

5-ALAホスフェート事件

引用例には5-ALAホスフェートについて記載されているが、その製造方法・ 入手方法を見出すことができないとして、引用発明と認定できないとした事案

東京地判令和5年7月28日(令和4年(ワ)第9716号) (裁判所ホームページ知的財産裁判例集)

室谷法律事務所 知的財産法研究会 弁護士 室谷 和彦

第1 概要

1 事案

本件は、原告が、被告による被告製品の製造、譲渡及び譲渡の申出は、原告の有する特許権を 侵害すると主張して、被告に対し、特許法100条1項2項に基づき、被告製品の製造、譲渡及び 譲渡の申出の差止め及び廃棄を求めた事案である。

2 本件特許権

登録番号 第4417865号

発明の名称 5-アミノレブリン酸リン酸塩、その製造方法及びその用途

優先日 平成16年3月30日(以下「本件優先日」という。)

同年11月30日

出願日 平成17年2月25日 登録日 平成21年12月4日

3 本件発明 請求項1

下記一般式(1)

 $HOCOCH_2CH_2COCH_2NH_2 \cdot HOP(O)(OR^1)_n(OH)_{2-n}-(1)$ (式中、 R^1 は、水素原子又は炭素数 $1 \sim 18$ のアルキル基を示し;nは $0 \sim 2$ の整数を示す。)で表される 5 - T ミノレブリン酸リン酸塩。

4 本件発明の技術的意義 本件特許公報から引用

【技術分野】

[0001]

本発明は、微生物・発酵、動物・医療、植物等の分野において有用な5-アミノレブリン酸リン酸塩、その製造方法、これを含有する医療用組成物及びこれを含有する植物活力剤組成物に関する。

【背景技術】

[0002]

5-アミノレブリン酸は、微生物・発酵分野においては、VB₁₂生産、ヘム酵素生産、微生物培養、ポルフィリン生産など、動物・医療分野においては、感染症治療(非特許文献 1)、殺菌、ヘモフィラス診断、誘導体原料、除毛、リウマチ治療(非特許文献 2)、がん治療(非特許文献 3)、血栓治療(非特許文献 4)、癌術中診断(非特許文献 5)、動物細胞培養、UVカット、ヘム代謝研究、育毛、重金属中毒ポルフィリン症診断、貧血予防などに、植物分野においては農薬などに有用なことが知られている。

[0003]

一方、5-アミノレブリン酸は塩酸塩としてのみ製造法が知られており、原料として馬尿酸 (特許文献 1 参照)、コハク酸モノエステルクロリド(特許文献 2 参照)、フルフリルアミン(例えば、特許文献 3 参照)、ヒドロキシメチルフルフラール (特許文献 4 参照)、オキソ吉草酸メチルエステル (特許文献 5 参照)、無水コハク酸 (特許文献 6 参照) を使用する方法が報告されている。

[0004]

しかしながら、5-アミノレブリン酸塩酸塩は塩酸を含んでいるため、製造過程、調剤・分包 過程で気化した塩化水素により、装置腐食や刺激性を発生することを考慮する必要があり、これ らを防止する措置を講ずることが望ましい。また、5-アミノレブリン酸塩酸塩を、直接、ヒト への経口投与や皮膚への塗布の場合、舌や皮膚に灼熱感を感じるような刺激性がある。よって、 医薬の分野で利用する5-アミノレブリン酸として、5-アミノレブリン酸塩酸塩よりも低刺激 性の5-アミノレブリン酸の塩が求められていた。

[0005]

また、5-アミノレブリン酸塩酸塩は植物の分野に利用されている(特許文献7参照)が、植物に対して一般的に使用されている殺菌剤成分の硝酸銀等と混合して使用すると、5-アミノレブリン酸塩酸塩と硝酸銀が反応して塩化銀の沈殿が発生する場合があり、噴霧器のノズルが詰まって噴霧できなくなる可能性があり、操作上、注意を要した。

また、5-アミノレブリン酸塩酸塩水溶液を果実へ直接噴霧をした場合、塩化物イオンが存在すると、果実の着色が十分ではない場合があった。 (略)

【発明が解決しようとする課題】

[0006]

従って、本発明は低刺激性の5-アミノレブリン酸の新規な塩、その製造方法、これを含有する医療用組成物及びこれを含有する植物活力剤組成物を提供することにある。

【課題を解決するための手段】

[0007]

本発明者らは、かかる実情に鑑み鋭意検討を行った結果、陽イオン交換樹脂に吸着した5-アミノレブリン酸を溶出させ、その溶出液をリン酸類と混合することにより、上記要求が満たされる5-アミノレブリン酸リン酸塩が得られることを見出し、本発明を完成させた。(略)

【発明の効果】

[0013]

本発明の5-アミノレブリン酸リン酸塩は、臭気が感じられず、そのため取り扱いやすい物質