

生田哲郎◎弁護士・弁理士／寺島英輔◎弁護士

## 進歩性判断において、構成の容易想到性を前提として、「予測できない顕著な効果」の認定手法を示した最高裁判決

[最高裁判所 令和元年8月27日 第三小法廷判決 平成30年(行ヒ)第69号]

### 1. 事件の概要

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）について、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（以下、本件審決）を受けたため、同審決の取り消しを求めた事案です。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点となりました。

いわゆる医薬用途発明における進歩性判断の考慮要素としての、予測できない顕著な効果の認定手法について、最高裁が判断を示したものとして、実務上大変参考になりますので、ご紹介します。

### 2. 本件特許に係る発明

(1)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む局所的眼科用処方物」とし、平成7年6月6日に米国でした特許出願に基づく優先権を主張して、平成8年5月3日に特許出願され、平成12年5月19日に設定登録がされたものです。

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、公知のオキセピン誘導体である「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] オキセピン-2-酢酸」（以下、本件化合物）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す。

(2)本件特許については、無効審判手続きのなかで、特許請求の範囲が訂正され、最終的に請求項1と請求項5に絞られました。なお、本件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が当業者にとって容易想到であったことは、第二次審決の取消判決において認定され、同判決は確定しました。本稿では、争点とされた「予測できない顕著な効果」との関連性が分かりやすい請求項5のみを引用します。

【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、治療の有効量の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] オキセピン-2-酢酸が、(Z)-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] オキセピン-2-酢酸であり、(E)-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

### 3. 原審（知財高裁）の判断

(1)本件各発明に係る効果および優先日当時の公知刊行物に関する知財高裁の認定事実は、以下のとおりです。

ア「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（ヒト結膜肥満細胞を培養した細胞集団に薬剤を投じて同細胞からのヒスタミン遊離抑制率を測定する実験）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 $\mu$ Mから2000 $\mu$ 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、1000  $\mu$ Mでは66.7%という高いヒスタミン遊離抑制効果を示し、その2倍の濃度である2000  $\mu$ Mでも92.6%という高率を維持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  $\mu$ 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ったというものである」

イ 「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り、引用例2は公開特許公報（特開昭63-10784号公報）である」

ウ 「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」

エ 「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」

(2)そのうえで、知財高裁は、「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というとはできない」「また、優先日における技術水準として、本件化合物のほか、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……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。）、その中には2.5倍から10倍程度の濃度範囲にわたって高いヒスタミン遊離抑制効果を維持する化合物も存在することが知られていたこと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とはできない」旨判示しました。そのうえで、本件各発明の効果は当業者において引用発明1および引用例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では

きないため、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ました。

#### 4. 最高裁判所の判断

最高裁判所第三小法廷は、以下のとおり判示して、本件を知財高裁に差し戻しました。

「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ではできず、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超越す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。

しかるに、原審は、本件他の各化合物が存在することが優先日当時知られ

ていたということ以外に考慮すべきとする諸事情の具体的な内容を明らかにしておらず、その他、本件他の各化合物の効果の程度をもって本件化合物の効果の程度を推認できるとする事情等は何ら認定していない。

そうすると、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ったものか否か、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超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もつ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、本件各発明の効果は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に、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」

「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」

## 5. 考察

(1) 本件各発明は、既知の本件化合物について、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の用途に適用できることを発見したことに基づく、いわゆる用途発明です。本件では、かかる用途発明における進歩性判断に際し、本件各発明が予測できない顕著な効果を有するか否かが問題となりました。

(2) 発明の進歩性は、当該発明の構成を当業者が容易に想到できたか否かにより判断されます(特許法29条2項)。もっとも、用途発明については、実務上、既存の物の新規な用途における作用が予測できない顕著な効果を有するか否かが、進歩性判断の際、重要な考慮要素とされています。

容易想到性と予測できない顕著な効果との関係については、大別して二つの説があります。一つは、①顕著な効果を有することと遂行困難な構成を得たこととを同等に評価し、顕著な効果を容易想到性とは独立した進歩性を認める要件とする見解です。もう一つは、②予測できない顕著な効果の存在が容易想到性の評価を妨げるとして、顕著な効果を容易想到性の判断の一考慮要素とする見解です。本判決がいずれの説を採用したかは、明確にはされていません。

(3) 本件では、構成の容易想到性については、第二次審決の取消判決が確定したことにより、上告審における争点となりませんでした。上告審で争点となったのは、何と比較して「予測できない

顕著な効果」を有するかという、比較対象です。

原審は、優先日の技術水準から予測できる範囲と比較して顕著な効果がないとして進歩性を否定しました。本件他の各化合物について、本件各発明と同程度以上のヒスタミン遊離抑制率が記録された文献がその根拠とされています。

これに対し、最高裁は、請求項に係る構成から予測される範囲と比較して顕著な効果の有無を判断すべきであるとの見解を採用したものと考えられます。すなわち、「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……できた範囲の効果を超える顕著なものであることを否定することもできない」「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……できなかったものか否か、当該構成から当業者が予測……できた範囲の効果を超える顕著なものであるか否かという観点」(傍点引用者)との表現から、最高裁の見解がうかがわれます。

本判決は、予測できない顕著な効果の認定方法を示した初の最高裁判例であり、今後の実務の指針として重要なものです。

差戻審においては、本判決に従い、本件他の各化合物の効果の程度を推認できるとする事情等の有無が争点になるものと思われれます。

### いくたてつお

東京工業大学大学院修士課程修了。技術者としてメーカーに入社。弁護士・弁理士登録後、もっぱら、国内外の侵害訴訟、ライセンス契約、特許・商標出願等の知財実務に従事。この間、米国の法律事務所に勤務し、独逸マックス・プランク特許法研究所に在籍。

### てらしま えいすけ

東京大学経済学部経済学科、同経営学科卒業。特許、商標、著作権等の知的財産法務以外にも、多数の一般民事事件における豊富な経験・実績を有する。交渉・訴訟対応全般を得意とする。AI・機械学習分野における法務も取り扱う。統計検定準1級取得。