схема XII):

ПМ
кат.

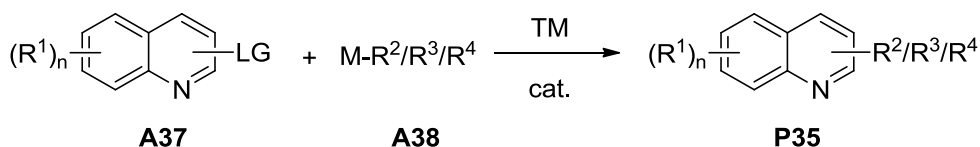


Схема XII

[0369] Інакше, одну або більше сполук Формули (XI), Формули (XIa), Формули (XIb), Формули (XIIIa), Формули (XIIIb) або навіть сполуки A31, A33 чи A35 готують за допомогою каталізованої перехідним металом реакції сполучення метало- або боро-сполуки A39, де як М позначена металева або борна група, зі сполукою A310, яка містить групу LG, що заміщається, в підходящих умовах реакції сполучення, визнаних у даній області, для одержання продукту сполучення P35 (Схема XIII):

ПМ
кат.

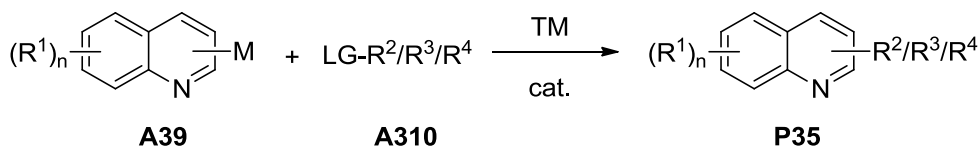


Схема XIII

[0370] Підходящі каталізатори на основі перехідних металів включають ті, що виготовлені на основі паладію, такі як Pd(PPh₃)₄, або інших благородних перехідних металів. Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області, такі як галогеніди (наприклад, хлоро, бромо, йодо), трифлати, мезилати, тозилати тощо. Підходящі металеві групи включають олово, цинк, магній, мідь або інші метали, здатні піддаватися реакції трансметалювання з паладієм або іншими благородними перехідними металами.

[0371] У окремих варіантах реалізації, заміщені сполуки хіноліну, такі як A35, A37, A39, P33, P34 і P35, можуть бути приготовані методами, визнаними в даній області, наприклад, такими як ті, що описані в патенті США № 6,297,258, включеному тут як посилання.

[0372] У деяких варіантах реалізації, одна або більше сполук Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc), як описано тут, є доступними для придбання, наприклад, із комерційних джерел, таких як ChemBridge Corporation of San Diego, California, USA; Sigma-Aldrich® of St. Louis, Missouri, USA; TCI America, Portland, Oregon, USA; і Acros Organics,

Geel, Belgium; у числі інших.

[0373] У інших варіантах реалізації, одну або більше сполук Формули (XIV), Формули (XVa), Формули (XVb) або Формули (XVc) готують із доступних для придбання реагентів типовими способами синтетичної органічної хімії.

- 5 [0374] У одному з варіантів реалізації, одну або більше сполук Формули (XIV) готують шляхом алкілювання аміну A41 ацильною сполукою A42, яка містить групу LG, що заміщається, для одержання продукту P41 (Схема I):

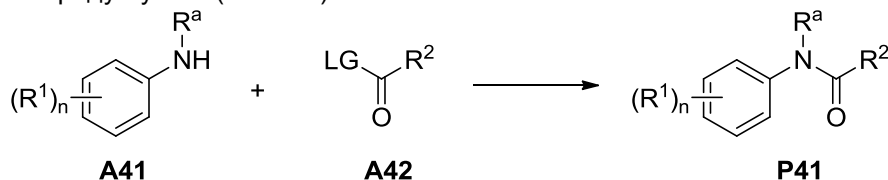


Схема XIV

- 10 [0375] Підходящі групи, що заміщаються, включають ті, які визнані в даній області для реакцій алкілювання, такі як галогенід (наприклад, хлоро, бромо, йодо), алкокси, арилокси, групи, що заміщаються, пов'язані з активованими ефірами (наприклад, N-сукцинамід) тощо. У окремих варіантах реалізації, ацильна сполука A42 є ангідридом кислоти; де як LG позначений -OC(O)R². У деяких варіантах реалізації, умови алкілювання також використовують неорганічну
- 15 або органічну основу. Підходящі основи включають ті, які визнані в даній області для таких реакцій, і включають, але не обмежуються перерахованим нижче: гідроксиди лугів і лужноземельних металів (такі як NaOH, LiOH і т.д.), карбонати (такі як Na₂CO₃, K₂CO₃, CaCO₃ і т.д.) і бікарбонати (такі як NaHCO₃, KHCO₃ і т.д.). Інші підходящі основи включають аміні
- 20 лутидин, 1,8-діазабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д.

[0376] У одному конкретному варіанті реалізації, сполука A42 є галогенангідридом, таким як хлор- або бромангідрид, і реакція алкілювання протікає в присутності амінової основи, такої як триетиламін, піридин, піперидин, піролідін, 2,6-лутидин, 1,8-діазабіциклоундец-7-ен (DBU), 4-(диметиламіно)-піридин і т.д.

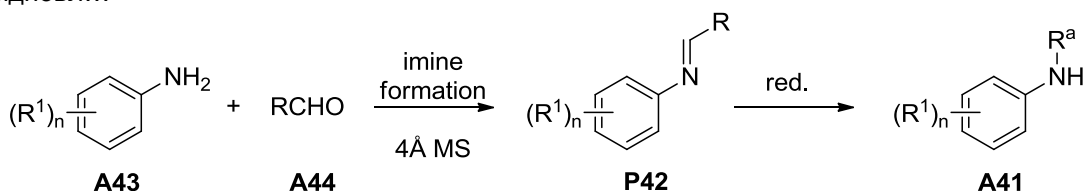
- 25 [0377] У іншому варіанті реалізації, сполука A42 є активованим ефіром, і ацилювання протікає в м'яких умовах, результатом яких не є утворення сильних кислот.

[0378] Сполука A42 може бути приготована з відповідної карбоксильної кислоти з використанням звичайних способів, відомих у цій області.

утворення іміну

- 30 [0379] У окремих варіантах реалізації, сполуку A41, де як R^a позначений CH₂R, готують за допомогою двоетапної послідовності, по-перше, за допомогою реакції утворення іміну між аміном A43 і альдегідом A44 для одержання іміну P42, по-друге, за допомогою реакції відновлення іміну P42 для одержання A41 (Схема XV):

відновл...



35

Схема XV

[0380] Підходящі умови для утворення іміну можуть використовувати зневоднюючі агенти, такі як молекулярні сита. Підходящі умови відновлення включають відомі в даній області умови для відновлення імінів та імінієвих йонів, такі як гідрогенізація із воднем і паладієм, таким як паладій на вуглі. Іншим підходящим джерелом водню є мурашина кислота.

40

[0381] Фахівці належним чином оцінять, що арильні і/або гетероарильні, алкенільні, алкінільні, аралкінільні, гетероаралкінільні, алільні та пропаргільні фрагменти тут можуть бути прямо піддані реакції сполучення Стіллі, Сузукі, Хека, Негісі, Соногасірі, Кумади, Гласера або іншим відповідним реакціям, таким як реакції паладій-опосередкованого перехресного сполучення. Арильні і/або гетероарильні фрагменти тут можуть також бути легко піддані реакції сполучення за допомогою гетероатома, наприклад, використовуючи реакції, такі як реакція Ульмана, будь-яка з різних паладій-опосередковуваних реакцій, розроблених С. Бухвальдом та іншими, за допомогою реакцій нуклеофільного ароматичного заміщення або інших таких реакцій. Таким же способом, аміни, спирти, тіоли та інші подібні гетероатом-несучі сполуки тут

45

50 можуть бути піддані реакції сполучення з арил і/або гетероарил фрагментами, використовуючи

паладій-опосередковані реакції, розроблені С. Бухвальдом та іншими, реакції нуклеофільного ароматичного заміщення і т.д. Арильні і/або гетероарильні фрагменти, пов'язані з вуглеводневими ланцюгами, тут можуть також бути приготовані за допомогою реакцій Стілле, Сузукі, Хека, Фрідель-Крафтса та інших реакцій, як буде очевидно фахівцеві в даній області.

5 [0382] Варто розуміти, що різні замісники в сполуках у описаних вище синтезах можуть бути захищені від реакційних умов, за необхідності використовуючи підходящі групи захисту, такі як ті, що розкрито в Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. Greene's Protective Groups in Organic Synthesis, 4th ed.; Wiley- Interscience: New York, 2006.

Приклади

10 [0383] Для більш повного розуміння запропонованих винаходів нижче наведені приклади. Ці приклади представлені винятково з ілюстративною метою, їх у жодному разі не слід розглядати як обмеження об'єму винаходу.

[0384] Досліджувані сполуки, які використовуються в наведених нижче прикладах, були отримані від комерційних постачальників синтетичних і природних сполук, включаючи Vitas, 15 ChemDiv, ChemBridge, Chromadex, Sigma Aldrich, Penta, Spectrum Chemical, Vigon та Indofine.

[0385] Був проведений скринінг учасників смакового експерименту, учасників відбирали за їхньою здатністю сприймати гіркий смак, пов'язаний із хлоридом калію. У описаних нижче смакових експериментах брали участь тільки експерти, здатні сприймати гіркий смак.

20 [0386] Внаслідок складної природи експериментів зі сприйняття смаку та їхнього неминуче суб'єктивного характеру, окремі випробування зі смаковими експериментами можуть давати різні результати для однієї сполуки. Дані, представлені в Прикладах нижче, ілюструють спостережувані результати смакових тестів. Слід зазначити, що дані, представлені на Фігурах, являють собою вибірки даних, представлених у Прикладах нижче.

25 [0387] Описані нижче смакові експерименти проводили з групами різних розмірів (тобто групи включали різне число учасників).

Приклад 1 Приготування досліджуваних розчинів KCl

30 [0388] Композиції їстівних розчинів KCl ("досліджувані розчини KCl") готували, розчиняючи спочатку різні кількості досліджуваних сполук у деякій кількості етанолу та води (в залежності від розчинності сполуки) з одержанням маткового розчину сполуки з концентрацією 5 мг/мл. Деяку кількість цього маткового розчину потім додають до водного розчину KCl. Потім до отриманої суміші матковий розчин сполуки/розчин KCl додають кількість EtOH, достатню для того, щоб кінцевий досліджуваний розчин KCl містив 1 % EtOH. Стандартні розчини KCl готували аналогічним чином, розчиняючи різні кількості KCl у воді та етанолі без додавання досліджуваної сполуки. Стандартні розчини NaCl готували аналогічним чином, розчиняючи різні 35 кількості NaCl у воді та етанолі без додавання досліджуваної сполуки (Стандартні розчини NaCl не містили KCl).

Таблиця 1.

Досліджувані розчини KCl

Сполука №	Конц. KCl	Конц. досліджуваної сполуки (ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку(ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку і $p \leq 0,1$ (ppm)
1	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1; 10
2	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1
3	4,85 г/л	2	2	2
4	4,85 г/л	1; 10	1; 10	10
5	4,85 г/л	1; 10	10	--
6	4,85 г/л	1; 10	1	--
7	4,85 г/л	1; 10	1	1
8	4,85 г/л	1; 10	1	--
9	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
10	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1
11	4,85 г/л	1; 10	--	--
12	4,85 г/л	1; 10	1; 10	10
13	4,85 г/л	1; 10	--	--
14	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1
15	4,85 г/л	1; 10	1; 10	10
16	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--

Таблица 1.

Досліджувані розчини KCl

Сполука №	Конц. KCl	Конц. досліджуваної сполуки (ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку(ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку і $p \leq 0,1$ (ppm)
17	4,85 г/л	1; 10	1	--
18	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
19	4,85 г/л	1; 10	1	1
20	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1
21	4,85 г/л	1; 10	--	--
22	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1
23	4,85 г/л	40	40	40
24	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10	--
25	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1; 10
26	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 30	--
27	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	--
28	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1; 10
29	4,85 г/л	1; 10	1; 10	10
30	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
31	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
32	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
33	4,85 г/л	1; 10	1	--
34	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
35	4,85 г/л	1; 10	1	1
36	4,85 г/л	1; 10	1; 10	10
37	4,85 г/л	1	1	1
38	4,85 г/л	1	1	1
39	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1; 10; 30
40	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	10; 30
41	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
42	4,85 г/л	1; 10	1; 10	--
43	4,85 г/л	1; 10	1	--
44	4,85 г/л	10	10	10
45	4,85 г/л	0,1; 1; 10	0,1; 1	0,1
46	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1
47	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1; 10
48	4,85 г/л	1; 10	1; 10	1
49	4,85 г/л	1; 10; 30	30	30
50	4,85 г/л	1; 10; 30	1	--
51	4,85 г/л	1; 10; 15; 30	15	15
52	4,85 г/л	1; 10; 30	10; 30	10
53	4,85 г/л	25	25	25
54	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 30	--
55	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	10; 30
56	4,85 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1
Стандарт	4,85 г/л	--		

Приклад 2 Вплив досліджуваної сполуки на сприйняття гіркого смаку водних розчинів KCl у людини

5 [0389] Вплив досліджуваних сполук на сприйняття гіркого смаку водного розчину KCl у людини досліджували в тесті, в якому учасники дослідження відпивають і спльовують досліджуваний розчин, як описано нижче.

10 [0390] Готували набір стандартних розчинів KCl і кожному стандартному розчину присвоювали значення гіркоти в діапазоні 0-15 (що відповідає концентраціям KCl у воді 0 мМ-120 мМ). Експертів тренували, щоб навчити розпізнавати ці стандарти. Крім того, на початку кожного дня тестування учасників тестували, щоб перевірити, чи здатні вони розпізнавати

відмінності смаку стандартних розчинів. Якщо учасник виявлявся не в змозі розпізнавати зміни концентрації KCl, його в цей день виключали з групи.

[0391] У сліпому тесті учасників просили порівняти гіркий смак невеликої кількості (наприклад, 8 мл) кожного з досліджуваних розчинів KCl зі смаком стандартного розчину KCl, не проковтуючи (див., наприклад, Таблицю 1). Зокрема, учасників просили оцінити гіркоту кожного розчину KCl з досліджуваною сполукою за шкалою 0-15 із використанням шкали, розробленої для стандартних розчинів KCl. Кожний зразок тестували в 3-4 окремих смакових експериментах. Учасників просили прополоскати рот водою, з'їсти крекер і почекаати приблизно 10 хвилин між зразками.

[0392] Ілюстративні результати представлені на Фігурах 1-5 і в Таблиці 1.

Приклад 3 Приготування досліджуваних розчинів лактату калію

[0393] Композиції їстівних розчинів лактату калію ("досліджувані розчини з лактатом калію") готували, розчиняючи спочатку різні кількості досліджуваних сполук у деякій кількості етанолу та води (в залежності від розчинності сполуки) з одержанням маткового розчину сполуки з концентрацією 5 мг/мл. Деяку кількість цього маткового розчину додавали до водного розчину лактату калію. Потім до отриманої суміші матковий розчин сполуки/лактат калію додавали достатню кількість EtOH, щоб кінцевий розчин лактату калію містив 1 % EtOH. Стандартні розчини лактату калію готували аналогічним чином, розчиняючи різні кількості лактату калію у воді та етанолі без додавання досліджуваних сполук. (стандартні розчини лактату натрію не містили лактату калію).

Таблиця 2.

Розчин лактату калію для смакових експериментів

Сполука №	Конц. KЛас	Конц. досліджуваної сполуки (ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку (ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку і $p \leq 0,1$ (ppm)
2	41 г/л	1; 5	1; 5	--
3	41 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1
4	41 г/л	1; 5	1; 5	--
7	41 г/л	1; 5	--	--
10	41 г/л	1; 10	--	--
14	41 г/л	1; 5	5	--
15	41 г/л	1; 10	1; 10	1; 10
17	41 г/л	1; 10	1	--
19	41 г/л	1; 10	1; 10	1; 10
20	41 г/л	1; 5	1; 5	5
22	41 г/л	1; 10	--	--
23	41 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1; 10
25	41 г/л	1; 10; 30	10	10
26	41 г/л	1; 10; 30	1; 30	1
27	41 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1; 10; 30
29	41 г/л	1; 5	5	--
37	41 г/л	0,1; 1; 10	0,1; 1; 10	--
38	41 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	--
39	41 г/л	1; 10; 30	1; 30	--
40	41 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	1; 10
44	41 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	10
45	41 г/л	1; 10; 30	10; 30	--
46	41 г/л	1; 10; 30	30	--
47	41 г/л	1; 10	1; 10	--
48	41 г/л	1	1	1
49	41 г/л	30	30	30
51	41 г/л	1; 10; 30	1; 10	--
52	41 г/л	1; 10; 30	1; 30	30
53	41 г/л	1	1	1
55	41 г/л	1; 10; 30	1	--

Таблиця 2.

Розчин лактату калію для смакових експериментів

Сполука №	Конц. KЛас	Конц. досліджуваної сполуки (ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку (ppm)	Конц., при якій спостерігається зменшення гіркого смаку і $p \leq 0,1$ (ppm)
56	41 г/л	1; 10; 30	1; 10; 30	10
Стандарт	41 г/л	--		

Приклад 4 Вплив досліджуваної сполуки на сприйняття гіркого смаку водних розчинів лактату калію у людини

- 5 [0394] Вплив досліджуваних сполук на сприйняття гіркого смаку водного розчину лактату калію у людини досліджували в тесті, у якому учасники дослідження відповідають і спльовують досліджуваний розчин, як описано в Прикладі 2.

[0395] Ілюстративні результати представлені на Фігурах 1-5 і в Таблиці 2.

Приклад 5 Приготування досліджуваних суспензій поживних речовин із KCl

- 10 [0396] Їстівні харчові композиції з KCl ("досліджувані суспензії поживних речовин із KCl") готували наступним чином. Дегідрований порошок з індички без солі зважували та змішували з різними кількостями KCl і/або NaCl і потім розчиняли в киплячій воді з одержанням гомогенізованої вологої суспензії з індички. Різні кількості досліджуваних сполук розчиняли в деякій кількості етанолу та води (в залежності від розчинності сполуки) з одержанням маткового розчину сполуки з концентрацією 5 мг/мл. Потім деяку кількість отриманого маткового розчину
- 15 сполуки додавали до суспензії з індички. Потім до отриманої суміші матковий розчин сполуки/суспензія з індички додавали достатню кількість EtOH, щоб суспензія містила 1 % EtOH. Суспензію знову гомогенізували шляхом кип'ятіння та перемішування і залишали охолоджуватися з одержанням кінцевої досліджуваної суспензії KCl для смакових експериментів. Стандартні суспензії харчового продукту з KCl готували аналогічним чином, без
- 20 досліджуваної сполуки. Стандартні суспензії харчового продукту з NaCl готували аналогічним чином, без досліджуваної сполуки (Суспензія харчового продукту з NaCl не містить KCl).

Таблиця 3

Композиції суспензії харчового продукту з KCl

Сполука №	Конц. KCl	Конц. досліджуваної сполуки (ppm)	Конц., при якій щонайменше 50 % учасників відзначають зниження гіркого смаку (ppm)	Конц., при якій щонайменше 50 % учасників відзначають зниження гіркого смаку і $p \leq 0,1$ (ppm)
1	1,6 %	1	1	--
2	1,6 %	1; 10	10	--
3	1,6 %	1; 10; 30	1; 10; 30	--
4	1,6 %	1; 10	1; 10	--
7	1,6 %	1; 10	1	--
10	1,6 %	1; 10	--	--
12	1,6 %	1; 10	10	--
14	1,6 %	1; 10	--	--
15	1,6 %	1; 10	10	10
17	1,6 %	1; 10	--	--
19	1,6 %	1; 10	1; 10	10
20	1,6 %	1; 10	--	--
22	1,6 %	1; 10	1; 10	--
23	1,6 %	1; 10; 30	1; 10	1; 10
24	1,6 %	1; 10; 30	1; 10	10
25	1,6 %	1; 10; 30	10; 30	10; 30
26	1,6 %	1; 10; 30	1; 10	1
27	1,6 %	1; 10; 30	30	--
28	1,6 %	1; 10	10	--

Таблиця 3

Композиції суспензії харчового продукту з KCl

Сполука №	Конц. KCl	Конц. досліджуваної сполуки (ppm)	Конц., при якій щонайменше 50 % учасників відзначають зниження гіркого смаку (ppm)	Конц., при якій щонайменше 50 % учасників відзначають зниження гіркого смаку і $p \leq 0,1$ (ppm)
29	1,6 %	1	1	1
31	1,6 %	1	1	--
35	1,6 %	1; 10; 30	10	--
36	1,6 %	10	10	--
37	1,6 %	1; 10; 30	1; 10; 30	10; 30
38	1,6 %	1; 10; 30	1; 10; 30	--
39	1,6 %	1; 10; 30	1; 10	10
40	1,6 %	1; 10; 30		--
42	1,6 %	1; 10; 30	1	--
44	1,6 %	10	10	--
45	1,6 %	0,1; 1; 10	1	--
46	1,6 %	1; 10; 30	1	--
47	1,6 %	10	10	10
48	1,6 %	10	10	--
49	1,6 %	1	1	1
50	1,6 %	1; 10; 30	1; 30	--
51	1,6 %	1; 10; 30	1; 10	---
52	1,6 %	1; 10; 30	10; 30	10
53	1,6 %	1; 10; 30	30	30
54	1,6 %	1; 10; 30	1	--
55	1,6 %	1; 10; 30	1; 10	1; 10
56	1,6 %	1; 10; 30	10; 30	--
Стандарт	1,6 %	--		

Приклад 6 Вплив досліджуваної сполуки на сприйняття гіркого смаку суспензій харчових продуктів з KCl у людини в експерименті примусового вибору з двома альтернативами (2AFC)

5 [0397] Вплив досліджуваних сполук на сприйняття гіркого смаку суспензій харчових продуктів з KCl у людини оцінювали з використанням описаного нижче експерименту примусового вибору з двома альтернативами, у якому учасники відпивали та спльовували.

10 [0398] У сліпому смаковому експерименті учасники одержували дві порції суспензії з індички – одна порція являла собою стандартну суспензію харчового продукту з KCl, а друга являла собою суспензію харчового продукту з KCl (кожну готували, як описано в Прикладі 5). Учасники досліджували кожну порцію відпиваючи та спльовуючи. Кожний зразок тестували в 3-4 окремих смакових експериментах. Учасників просили прополоскати рот водою, з'їсти крекер і почекати приблизно 10 хвилин між зразками. У кожному випадку учасників просили порівняти гіркий смак двох зразків індички один із одним (тобто учасників просили оцінити, який зразок є менш гірким).

15 [0399] Ілюстративні результати дослідження харчових продуктів представлені на Фігурах 1-5 і в Таблиці 3.

Приклад 7 Приготування суспензій харчового продукту з лактатом калію

20 [0400] Істівні харчові композиції з лактатом калію ("приготування суспензій харчового продукту з лактатом калію") готували наступним чином. Дегідрований порошок з індички без солі зважували та змішували з різними кількостями лактат калію і/або лактат натрію і потім розчиняли в киплячій воді з одержанням гомогенізованої вологої суспензії з індички. Різні кількості досліджуваних сполук розчиняли в деякій кількості етанолу та води (в залежності від розчинності сполуки) з одержанням маткового розчину сполуки з концентрацією 5 мг/мл. Потім деяку кількість отриманого маткового розчину сполуки додавали до суспензії з індички. Потім до отриманої суміші матковий розчин сполуки/суспензія з індички додавали достатньо EtOH, щоб

25 кінцева суспензія містила 1 % EtOH. Кінцеву суспензію знову гомогенізували шляхом кип'ятіння та перемішування і залишали охолоджуватися з одержанням кінцевої суспензії для смакових експериментів. Стандартні суспензії харчового продукту з лактатом калію готували аналогічним чином, без досліджуваної сполуки. Стандартні суспензії харчового продукту з лактатом натрію

готували аналогічним чином, без досліджуваної сполуки (Стандартні суспензії харчового продукту з лактатом натрію не містили лактату калію).

Таблиця 4

Склади суспензій поживних речовин із лактатом калію

Сполука №	Конц. KLaс	Конц. досліджуваної сполуки (ppm)	Конц., при якій щонайменше 50 % учасників відзначають зниження гіркого смаку (ppm)	Конц., при якій щонайменше 50 % учасників відзначають зниження гіркого смаку і $p \leq 0,1$ (ppm)
3	4,5 %	1; 10; 30	1; 10; 30	--
23	4,5 %	1; 10; 30	1; 30	1
24	4,5 %	1; 10; 30	1; 10; 30	30
25	4,5 %	1; 10; 30	1	--
26	4,5 %	1; 10; 30	30	--
27	4,5 %	1; 10; 30	1; 30	--
37	4,5 %	1; 10; 30	1; 10; 30	10
38	4,5 %	1; 10; 30	30	--
49	4,5 %	30	30	30
51	4,5 %	1; 10; 30	10	--
52	4,5 %	1; 10; 30	10; 30	--
53	4,5 %	30	30	--
55	4,5 %	1; 10; 30	10	--
56	4,5 %	1; 10; 30	1	1
Стандарт	4,5 %	--		

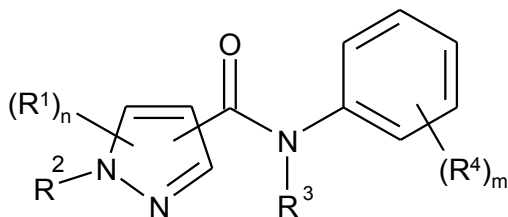
5 Приклад 8 Вплив досліджуваної сполуки на сприйняття гіркого смаку суспензій поживних речовин із лактатом калію у людини в експерименті примусового вибору з двома альтернативами (2AFC)

[0401] Вплив досліджуваних сполук на сприйняття гіркого смаку оцінювали з використанням експерименту примусового вибору з двома альтернативами, в якому учасники відпівали та спльовували, описаному в Прикладі 6.

10 [0402] Ілюстративні результати дослідження харчових продуктів представлені на Фігурах 1-5 і в Таблиці 4.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

15 1. Композиція, яка містить речовину, що має гіркий смак, і сполуку, що відповідає Формулі (IV):



Формула (IV)

або прийнятну для вживання в їжу чи біологічно прийнятну сіль, енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності та стабільності:

20 R^1 , незалежно у кожному випадку, вибраний з групи, яка складається з наступного: галоген, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^2 вибраний з групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл і C_{1-6} ацил;

25 R^3 вибраний з групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

R^4 , незалежно в кожному випадку, вибраний з групи, яка складається з наступного: галоген, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл, C_{2-6} алкініл, C_{1-6} алкокси, $-C(O)-O-R^5$ і $-C(O)-N(R^5)_2$;

R^5 , незалежно в кожному випадку, вибраний з групи, яка складається з наступного: водень, C_{1-6} алкіл, C_{2-6} алкеніл і C_{2-6} алкініл;

5 причому будь-який з R^1 , R^2 , R^3 та R^4 , незалежно та незалежно в кожному випадку, можливо містить 1-3 замісники, вибрані із групи, яка складається з наступного: C_{1-10} алкіл, C_{1-10} галоалкіл, галоген, гідроксил, карбоксил, C_{1-10} алкоксикарбоніл, C_{2-10} алкенілоксикарбоніл, C_{2-10} алкінілоксикарбоніл, C_{1-10} ацил, C_{1-10} ациламіно, C_{1-10} ацилокси, C_{1-10} карбонат, C_{1-10} алкокси, фенілокси, фосфорил, фосфат, фосфонат, фосфінат, аміно, ді- C_{1-10} алкіламіно, моно- C_{1-10} алкіламіно, C_{1-13} амідо, C_{1-10} іміно, C_{1-10} карбамат, C_{1-10} сечовина, ціано, нітро, азидо, сульфгідрил, C_{1-10} алкілтіо, сульфат, сульфонат, сульфоамід, сульфоамідо, сульфоніл, C_{3-7} карбоцикліл, C_{3-7} карбоцикліл- C_{1-6} алкіл, C_{1-6} гетероцикліл, C_{1-6} гетероцикліл- C_{1-6} алкіл, феніл, феніл- C_{1-6} алкіл, C_{1-5} гетероарил і C_{1-5} гетероарил- C_{1-6} алкіл; і при цьому гетероциклічні та гетероароматичні кільця, незалежно в кожному випадку, містять 1-4 гетероатоми, незалежно

15 вибрані з N, O і S;

n являє собою 0-2;

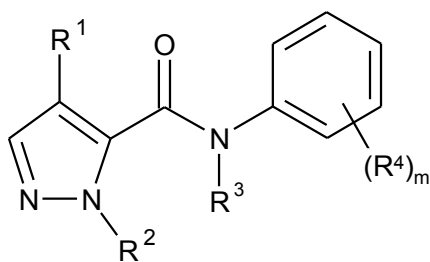
m являє собою 0-3;

або комбінацію будь-яких із зазначених вище сполук; і

при цьому зазначена композиція їстівна, і при цьому гіркий смак речовини, що має гіркий смак, знижений.

2. Композиція за п. 1, в якій зазначена сполука, що відповідає Формулі (IV), являє собою сполуку, вибрану з наступних:

(a) сполука Формули (Va)

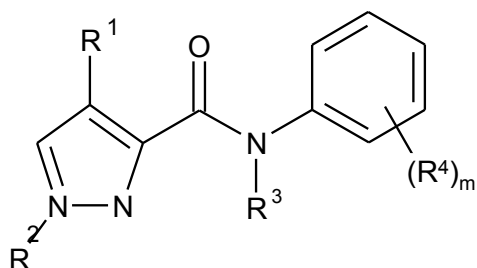


Формула (Va)

25 або прийнятна для вживання в їжу чи біологічно прийнятна сіль, енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності та стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та m мають значення, визначені для сполуки Формули (IV) у п. 1; або

(b) сполука Формули (Vb)



Формула (Vb)

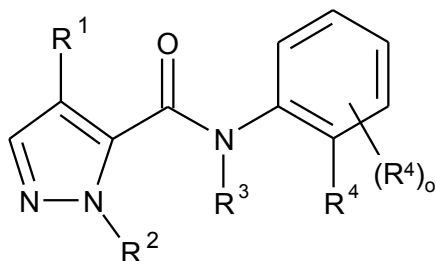
30 або прийнятна для вживання в їжу чи біологічно прийнятна сіль, енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності та стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та m мають значення, визначені для сполуки Формули (IV) у п. 1,

або комбінацію зазначених сполук.

3. Композиція за п. 1, в якій зазначена сполука, що відповідає Формулі (IV), являє собою сполуку, вибрану з наступного:

(a) сполука Формули (VIa)



Формула (VIa)

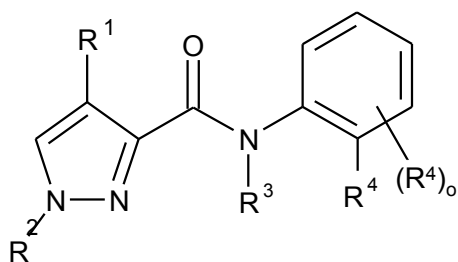
або прийнятна для вживання в їжу чи біологічно прийнятна сіль, енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності та стабільності:

5 R^1, R^2, R^3, R^4 мають значення, визначені для сполуки Формули (IV) у п. 1; і

о являє собою 0-2; або

(b) сполука Формули (VIb)



Формула (VIb)

або прийнятна для вживання в їжу чи біологічно прийнятна сіль, енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності та стабільності:

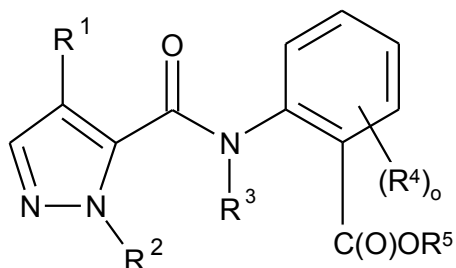
10 R^1, R^2, R^3, R^4 мають значення, визначені для сполуки Формули (IV) у п. 1; і

о являє собою 0-2,

або комбінацію зазначених сполук.

15 4. Композиція за п. 1, в якій зазначена сполука, що відповідає Формулі (IV), являє собою сполуку, вибрану з наступного:

(a) сполука Формули (VIIa)



Формула (VIIa)

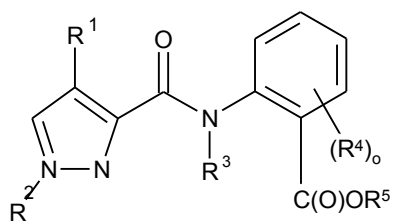
або прийнятна для вживання в їжу чи біологічно прийнятна сіль, енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності та стабільності:

20 R^1, R^2, R^3, R^4 та R^5 мають значення, визначені для сполуки Формули (IV) у п. 1; і

о являє собою 0-2; або

(b) сполука Формули (VIIb)



Формула (VIIb)

або прийнятна для вживання в їжу або біологічно прийнятна сіль, енантіомер або діастереомер зазначеної сполуки,

де, за умови, що це допускають вимоги валентності та стабільності, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 мають значення, визначені для сполуки Формули (IV) в п. 1; і

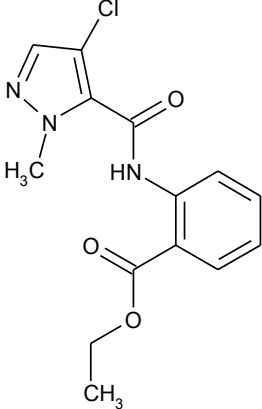
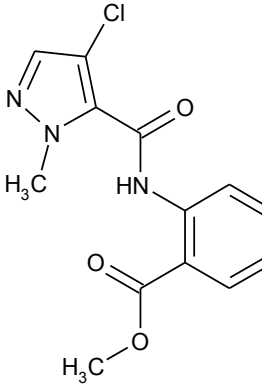
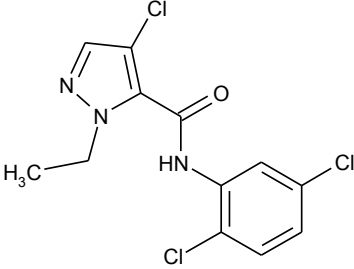
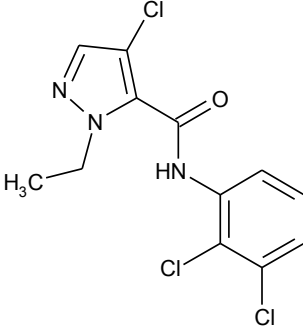
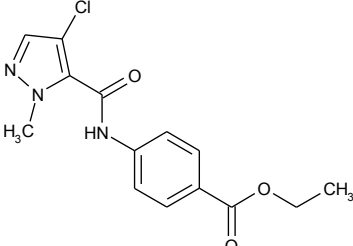
о являє собою 0-2,

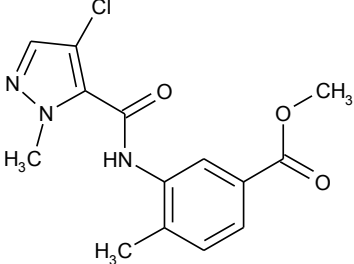
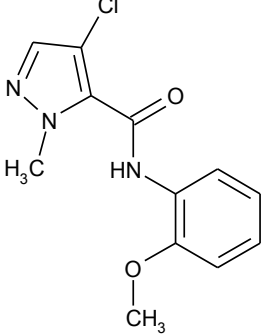
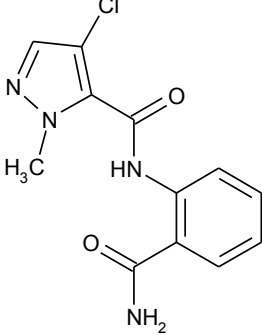
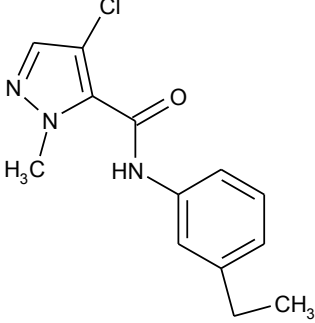
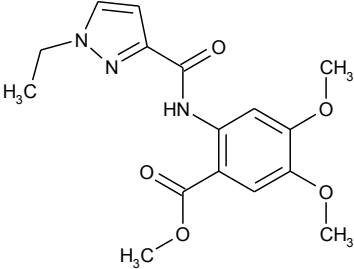
або комбінацію будь-яких із зазначених сполук.

5. Композиція за п. 1, в якій зазначена сполука вибрана з групи, яка складається зі сполук 23-36, що мають наступну структуру:

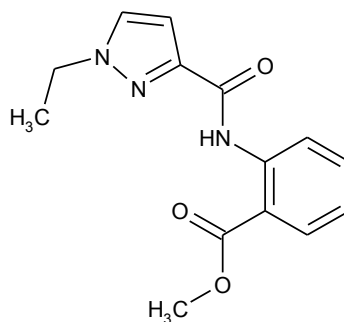
10

Сполука 23	
Сполука 24	
Сполука 25	

<p>Сполука 26</p>	
<p>Сполука 27</p>	
<p>Сполука 28</p>	
<p>Сполука 29</p>	
<p>Сполука 30</p>	

<p>Сполука 31</p>	
<p>Сполука 32</p>	
<p>Сполука 33</p>	
<p>Сполука 34</p>	
<p>Сполука 35</p>	

Сполука 36



або прийнятної для вживання в їжу чи біологічно прийнятної солі зазначеної сполуки, або комбінації будь-яких із зазначених сполук.

6. Композиція за будь-яким із пп. 1-5, в якій зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль калію.

7. Композиція за п. 6, в якій зазначена сіль калію вибрана з хлориду калію та лактату калію.

8. Композиція за будь-яким із пп. 1-7, яка додатково містить один або більше компонентів, вибраних із групи, яка складається з наступного: NaCl і лактат натрію.

9. Композиція за будь-яким із пп. 1-8, яка **відрізняється** тим, що зазначена композиція знаходиться у харчовому продукті або споживчому продукті.

10. Композиція за будь-яким із пп. 1-5, в якій зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою фармацевтично активний інгредієнт.

11. Композиція за п. 10, в якій фармацевтично активний інгредієнт являє собою сіль калію.

12. Спосіб приглушення або зменшення гіркої смаку, обумовленого речовиною, що має гіркий смак, який включає поміщення їстівної композиції за будь-яким із пп. 1-11 у ротову порожнину суб'єкта.

13. Спосіб за п. 12, у якому зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою сіль калію.

14. Спосіб за п. 13, у якому зазначена сіль калію вибрана з хлориду калію та лактату калію.

15. Спосіб за п. 12, у якому зазначена речовина, що має гіркий смак, являє собою фармацевтично активний інгредієнт.

16. Спосіб за п. 15, у якому зазначений фармацевтично активний інгредієнт являє собою сіль калію.

17. Спосіб за будь-яким із пп. 12-14, який включає застосування ефективної кількості зазначеної композиції для:

(i) зменшення або заміни однієї або більше солей натрію на одну або більше солей калію зі зменшенням кількості солі натрію в їстівній композиції, або

ii) консервації їстівної композиції у присутності лактату калію; або

iii) зменшення або заміни деякої кількості натрію в їстівній композиції, яка містить речовину, що має гіркий смак, або сіль калію, з одночасною консервацією зазначеної їстівної композиції.

18. Спосіб за п. 17, у якому зазначена ефективна кількість композиції в їстівній композиції є достатньою для забезпечення зменшення або заміни кількості солі натрію, яка присутня в їстівній композиції, на величину до 25 %, 50 %, 75 % або 100 %.

19. Спосіб за п. 12, у якому досягається усунення сприйняття гіркої смаку у ротовій порожнині суб'єкта.

20. Спосіб за п. 17, у якому:

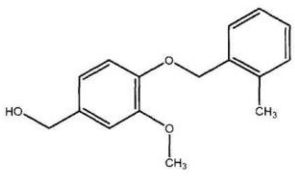
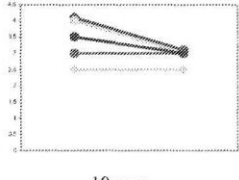
i) їстівна композиція зі зниженим вмістом солі зберігає солоний смак; або ii) консервацію їстівної композиції здійснюють шляхом заміни деякої кількості лактату натрію, який використовується для приготування їстівної композиції, на деяку кількість лактату калію, і при цьому консервована їстівна композиція має той самий термін придатності, що і їстівна композиція з вихідною кількістю лактату натрію.

21. Спосіб за п. 17, у якому зазначену кількість хлориду натрію в їстівній композиції замінюють на деяку кількість хлориду калію.

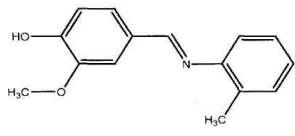
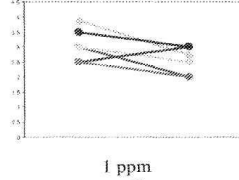
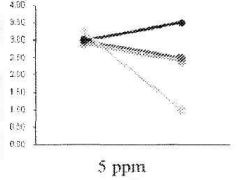
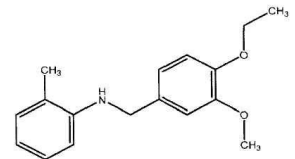
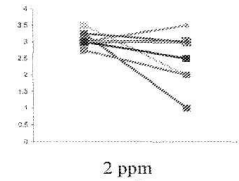
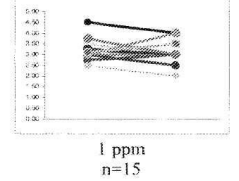
22. Спосіб за будь-яким із пп. 12-21, у якому зазначена їстівна композиція вибрана з групи, яка складається з харчового продукту, споживчого продукту та фармацевтичної композиції.

Дослідження розчину – точка зліва на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття стандарту KCl/лактат калію. Точка справа на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття досліджуваного розчину. Концентрація досліджуваної сполуки в кожному експерименті наведена під діаграмою. Додатково представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного розчину, отримані з використанням парного t-критерію, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

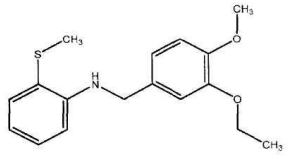
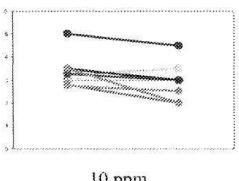
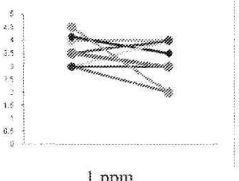
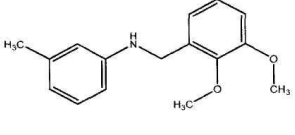
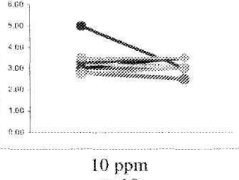
Дослідження харчового продукту – долі позначають число учасників, які відчули зниження гіркоти або металевого смаку/відчуття. Представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного харчового продукту, отримані з аналізу біноміального розподілу, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
1		 10 ppm n=5 b	19/28 10 ppm b	--	--

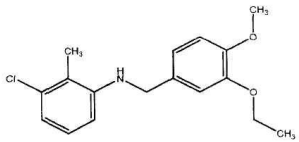
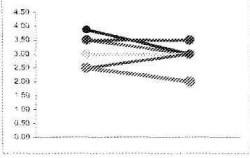
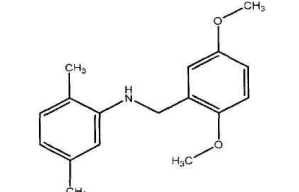
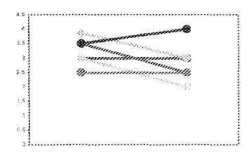
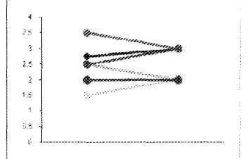
ФІГ. 1А

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
2		 1 ppm n=7 b	14/24 10 ppm d	 5 ppm n=4 d	--
3		 2 ppm n=8 a	19/33 30 ppm d	 1 ppm n=15 a	21/37 1 ppm d

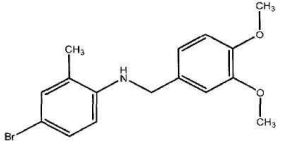
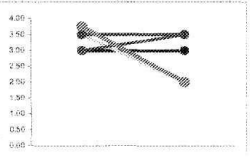
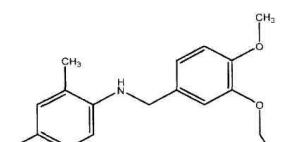
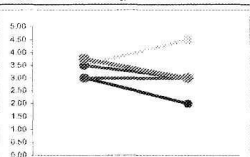
ФІГ. 1В

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
4		 10 ppm n=10 b	15/24 10 ppm d	 1 ppm n=8 d	--
5		 10 ppm n=10 d	--	--	--

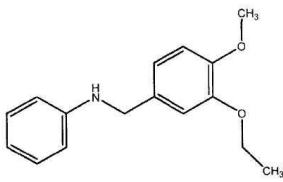
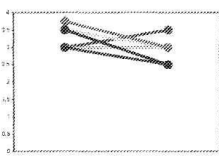
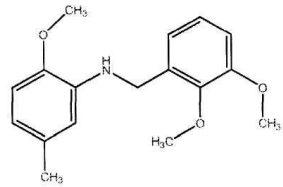
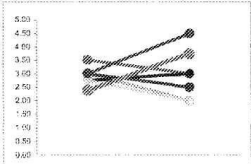
ФІГ. 1С

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
6		 1 ppm n=7 d	--	--	--
7		 1 ppm n=7 a	11/18 1 ppm d	 n=6 5 ppm d	--

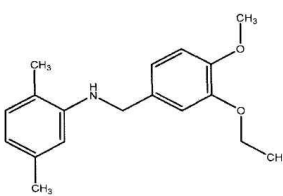
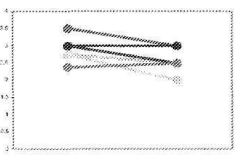
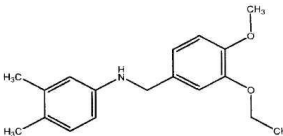
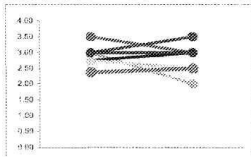
ФІГ. 1D

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
8		 1 ppm n=7 d	--	--	--
9		 10 ppm n=7 d	--	--	--

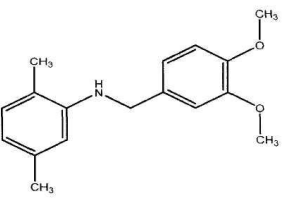
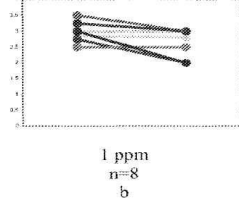
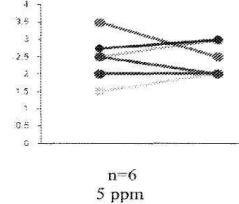
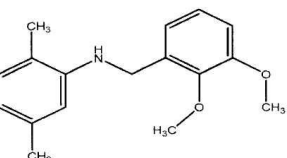
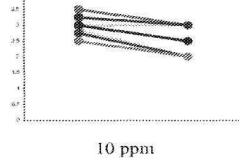
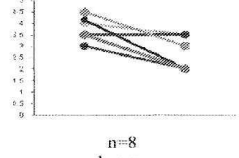
ФІГ. 1E

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
10		 1 ppm n=7 a	9/18 1 ppm d	--	--
11		 10 ppm n=7 d	--	--	--

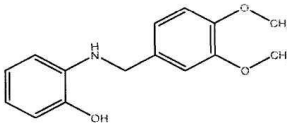
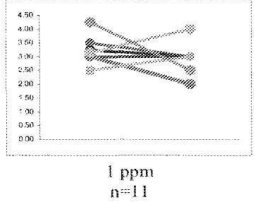
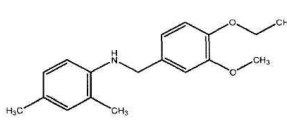
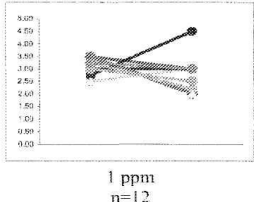
ФІГ. 1F

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
12		 10 ppm n=7 b	--	--	--
13		 1 ppm n=7 d	--	--	--

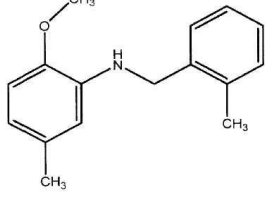
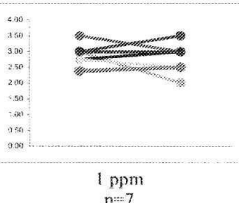
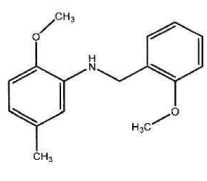
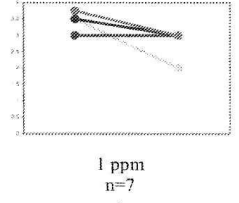
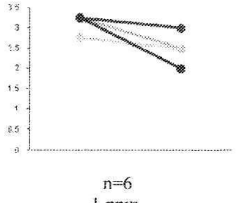
ФІГ. 2G

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
14		 1 ppm n=8 b	14/28 1 ppm d	 n=6 5 ppm d	--
15		 10 ppm n=8 c	20/28 10 ppm b	 n=8 1 ppm c	--

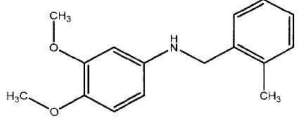
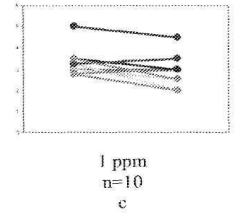
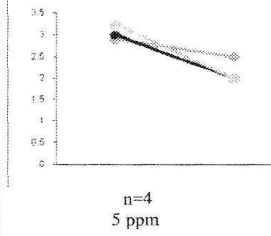
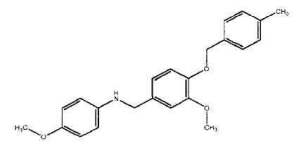
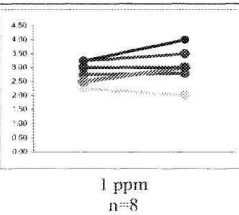
ФІГ. 2H

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
16		 1 ppm n=11 d	--	--	--
17		 1 ppm n=12 d	12/28 1 ppm d	--	--

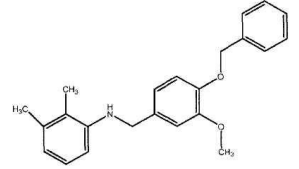
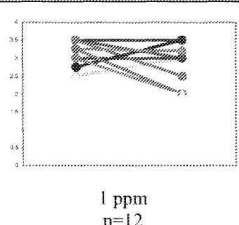
ФІГ. 2I

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
18		 1 ppm n=7 d	--	--	--
19		 1 ppm n=7 a	13/18 10 ppm b	 n=6 1 ppm c	--

ФІГ. 2J

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
20		 1 ppm n=10 с	10/23 1 ppm d	 n=4 5 ppm с	--
21		 1 ppm n=8 d	--	--	--

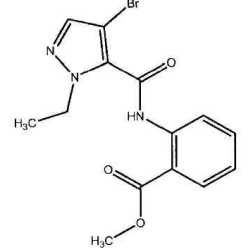
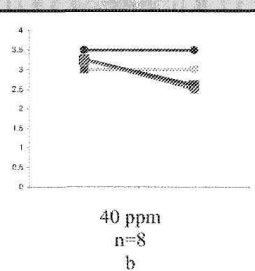
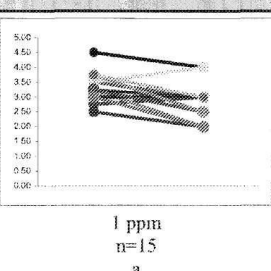
ФІГ. 2К

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
22		 1 ppm n=12 a	17/28 1 ppm d	--	--

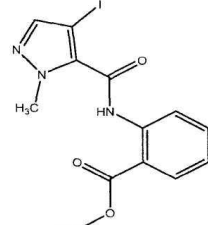
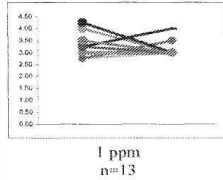
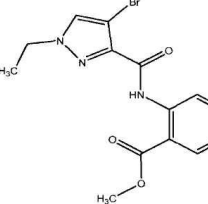
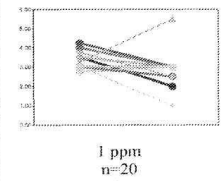
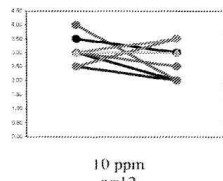
ФІГ. 2L

Дослідження розчину – точка зліва на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття стандарту KCl/лактату калію. Точка справа на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття досліджуваного розчину. Концентрація досліджуваної сполуки в кожному експерименті наведена під діаграмою. Додатково представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного розчину, отримані з використанням парного t-критерію, причому «а» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «с» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

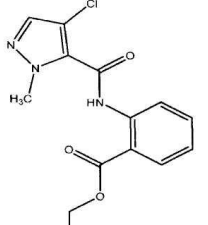
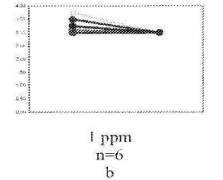
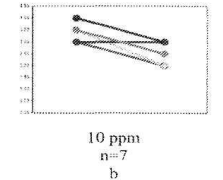
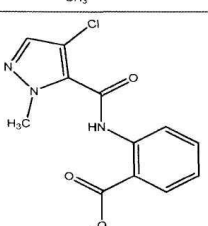
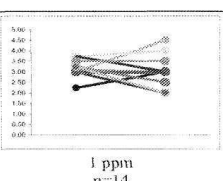
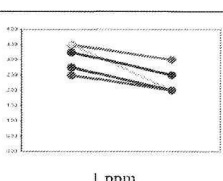
Дослідження харчового продукту – долі позначають число учасників, які відчули зниження гіркоти або металевого смаку/відчуття. Представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного харчового продукту, отримані з аналізу біноміального розподілу, причому «а» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «с» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
23		 40 ppm n=8 b	39/65 10 ppm a	 1 ppm n=15 a	29/45 1 ppm b

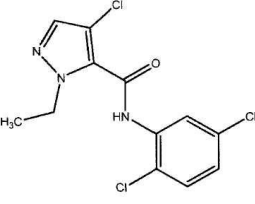
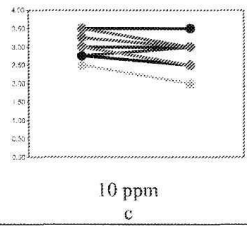
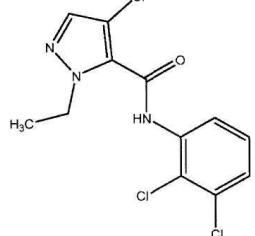
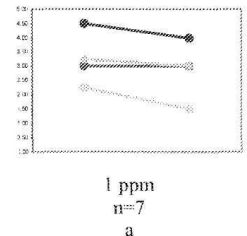
ФІГ. 2A

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
24		 1 ppm n=13 d	28/34 10 ppm с	--	19/30 1 ppm а
25		 1 ppm n=20 b	25/34 10 ppm с	 10 ppm n=12 а	--

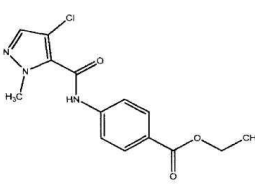
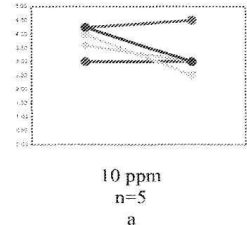
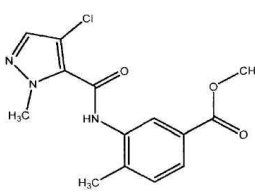
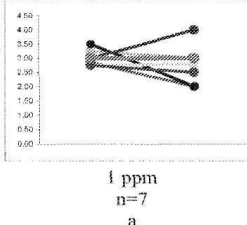
ФІГ. 2В

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
26		 1 ppm n=6 b	18/28 1 ppm а	 10 ppm n=7 b	18/32 30 ppm d
27		 1 ppm n=14 b	22/38 30 ppm d	 1 ppm n=6 с	19/32 30 ppm а

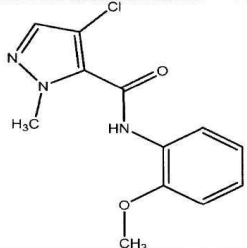
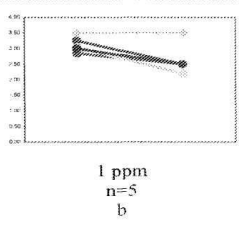
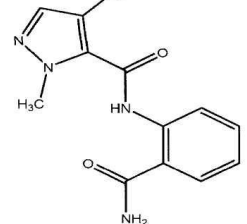
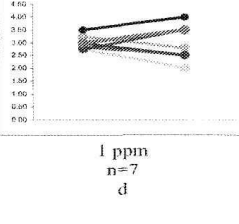
ФІГ. 2С

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
28		 10 ppm c	12/20 10 ppm d	--	--
29		 1 ppm n=7 a	17/26 1 ppm a	--	--

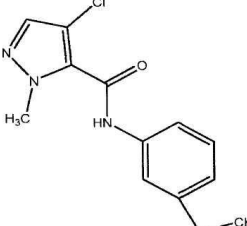
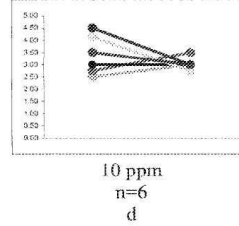
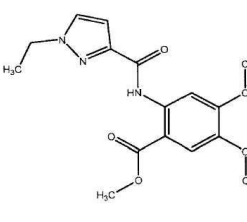
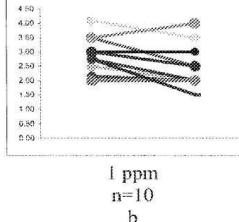
ФІГ. 2D

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
30		 10 ppm n=5 a	--	--	--
31		 1 ppm n=7 a	8/16 1 ppm d	--	--

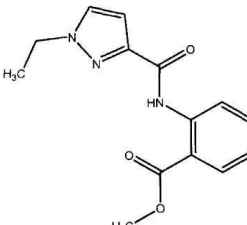
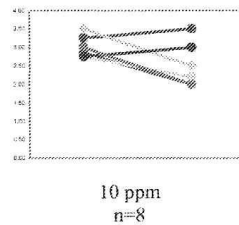
ФІГ. 2E

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
32		 1 ppm n=5 b	--	--	--
33		 1 ppm n=7 d	--	--	--

ФІГ. 2F

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
34		 10 ppm n=6 d	--	--	--
35		 1 ppm n=10 b	20/36 10 ppm d	--	--

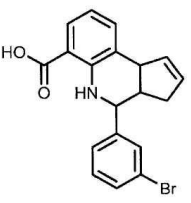
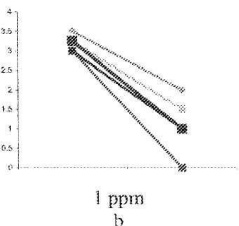
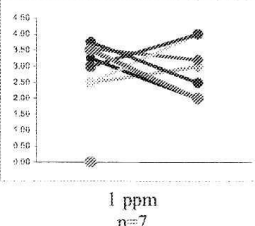
ФІГ. 2G

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
36		 10 ppm n=8 b	9/16 10 ppm d	--	--

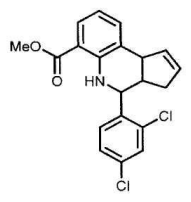
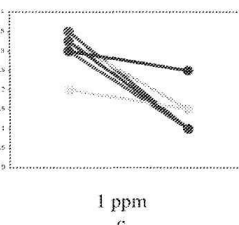
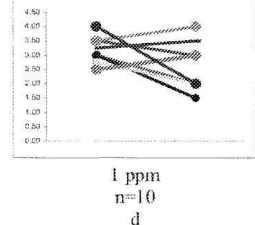
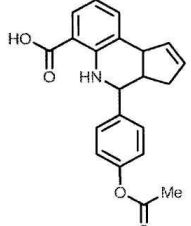
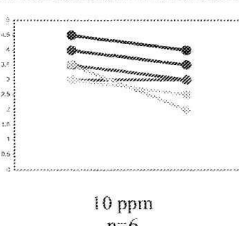
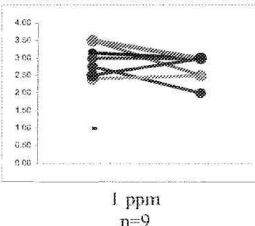
ФІГ. 2H

Дослідження розчину – точка зліва на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття стандарту KCl/лактат калію. Точка справа на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття досліджуваного розчину. Концентрація досліджуваної сполуки в кожному експерименті наведена під діаграмою. Додатково представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного розчину, отримані з використанням парного t-критерію, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

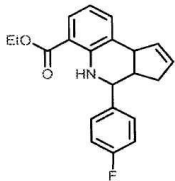
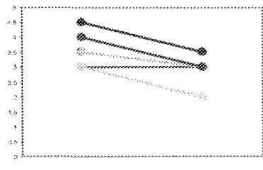
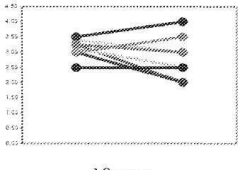
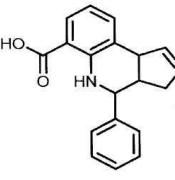
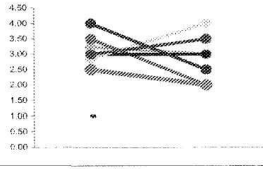
Дослідження харчового продукту – долі позначають число учасників, які відчували зниження гіркоти або металевого смаку/відчуття. Представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного харчового продукту, отримані з аналізу біноміального розподілу, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
37		 1 ppm b	29/34 10 ppm c	 1 ppm n=7 a	26/39 10 ppm b

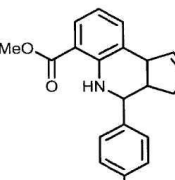
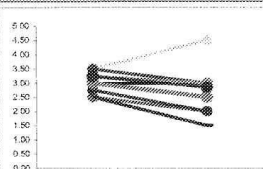
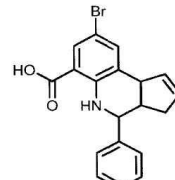
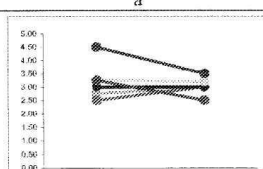
ФІГ. 3А

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
38		 1 ppm c	14/24 10 ppm d	 1 ppm n=10 d	19/36 30 ppm d
39		 10 ppm n=6 b	25/40 10 ppm a	 1 ppm n=9 d	--

ФІГ. 3В

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
40		 30 ppm n=6 c	17/34 30 ppm d	 10 ppm b	--
41		 10 ppm n=7 d	--	--	--

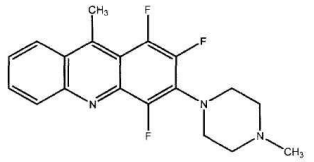
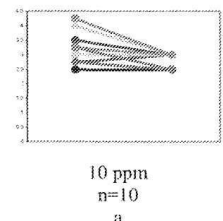
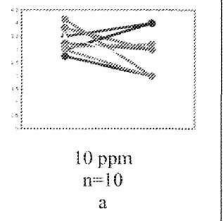
ФІГ. 3С

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
42		 10 ppm n=10 a	8/20 1 ppm d	--	--
43		 1 ppm n=6 d	--	--	--

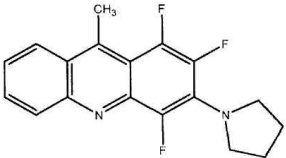
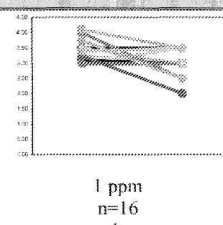
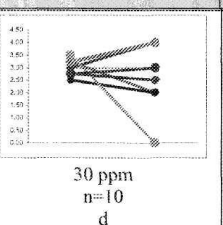
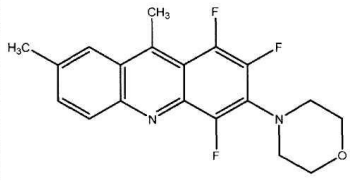
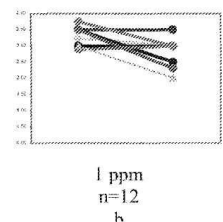
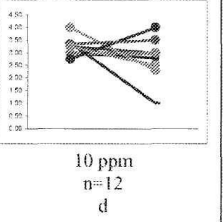
ФІГ. 3D

Дослідження розчину – точка зліва на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття стандарту KCl/лактату калію. Точка справа на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття досліджуваного розчину. Концентрація досліджуваної сполуки в кожному експерименті наведена під діаграмою. Додатково представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного розчину, отримані з використанням парного t-критерію, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

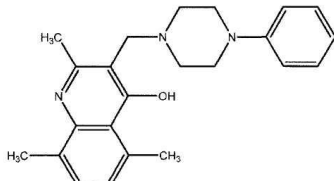
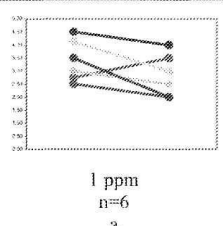
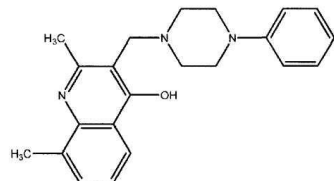
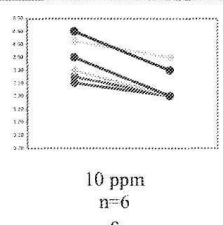
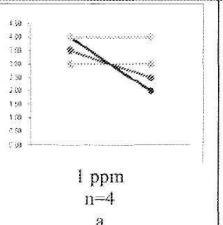
Дослідження харчового продукту – долі позначають число учасників, які відчули зниження гіркоти або металевого смаку/відчуття. Представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного харчового продукту, отримані з аналізу біноміального розподілу, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
44		 10 ppm n=10 a	14/26 10 ppm d	 10 ppm n=10 a	--

ФІГ. 4А

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
45		 1 ppm n=16 b	17/30 1 ppm d	 30 ppm n=10 d	--
46		 1 ppm n=12 b	20/34 1 ppm d	 10 ppm n=12 d	--

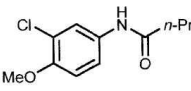
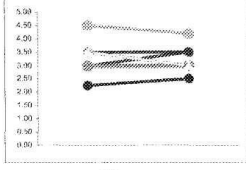
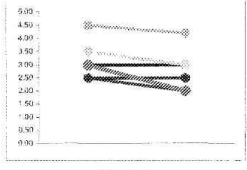
ФІГ. 4В

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
47		 1 ppm n=6 a	12/16 10 ppm b	--	--
48		 10 ppm n=6 c	17/38 10 ppm d	 1 ppm n=4 a	--

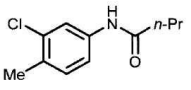
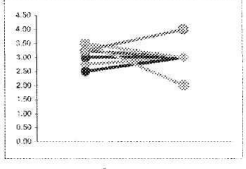
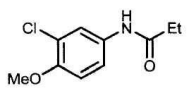
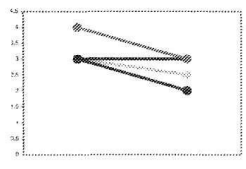
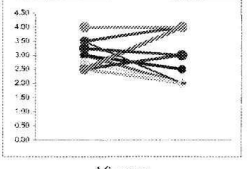
ФІГ. 4С

Дослідження розчину – точка зліва на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття стандарту KCl/лактат калію. Точка справа на діаграмах розчинів представляє оцінку гіркоти або металевого смаку/відчуття досліджуваного розчину. Концентрація досліджуваної сполуки в кожному експерименті наведена під діаграмою. Додатково представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного розчину, отримані з використанням парного t-критерію, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

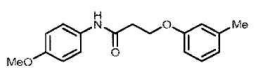
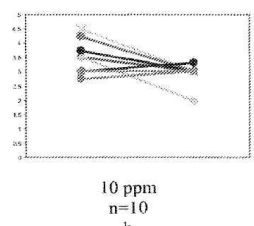
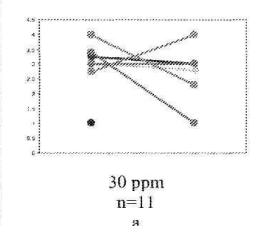
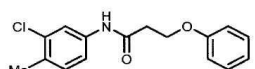
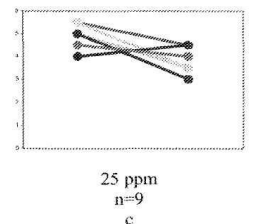
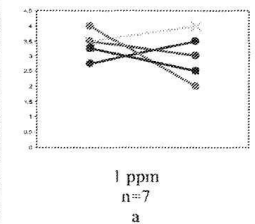
Дослідження харчового продукту – долі позначають число учасників, які відчули зниження гіркоти або металевого смаку/відчуття. Представлені значення статистичної значущості даних досліджуваного харчового продукту, отримані з аналізу біноміального розподілу, причому «a» представляє $p < 0,1$; «b» представляє $p < 0,05$; «c» представляє $p < 0,01$; «d» представляє $p > 0,01$ (дані не показані).

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
49		 30 ppm n=15 a	18/34 1 ppm d	 30 ppm n=7 a	26/38 30 ppm b

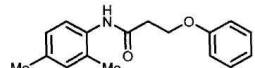
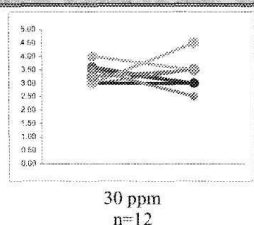
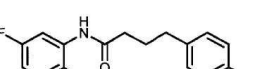
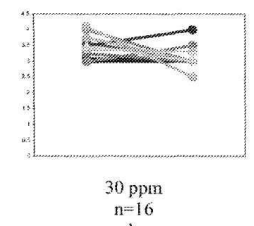
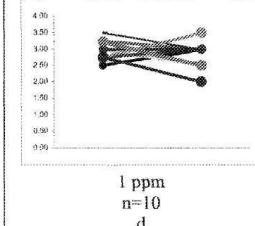
ФІГ. 5A

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
50		 1 ppm n=11 d	18/34 1 ppm d	--	--
51		 15 ppm n=5 b	10/16 10 ppm d	 10 ppm n=10 d	19/38 10 ppm d

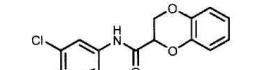
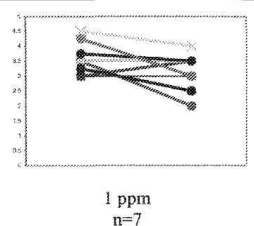
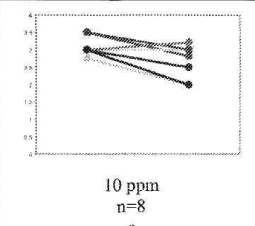
ФІГ. 5B

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
52		 10 ppm n=10 b	18/26 10 ppm a	 30 ppm n=11 a	15/26 30 ppm d
53		 25 ppm n=9 c	11/16 30 ppm a	 1 ppm n=7 a	18/32 30 ppm d

ФІГ. 5C

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
54		 30 ppm n=12 d	16/30 1 ppm d	--	--
55		 30 ppm n=16 b	25/36 1 ppm b	 1 ppm n=10 d	19/22 10 ppm c

ФІГ. 5D

№	Структура досліджуваної сполуки	Сполука KCl	Харчовий продукт KCl	Розчин лактату калію	Харчовий продукт лактату калію
56		 1 ppm n=7 a	11/16 30 ppm a	 10 ppm n=8 c	18/26 1 ppm b

ФІГ. 5E

Комп'ютерна верстка О. Рябко

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601