

注目判決

平成30年（行ヒ）第69号 審決取消請求事件

（令和元年8月27日 第三小法廷判決）

1 本件は、被上告人が、ヒトにおけるアレルギー性眼疾患を処置するための点眼剤に係る特許（特許第3068858号。以下「**本件特許**」という。）につき、その特許権を共有する上告人らを被請求人として特許無効審判を請求したところ、同請求は成り立たない旨の審決を受けたため、同審決の取消しを求める事案である。本件特許に係る発明の進歩性の有無に関し、当該発明が予測できない顕著な効果を有するか否かが争われている。

2 原審の確定した事実関係等の概要は、次のとおりである。

（1）本件特許

本件特許は、発明の名称を「アレルギー性眼疾患を処置するためのドキセピン誘導体を含有する局所的眼科用処方物」とし、平成8年5月3日に特許出願（優先日：平成7年6月6日）されたものであり、平成12年5月19日に設定登録がされた。

本件特許に係る発明は、ヒトにおけるアレルギー性眼疾患を処置するための点眼剤として、公知のオキシピン誘導体である「11-（3-ジメチルアミノプロピリデン）-6,11-ジヒドロジベンズ[b,e]オキシピン-2-酢酸」（以下「**本件化合物**」という。）を、ヒト結膜肥満細胞安定化（ヒト結膜の肥満細胞からのヒスタミンの遊離抑制）の用途に適用する薬剤に関するものである。

（2）無効審判請求の経緯等

ア 被上告人は、平成23年2月、本件特許について特許無効審判を請求し（無効2011-800018号事件）、上告人らは、平成24年8月、本件特許に係る特許請求の範囲の訂正（以下「**本件訂正1**」という。）を請求した。

特許庁は、平成25年1月、本件訂正1を認めるとともに、・・・引用例1を主引用例とする進歩性欠如の無効理由は理由がないと判断して、上記特許無効審判の請求は成り立たない旨の審決（以下「**前審決**」という。）をした。

引用例1は、アレルギー性結膜炎を抑制するための本件化合物のシス異性体の塩酸塩を含有する点眼剤（以下「**引用発明1**」という。）をモルモットに点眼して結膜炎に対する影響を検討した実験結果等が記載されている、優先日前に頒布された論文である。

イ 被上告人が、平成25年3月、前審決の取消しを求めて訴訟を提起したところ、知的財産高等裁判所は、平成26年7月、引用例1及び引用例2に接した当業者は、引用発明1をヒトにおけるアレルギー性眼疾患の点眼剤として適用することを試みる際に、引用発明1に係る化合物についてヒト結膜肥満細胞安定化作用を有することを確認し、ヒト結膜肥満細胞安定化剤の用途に適用することを容易に想到することができたものと認められるから、前審決の上記の判断は誤りであるとして、前審決を取り消す旨の判決（以下「**前訴判決**」という。）を言い渡し、前訴判決は確定した。

ウ 特許庁は、上記の特許無効審判事件につき更に審理を行い、上告人らは、平成28年2月、本件特許に係る特許請求の範囲の訂正（以下「**本件訂正2**」という。）を請求した。本件訂正2後の特許請求の範囲の請求項1（以下、これに係る発明を「**本件発明1**」という。）の記載（本件訂正1後の特許請求の範囲の請求項1の記載と同じである。）、および本件訂正2後の特許請求の範囲の請求項5（以下、これに係る発明と本件発明1とを併せて「**本件各発明**」という。）の記載は、後記（参考）に記載のとおりである。

特許庁は、同年12月、本件訂正2を認めるとともに、本件発明1と引用発明1との各相違点は、引用例1及び引用例2に接した当業者が容易に想到することができたもの又は単なる設計事項であるが、本件化合物の効果は、引用例1、引用例2及び優先日当時の技術常識から当業者が予測し得ない格別顕著な効果であるとし、本件各発明は当業者が容易に発明できたものとはいえないと判断して、上記特許無効審判の請求は成り立たない旨の審決（以下「**本件審決**」という。）をした。

（3）本件各発明に係る効果

本件特許の特許出願に係る明細書（以下「**本件明細書**」という。）に接した当業者が認識する本件各発明に係る本件化合物のヒスタミン遊離抑制効果は、本件明細書記載の実験において、本件化合物（シス異性体）のヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制率が、 $30\mu\text{M}$ から $2000\mu\text{M}$ までの濃度範囲内において濃度の増加とともに上昇していたというものであり、これに対して抗アレルギー薬として知られるクロモグリク酸二ナトリウム及びネドクロミルナトリウムが、 $2000\mu\text{M}$ までの濃度範囲でヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン遊離を有意に阻害することができなかつたというものである。

（4）優先日当時の公知刊行物の記載

ア 引用例1及び引用例2には、本件化合物がヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制作用を有するか否か及び同作用を有する場合にどの程度の効果を示すのかについての記載はない。

イ 優先日前に頒布された刊行物には、スギ花粉症患者11例ないし30例に対して、本件化合物以外の化合物について、所定濃度の点眼液の点眼後にスギ抗原液を点眼することによりアレルギー反応を誘発する試験を行い、誘発から5分後及び10分後の涙液中のヒスタミン遊離抑制率を測定した結果、5分後の平均値及び10分後の平均値が、①塩酸プロカテロール点眼液0.0003%では79.0%及び82.5%，同点眼液0.001%では81.6%及び89.5%，同点眼液0.003%では81.7%及び90.7%，②ケトチフェン点眼液0.05%では67.5%及び67.2%，③クロモグリク酸二ナトリウム点眼液2%では73.8%及び67.5%，④ペミロラストカリウム点眼液0.1%では69.6%及び69.0%，同点眼液0.25%では71.8%及び61.3%をそれぞれ記録した旨が開示されていた。

3 原審は、上記事実関係等の下において、要旨次のとおり判断し、本件各発明の効果は当業者において引用発明1及び引用例2記載の発明から容易に想到する本件各発明の構成を前提として予測し難い顕著なものであるということとはできないから、本件各発明の効果に係る本件審決の判断には誤りがあるとして、本件審決を取り消した。

前訴判決によれば、上記2(2)イのとおり、引用例1及び引用例2に接した当業者は引用発明1に係る化合物をヒト結膜肥満細胞安定化剤の用途に適用することを容易に想到することができたものであるから、本件化合物がヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制作用を有すること自体は、当業者にとって予測し難い顕著なものであるということとはできない。

また、優先日における技術水準として、本件化合物のほかに、所定濃度の点眼液を点眼することにより70%ないし90%程度の高いヒスタミン遊離抑制率を示す他の化合物が上記2(4)イのとおり複数存在すること(以下、これらの化合物を「本件他の各化合物」という。)・・・などの諸事情を考慮すると、本件明細書に記載された、本件各発明に係る本件化合物を含有するヒト結膜肥満細胞安定化剤のヒスタミン遊離抑制効果が、当業者にとって当時の技術水準を参酌した上で予測することができた範囲を超える顕著なものであるということとはできない。

4 しかしながら、原審の上記判断は是認することができない。

上記事実関係等によれば、本件他の各化合物は、本件化合物と同種の効果であるヒスタミン遊離抑制効果を有するものの、いずれも本件化合物とは構造の異なる化合物であって、引用発明1に係るものではなく、引用例2との関連もうかがわれない。そして、引用例1及び引用例2には、本件化合物がヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン遊離抑制作用を有するか否か及び同作用を有する場合にどの程度の効果を示すのかについての記載はない。このような事情の下では、本件化合物と同等の効果を有する本件他の各化合物が存在することが優先日当時知られていたということから直ちに、当業者が本件各発明の効果の程度を予測することができたということとはできず、また、本件各発明の効果が化合物の医薬用途に係るものであることをも考慮すると、本件化合物と同等の効果を有する化合物ではあるが構造を異にする本件他の各化合物が存在することが優先日当時知られていたということのみをもって、本件各発明の効果の程度が、本件各発明の構成から当業者が予測することができた範囲の効果を越える顕著なものであることを否定することもできないというべきである。

原審は、結局のところ、本件各発明の効果、取り分けその程度が、予測できない顕著なものであるかについて、優先日当時本件各発明の構成が奏するものとして当業者が予測することができなかつたものか否か、当該構成から当業者が予測することができた範囲の効果を越える顕著なものであるか否かという観点から十分に検討することなく、本件化合物を本件各発明に係る用途に適用することを容易に想到することができたことを前提として、本件化合物と同等の効果を有する本件他の各化合物が存在することが優先日当時知られていたということのみから直ちに、本件各発明の効果が予測できない顕著なものであることを否定して本件審決を取り消したものとみるほかなく、このような原審の判断には、法令の解釈適用を誤った違法があるといわざるを得ない。

5 以上によれば、原審の上記判断には、判決に影響を及ぼすことが明らかな法令の違反がある。論旨は、この趣旨をいうものとして理由があり、原判決は破棄を免れない。そして、本件各発明についての予測できない顕著な効果の有無等につき更に審理を尽くさせるため、本件を原審に差し戻すこととする。

以上

(参考)

本件訂正 2 後の特許請求の範囲の請求項 1 および 5 の記載は以下のとおりである。

【請求項 1】 ヒトにおけるアレルギー性眼疾患を処置するための局所投与可能な、点眼剤として調製された眼科用ヒト結膜肥満細胞安定化剤であって、治療的有効量の 1,1-(3-ジメチルアミノプロピリデン)-6,1,1-ジヒドロジベンズ [b, e] オキセピン-2-酢酸またはその薬学的に受容可能な塩を含有する、ヒト結膜肥満細胞安定化剤。

【請求項 5】 ヒトにおけるアレルギー性眼疾患を処置するための局所投与可能な、点眼剤として調製された眼科用ヒト結膜肥満細胞安定化剤であって、治療的有効量の 1,1-(3-ジメチルアミノプロピリデン)-6,1,1-ジヒドロジベンズ [b, e] オキセピン-2-酢酸またはその薬学的に受容可能な塩を含有し、前記 1,1-(3-ジメチルアミノプロピリデン)-6,1,1-ジヒドロジベンズ [b, e] オキセピン-2-酢酸が、(Z)-1,1-(3-ジメチルアミノプロピリデン)-6,1,1-ジヒドロジベンズ [b, e] オキセピン-2-酢酸であり、(E)-1,1-(3-ジメチルアミノプロピリデン)-6,1,1-ジヒドロジベンズ [b, e] オキセピン-2-酢酸を実質的に含まない、ヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン放出を 66.7%以上阻害する、ヒト結膜肥満細胞安定化剤。

2024年9月

弁理士法人エスエス国際特許事務所