

化学・バイオ特許判例紹介（20）

～サポート要件の判断～

平成30年（行ケ）第10110号

原告：東和薬品株式会社

被告：ジー・ディー・サール，リミテッド，ライアビリティ，カンパニー

2020年12月25日

執筆者 弁理士 鶴川智子

1. 概要

本件は，GDサール（被告）の有する，発明の名称を「セレコキシブ組成物」とし，所定の数値範囲を発明特定事項とする特許権に対する特許無効審判の有効審決に対し，医薬品後発メーカーの東和薬品（原告）らが請求（その他複数の医薬品後発メーカーが参加）した審決取消訴訟である。知財高裁は，本件発明はサポート要件に適合しないと見て，これと結論を異にする本件審決を取り消す旨の判決を下した。

2. 手続きの経緯

被告は，発明の名称を「セレコキシブ組成物」とする発明について，平成16年6月11日，特許権の設定登録（特許第3563036号，請求項の数19）を受けた。

原告は，平成28年9月30日，本件特許について特許無効審判を請求した。

被告は，平成29年2月6日付けで，本件特許の特許請求の範囲について訂正請求をした後，平成30年2月1日付けの審決の予告を受けたため，同年5月7日付けで，請求項1～5，7～19を訂正し，請求項6を削除する旨の訂正請求をした。

特許庁は，同年6月26日，本件訂正を認めた上で，「特許第3563036号の請求項6に係る発明についての審判請求を却下する。特許第3563036号の請求項1～5，7～19に係る発明についての審判請求は，成り立たない。」との審決を行った。

原告は，本件審決のうち，請求項1～5，7～19に係る部分の取消しを求める審決取消訴訟を知財高裁に提起した。

3. 本件発明の要旨

本件訂正後の請求項1（以下「本件発明1」という）は，以下の通りである。

【請求項1】

一つ以上の薬剤的に許容な賦形剤と密に混合させた10mg乃至1000mgの量の微粒子セレコキシブを含み，一つ以上の個別な固体の経口運搬可能な投与量単位を含む製薬組成物であって，粒子の最大長において，セレコキシブ粒子の $D_{90}$ が $200\mu\text{m}$ 未満である粒子サイズの分布を有する製薬組成物。

#### 4. 争点

原告らは、新規性の判断の誤り、進歩性の判断の誤り、サポート要件違反の判断の誤り、実施可能要件の判断の誤りを本件審決の取消事由として主張したが、知財高裁ではサポート要件のみが争点とされた。

具体的には、本件発明1の「粒子の最大長において、セレコキシブ粒子の $D_{90}$ が200  $\mu\text{m}$ 未満」(下線部は筆者、以下同様。)という数値範囲を発明特定事項に含む発明について、特許請求の範囲の記載がサポート要件に適合するか否かが争点とされた。

#### 5. 知財高裁の判断

知財高裁は、本件発明1について以下のように判断した(一部抜粋)。

所定の数値範囲を発明特定事項に含む発明について、特許請求の範囲の記載が特許法36条6項1号の要件(サポート要件)に適合するか否かは、当業者が、発明の詳細な説明の記載及び出願時の技術常識から、当該発明に含まれる数値範囲の全体にわたり当該発明の課題を解決することができると認識できるか否かを検討して判断すべきものと解するのが相当である。

これを本件発明1についてみると、本件発明1の特許請求の範囲の請求項1に記載された発明は、「一つ以上の薬剤的に許容な賦形剤と密に混合させた10mg乃至1000mgの量の微粒子セレコキシブ」を含む「固体の経口運搬可能な投与量単位を含む製薬組成物」に関する発明であって、「粒子の最大長において、セレコキシブ粒子の $D_{90}$ が200  $\mu\text{m}$ 未満である粒子サイズの分布を有する」ことを特徴とするものであるから、所定の数値範囲を発明特定事項に含む発明であるといえる。

本件明細書の発明の詳細な説明には、セレコキシブの生物学的利用能に関し、「発明の組成物は、粒子の最長の大きさで、粒子の $D_{90}$ が約200  $\mu\text{m}$ 以下、好ましくは約100  $\mu\text{m}$ 以下、より好ましくは75  $\mu\text{m}$ 以下、さらに好ましくは約40  $\mu\text{m}$ 以下、最も好ましくは約25  $\mu\text{m}$ 以下であるように、セレコキシブの粒子分布を有する。通常、本発明の上記実施例によるセレコキシブの粒子サイズの減少により、セレコキシブの生物学的利用能が改良される。」(【0022】)、「カプセル若しくは錠剤の形で経口投与されると、セレコキシブ粒子サイズの減少により、セレコキシブの生物学的利用能が改善されるを発見した。したがって、セレコキシブの $D_{90}$ 粒子サイズは約200  $\mu\text{m}$ 以下、好ましくは約100  $\mu\text{m}$ 以下、より好ましくは約75  $\mu\text{m}$ 以下、さらに好ましくは約40  $\mu\text{m}$ 以下、最も好ましくは25  $\mu\text{m}$ 以下である。例えば、例11に例示するように、出発材料のセレコキシブの $D_{90}$ 粒子サイズを約60  $\mu\text{m}$ から約30  $\mu\text{m}$ に減少させると、組成物の生物学的利用能は非常に改善される。加えて又はあるいは、セレコキシブは約1  $\mu\text{m}$ から約10  $\mu\text{m}$ であり、好ましくは約5  $\mu\text{m}$ から約7  $\mu\text{m}$ の範囲の平均粒子サイズを有する。」(【0124】)、…(略)…との記載がある。これらの記載は、未調合のセレコキシブを粉碎し、「セレコキシブの $D_{90}$ 粒子サイズが約200  $\mu\text{m}$

以下」とした場合には、セレコキシブの生物学的利用能が改善されること、…（略）…  
セレコキシブのピンミリングのような衝撃粉碎により、他のタイプの粉碎と比較して、  
最終組成物に改善されたブレンド均一性がもたらせることを示したものと見える。

一方で、①本件発明1の特許請求の範囲（請求項1）には、「粒子の最大長において、  
セレコキシブ粒子のD<sub>90</sub>が200 μm未満である粒子サイズの分布を有する」構成と  
する具体的な方法を規定した記載はなく、…（略）…、③本件優先日当時、粉碎によっ  
て薬物の粒子径を小さくし、比表面積（有効表面積）を増大させることにより、薬物の  
溶出が改善されるが、他方で、難溶性薬物については、溶媒による濡れ性が劣る場合  
には、粒子径を小さくすると凝集が起りやすくなり、有効表面積が小さくなる結果、溶  
解速度が遅くなることがあり、また、粒子を微小化することにより粉体の流動性が悪く  
なり凝集が起りやすくなることがあることは周知又は技術常識であったことに照ら  
すと、難溶性薬物であるセレコキシブについて、「セレコキシブのD<sub>90</sub>粒子サイズが約  
200 μm以下」の構成とすることにより、セレコキシブの生物学的利用能が改善され  
ることを直ちに理解することはできない。

また、本件明細書の記載を全体としてみても、粒子の最大長におけるセレコキシブ粒  
子の「D<sub>90</sub>」の値を用いて粒子サイズの分布を規定することの技術的意義や「D<sub>90</sub>」の  
値と生物学的利用能との関係について具体的に説明した記載はない。しかるところ、「D<sub>90</sub>」  
は、粒子の累積個数が90%に達したときの粒子径の値をいうものであり、本件発  
明1の「D<sub>90</sub>が200 μm未満である」とは、200 μm以上の粒子の割合が10%を  
超えないように限定することを意味するものであるが、難溶性薬物の原薬の粒子径分布  
は、化合物によって様々な形態を採ることに照らすと、200 μm以上の粒子の割合を  
制限しさえすれば、90%の粒子の粒度分布がどのようなものであっても、生物学的利  
用能が改善されるとものと理解することはできない。

しかるところ、本件明細書の発明の詳細な説明の記載及び本件優先日当時の技術常識  
から、当業者が、本件発明1に含まれる「粒子の最大長において、セレコキシブ粒子の  
D<sub>90</sub>が200 μm未満」の数値範囲の全体にわたり、未調合のセレコキシブに対して生  
物学的利用能が改善された固体の経口運搬可能なセレコキシブ粒子を含む製薬組成物  
を提供するという課題を解決できると認識することはできないから、サポート要件に適  
合するものと認めることはできない。

以上のとおり、本件発明1は、サポート要件に適合するものと認めることができない  
から、これと異なる本件審決の判断は誤りである。

## 6. 考察

サポート要件の適合性については、知財高裁大合議判決（「偏光フィルム事件（平成  
17年（行ケ）第10042号）判決」）において、「特許請求の範囲の記載が、明細書  
のサポート要件に適合するか否かは、特許請求の範囲の記載と発明の詳細な説明の記載

とを対比し、特許請求の範囲に記載された発明が、発明の詳細な説明に記載された発明で、発明の詳細な説明の記載により当業者が当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否か、また、その記載や示唆がなくとも当業者が出願時の技術常識に照らし当該発明の課題を解決できると認識できる範囲のものであるか否かを検討して判断すべき」と判断されており、特許法36条6項1号がサポート要件に関する規定であることを明示し、請求項と明細書の記載との間に実質的な対応関係が必要であることが明らかにされた。

今回のような「数値限定（パラメータ）発明」においては、上述のサポート要件の判断、すなわち、発明に含まれる数値範囲全体について「当業者が当該発明の課題を解決できると認識できる」必要があるかを厳格に判断されるほど、サポート要件の適合性が否定されやすくなる。

本判決においても、「粒子の最大長において、セレキシブ粒子の $D_{90}$ が $200\mu\text{m}$ 未満」の数値範囲の全体にわたり、未調合のセレキシブに対して生物学的利用能が改善された固体の経口運搬可能なセレキシブ粒子を含む製薬組成物を提供するという課題を解決できると認識することはできないとし、数値範囲全体について当該発明の課題を解決できると認識できる必要があると判断されている。当該判決は、明細書の記載内容から妥当であると考えられるとともに、パラメータ発明のサポート要件における判断が厳しいものであると改めて感じるものである。

なお、本件特許については、本件審判とは別に特許無効審判に対する審決取消訴訟（知財高裁 令和1（行ケ）10137）が提起され、主に進歩性が争点とされ、進歩性を有する旨の知財高裁判決が下されている。

以上