

作用機序を記載したクレームの自明性判断
～固有の作用機序であるか否か～
米国特許判例紹介(165)

2023年8月10日
執筆者 河野特許事務所
所長弁理士 河野 英仁

IN RE: JOHN L. COUVARAS,
Appellant

1. 概要

自明か否かの判断においては、Graham 最高裁判決¹において判示された下記事項を検討する。

- (a) 「先行技術の範囲及び内容を決定する」
- (b) 「先行技術とクレーム発明との相違点を確定する」
- (c) 「当業者レベルを決定する」
- (d) 「二次的考察を評価する」

本事件ではクレーム中に2つの良く知られた降圧剤の組み合わせによるこれまで知られていなかった作用機序を記載しており、この予期せぬ作用機序により非自明といえるか否かが争点となった。

CAFC は、作用機序はクレームされた方法に固有のものであるとして拒絶の判断を下した審判部の決定を維持した。

2. 背景

(1)特許の内容

Couvaras は、米国特許出願第 15/131,442 号(422 出願)を USPTO に出願した。422 出願の係属中のクレームは、本態性高血圧症のヒトの全身血管におけるプロスタサイクリンの放出を増加させて血管拡張を改善する方法を記載している。プロスタサイクリン放出の増加は、GABA- α アゴニストとアンジオテンシン II 受容体遮断薬 (ARB) という 2 つのよく知られたタイプの降圧剤を同時投与することによって達成される。実際、これらのクレームは、既知の降圧剤による高血圧の治療と、これまで評価されていなかったその作用機序 (mechanism of action) をクレームしている。

争点となったクレーム 11 は以下の通りである。なお、争点となった箇所には下線を付し

¹ *Graham v. John Deere Co.*, 383 U.S. 1, 17-18 (1966)

ている。

11. 本態性高血圧症患者の全身血管におけるプロスタサイクリン放出を増加させ、血管拡張を改善する方法において、

本態性高血圧症により全身血管内に GABA-a 受容体を発現しているヒト個体を提供し、GABA-a アゴニストの投与量と送達可能な形態に組み合わせられた ARB の投与量との組成物を提供し、ARB はアンジオテンシン II、1 型受容体アンタゴニストであり、

GABA- α アゴニストの投与量と ARB の投与量をヒト個体に経口または IV を介して同時投与することにより、組成物をヒト個体の循環系に送達し、

一定期間のアンジオテンシン II の存在による GABA-a 受容体阻害を軽減するための ARB 投与量の作用により、ヒト個体のアンジオテンシン II を遮断することにより、プロスタサイクリンの放出増加を相乗的に促進し、

一定期間中の GABA-a アゴニストの作用により、阻害されていない GABA-a 受容体を活性化し、

プロスタサイクリン放出の増加の結果として、全身血管の平滑筋を弛緩する。

(2) 訴訟の経緯

Couvaras は審査手続き中に、GABA-a アゴニストと ARB が「何十年もの間、必須の高血圧治療法として知られてきた」と認めた。審査官もこれに同意し、GABA-a アゴニストと ARB が血圧を低下させ、それによって高血圧を治療することを確立している 10 件の参考文献を引用した。

審査官はまた、クレームされた化合物の投与結果（すなわち、プロスタサイクリン放出の増加、阻害されていない GABA-a 受容体の活性化、および平滑筋弛緩）は、クレームされた既知の降圧剤の投与から自然に生じたものであるため、特許性がないと認定した。

Couvaras は、プロスタサイクリンの増加は予期せぬものであり、したがって特許対象となるべきであると主張して、審判部にアピールした。審判部は拒絶を維持した。特に、審判部は、プロスタサイクリン放出の増加というクレームされた結果は、2 つの既知の降圧剤の明らかな投与に内在するものであると判断した。Couvaras は CAFC に控訴した。

3. CAFC での争点

争点：作用機序をクレームした場合に進歩性が認められるか否か

4. CAFC の判断

結論：クレームされた作用機序は固有のものであり一応の自明を覆すことはできない

Couvaras は、クレームされた作用機序は予期せぬものであり、審判部はそれを単にクレームされた方法に固有(inherent)のであるとみなして特許性の重要性を軽視したと主張した。

Couvaras によれば、たとえ列挙された作用機序が事実上、クレームされている GABA- α アゴニストと ARB の投与に固有のものであるとしても、その機序、特にプロスタサイクリン放出の増加は予想外であったと主張した。

Couvaras は、Honeywell 事件²に基づき、プロスタサイクリン放出の増加は予期せぬものであったため、固有性を理由に特許性の重要性がないと却下することはできないと主張した。

しかし Honeywell 事件は、「予期せぬ特性により、自明に見える組成物が非自明である可能性がある」とし、既知の化合物の既知の使用を非自明にするためには予期せぬ作用機序が発見されなければならない、ということではないと判示した。

ここで、Couvaras は、2つの既知の降圧剤の同時投与から自然に生じる作用機序をクレームしようとしている。プロスタサイクリンのメカニズムでは、2つの降圧剤は、2つの別個の化合物が効果を発揮することが知られているのと同じ最終的な結果、つまり血圧の低下をもたらす。

過去の判例では、「同じ目的を対象とする既知のプロセスで新たに発見された結果は、そのような結果は固有のものであるため、特許を受けることができない」と判断している³。作用機序は常に最も厳密な固有の基準を満たしているとは限らないが、それでも、特定の化合物または化合物の混合物の投与から自然に生じる単なる結果にすぎない。

既知の化合物が既知の結果をもたらすメカニズムを記載することは、たとえそのメカニズムの性質が予期せぬものであったとしても、自明性の一応のケースを克服することはできない。

² *Honeywell International Inc. v. Mexichem Amanco Holdings S.A.*, 865 F.3d 1348, 1355 (Fed. Cir. 2017).

³ *In re Montgomery*, 677 F.3d 1375, 1381 (Fed. Cir. 2012) *In re Huai-Hung Kao*, 639 F.3d 1057, 1070-71 (Fed. Cir. 2011) (効果は組成物の固有の特性であるため、「食品の効果」は明らかであると判示)

以上の理由により CAFC は、係属中のクレームにおけるさまざまな作用機序的な記載は、クレームされた方法の一応の自明性を克服するには不十分であるという点で審判部に同意した。

5. 結論

CAFC は、422 出願は自明であるとした審判部の判断を維持した。

6. コメント

公知の化合物の作用機序をクレームに記載した場合、当該作用機序が予期せぬものであったとしても、それは固有のものであり、自明性の判断では評価されない点、判示された。なお、基礎となった出願は US9339542 として特許が成立しているが、作用機序をクレームした分割出願である 422 出願は、先行技術との相違点が作用機序だけであったため自明であるとして拒絶された。

判決日 2023 年 6 月 14 日

以上