

化学・バイオ特許判例紹介（33）

～進歩性（動機付け）の判断～

令和4年（行ケ）第10064号

原告：共和薬品工業株式会社，日医工株式会社、被告：協和キリン株式会社

2023年10月25日

執筆者 弁理士 鶴川智子

1. 概要

本件は，協和キリン株式会社の有する「微細結晶」に関する特許に対し，共和薬品工業株式会社らが特許無効審判を請求したところ，特許庁が不成立審決を下したことから，これに不服の共和薬品工業株式会社らが提起した審決取消訴訟である。争点の一つは，進歩性の有無である。

知財高裁は，化合物1の溶解性を追求するとの観点から結晶の粒子径を小さくするとの周知技術を採用し，かつ，化合物1の安定性を追求するとの観点から結晶の結晶化度を大きくするとの周知技術をあえて採用することが容易に想到し得たことであると認めることはできないとし，進歩性ありと判断した審決を支持した。

2. 手続きの経緯

被告は，名称を「微細結晶」とする発明についての特許（特許第4606326号。以下「本件特許」という。）の特許権者である。本件特許については，平成16年5月7日を国際出願日とし，特願2005-506044号として出願され，平成22年10月15日に設定登録がされた

原告らは，令和2年10月12日，本件特許（請求項の数は5）について特許無効審判の請求をし，特許庁は，令和4年6月7日，「本件審判の請求は，成り立たない。」との審決をした。

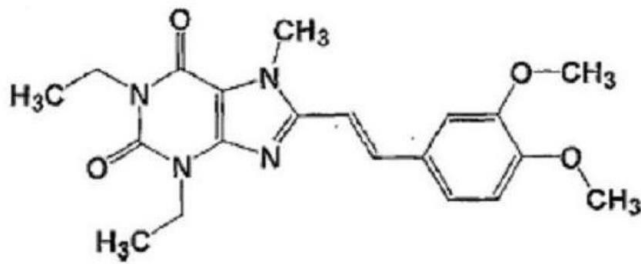
3. 本件発明の要旨

本件特許に係る特許請求の範囲の記載は，次のとおりである（争点となる請求項のみ記載する）。

【請求項1】

0. 5～20 μ mの平均粒径を有し，結晶化度が40%以上である

【化1】



で表される (E) - 8 - (3 , 4 - ジメトキシスチリル) - 1 , 3 - ジエチル - 7 - メチル - 3 , 7 - ジヒドロ - 1 H - プリン - 2 , 6 - ジオンの微細結晶。

4. 争点

争点は、進歩性の有無及びサポート要件（特許法 36 条 6 項 1 号）違反の有無である。本稿では、進歩性の有無について採り上げる。

審決で認定された本件発明 1 と甲 1 結晶発明との相違点は以下の通りである。

（相違点 1）本件発明 1 は、平均粒径が 0.5 ~ 20 μm の微細結晶であると特定しているのに対して、甲 1 結晶発明は、平均粒径及び微細結晶であることの特定がない点

（相違点 2）本件発明 1 は、結晶化度が 40 % 以上であると特定しているのに対して、甲 1 結晶発明は、結晶化度の特定がない点

5. 知財高裁の判断（筆者にて適宜抜粋，下線，ナンバリング等を一部修正）

・甲 1 結晶発明から認識される課題について

甲 1 によると、甲 1 結晶発明は、キサンチン骨格を有し、強力かつ特異性の高い A2 拮抗作用を有する優れたパーキンソン氏病治療剤を提供することを目的とするものであると認められ、甲 1 結晶発明自体からは、化合物 1 の結晶の溶解性を高めるとの課題は直ちに導かれず、その他、甲 1 には、当該課題についての記載ないし示唆は見られない。

しかしながら、甲 4、52 ないし 54 及び 71 によると、経口投与される水難溶性の薬物において、薬物の吸収性及びバイオアベイラビリティを向上させるため、その溶解性を高めることは、本件優先日当時の当業者にとって、周知の課題であったと認められるところ、甲 1 によると、甲 1 結晶発明（化合物 1 の結晶）は、経口投与される薬物としても使用されるものであると認められ、本件優先日当時の当業者は、化合物 1 の結晶の溶解性が低いものと認識していたと認められるから、甲 1 結晶発明に接した本件優先日当時の当業者は、甲 1 結晶発明（化合物 1 の結晶）の溶解性を高めるとの課題を認識したものと認めるのが相当である。

前記のとおり、甲 1 結晶発明は、キサンチン骨格を有し、強力かつ特異性の高い A2 A 拮抗作用を有する優れたパーキンソン氏病治療剤を提供することを目的とするも

のであり、甲1結晶発明自体からは、化合物1の結晶の安定性を高めるとの課題は直ちに導かれず、その他、甲1には、当該課題についての記載ないし示唆は見られない。

しかしながら、甲5、7、9、52、61、63、71及び72並びに乙7によると、薬物の安定性を高めることは、本件優先日当時の当業者にとって、自明の課題であったと認められるから、甲1結晶発明に接した本件優先日当時の当業者は、甲1結晶発明の安定性を高めるとの課題を認識したものと認めるのが相当である。

・化合物1の結晶の平均粒径を小さくし、かつ、化合物1の結晶の結晶化度を大きくすることについて

甲4、52ないし54及び61によると、経口投与される水難溶性の薬物の溶解性を高める方法として、ハンマーミル、ボールミル、ジェットミル等を利用した粉碎等により結晶の粒子径を小さくすること、結晶形を不安定型又は準安定型に変えること、結晶の結晶化度を低下させることなどは、本件優先日当時の周知技術であったと認められる。

また、甲7、9、52、61、63、71及び73並びに乙7によると、薬物の安定性を高める方法として、結晶の結晶化度を高めること、遮光、湿気の遮断等を目的として薬剤に保護コーティングを形成すること、遮光を目的として遮光剤を含むコーティング液をコーティングすることなどは、本件優先日当時の周知技術であったと認められる。

しかしながら、甲5、7、52、54及び61によると、本件優先日当時、非晶質の薬物の方が一般に溶解性が高いとの技術常識が存在し、そのため、水難溶性の薬物の溶解性を改善するとの目的で、かえって結晶化度を低くすることが一般に行われていたものと認められるところ、前記のとおり、本件優先日当時、経口投与される水難溶性の薬物の溶解性を高めるための周知技術として、結晶の粒子径を小さくすること以外の方法も存在し、また、薬物の安定性を高めるための周知技術として、結晶の結晶化度を高めること以外の方法も存在していたのであるから、化合物1の溶解性及び安定性を高めるとの課題を認識していた本件優先日当時の当業者において、化合物1の溶解性を追求するとの観点から、経口投与される水難溶性の薬物の溶解性を高めるための周知技術（結晶の粒子径を小さくするとの周知技術）を採用し、かつ、化合物1の安定性を追求するとの観点から、薬物の溶解性を低下させる結果となり得る周知技術（結晶の結晶化度を大きくするとの周知技術）をあえて採用することが容易に想到し得たことであったと認めることはできない。

この点に関し、原告らは、結晶の結晶化度を一定の数値以上に維持することは特段の処理が不要で薬剤をそのまま使用するという最も基本的な態様を含むものであり、他の手段よりはるかに容易な態様のものであると主張する。しかしながら、本件優先日当時、結晶の粒子径を小さくするための主たる手段として、ハンマーミル、ボール

ミル、ジェットミル等を利用した粉砕が考えられていたところ、甲52によると、粉砕により結晶の結晶化度が低下し、結晶が非晶質化することは、よく経験される事象であったものと認められるから、結晶の結晶化度を一定の数値以上に維持することが特段の処理を要しないものであるということはできず、原告らの上記主張は、前提を誤るものというべきである。また、原告らは、本件優先日の当業者であれば、薬物の安定性を向上させるとの課題に基づいて結晶の結晶化度を一定の数値以上に維持することを検討しつつ、粒子の微細化等の手段により溶解度を向上させるなど、結晶の結晶化度や平均粒径といったパラメータを適宜調整することを十分に動機付けられると主張するが、上記のとおり、非晶質の薬物の方が一般に溶解性が高いとの技術常識が存在したことを考慮すると、原告らの上記主張によっても、本件優先日当時の当業者において、相反する効果を生ずる事項同士であると認識されていた、化合物1の結晶の平均粒径を小さくし、かつ、その結晶化度を大きくすることが容易に想到し得たことであったと認めることはできないといわざるを得ない。

以上のとおり、化合物1の溶解性及び安定性を高めるとの甲1結晶発明の課題を認識していた本件優先日当時の当業者において、化合物1の結晶の平均粒径を相違点1の数値範囲とし、かつ、その結晶化度を相違点2の数値範囲とすることが容易に想到し得たことであったと認めることはできない。

6. 考察

知財高裁は、当業者であれば、甲1結晶発明において化合物1の溶解性及び安定性を高めるとの課題を認識したと認定した上で、双方の課題を解決するためにそれぞれ複数の周知技術が存在している場合において、相反する効果を生ずる周知技術を組み合わせる動機付けがないと判断している。審査基準においては、「審査官は、論理付けのために引用発明として用いたり、設計変更等の根拠として用いたりする周知技術について、周知技術であるという理由だけで、論理付けができるか否かの検討(その周知技術の適用に阻害要因がないか等の検討)を省略してはならない。」とされている。本件においては、複数の周知技術が存在する中で敢えて相反する周知技術を採用することの動機付けがあるとはいえず、またその効果についても予測し得るものではなく、裁判所の判断は妥当であると筆者は考える。

以上